

【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23年1月27日 (2011.1.27)

【公表番号】特表2008-531604(P2008-531604A)

【公表日】平成20年8月14日 (2008.8.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-032

【出願番号】特願2007-557300(P2007-557300)

【国際特許分類】

C 0 7 H 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7042 (2006.01)

C 0 7 H 13/06 (2006.01)

C 0 7 D 309/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 9/00 C S P

A 6 1 K 31/7042

C 0 7 H 13/06

C 0 7 D 309/30 Z

A 6 1 K 31/351

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月2日 (2010.12.2)

【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

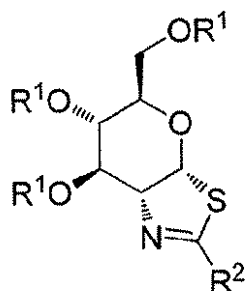
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般的な化学式 ( I )

## 【化 1】



(I)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで、

$R^1$  は、H および  $\text{COCH}_3$  からなる群より選択され、そして

$R^2$  は、 $\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$ 、 $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$  および  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$  からなる群より選択される、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2】

O - 糖タンパク質 2 - アセトアミド - 2 - デオキシ - D - グルコピラノシダーゼ (O - GlcNAcase) の選択的インヒビターである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

O 結合型 N - アセチルグルコサミン (O - GlcNAc) の切断を阻害する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 2 - エチル - 5 - (ヒドロキシメチル) - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 2 - ブチル - 5 - (ヒドロキシメチル) - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - ペンチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - イソプロピル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - イソブチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC 名: (3aR, 5R, 6

S, 7 R, 7 a R) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - エチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - ブチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - ペンチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - イソプロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、および

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - イソブチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート) からなる群より選択される、

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 5】

プロドラッグを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

前記プロドラッグが、以下：

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - エチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - ブチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R,

6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - ペンチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート ) 、

3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート ) 、 および

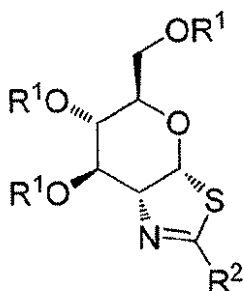
3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート ) 、 または、その薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、

請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて、一般的な化学式 ( I )

【化 1 A】



(I)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含む薬学的組成物であって、ここで、

$R^1$  は、H および  $COCH_3$  からなる群より選択され、そして

$R^2$  は、 $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 、 $(CH_2)_2CH_3$ 、 $(CH_2)_3CH_3$ 、 $(CH_2)_4CH_3$ 、 $CH(CH_3)_2$  および  $CH_2CH(CH_3)_2$  からなる群より選択される

、  
薬学的組成物。

【請求項 8】

前記化合物が、

1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - メチル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 2 - メチル - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、

1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - エチル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 2 - エチル - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、

1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - プロピル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - プロピル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、

1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - ブチル - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 2 - ブチル -

5 - (ヒドロキシメチル) - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - ペンチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - イソプロピル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (ヒドロキシメチル) - 2 - イソブチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - メチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - メチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - エチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - ブチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - ペンチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - イソプロピル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)、および

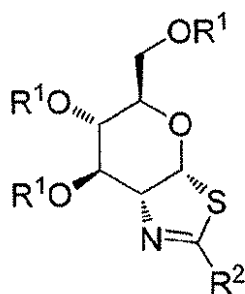
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [2, 1 - d] - 2' - チアゾリン (IUPAC名: (3aR, 5R, 6S, 7R, 7aR) - 5 - (アセトキシメチル) - 2 - イソブチル - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 3aH - ピラノ [3, 2 - d] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート)

からなる群の1つ以上より選択される、請求項7に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 9】

O - G l c N A c レベルの上昇を必要とする患者において、O - G l c N A c レベルを上昇させるための医薬の調製における、一般的な化学式 ( I )

## 【化 2】



(I)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用であって、ここで、

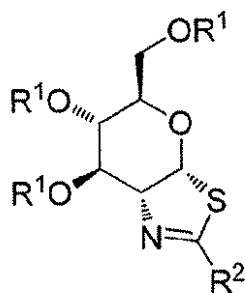
R<sup>1</sup> は、HおよびCOCH<sub>3</sub>からなる群より選択され、そして

R<sup>2</sup> は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>およびCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群より選択される、使用。

