

【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20年11月13日(2008.11.13)

【公表番号】特表2008-514668(P2008-514668A)

【公表日】平成20年5月8日(2008.5.8)

【年通号数】公開・登録公報2008-018

【出願番号】特願2007-533940(P2007-533940)

【国際特許分類】

| | |
|---------------|-----------|
| C 07 D 309/10 | (2006.01) |
| A 61 P 3/00 | (2006.01) |
| A 61 P 3/10 | (2006.01) |
| A 61 P 3/12 | (2006.01) |
| A 61 P 5/48 | (2006.01) |
| A 61 P 3/08 | (2006.01) |
| A 61 P 3/06 | (2006.01) |
| A 61 P 9/10 | (2006.01) |
| A 61 P 3/04 | (2006.01) |
| A 61 P 9/12 | (2006.01) |
| A 61 P 9/04 | (2006.01) |
| A 61 P 19/06 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P 1/08 | (2006.01) |
| A 61 K 31/351 | (2006.01) |
| A 61 P 7/10 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|---------------|-------|
| C 07 D 309/10 | C S P |
| A 61 P 3/00 | |
| A 61 P 3/10 | |
| A 61 P 3/12 | |
| A 61 P 5/48 | |
| A 61 P 3/08 | |
| A 61 P 3/06 | |
| A 61 P 9/10 | 1 0 1 |
| A 61 P 3/04 | |
| A 61 P 9/12 | |
| A 61 P 9/04 | |
| A 61 P 19/06 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 1 |
| A 61 P 1/08 | |
| A 61 K 31/351 | |
| A 61 P 7/10 | |

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月29日(2008.9.29)

【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

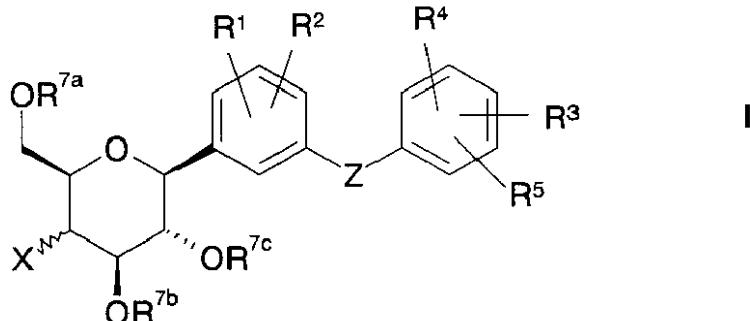
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式IのD-ピラノシリル置換フェニル、その互変異性体、立体異性体、その混合物又は塩。

【化 1】



(式中、

R¹は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₁₋₆-アルキル、C₂₋₆-アルキニル、C₂₋₆-アルケニル、C₃₋₁₀-シクロアルキル、C₃₋₁₀-シクロアルキル-C₁₋₃-アルキル、C₅₋₁₀-シクロアルケニル、C₅₋₁₀-シクロアルケニル-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アミノカルボニル、C₁₋₄-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノカルボニル、ピロリジン-1-イルカルボニル、ピペリジン-1-イルカルボニル、モルフォリン-4-イルカルボニル、ピペラジン-1-イルカルボニル、4-(C₁₋₄-アルキル)ピペラジン-1-イルカルボニル、C₁₋₄-アルコキシカルボニル、アミノ、C₁₋₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、モルフォリン-4-イル、ピペラジン-1-イル、4-(C₁₋₄-アルキル)ピペラジン-1-イル、C₁₋₄-アルキルカルボニルアミノ、C₁₋₆-アルキルオキシ、C₃₋₁₀-シクロアルキルオキシ、C₅₋₁₀-シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、C₁₋₄-アルキルスルファン、C₁₋₄-アルキルスルフィニル、C₁₋₄-アルキルスルホニル、C₃₋₁₀-シクロアルキルスルフィニル、C₃₋₁₀-シクロアルキルスルホニル、C₅₋₁₀-シクロアルケニルスルファン、C₅₋₁₀-シクロアルケニルスルホニル、アリールスルファン、アリールスルホニル、アリールスルホニル、ヒドロキシ、シアノ又はニトロを表し、このときアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、C₁₋₃-アルコキシ及びC₁₋₃-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ

シクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

N-ヘテロシクロアルキル基中、メチレン基がCO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつR²は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、C₁₋₄-アルキル、C₁₋₄-アルコキシ、シアノ又はニトロを表し、このときアルキル基はフッ素で一置換又は多置換されていてもよく、或いは

該フェニル環の隣接する2個のC原子にR¹とR²が結合している場合、R¹とR²が一緒に結合して、R¹とR²が一緒にC₃₋₅-アルキレン、C₃₋₅-アルケニレン又はブタジエニレンブリッジ(部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、C₁₋₃-アルコキシ及びC₁₋₃-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO、SO₂又はNR^Nと置き換わっていてもよく、かつブタジエニレンブリッジの場合、1又は2個のメチレン基がN原子と置き換わっていてもよい)を形成していてもよく、

R³は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₁₋₆-アルキル、C₂₋₆-アルキニル、C₂₋₆-アルケニル、C₃₋₁₀-シクロアルキル、C₃₋₁₀-シクロアルキル-C₁₋₃-アルキル、C₅₋₁₀-シクロ

アルケニル、 C_{5-10} -シクロアルケニル- C_{1-3} -アルキル、アリール、ヘテロアリール、 C_{1-4} -アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アミノカルボニル、 C_{1-4} -アルキルアミノカルボニル、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニル、ピロリジン-1-イルカルボニル、ピペリジン-1-イルカルボニル、モルフォリン-4-イルカルボニル、ピペラジン-1-イルカルボニル、4-(C_{1-4} -アルキル)ピペラジン-1-イルカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_{1-4} -アルコキシカルボニル、 C_{1-4} -アルキルアミノ、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、モルフォリン-4-イル、ピペラジン-1-イル、4-(C_{1-4} -アルキル)ピペラジン-1-イル、 C_{1-4} -アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ、 C_{1-4} -アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、 C_{1-6} -アルコキシ、 C_{3-7} -シクロアルキルオキシ、 C_{5-7} -シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、 C_{1-4} -アルキルスルファニル、 C_{1-4} -アルキルスルフィニル、 C_{1-4} -アルキルスルホニル、 C_{3-10} -シクロアルキルスルフィニル、 C_{3-10} -シクロアルキルスルホニル、 C_{5-10} -シクロアルケニルスルファニル、 C_{5-10} -シクロアルケニルスルフィニル、 C_{5-10} -シクロアルケニルスルホニル、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、アミノ、ヒドロキシ、シアノ又はニトロを表し、このときアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、 C_{1-3} -アルコキシ及び C_{1-3} -アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ

シクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO又は SO_2 と置き換わっていてもよく、かつ

N-ヘテロシクロアルキル基中、メチレン基がCO又は SO_2 と置き換わっていてもよく、かつ R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 C_{1-3} -アルキル、 C_{1-3} -アルコキシ、又は1~3個のフッ素原子で置換されているメチル若しくはメトキシを表し、或いは

該フェニル環の隣接する2個のC原子に R^3 と R^4 が結合している場合、 R^3 と R^4 が一緒に結合して、 R^3 と R^4 が一緒に C_{3-5} -アルキレン、 C_{3-5} -アルケニレン又はブタジエニレンブリッジ(部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、 C_{1-3} -アルコキシ及び C_{1-3} -アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO、 SO_2 又は NR^N と置き換わっていてもよく、かつブタジエニレンブリッジの場合、1又は2個のメチン基がN原子と置き換わっていてもよい)を形成していてもよく、

R^5 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 C_{1-3} -アルキル、 C_{1-3} -アルコキシ、又は1~3個のフッ素原子で置換されているメチル若しくはメトキシを表し、かつ R^N は、H、 C_{1-4} -アルキル又は C_{1-4} -アルキルカルボニルを表し、

Lは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_{1-3} -アルキル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、 C_{1-3} -アルコキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ及びシアノの中から相互独立に選択され、

R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{7c} は、相互独立に、水素、(C_{1-18} -アルキル)カルボニル、(C_{1-18} -アルキル)オキシカルボニル、アリールカルボニル及びアリール-(C_{1-3} -アルキル)-カルボニルの中から選択される意味を有し、

