

【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22年5月27日 (2010.5.27)

【公表番号】特表2009-533346(P2009-533346A)

【公表日】平成21年9月17日 (2009.9.17)

【年通号数】公開・登録公報2009-037

【出願番号】特願2009-504327(P2009-504327)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/26 (2006.01)
 C 0 7 D 295/04 (2006.01)
 C 0 7 D 295/18 (2006.01)
 C 0 7 D 295/14 (2006.01)
 C 0 7 D 221/18 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)
 C 0 7 D 261/20 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/65 (2006.01)
 C 0 7 C 231/10 (2006.01)
 C 0 7 C 231/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 237/26	C S P
C 0 7 D 295/04	
C 0 7 D 295/18	A
C 0 7 D 295/14	Z
C 0 7 D 295/14	A
C 0 7 D 221/18	
A 6 1 P 43/00	1 2 3
A 6 1 P 31/04	
C 0 7 D 261/20	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 43/00	1 0 5
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 K 31/65	
C 0 7 C 231/10	
C 0 7 C 231/18	

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月5日(2010.4.5)

【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

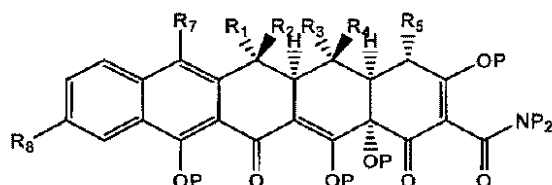
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化1】



の化合物であって、
式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換また

は非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；または $-C(R_G)_3$ であり、 R_G の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_8 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールである、化合物；およびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項2】

R_7 は水素、 $-N(R_G)_2$ （例えば、 $-N(Me)_2$ ）または $-NHMe$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

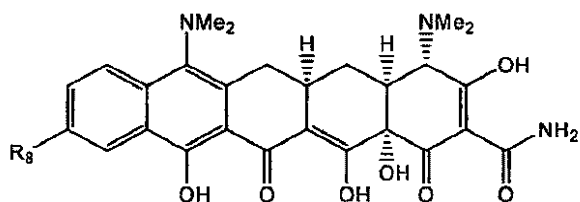
R_8 は水素、ハロゲン（例えば、臭素）、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、アシル、 $-CHO$ 、ヒドロキシメチル、複素環式脂肪族、炭素環式脂肪族、アミノ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノ、 $-NHR_H$ 、 $-N(R_H)_2$ 、アミノメチル、 $-CH_2N(R_H)_2$ （好ましくは、2つの R_H 部分は、複素環式構造を形成する）、 $-CH_2NHR_H$ 、 $-CON(R_H)_2$ 、 $-CONHR_H$ 、 $-CO_2R_H$ 、 $-COR_H$ 、 $-OR_H$ 、 $-SR_H$ 、 $-CH_2R_H$ 、 $-CH_2OR_H$ （好ましくは、 R_H は水素で

ある)、 $-\text{CH}_2\text{SR}_\text{H}$ (好ましくは、 R_H は水素である)、 $-\text{CH}_2\text{NHR}_\text{H}$ (好ましくは、 R_H は水素である)、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}_\text{H})_2$ (好ましくは、 R_H の2つの発生は、複素環式またはヘテロアリール部分を形成する)、置換または非置換アリール、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである、請求項1または2に記載の化合物。

