

【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5年8月23日(2023.8.23)

【国際公開番号】WO2021/028570  
 【公表番号】特表2022-544248(P2022-544248A)  
 【公表日】令和4年10月17日(2022.10.17)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-190  
 【出願番号】特願2022-508567(P2022-508567)  
 【国際特許分類】

10

- C 0 7 D 4 0 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 1 7 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 2 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 2 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 7 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 3 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 5 / 2 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 7 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

30

【 F I 】

- C 0 7 D 4 0 5 / 0 4                    C S P
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2
- C 0 7 D 4 0 5 / 1 4
- A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9
- C 0 7 D 4 1 7 / 1 4
- A 6 1 K 3 1 / 4 2 7
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4
- A 6 1 K 3 1 / 4 2 2
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7
- C 0 7 D 4 0 9 / 1 4
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 6
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9

40

50

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 11/00

10

## 【手続補正書】

【提出日】令和5年8月10日(2023.8.10)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

20

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

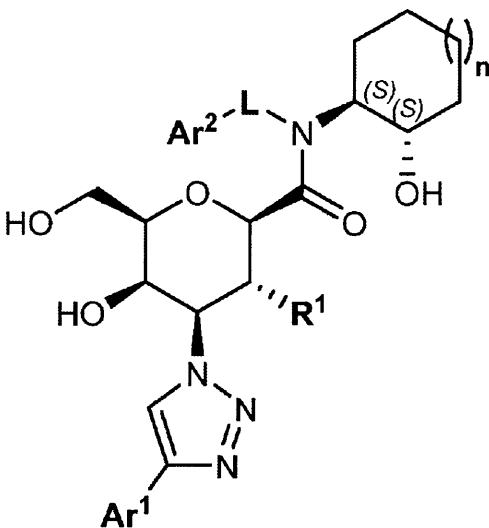
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物又はその薬学的に許容される塩：

【化1】



30

式 (I)

40

(式中、

nは、整数の1又は2を表し；

Ar<sup>1</sup>は、

- アリールであって、1、2、3、4又は5個の置換基により置換され、上記置換基が、ハロゲン；メチル；シアノ；メトキシ；トリフルオロメチル；トリフルオロメトキシ；NR<sup>N11</sup>R<sup>N12</sup>（R<sup>N11</sup>は水素を表し、かつ、R<sup>N12</sup>はヒドロキシ-C<sub>2-3</sub>-アルキルを表すか、又は、R<sup>N11</sup>及びR<sup>N12</sup>は、それらが結合する窒素原子と一緒に、

50

モルフォリン - 4 - イル、アゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル及びピペリジン - 1 - イルから選択される 4 ~ 6 員のヘテロシクリルを形成し、当該 4 ~ 6 員のヘテロシクリルは、未置換であるか又は 1 個のヒドロキシにより置換される。) から独立に選択される、アリール；

- 5 又は 6 員のヘテロアリールであって、当該 5 又は 6 員のヘテロアリールが、独立に、未置換であるか、1 又は 2 個の置換基により置換され、上記置換基が、ハロゲン、メチル、シアノ及びメトキシから独立に選択される、5 又は 6 員のヘテロアリール；又は、

- 9 又は 10 員のヘテロアリールであって、当該 9 又は 10 員のヘテロアリールが、独立に、未置換であるか又は 1 個のメチルにより置換される、9 又は 10 員のヘテロアリール；

を表し；

$R^1$  は、

- ヒドロキシ；
- $C_{1-3}$ -アルコキシ；
- $-O-CO-C_{1-3}$ -アルキル；
- $-O-CH_2-CH_2-OH$ ；又は、
- $-O-CH_2-CO-R^{1X}$  ( $R^{1X}$  は、
- - ヒドロキシ；
- - モルフォリン - 4 - イル；又は、

- -  $-NR^{N21}R^{N22}$  ( $R^{N21}$  及び  $R^{N22}$  は、それらが結合する窒素原子と一緒に、アゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル及びピペリジン - 1 - イルから選択される 4 ~ 6 員のヘテロシクリルを形成し、当該 4 ~ 6 員のヘテロシクリルは 1 個のヒドロキシにより置換される。)；