## 【請求項 10】

処置を必要とする患者において、グリコシダーゼ阻害療法に応答性の障害を処置するための医薬の調製における、一般的な化学式 ( I )

## 【化 3】



(I)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用であって、ここで、

R<sup>1</sup> は、HおよびCOCH<sub>3</sub>からなる群より選択され、そして

R<sup>2</sup> は、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>およびCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群より選択される、使用。

## 【請求項 11】

前記障害が、糖尿病、神経変性疾患、タウオパチー、癌およびストレスからなる群の1つ以上より選択される、請求項10に記載の使用。

## 【請求項 12】

前記グリコシダーゼがO - G l c N A c a s eである、請求項10または11に記載の使用。

## 【請求項 13】

前記タウオパチーがアルツハイマー病である、請求項11または12に記載の使用。

## 【請求項 14】

前記ストレスが心臓の障害を含む、請求項 11 または 12 に記載の使用。

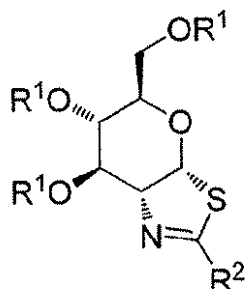
## 【請求項 15】

前記医薬が、前記患者の O - G l c N A c レベルを上昇させる、請求項 10 ~ 14 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 16】

O - G l c N A c a s e の選択的な阻害を必要とする患者において、O - G l c N A c a s e を選択的に阻害するための医薬の調製における、一般的な化学式 (I)

## 【化 4】



(I)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩の使用であって、ここで、

R<sup>1</sup> は、H および C O C H<sub>3</sub> からなる群より選択され、そして

R<sup>2</sup> は、C H<sub>3</sub>、C H<sub>2</sub> C H<sub>3</sub>、( C H<sub>2</sub> )<sub>2</sub> C H<sub>3</sub>、( C H<sub>2</sub> )<sub>3</sub> C H<sub>3</sub>、( C H<sub>2</sub> )<sub>4</sub> C H<sub>3</sub>、C H ( C H<sub>3</sub> )<sub>2</sub> および C H<sub>2</sub> C H ( C H<sub>3</sub> )<sub>2</sub> からなる群より選択される、使用。

## 【請求項 17】

前記化合物が、O - 糖タンパク質 2 - アセトアミド - 2 - デオキシ - D - グルコピラノシダーゼ ( O - G l c N A c a s e ) の選択的インヒビターである、請求項 9 ~ 16 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 18】

前記化合物が、O 結合型 N - アセチルグルコサミン ( O - G l c N A c ) の切断を阻害する、請求項 9 ~ 17 のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 19】

前記化合物が、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - メチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - メチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 2 - エチル - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジオール)、

1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( I U P A C 名: ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 2 - ブチル - 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2

- d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、  
 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - ペンチル - - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] -  
 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( ヒド  
 ロキシメチル ) - 2 - ペンチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3  
 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、  
 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソプロピル - - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ]  
 - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( ヒ  
 ドロキシメチル ) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピ  
 ラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、  
 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソブチル - - D - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] -  
 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( ヒ  
 ドロキシメチル ) - 2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ  
 [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジオール ) 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - メチル - - D - グル  
 コピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6  
 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - メチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テト  
 ラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート )  
 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - エチル - - D - グル  
 コピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6  
 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - エチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テト  
 ラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート )  
 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - プロピル - - D - グ  
 ルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R ,  
 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - プロピル - 5 , 6 , 7 , 7 a -  
 テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテ  
 ート ) 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - ブチル - - D - グル  
 コピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R , 6  
 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - ブチル - 5 , 6 , 7 , 7 a - テト  
 ラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテート )  
 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - ペンチル - - D - グ  
 ルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R ,  
 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - ペンチル - 5 , 6 , 7 , 7 a -  
 テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセテ  
 ート ) 、  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソプロピル - - D  
 - グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5  
 R , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7  
 , 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジ  
 アセテート ) 、 および  
 3 , 4 , 6 - トリ - O - アセチル - 1 , 2 - ジデオキシ - 2 ' - イソブチル - - D -  
 グルコピラノソ - [ 2 , 1 - d ] - 2 ' - チアゾリン ( I U P A C 名 : ( 3 a R , 5 R  
 , 6 S , 7 R , 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 7  
 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3 , 2 - d ] チアゾール - 6 , 7 - ジイル ジアセ  
 テート ) 、 またはその薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、  
 請求項 9 ~ 18 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 20】