Xは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 C_{1-6} -アルキル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{2-6} -アルケニル、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-3} -アルキル、 C_{5-7} -シクロアルケニル- C_{1-3} -アルキル、アリール- C_{1-3} -アルキル、ヘテロアリール- C_{1-3} -アルキル、 C_{1-6} -アルコキシ、 C_{2-6} -アルケニルオキシ、 C_{2-6} -アルキニルオキシ、 C_{3-7} -シクロアルキルオキシ、 C_{5-7} -シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-3} -アルキルオキシ、 C_{5-7} -シクロアルケニル- C_{1-3} -アルキルオキシ、アリール- C_{1-3} -アルキルオキシ、ヘテロアリール- C_{1-3} -アルキルオキシ、アミノカルボニル、 C_{1-4} -アルキルアミノカルボニル、ジ-(C_{1-3} -アルキル)アミノカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_{1-4} -ア

ルコキシカルボニル、アミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルキルアミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、ヒドロキシカルボニル-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルコキシカルボニル-C₁₋₃-アルキル、C₃₋₇-シクロアルキルオキシ-C₁₋₃-アルキル、C₅₋₇-シクロアルケニルオキシ-C₁₋₃-アルキル、アリールオキシ-C₁₋₃-アルキル、ヘテロアリールオキシ-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルキルスルホニルオキシ、アリールスルホニルオキシ、アリール-C₁₋₃-アルキル-スルホニルオキシ又はシアノを表し、

このとき該ピラノース環に直接結合しているメチレン基は、NR^N、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されてもよく、或いは塩素、シアノ、ヒドロキシ、C₁₋₃-アルコキシ、C₁₋₃-アルキルスルファニル、-NH₂、-NHR^N、-NR^N(C₁₋₃-アルキル)及びC₁₋₃-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されてもよく、かつシクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

Zは、酸素、メチレン、ジメチルメチレン、1,1-シクロプロピレン、ジフルオロメチレン又はカルボニルを表し；

このとき、上記基の定義で言及したアリール基は、フェニル又はナフチル基（同一又は異なる基で相互独立に一置換又は二置換されてもよい）を表し；かつ

上記基の定義で言及したヘテロアリール基は、ピロリル、フラニル、チエニル、ピリジル、インドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、キノリニル若しくはイソキノリニル基、

又は1若しくは2個のメチン基が窒素原子と置き換わっているピロリル、フラニル、チエニル若しくはピリジル基、

又は1~3個のメチン基が窒素原子と置き換わっているインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、キノリニル若しくはイソキノリニル基を表し、

さらに上記ヘテロアリール基は、同一又は異なる基で相互独立に一置換又は二置換されてもよく；

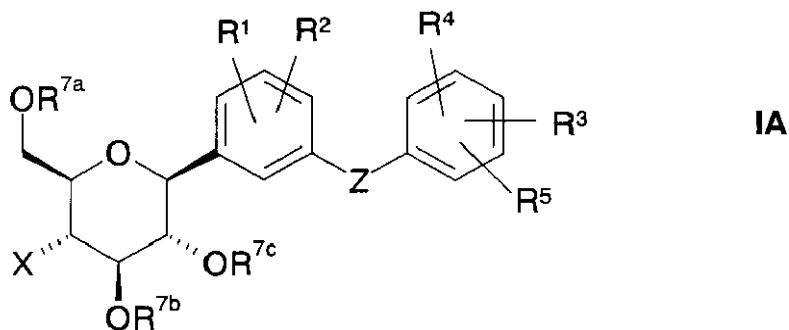
さらに上記基の定義で言及したN-ヘテロシクロアルキル基は飽和炭素環式環（該環中にイミノ基を含み、該環中に、さらなるイミノ基又はO若しくはS原子を含んでよい）を意味し、かつ

特に断らない限り、上記アルキル基は、直鎖又は分岐していてよい。）

【請求項2】

下記式IAを特徴とする請求項1記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【化2】



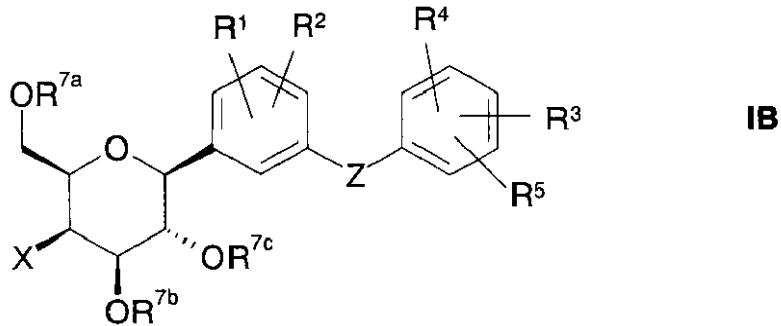
（式中、

R¹~R⁵、X、Z、R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}は、請求項1記載の意味を有する。）