を表す。)；

を表し；

L は、直接結合、メチレン又はエチレンを表し；

$Ar^2$  は、

- フェニル又は 5 若しくは 6 員のヘテロアリールであって、当該フェニル又は 5 若しくは 6 員のヘテロアリールが、独立に、未置換であるか、1、2 又は 3 個の置換基により置換され、上記置換基が、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{3-6}$ -シクロアルキル、 $-CH_2-C_3$ -シクロアルキル、 $C_{1-3}$ -フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ -フルオロアルコキシ、 $C_{1-3}$ -アルコキシ、ハロゲン、モルフォリン - 4 - イル、アミノ、エチニル及びシアノから独立に選択される、フェニル又は 5 若しくは 6 員のヘテロアリール；

- 9 員の二環式ヘテロアリール又は 10 員の二環式ヘテロアリールであって、当該 9 又は 10 員の二環式ヘテロアリールが、独立に、未置換であるか、1 又は 2 個の置換基により置換され、上記置換基が、メチル、メトキシ及びハロゲンから独立に選択される、9 員の二環式ヘテロアリール又は 10 員の二環式ヘテロアリール；又は、

- ナフチル；

を表す。)

【請求項 2】

$Ar^1$  が、フェニルであって、1、2 又は 3 個の置換基により置換され、上記置換基が、ハロゲン、メチル、シアノ及びメトキシから独立に選択される、フェニルを表し；

前記置換基の少なくとも 1 つは、前記フェニルのメタ又はパラ位において結合し、

- パラ位の置換基が存在する場合には、当該パラ位の置換基は、好ましくは、ハロゲン、メチル、シアノ及びメトキシから選択され；

- メタ位の置換基が存在する場合には、当該メタ位の置換基は、好ましくはハロゲンである；

請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

$Ar^1$  が構造：

10

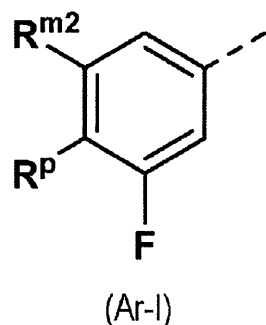
20

30

40

50

【化 2】



10

(式中、

-  $R^{m2}$  はハロゲンを表し；-  $R^p$  は、水素、ハロゲン、メチル、シアノ又はメトキシを表す。)；

のフェニル基を表す；請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

$R^1$  がメトキシを表す；請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

L が直接結合を表す；請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 6】

 $Ar^2$  が、

- フェニルであって、未置換であるか、1 又は 2 個の置換基により置換され、上記置換基が、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-3}$ -フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ -アルコキシ、ハロゲン、エチニル及びシアノから独立に選択される、フェニル；又は、

- 5 又は 6 員のヘテロアリアルであって、当該 5 又は 6 員のヘテロアリアルが、独立に、未置換であるか、1 又は 2 個の置換基により置換され、上記置換基が、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $-CH_2-C_{3-6}$ -シクロアルキル、 $C_{1-3}$ -フルオロアルキル、 $C_{1-3}$ -アルコキシ、ハロゲン、モルフォリン-4-イル及びアミノから独立に選択される、5 又は 6 員のヘテロアリアル；

30

を表す；請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

 $Ar^2$  が：

- フェニルであって、1 又は 2 個の置換基により置換され、前記置換基が、 $C_{1-3}$ -フルオロアルキル及びハロゲンから独立に選択される、フェニル；又は、

- 5 又は 6 員のヘテロアリアルであって、当該 5 又は 6 員のヘテロアリアルが、独立に、1 又は 2 個の置換基により置換され、前記置換基が、 $C_{1-4}$ -アルキル及び  $C_{1-3}$ -フルオロアルキルから独立に選択される、5 又は 6 員のヘテロアリアル；