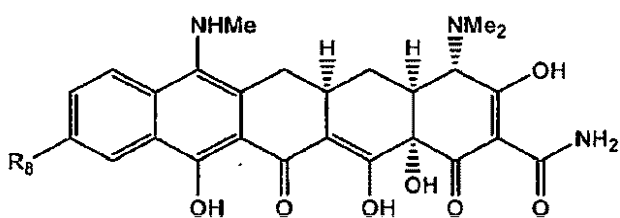
【請求項4】

式：

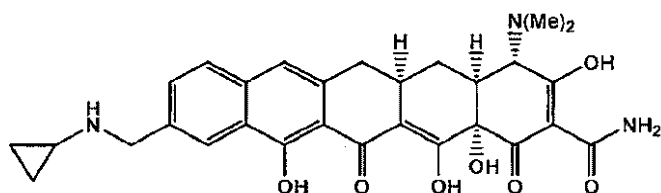
【化2】



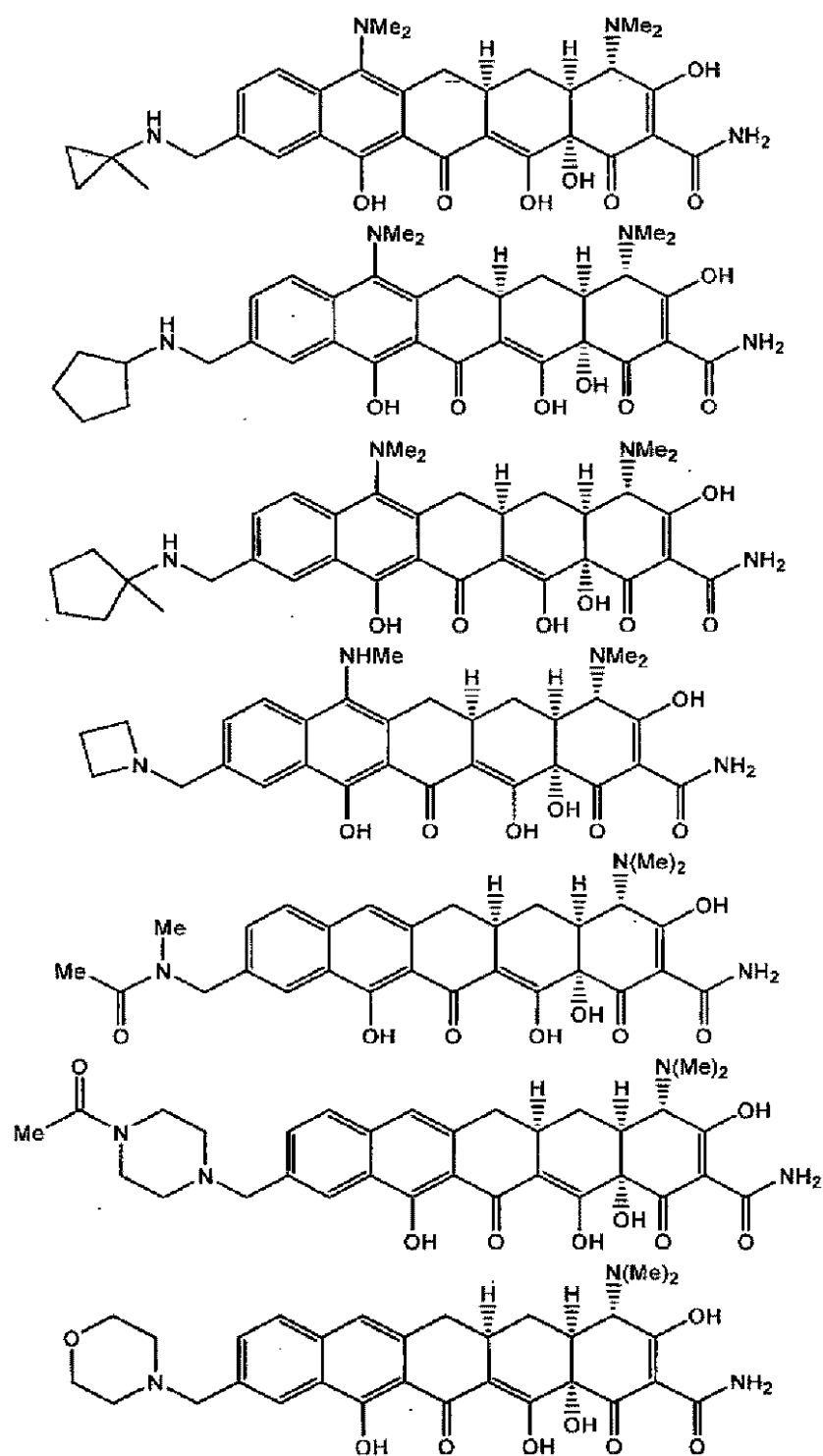
【化3】



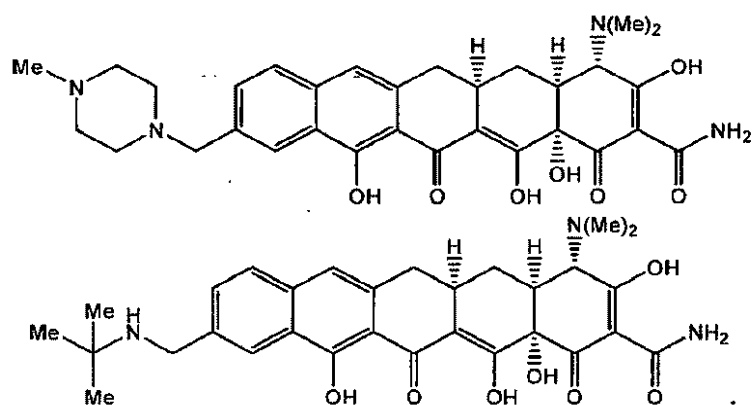
【化4】



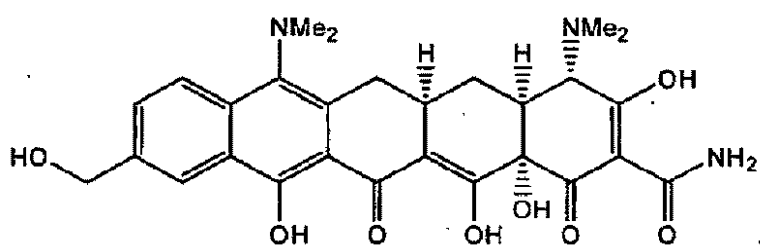
【化 5】



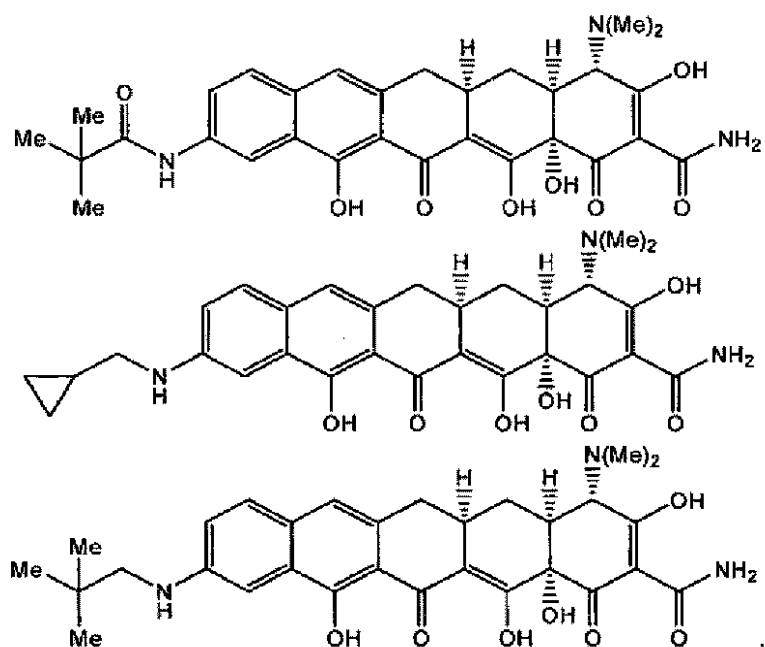
【化 6】



【化 7】

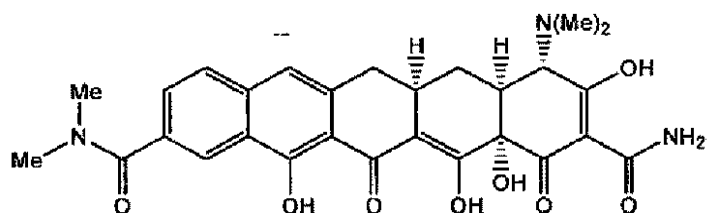


【化 8】



または

【化 9】

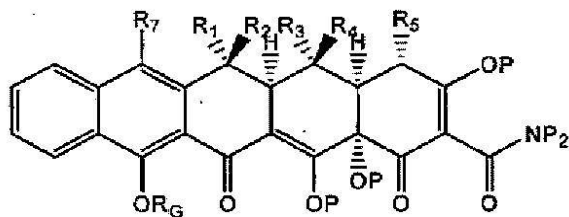


の、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

式：

【化 10】



の化合物であって、
式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

オ部分であり、

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；または $-C(R_G)_3$ であり、 R_G の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールである、化合物；およびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 6】

a) R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、

b) R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、

c) R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、

d) R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、あるいは

e) R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、請求項 1、2、3 または 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_3 は $-OH$ である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 8】