【請求項3】

下記式IBを特徴とする請求項1記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【化3】



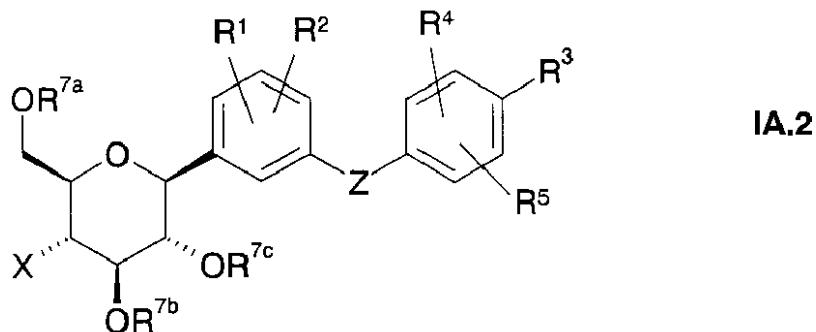
(式中、

R¹ ~ R⁵、X、Z、R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}は、請求項1記載の意味を有する。)

【請求項4】

下記式IA.2を特徴とする請求項2記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【化4】



(式中、

R¹ ~ R⁵、X、Z、R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}は、請求項1記載の意味を有する。)

【請求項5】

R¹が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_{1~6}-アルキル、C_{2~6}-アルキニル、C_{2~6}-アルケニル、C_{3~7}-シクロアルキル、C_{5~7}-シクロアルケニル、C_{1~4}-アルキルカルボニル、アミノカルボニル、C_{1~4}-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C_{1~3}-アルキル)アミノカルボニル、C_{1~4}-アルコキシカルボニル、C_{1~4}-アルキルアミノ、ジ-(C_{1~3}-アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、モルフォリン-4-イル、C_{1~4}-アルキルカルボニルアミノ、C_{1~6}-アルキルオキシ、C_{3~7}-シクロアルキルオキシ、C_{5~7}-シクロアルケニルオキシ、C_{1~4}-アルキルスルファニル、C_{1~4}-アルキルスルホニル、C_{3~7}-シクロアルキルスルファニル、C_{3~7}-シクロアルキルスルホニル、C_{5~7}-シクロアルケニルスルファニル、C_{5~7}-シクロアルケニルスルホニル、ヒドロキシ及びシアノを表し、このときアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、C_{1~3}-アルコキシ及びC_{1~3}-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ

シクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

N-ヘテロシクロアルキル基中、メチレン基がCO又はSO₂と置き換わっていてもよいことを特徴とする請求項1~4のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項6】

R³が、水素、フッ素、塩素、臭素、C_{1~6}-アルキル、C_{2~6}-アルキニル、C_{2~6}-アルケニル、C_{3~7}-シクロアルキル、C_{3~7}-シクロアルキル-メチル、C_{5~7}-シクロアルケニル、C_{3~7}-シクロアルケニル-メチル、アリール、ヘテロアリール、C_{1~4}-アルキルカルボニル、アミノカルボニル、C_{1~4}-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C_{1~3}-アルキル)-アミノカルボニル、C_{1~4}-アルコキシカルボニル、ジ-(C_{1~3}-アルキル)アミノ、ピロリジン-1-イル、ピペリ

ジン-1-イル、モルフォリン-4-イル、C₁₋₄-アルキルカルボニルアミノ、C₁₋₆-アルコキシ、C₃₋₇-シクロアルキルオキシ、C₅₋₇-シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、C₁₋₄-アルキルスルファニル、C₁₋₄-アルキルスルホニル、C₃₋₇-シクロアルキルスルファニル、C₃₋₇-シクロアルキルスルホニル、C₅₋₇-シクロアルケニルスルファニル、C₅₋₇-シクロアルケニルスルホニル、ヒドロキシ又はシアノを表し、このときアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、ヒドロキシ、C₁₋₃-アルコキシ及びC₁₋₃-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ

シクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基が相互独立にO、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