を表す；請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

40

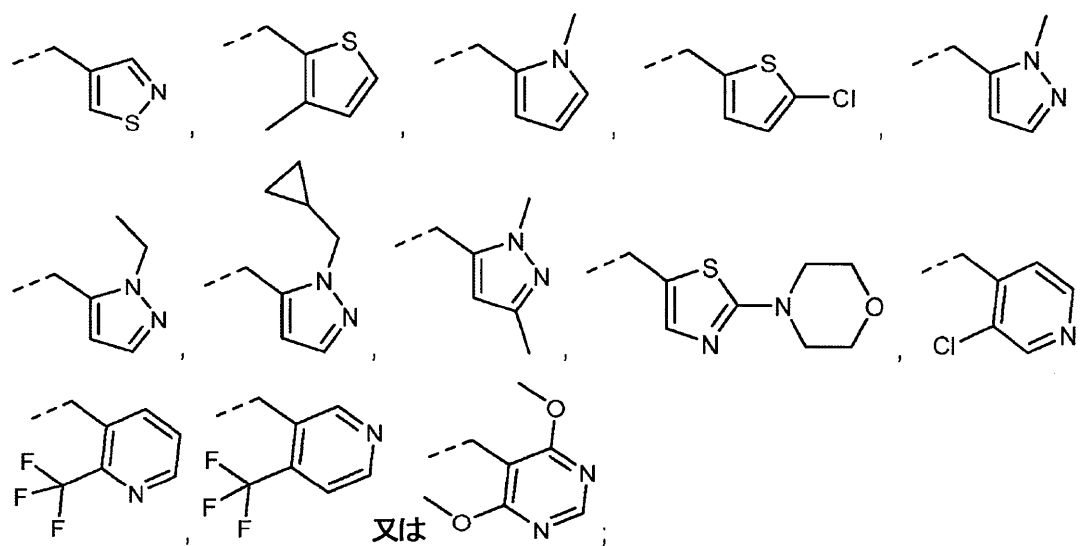
【請求項 8】

フラグメント - L -  $Ar^2$  が：

50

【化3】

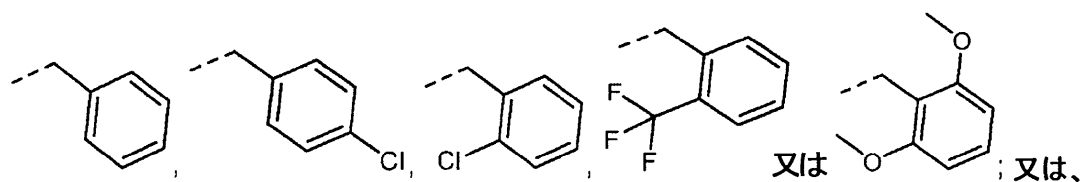
A)



10

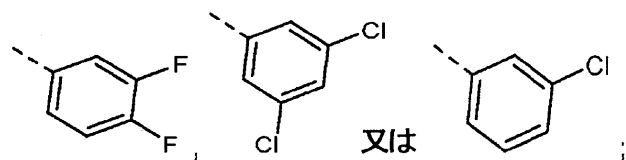
【化4】

B)



20

C)