R_5 は $-N(R_E)_2$ (例えば、 $-N(Me)_2$) である、請求項 1、2、3、5 または 6 に記載の化合物。

【請求項 9】

R_7 は水素または $-N(R_G)_2$ (例えば、 $-N(Me)_2$) である、請求項 1、5 または 6 に記載の化合物。

【請求項 10】

全ての P は水素である、請求項 1、5 または 6 に記載の化合物。

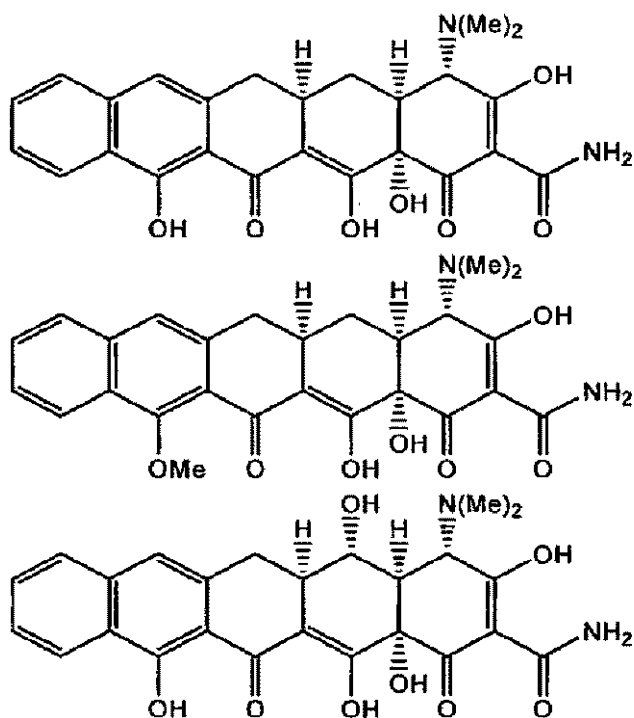
【請求項 11】

R_G は水素、 $C_1 - C_6$ アルキル (例えば、メチル)、アシル、アセチル、または酸素保護基である、請求項 5 または 6 に記載の化合物。

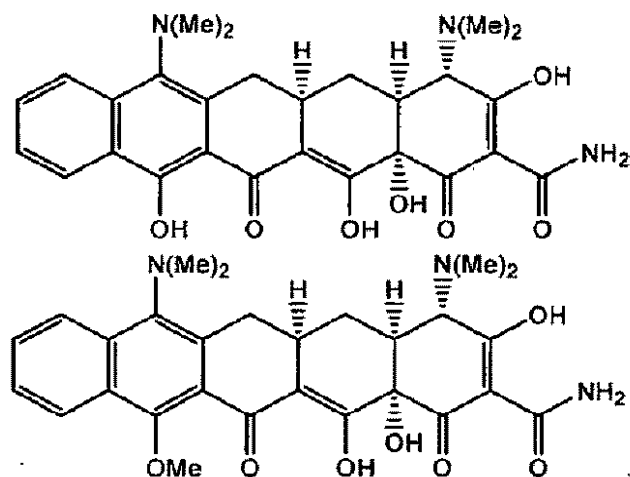
【請求項 12】

式：

【化 1 1】



【化 1 2】



のうちの1つの、請求項5に記載の化合物。

【請求項 1 3】

医薬組成物であって、請求項1から12のいずれか1項に記載の化合物と医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 1 4】

感染の治療において使用するための、請求項1から12のいずれか1項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 1 5】

前記感染は、グラム陽性菌、グラム陰性菌、リケッチア、クラミジアおよび肺炎マイコプラズマからなる群から選択される菌、テトラサイクリンに抵抗性のある菌、メチシリンに抵抗性のある菌またはバンコマイシンに抵抗性のある菌により引き起こされる、請求項14に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

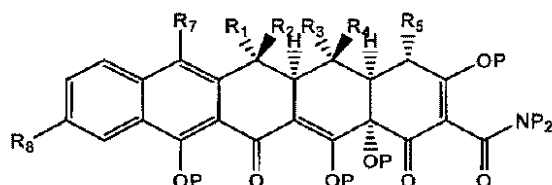
発明の要約

本発明は、例えば、以下を提供する。

(項目1)

式：

【化1】



の化合物であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂

肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_E は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_G は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；または $-C(R_G)_3$ であり、 R_G の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_H は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリール；およびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目2)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目1に記載の化合物。

(項目4)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目1に記載の化合物。

(項目5)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7)

R_5 は $-N(R_E)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 8)

R_5 は $-N(Me)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 9)

P は全て水素である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 10)

R_7 は水素である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 11)

R_7 は $-N(R_G)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 12)

R_7 は $-N(Me)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 13)

R_7 は $-NHMe$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 14)

R_8 は水素である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 15)

R_8 はハロゲンである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 16)

R_8 は臭素である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 17)

R_8 は置換または非置換脂肪族である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 18)

R_8 は置換または非置換ヘテロ脂肪族である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 19)

R_8 はアシルである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 20)

R_8 は $-CHO$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 21)

R_8 はヒドロキシメチルである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 22)

R_8 は複素環式脂肪族である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 23)

R_8 は炭素環式脂肪族である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 24)

R_8 はアミノ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 25)

R_8 は $-NHR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 26)

R_8 は $-N(R_H)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 27)

アミノメチルである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 28)

R_8 は $-CH_2N(R_H)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 29)

2 つの R_H 部分は、複素環式構造を形成する、項目 28 に記載の化合物。

(項目 30)

R_8 は $-CH_2NHR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 31)

R_8 は $-CON(R_H)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 32)

R_8 は $-CONHR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 33)

R_8 は $-CO_2R_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 34)

R_8 は $-COR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 35)

R_8 は $-OR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 36)

R_8 は $-SR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 37)

R_8 は $-CH_2R_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 38)

R_8 は $-CH_2OR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 39)

R_H は水素である、項目 38 に記載の化合物。

(項目 40)

R_8 は $-CH_2SR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 41)

R_H は水素である、項目 40 に記載の化合物。

(項目 42)

R_8 は $-CH_2NHR_H$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 43)

R_H は水素である、項目 42 に記載の化合物。

(項目 44)