N-ヘテロシクロアルキル基中、メチレン基がCO又はSO₂と置き換わっていてもよく、このとき用語アリール及びヘテロアリールは上記定義どおりであり、かつアリール及びヘテロアリール基は、相互独立に同一又は異なる基Lで一置換又は二置換されていてもよく、Lは請求項1の定義どおりであることを特徴とする請求項1～5のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項7】

Xが、水素、フッ素、塩素、C₁₋₆-アルキル、C₂₋₆-アルキニル、C₃₋₇-シクロアルキル-C₁₋₃-アルキル、C₅₋₇-シクロアルケニル-C₁₋₃-アルキル、アリール-C₁₋₃-アルキル、ヘテロアリール-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₆-アルコキシ、C₂₋₆-アルケニルオキシ、C₂₋₆-アルキニルオキシ、C₃₋₇-シクロアルキルオキシ、C₅₋₇-シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリール-C₁₋₃-アルキルオキシ、C₃₋₇-シクロアルキルオキシ-C₁₋₃-アルキル、アリールオキシ-C₁₋₃-アルキル、ヘテロアリールオキシ-C₁₋₃-アルキル、アミノカルボニル、C₁₋₄-アルキルアミノカルボニル、C₁₋₄-アルキルカルボニルアミノ、N-(C₁₋₅-アルキル)-N-(C₁₋₄-アルキルカルボニル)-アミノ、ヒドロキシカルボニル、C₁₋₄-アルコキシカルボニル、C₁₋₆-アルキルスルホニル、アミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルキルアミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、ジ-(C₁₋₃-アルキル)アミノカルボニル-C₁₋₃-アルキル、C₁₋₄-アルコキシカルボニル-C₁₋₃-アルキル、アミノ、C₁₋₅-アルキルアミノ、N-(C₁₋₅-アルキル)-N-(C₁₋₃-アルキル)-アミノ、メルカブト又はシアノを表し、

このときアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは塩素、シアノ、ヒドロキシ、C₁₋₃-アルコキシ、C₁₋₃-アルキルスルファニル、-NH₂、-NHR^N、-NR^N(C₁₋₃-アルキル)及びC₁₋₃-アルキルから選択される同一又は異なる置換基で一置換又は二置換されていてもよく、かつ

上記シクロアルキル及びシクロアルケニル基中、1又は2個のメチレン基は、相互独立にO、S、CO、SO又はSO₂と置き換わっていてもよく、かつ

用語アリール及びヘテロアリールは前記定義どおりであり、かつアリール及びヘテロアリール基は、相互独立に同一又は異なる基Lで一置換又は二置換されていてもよく、Lは請求項1の定義どおりであることを特徴とする請求項1～6のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項8】

第1実施態様により、基Xが、水素、塩素、シアノ、C₁₋₆-アルキル、C₂₋₆-アルキニル、C₂₋₆-アルケニル、C₁₋₆-アルキルスルホニル、ヒドロキシカルボニル、C₁₋₄-アルコキシカルボニル、アミノカルボニル又はC₁₋₄-アルキルアミノカルボニルを表し（このときアルキル基は、一フッ素化若しくは多フッ素化又はヒドロキシ若しくはシアノで一置換されていてもよい）；或いは

第2実施態様により、基Xが、C₁₋₅-アルキルオキシ、C₂₋₅-アルケニルオキシ、C₂₋₅-アルキニルオキシ、C₃₋₇-シクロアルキルオキシ、アリール-C₁₋₃-アルキルオキシ又はアリールオキシを表し；或いは

第3実施態様により、基Xが、メルカプト、C₁₋₅-アルキルスルファニル、C₂₋₅-アルケニルスルファニル、C₂₋₅-アルキニルスルファニル、C₃₋₇-シクロアルキルスルファニル又はアリールスルファニルを表し；或いは

第4実施態様により、基Xが、アミノ、C₁₋₅-アルキルアミノ、N-(C₁₋₅-アルキル)-N-(C₁₋₃-アルキル)-アミノ、C₁₋₄-アルキルカルボニルアミノ、N-(C₁₋₅-アルキル)-N-(C₁₋₄-アルキルカルボニル)-アミノ又はアリールアミノを表し；或いは

第5実施態様により、基Xが、フッ素を表し；

このときアリールはフェニル又はナフチル基を意味し、同一又は異なる置換基Lで一置換又は二置換されていてもよく；かつ

Lは請求項1の定義どおりであることを特徴とする請求項1～7のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項9】