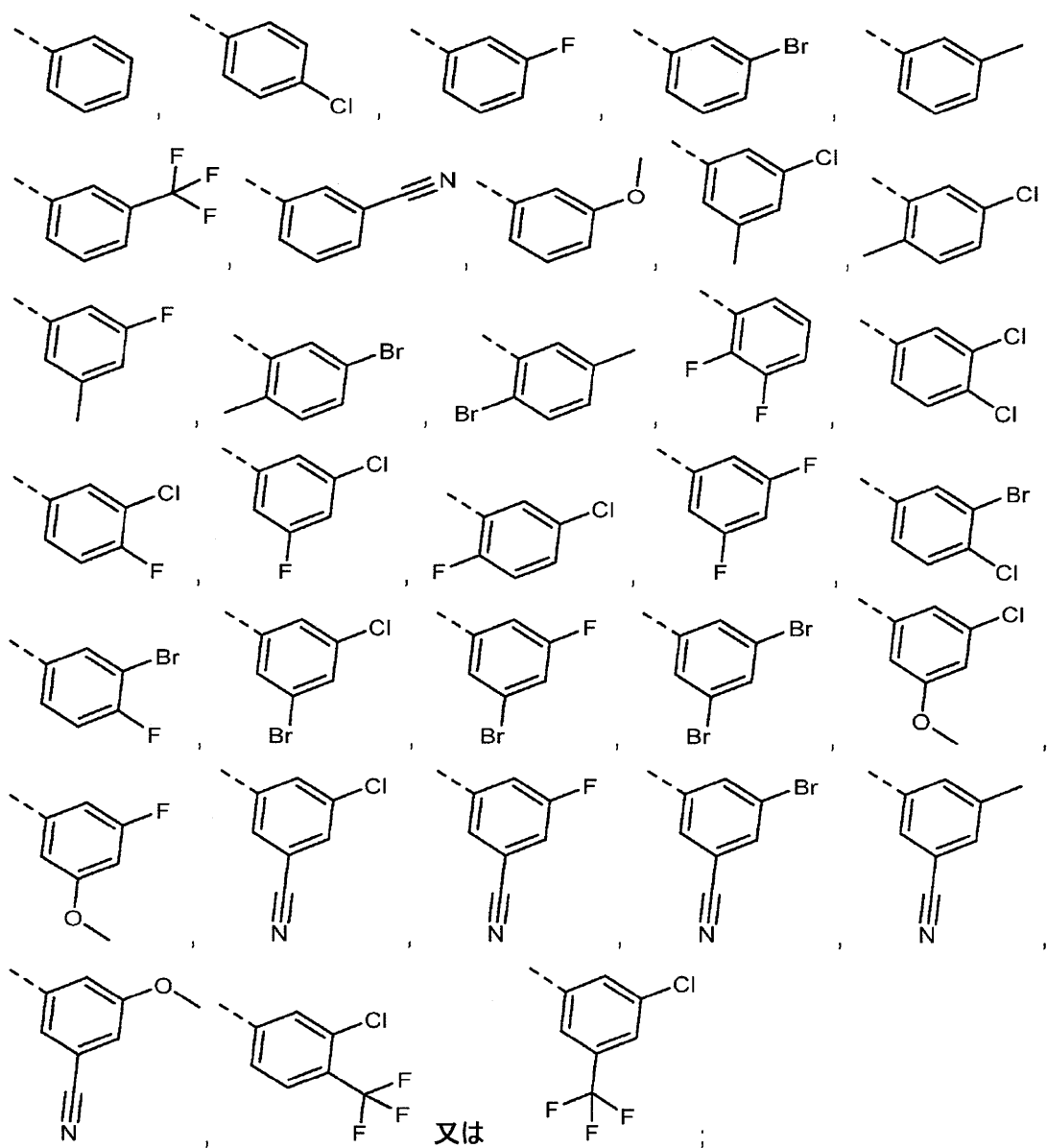
30

40

50

【化 5】

D)



10

20

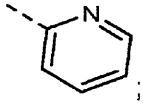
30

40

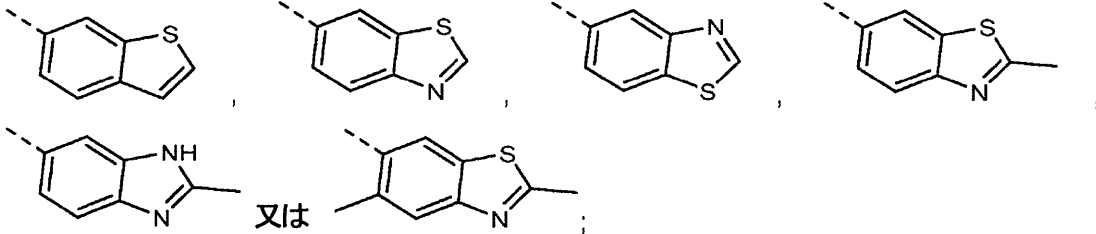
50

## 【化 6】

E)

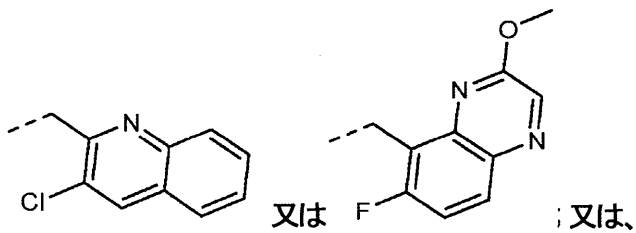


F)