R_8 は $-CH_2N(R_H)_2$ である、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 45)

R_H の 2 つの発生は、複素環式またはヘテロアリアル部分を形成する、項目 44 に記載の化合物。

(項目 46)

R_8 は置換または非置換アリアルである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

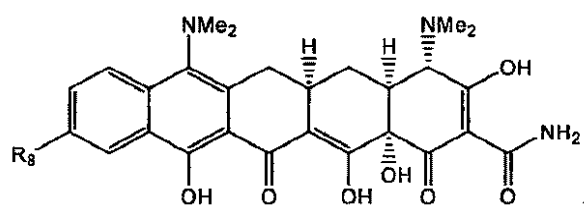
(項目 47)

R_8 は置換または非置換ヘテロアリアルである、項目 1、2、3、4、5 または 6 に記載の化合物。

(項目 48)

式：

【化 2】

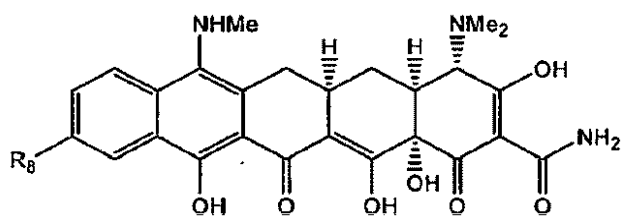


の、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4 9)

式：

【化 3】

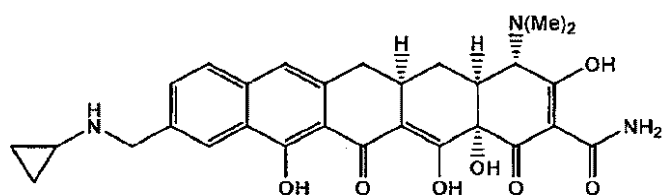


の、項目 1 に記載の化合物。

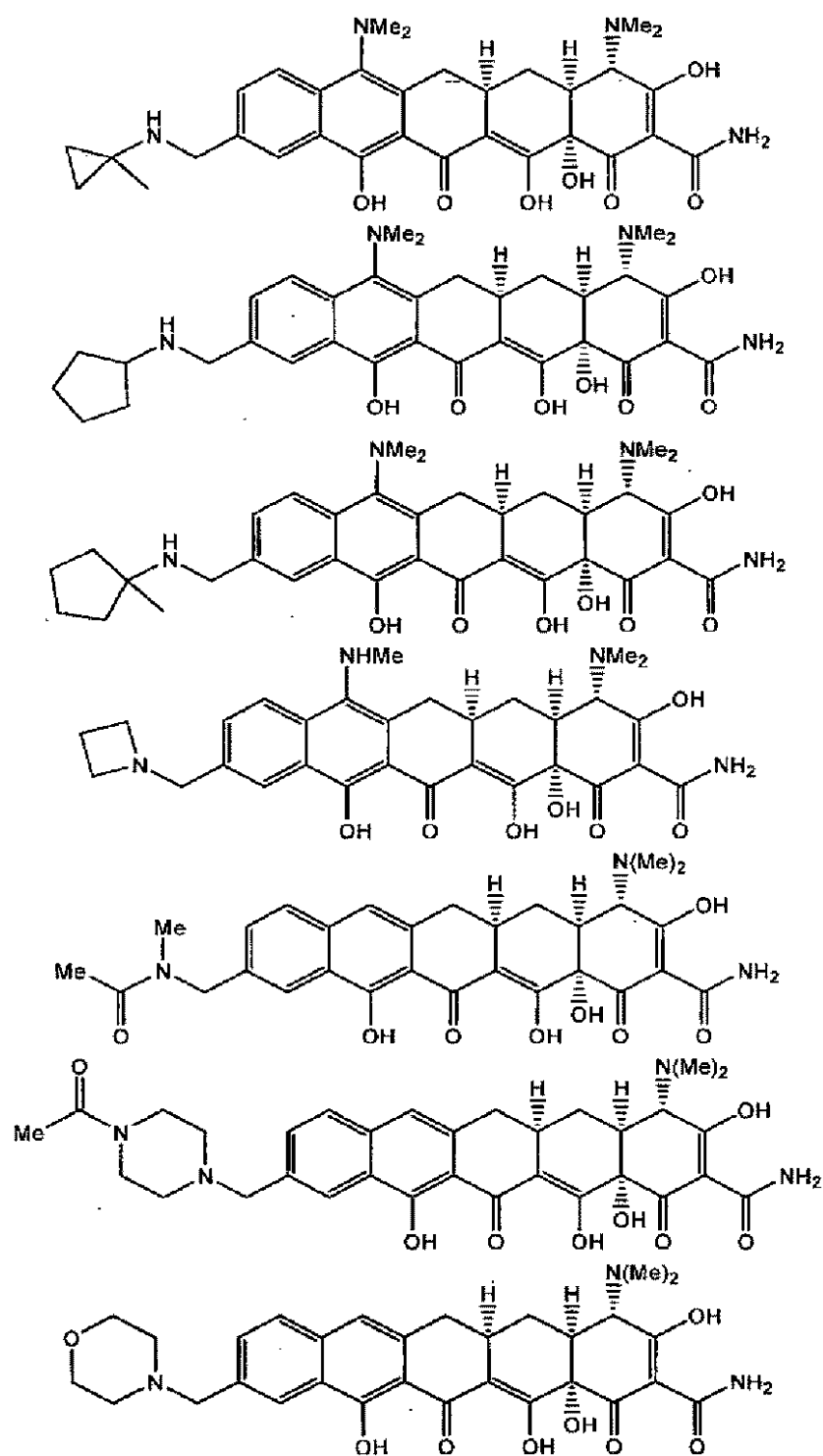
(項目 5 0)