前記化合物がプロドラッグを含む、請求項 9 ～ 18 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 21】

前記プロドラッグが、以下：

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - メチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - メチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - エチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - エチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - プロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - プロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - ブチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )

、  
3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - ペンチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - ペンチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )、

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソプロピル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソプロピル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )、および

3, 4, 6 - トリ - O - アセチル - 1, 2 - ジデオキシ - 2' - イソブチル - D - グルコピラノソ - [ 2, 1 - d ] - 2' - チアゾリン ( IUPAC 名 : ( 3 a R, 5 R, 6 S, 7 R, 7 a R ) - 5 - ( アセトキシメチル ) - 2 - イソブチル - 5, 6, 7, 7 a - テトラヒドロ - 3 a H - ピラノ [ 3, 2 - d ] チアゾール - 6, 7 - ジイル ジアセテート )、または、その薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、

請求項 20 に記載の使用。

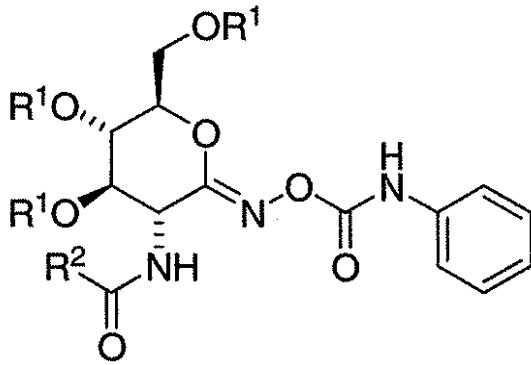
【請求項 22】

前記化合物が、薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて薬学的組成物として提供される、請求項 9 ～ 21 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 23】

一般的な化学式 ( I I )

## 【化 5】



(II)

を含む化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで、

R<sup>1</sup> は、H および C O C H<sub>3</sub> からなる群より選択され、そして

R<sup>2</sup> は、分枝アルキル鎖、非分枝アルキル鎖およびシクロアルキル基からなる群より選択される、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2 4】

R<sup>2</sup> が C 2 - C 2 0 アルキル鎖、C 2 - C 2 0 分枝アルキル鎖および C 3 - C 1 0 シクロアルキル基からなる群より選択される、請求項 2 3 に記載の化合物。

## 【請求項 2 5】

以下：

O - ( 2 - デオキシ - 2 - プロパミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) プロピオンアミド ) 、

O - ( 2 - デオキシ - 2 - ブタミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) ブチルアミド ) 、

O - ( 2 - デオキシ - 2 - 吉草酸アミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) ペンタンアミド ) 、

O - ( 2 - デオキシ - 2 - ヘキサミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) ヘキサンアミド ) 、

O - ( 2 - デオキシ - 2 - イソブタミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル ) イソブチルアミド ) 、

O - ( 2 - デオキシ - 2 - イソ吉草酸アミド - D - グルコピラノシリデン ) アミノ N - フェニルカルバメート ( I U P A C 名 : N - ( ( 3 R , 4 R , 5 S , 6 R ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - 6 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) -

テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) - 3 - メチルブタンアミド、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - 5 - プロピオンアミド - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ブチルアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ペンタンアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ヘキサンアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - イソブチルアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、および

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ( 3 - メチルブタンアミド ) - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

からなる群より選択される、請求項 2 3 または 2 4 に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2 6】

プロドラッグを含む、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

前記プロドラッグが、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - 5 - プロピオンアミド - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ブチルアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ペンタンアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ヘキサンアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - イソブチルアミド - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、および

( 2 R , 3 S , 4 R , 5 R ) - 2 - ( アセトキシメチル ) - 5 - ( 3 - メチルブタンアミド ) - 6 - ( フェニルカルバモイルオキシイミノ ) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 , 4 - ジイル ジアセテート、

またはその薬学的に受容可能な塩、

からなる群より選択される、請求項 2 6 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

神経変性疾患の処置を必要とする患者において神経変性疾患を処置するための医薬の調製における、         - ヘキササミニダーゼより O - G l c N A c a s e を選択的に阻害する化合物、または該化合物のプロドラッグ、あるいは該化合物または該プロドラッグの薬学的に受容可能な塩の使用。

【請求項 29】

前記神経変性疾患がアルツハイマー病である、請求項 28 に記載の使用。

【請求項 30】

前記神経変性疾患がタウオパチーである、請求項 28 に記載の使用。