Xが、臭素、ヨウ素、C₁₋₆-アルキルスルホニルオキシ、アリールスルホニルオキシ又はアリール-C₁₋₃-アルキル-スルホニルオキシを表し；

このとき上記アルキル基は、部分的又は完全にフッ素化されていてもよく、或いは一塩素化又は二塩素化されていてもよく、かつ上記アリール基は、同一又は異なる基Lで一置換又は二置換されていてもよく、かつLは請求項1の定義どおりであることを特徴とする請求項1～6のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項10】

R²が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、又は1～3個のフッ素原子で置換されているメチルを表すことを特徴とする請求項1～9のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項11】

R⁴とR⁵が、相互独立に水素又はフッ素を表すことを特徴とする請求項1～10のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項12】

Zが、酸素又はメチレンを表すことを特徴とする請求項1～11のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項13】

R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}が、相互独立に水素、(C₁₋₅-アルキル)オキシカルボニル、(C₁₋₈-アルキル)カルボニル又はベンゾイルを表すことを特徴とする請求項1～12のいずれか1項に記載のD-ピラノシリル置換フェニル。

【請求項14】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物の、無機又は有機酸との生理学的に許容しうる塩。

【請求項15】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物又は請求項14記載の生理学的に許容しうる塩を含有する医薬組成物。

【請求項16】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物又は請求項14記載の生理学的に許容しうる塩を含有し、任意に1種以上の不活性な担体及び／又は希釈剤を含んでよい、医薬組成物。

【請求項17】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物又は請求項14記載の生理学的に許容しうる塩の、ナトリウム依存性グルコース共輸送体SGLTを阻害することによって影響を与える疾患又は状態の治療又は予防に適した医薬組成物を調製するための使用。

【請求項18】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物又は請求項14記載の生理学的に許容しうる塩の、代謝障害の治療又は予防に適した医薬組成物を調製するための使用。

【請求項19】

前記代謝障害が、1型及び2型糖尿病、糖尿病合併症、代謝性アシドーシス若しくはケトーシス、反応性低血糖症、高インスリン血症、グルコース代謝障害、インスリン耐性、代謝症候群、種々起源の異脂肪血症、アテローム性動脈硬化症及び関連疾患、肥満症、高血圧、慢性心不全、浮腫及び高尿酸血症の中から選択されることを特徴とする請求項18記載の使用。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 14 記載の生理学的に許容しうる塩の、ナトリウム依存性グルコース共輸送体SGLTを阻害するための医薬組成物を調製するための使用。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 14 記載の生理学的に許容しうる塩の、膵臍 細胞の変性を予防するための医薬組成物及び / 又は膵臍 細胞の機能を改善し、及び / 又は回復させるための医薬組成物を調製するための使用。

【請求項 22】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物又は請求項14記載の生理学的に許容しうる塩の、利尿薬又は抗高血圧薬を調製するための使用。

【請求項 2 3】

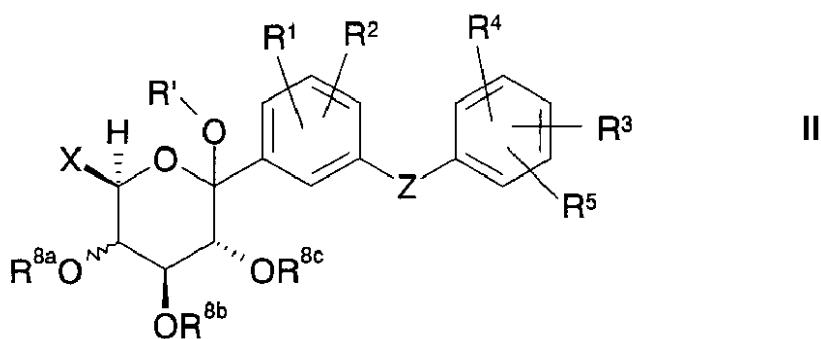
請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 14 記載の生理学的に許容しうる塩を 1 種以上の不活性な担体及び / 又は希釈剤中に非化学的方法で組み入れることを特徴とする請求項 16 記載の医薬組成物の調製方法。

【請求項 24】

請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 項に記載の一般式 1 の化合物の調製方法であつて、

下記一般式 || :