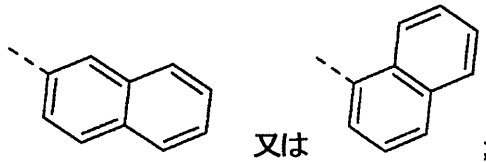
10

G)



20

H)



を表す；請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

30

## 【請求項 9】

n が整数の 1 を表す；請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 10】

当該化合物が、

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - ベンジル - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド；

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3 - クロロベンジル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド；

40

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3 - エチルベンジル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド；

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - フェネチル - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル)

50



- ル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - N - ( イソオキサゾール - 4 - イルメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( ( 5 - クロロフラン - 2 - イル) メチル ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - N - ( イソチアゾール - 4 - イルメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - N - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル) メチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( ( 2 - ブロモチアゾール - 4 - イル) メチル ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - N - ( ( 2 - モルフォリノチアゾール - 5 - イル) メチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( ( 5 - クロロチオフエン - 2 - イル) メチル ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( ( 5 - クロロチアゾール - 2 - イル) メチル ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - N - ( ( 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシ - N - ( ( 3 - ( トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) メチル ) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒド



- ロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( ( 4 - メチルチアゾール - 5 - イル)メチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)メチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( ( 2 - メチルチオフェン - 3 - イル)メチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( 2 - メトキシベンジル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 2 , 6 - ジメトキシベンジル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)メチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 3 , 5 - ジヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - ( ( 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)メチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ( ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) ( ( 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( ( 1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - ( ( 1 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( ( 1 - (シクロプロピルメチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 ,

5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - ((1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル) - 5 - ヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 5 - ヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ((1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル)メチル) - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (4 - クロロ - 3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3, 5 - ジフルオロ - 4 - メチルフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3 - フルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)メチル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3 - クロロベンジル) - 5 - ヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3, 5 - ジフルオロ - 4 - メチルフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) (2 - (トリフルオロメチル)ベンジル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) (2 - (トリフルオロメチル)ベンジル)カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ((1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド;

10

20

30

40

50

- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3 - クロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3 - フルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ( ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート ; 10
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ( ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - ( (6 - フルオロ - 3 - メトキシキノキサリン - 5 - イル) メチル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - 20  
- ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - N - ( (3 - クロロキノリン - 2 - イル) メチル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (3 - クロロ - 4, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ; 30
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (4 - クロロ - 3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (4 - クロロ - 3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - ( ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) カルバモイル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル アセテート ; 40
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (4 - ブロモ - 3, 5 - ジフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;
- (2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R) - 4 - (4 - (4 - ブロモ - 3 - フルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 3, 5 - ジヒドロキシ - N - ( (1 S, 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - N - (2 - (トリフルオロメチル) ベンジル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ; 50

















ロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - プロモ - 3 - フルオロフェニル )  
 - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 , 4 - ジフルオロフェニル )  
 - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒ  
 ドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - プロモ - 3 - フルオロフェニル )  
 - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニ  
 ル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 -  
 ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド  
 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 5 - フルオロフェ  
 ニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニ  
 ル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 -  
 ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド  
 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 5 - フルオロフェ  
 ニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 , 4 - ジフルオロフェ  
 ニル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6  
 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミ  
 ド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( ベンゾ [ d ] チアゾール - 6 - イル ) - 4 -  
 ( 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 5 - フルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール  
 - 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル  
 ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボ  
 キキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 -  
 ( 3 , 4 - ジクロロ - 5 - フルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -  
 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル )  
 - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキ  
 サミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 -  
 ( 3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イ  
 ル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 -  
 ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド  
 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 -  
 ( 2 , 3 - ジフルオロ - 4 - メチルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -  
 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル )  
 - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキ  
 サミド ;  
 2 - ( ( ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル  
 ) ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) カルバモイル ) - 4 - ( 4 - ( 2  
 , 3 - ジフルオロ - 4 - メチルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル  
 ) - 5 - 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 - 3 - イル  
 ) オキシ ) 酢酸 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 -  
 ( 2 , 3 - ジフルオロ - 4 - メチルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -  
 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル )  
 - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - ( 2 - モルフォリノ - 2 - オキソエトキシ ) テトラヒ  
 ドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