式：

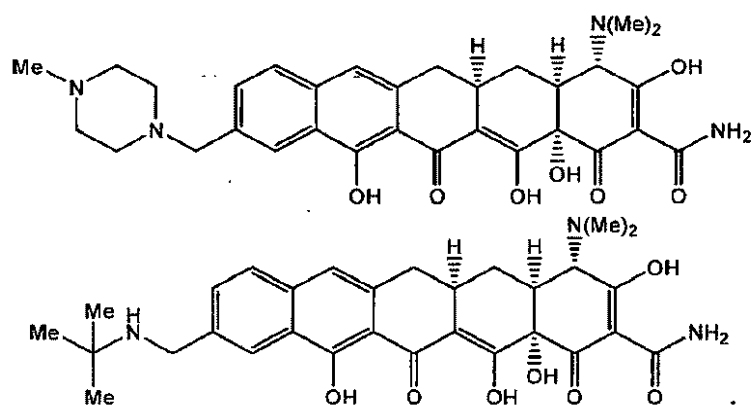
【化 4】



【化 5】



【化 6】

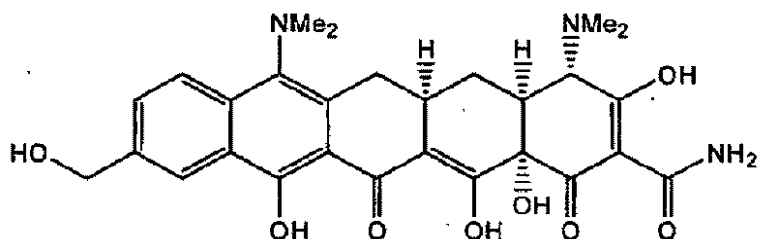


のうちの1つの、項目1に記載の化合物。

(項目51)

式：

【化 7】

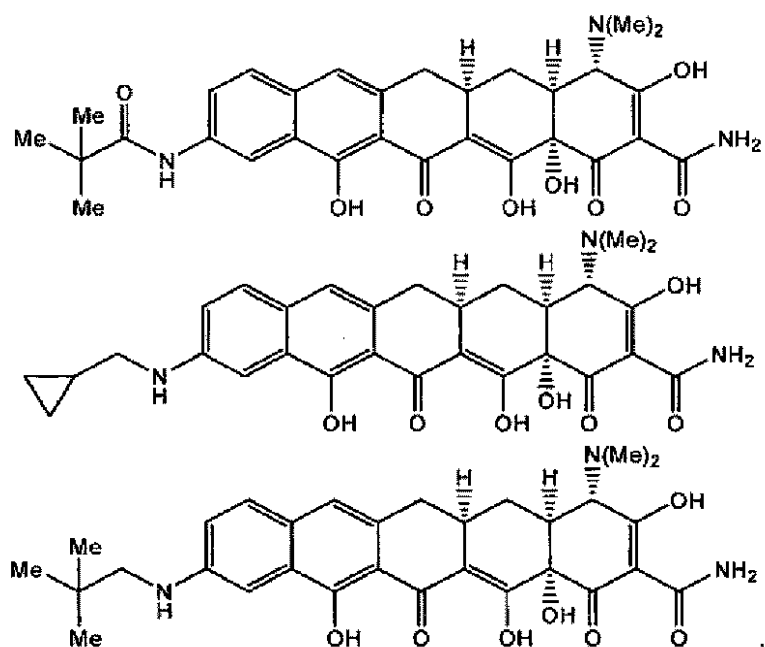


の、項目1に記載の化合物。

(項目52)

式：

【化 8】

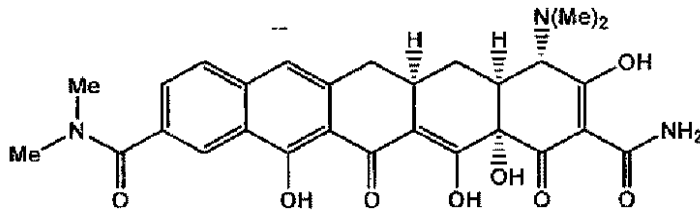


のうちの１つの、項目１に記載の化合物。

(項目５３)

式：

【化９】

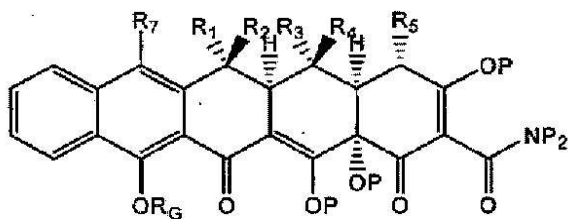


の、項目１に記載の化合物。

(項目５４)

式：

【化１０】



の化合物であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、

独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；または $-C(R_G)_3$ であり、 R_G の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリール；およびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目55)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目54に記載の化合物。

(項目56)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目57)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目58)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目59)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目44に記載の化合物。

(項目 6 0)

R₃ は - OH である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 1)

R₅ は - N (R_F)₂ である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 2)

R₅ は - N (Me)₂ である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 3)

R₁、R₂、R₃、および R₄ は全て水素、および R₅ は - N (Me)₂ である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 4)

R₇ は水素である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 5)

R₇ は - N (R_G)₂ である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 6)

R₇ は - N (Me)₂ である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 7)

全ての P は水素である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 8)

R_G は水素である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 9)

R_G はメチルである、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 7 0)

R_G は C₁ - C₆ アルキルである、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 7 1)

R_G はアシルである、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

(項目 7 2)

R_G はアセチルである、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

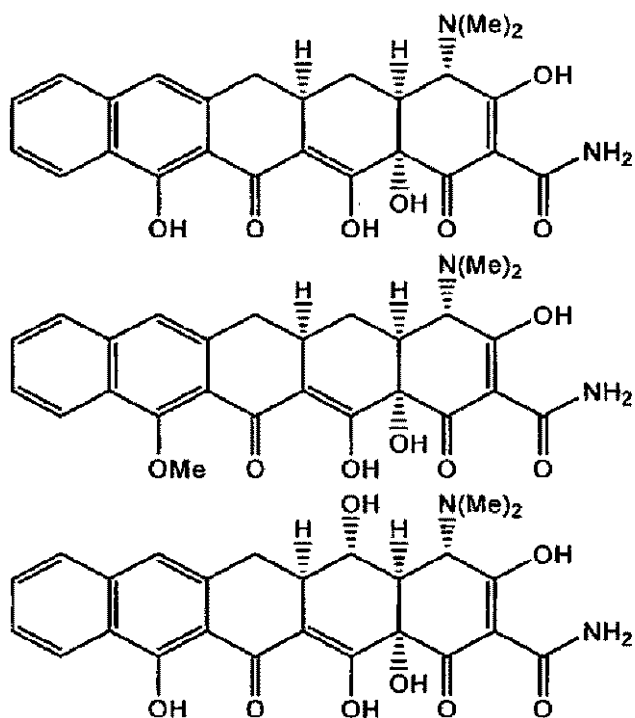
(項目 7 3)