【化 5 】



(式中、

R' は、H、 C_{1-4} -アルキル、 $(C_{1-18}$ -アルキル)カルボニル、 $(C_{1-18}$ -アルキル)オキシカルボニル、アリールカルボニル又はアリール- $(C_{1-3}$ -アルキル)-カルボニルを表し（前記アルキル又はアリール基は、ハロゲンで一置換又は多置換されていてもよい）；

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} は、相互独立に、基 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{7c} について請求項1又は13で与えた意味の1つを有し、或いはベンジル基、 $R^aR^bR^cSi$ 基又はケタール若しくはアセタール基を表し（各場合2個の隣接基 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} が、環式ケタール若しくはアセタール基を形成し、又は該ピラノース環の2個の酸素原子と置換2,3-オキシジオキサン環を形成していてよく、かつアルキル、アリール及び/又はベンジル基は、ハロゲン、 C_{1-3} -アルキル又は C_{1-3} -アルコキシで一置換又は多置換されていてもよく、かつベンジル基は、ジ- $(C_{1-3}$ -アルキル)アミノ基で置換されていてもよい）；かつ

R^a、R^b、R^cは、相互独立にC₁₋₄-アルキル、アリール又はアリール-C₁₋₃-アルキルを表し（該アルキル又はアリール基は、ハロゲンで一置換又は多置換されていてもよい）；

このとき上記基の定義で言及したアリニル基は、フェニル又はオフチル基を意味する。

かつX、Z、R¹～R⁵は、請求項1～13で与えた意味を有する)

の化合物を酸の存在下で還元剤と反応させ（このとき、同時又はその後に、存在するいす

れの保護基も切断する) ;

上記反応中に用いたいずれの保護基も切断し、及び／又は

所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をヒドロキシ基のところで選択的に誘導体化し、若しくはヒドロキシ基を置換し、及び／又は

所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をその立体異性体に分割し、及び／又は

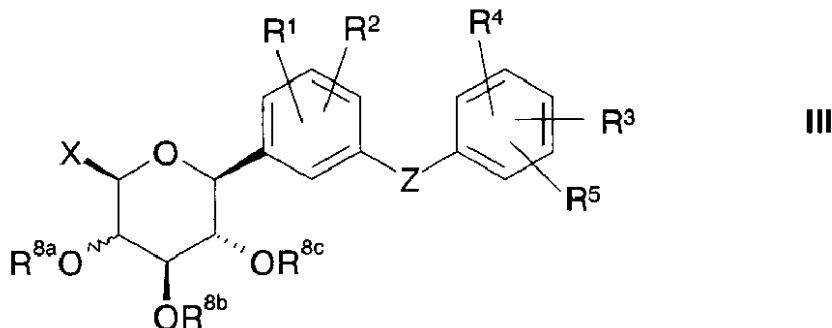
所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をその生理学的に許容しうる塩に変換することを特徴とする前記方法。

【請求項 25】

請求項 1～13 のいずれか 1 項に記載の一般式Iの化合物の調製方法であって、

下記一般式III：

【化 6】



(式中、

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} は、相互独立に、基 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{7c} について請求項 1 又は 13 で与えた意味の水素以外の 1 つを有し、或いは $R^aR^bR^cSi$ 基又はケタール若しくはアセタール基を表し(各場合2個の隣接基 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} が、環式ケタール若しくはアセタール基を形成していくよく、かつアルキル及び／又はアリール基は、一ハロゲン化又は多ハロゲン化されていてもよい)；かつ

R^a 、 R^b 、 R^c は、相互独立に $C_{1\sim 4}$ -アルキル、アリール又はアリール- $C_{1\sim 3}$ -アルキルを表し(該アルキル又はアリール基は、ハロゲンで一置換又は多置換されていてもよい)；

このとき上記基の定義で言及したアリール基は、フェニル又はナフチル基を意味し；

かつX、Z、 R^1 ～ R^5 は、請求項 1～13 で与えた意味を有する)の化合物において、

水素を意味しない基 R^{8a} 、 R^{8b} 又は R^{8c} を除去し；かつ

上記反応中に用いたいずれの保護基も切断し、及び／又は

所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をヒドロキシ基のところで選択的に誘導体化し、若しくはヒドロキシ基を置換し、及び／又は

所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をその立体異性体に分割し、及び／又は

所望により、このようにして得た一般式Iの化合物をその塩に変換することを特徴とする前記方法。