10

20

30

40

50



- 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメトキシ) フェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3 - シアノ - 5 - フルオロフェニル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3 - シアノ - 5 - メトキシフェニル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3, 5 - ジクロロフェニル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 4 - ( 4 - ( 3 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 2 - メチルベンゾ [ d ] チアゾール - 6 - イル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - N - ( 3, 5 - ジクロロフェニル) - 4 - ( 4 - ( 4 - フルオロナフタレン - 1 - イル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - クロロチアゾール - 2 - イル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) - N - ( 2, 3 - ジフルオロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( ピリジン - 2 - イル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

( 2 R, 3 R, 4 S, 5 R, 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S, 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 6 - ( ヒドロキシメチル) - 3 - メトキシ - N - ( ナフタレン - 2 - イル) - 4 - ( 4 - ( 3, 4, 5 - トリフルオロフェニル) - 1 H - 1, 2, 3 -

10

20

30

40

50

トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒド  
 ロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシ - N - ( ナフタレン  
 - 1 - イル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 -  
 トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 1 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 3 -  
 イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6  
 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニ  
 ル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 -  
 カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - ブロモ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 - ( 3 - フルオロ - 4 - メチルフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 4 - ( 4 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - 5 - ヒド  
 ロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメ  
 チル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - ブロモフェニル ) - 1 H - 1 , 2  
 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 - クロロ - 5 - シアノフェニル ) - 5 - ヒド  
 ロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメ  
 チル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル )  
 - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 - シアノ - 5 - メトキシフェ  
 ニル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6  
 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミ  
 ド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 4 - ( 4 - ( 4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル )  
 - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - N - ( 3 - シアノ - 5 - メチルフェニ  
 ル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 -  
 ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド  
 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 - クロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - N  
 - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3  
 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ト  
 リアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ  
 シ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル  
 ) - 3 - メトキシ - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 ,  
 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ  
 シ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル  
 ) - 3 - ( 2 - モルフォリノ - 2 - オキソエトキシ ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフ  
 ルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H -  
 ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ  
 シ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル  
 ) - 3 - ( 2 - ( S ) - 3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソエトキシ  
 ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾー

10

20

30

40

50

ル - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - ( 2 - ( ( R ) - 3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソエトキシ ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - ( 2 - ( 4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソエトキシ ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 3 - ( 2 - ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) - 2 - オキソエトキシ ) - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 2 - ( ( ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - 2 - ( ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) カルバモイル ) - 5 - ヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) オキシ ) 酢酸 ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 3 - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルフォリノフェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ; 又は、  
 ( 2 R , 3 R , 4 S , 5 R , 6 R ) - N - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 4 - ( 4 - ( 3 , 5 - ジフルオロ - 4 - ( ( 3 - ヒドロキシプロピル ) アミノ ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル ) - 5 - ヒドロキシ - N - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 3 - メトキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - カルボキサミド ;

である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 1】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩；及び薬学的に許容される担体を有する医薬組成物。

【請求項 1 2】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

活性成分として、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、 器官の線維症；肝疾患及び障害；心血管疾患及び障害；細胞増殖性疾患及び癌；炎症性及び自己免疫疾患及び障害；消化器疾患及び障害；尿路疾患及び障害；膵臓疾患及び障害；異常血管新生関連疾患及び障害；脳関連疾患及び障害；神経因性疼痛及び末梢性ニューロパチー；眼疾患及び障害；急性腎障害及び慢性腎臓病；間質性肺疾患及び障害；又は移植拒絶の予防用又は治療用の薬剤。

10

20

30

40

50

## 【請求項 1 4】

器官の線維症；肝疾患及び障害；心血管疾患及び障害；細胞増殖性疾患及び癌；炎症性及び自己免疫疾患及び障害；消化器疾患及び障害；膵臓疾患及び障害；異常血管新生関連疾患及び障害；脳関連疾患及び障害；神経因性疼痛及び末梢性ニューロパチー；眼疾患及び障害；急性腎障害及び慢性腎臓病；間質性肺疾患及び障害；又は移植拒絶の予防又は治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の使用。

10

20

30

40

50