R_G は酸素保護基である、項目 5 4、5 5、5 6、5 7、5 8 または 5 9 に記載の化合物。

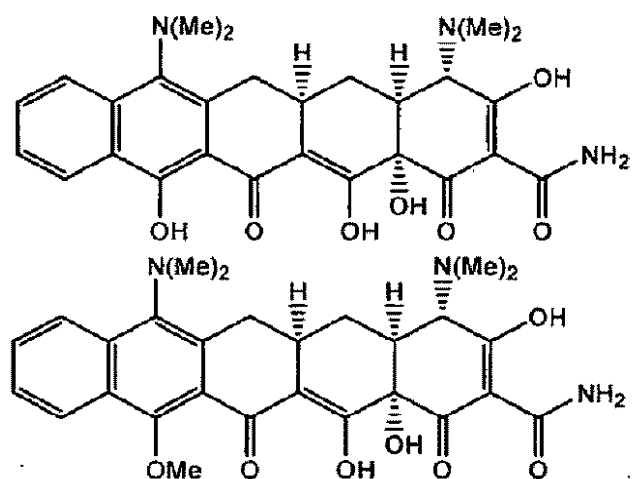
(項目 7 4)

式：

【化 1 1】



【化 1 2】

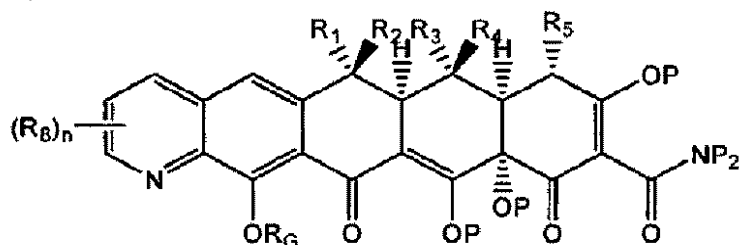


のうちの1つの、項目54に記載の化合物。

(項目 7 5)

式：

【化 1 3】



の化合物であって、
式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミ

ノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリーールオキシまたはヘテロアリーールチオ部分であり、

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリーール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリーール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリーール部分；ヘテロアリーール部分；アルコキシ；アリーールオキシ；アルキルチオ；アリーールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリーールオキシまたはヘテロアリーールチオ部分であり、

R_8 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリーール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリーール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリーール部分；ヘテロアリーール部分；アルコキシ；アリーールオキシ；アルキルチオ；アリーールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリーールオキシまたはヘテロアリーールチオ部分であり、

R_6 は、独立して、水素、保護基、アシル、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリーール部分、ヘテロアリーール部分；アルコキシ；アリーールオキシ；アルキルチオ；アリーールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリーールオキシまたはヘテロアリーールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリーール、または置換または非置換ヘテロアリーールであり、

nは、包括的に、0から3の間の整数であり、それらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目76)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目75に記載の化合物。

(項目77)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目78)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目79)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目80)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目81)

R_5 は、 $-N(R_E)_2$ である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目82)

R_5 は、 $-N(Me)_2$ である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目83)

R₁、R₂、R₃ および R₄ は全て水素であり、R₅ は - N (Me)₂ である、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 4)

P は、全て水素である、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 5)

R_G は水素である、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 6)

R_G はメチルである、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 7)

R_G は C₁ - C₆ アルキルである、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 8)

R_G はアシルである、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 9)

R_G はアセチルである、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 9 0)

R_G は酸素保護基である、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物

。

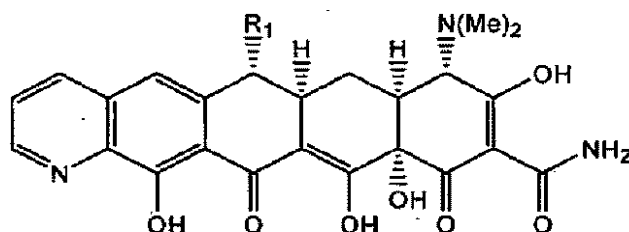
(項目 9 1)

n は 0 である、項目 7 5、7 6、7 7、7 8、7 9 または 8 0 に記載の化合物。

(項目 9 2)

式：

【化 1 4】



の、項目 7 5 に記載の化合物。

(項目 9 3)

R₁ は置換または非置換アリールである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 9 4)

R₁ は置換または非置換フェニルである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 9 5)

R₁ は非置換フェニルである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 9 6)

R₁ は一置換フェニルである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 9 7)

R₁ はパラ置換フェニルである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 9 8)

R₁ は二置換フェニルである、項目 9 2 に記載の化合物。

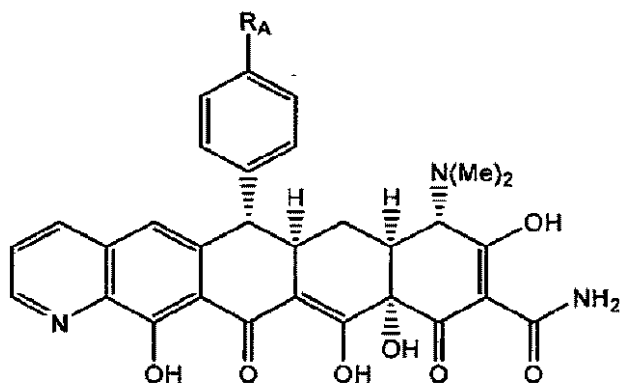
(項目 9 9)

R₁ は置換または非置換ヘテロアリールである、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 1 0 0)

式：

【化 1 5】



の、項目 9 2 に記載の化合物。

(項目 1 0 1)

R_A は $C_1 - C_6$ アルキルである、項目 1 0 0 に記載の化合物。

(項目 1 0 2)

R_A はハロゲンである、項目 1 0 0 に記載の化合物。

(項目 1 0 3)

R_A は $-N(Me)_2$ である、項目 1 0 0 に記載の化合物。

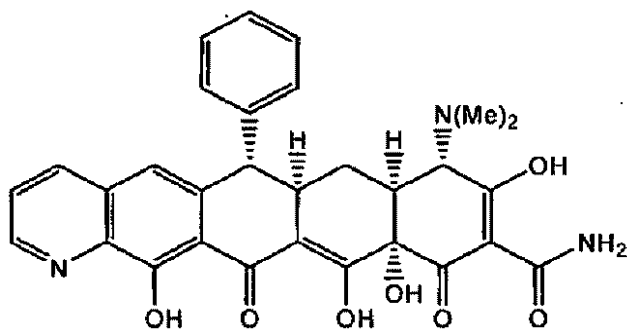
(項目 1 0 4)

R_A は水素である、項目 1 0 0 に記載の化合物。

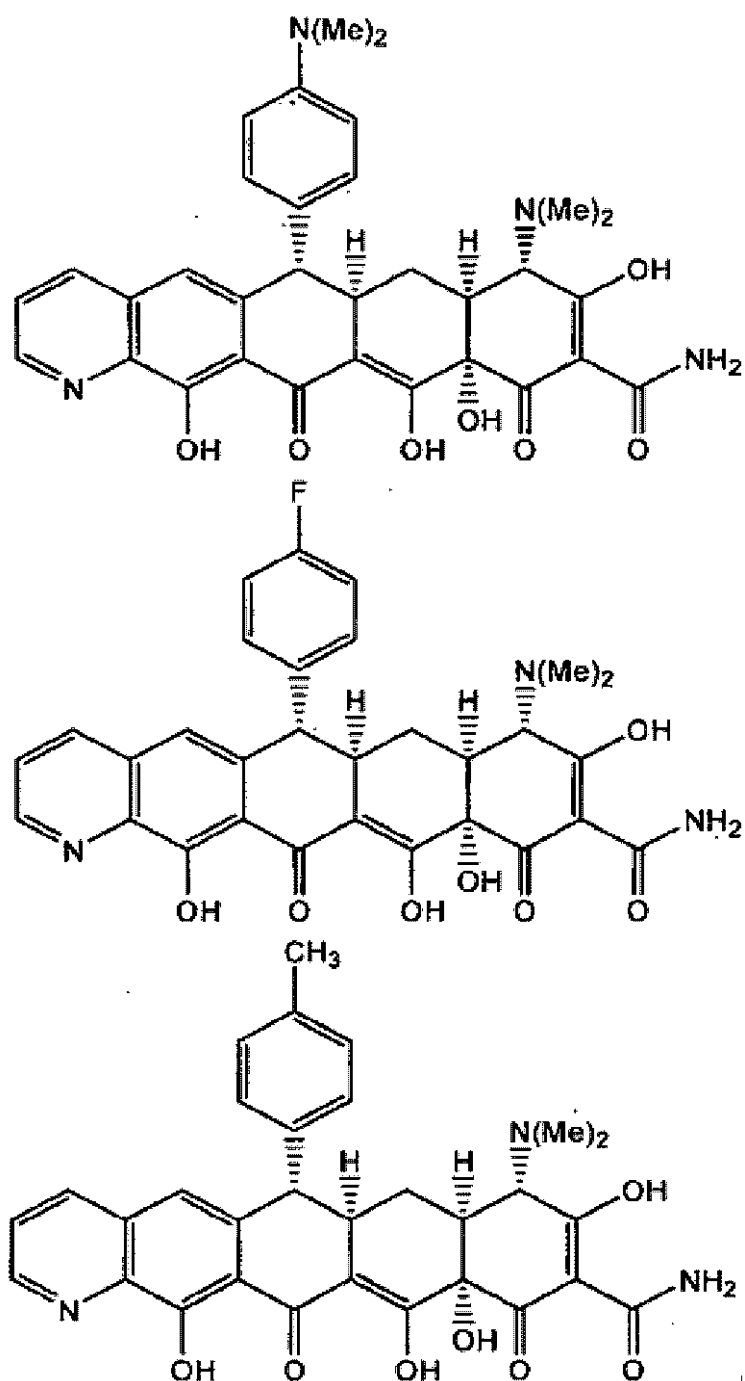
(項目 1 0 5)

式：

【化 1 6】



【化 1 7】

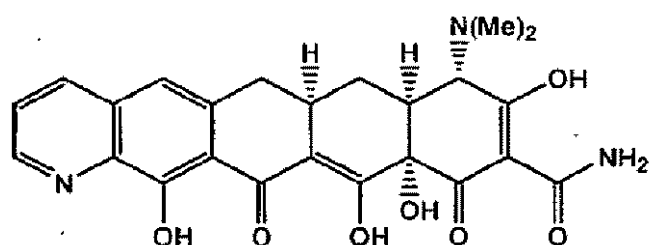


のうちの1つの、項目100に記載の化合物。

(項目106)

式：

【化 1 8】

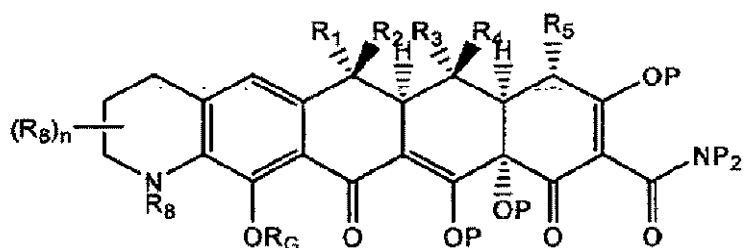


の 1 つである、項目 75 に記載の化合物。

(項目 107)

式：

【化 19】



の化合物であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ；

$-N(R_D)_2$; $-NHC(O)R_D$; または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_5 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_E$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_8 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_H$; $=O$; $-C(=O)R_H$; $-CO_2R_H$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_H$; $-SOR_H$; $-SO_2R_H$; $-NO_2$; $-N(R_H)_2$; $-NHC(O)R_H$; または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_G は、独立して、水素、保護基、アシル、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分、ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールであり、

n は、包括的に、0 から 3 の間の整数であり、それらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 108)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目 107 に記載の化合物。

(項目 109)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目 107 に記載の化合物。

(項目 110)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目 107 に記載の化合物。

(項目 111)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目 107 に記載の化合物。

(項目 112)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目 107 に記載の化合物。

(項目 113)

R_5 は、 $-N(R_E)_2$ である、項目 107、108、109、110、111 または 112 に記載の化合物。

(項目 114)

R₅ は、- N (Me)₂ である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 5)

R₁、R₂、R₃ および R₄ は全て水素であり、R₅ は - N (Me)₂ である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 6)

P は、全て水素である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 7)

R_G は水素である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 8)

R_G はメチルである、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 1 9)

R_G は C₁ - C₆ アルキルである、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 0)

R_G はアシルである、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 1)

R_G はアセチルである、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 2)

R_G は酸素保護基である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 3)

n は 0 である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

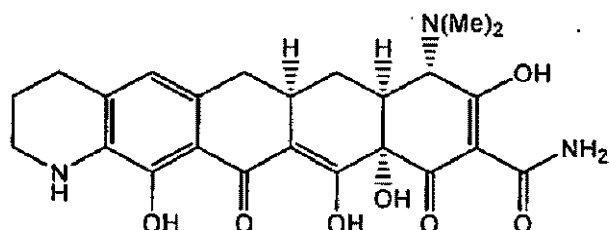
(項目 1 2 4)

全ての R₈ は水素である、項目 1 0 7、1 0 8、1 0 9、1 1 0、1 1 1 または 1 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 5)

式：

【化 2 0】

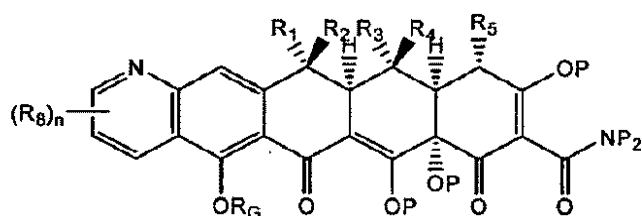


の 1 つである、項目 1 0 7 に記載の化合物。

(項目 1 2 6)

式：

【化 2 1】



の化合物であって、
式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_8 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_6 は、独立して、水素、保護基、アシル、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分、ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールであり、

n は、包括的に、0 から 3 の間の整数であり、それらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 1 2 7)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 2 8)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 2 9)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 3 0)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 3 1)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 3 2)

R_5 は、 $-N(R_E)_2$ である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 3)

R_5 は、 $-N(Me)_2$ である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 4)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は全て水素であり、 R_5 は $-N(Me)_2$ である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 5)

全ての P は、水素である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 6)

R_G は水素である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 7)

R_G はメチルである、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 8)

R_G は C₁ - C₆ アルキルである、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 3 9)

R_G はアシルである、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 4 0)

R_G はアセチルである、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 4 1)

R_G は酸素保護基である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

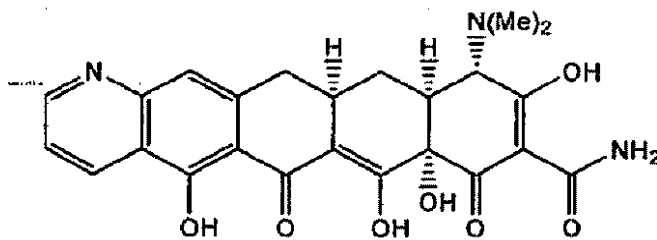
(項目 1 4 2)

n は 0 である、項目 1 2 6、1 2 7、1 2 8、1 2 9、1 3 0 または 1 3 1 に記載の化合物。

(項目 1 4 3)

式：

【化 2 2】

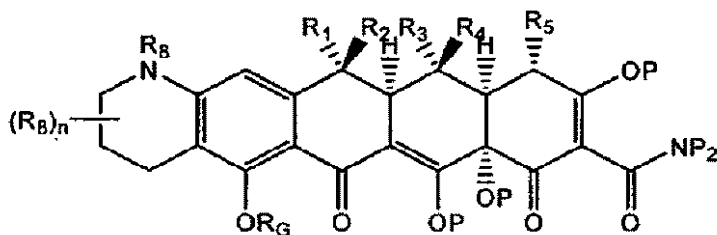


の 1 つである、項目 1 2 6 に記載の化合物。

(項目 1 4 4)

式：

【化 2 3】



の化合物であって、

式中、

R₈ は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換また

は非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_G は、独立して、水素、保護基、アシル、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分、ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールであり、

nは、包括的に、0から3の間の整数であり、それらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目145)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、全て水素である、項目144に記載の化合物。

(項目146)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目147)

R_1 はメチルであり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目148)

R_1 は水素であり、 R_2 はヒドロキシルであり、 R_3 は水素であり、 R_4 は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目149)

R_1 はメチルであり、 R_2 は水素であり、 R_3 はヒドロキシルであり、 R_4 は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目150)

R_5 は、 $-N(R_E)_2$ である、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目151)

R_5 は、 $-N(Me)_2$ である、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目152)

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は全て水素であり、 R_5 は $-N(Me)_2$ である、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目153)

全てのPは、水素である、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目154)

R_G は水素である、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目155)

R_G はメチルである、項目144、145、146、147、148または149に記載の化合物。

(項目156)

R_G は $C_1 - C_6$ アルキルである、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

(項目 157)

R_G はアシルである、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

(項目 158)

R_G はアセチルである、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

(項目 159)

R_G は酸素保護基である、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

(項目 160)

n は 0 である、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

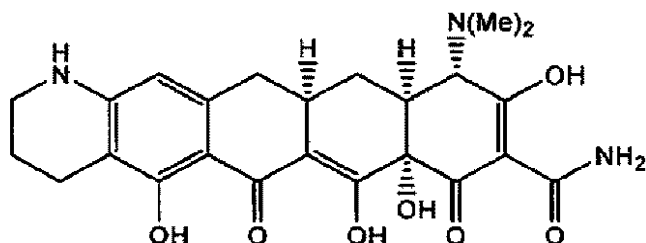
(項目 161)

全ての R_G は水素である、項目 144、145、146、147、148 または 149 に記載の化合物。

(項目 162)

式：

【化 24】

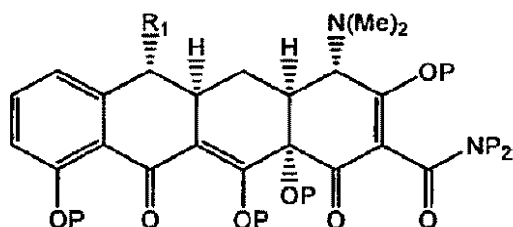


の 1 つである、項目 144 に記載の化合物。

(項目 163)

式：

【化 25】



の化合物であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミ

ノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールおよびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 1 6 4)

R₁ は水素である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 6 5)

R₁ は、環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 6 6)

R₁ は、環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 6 7)

R₁ は、置換または非置換アリールである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 6 8)

R₁ は、置換または非置換ヘテロアリールである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 6 9)

R₁ は、アシルである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 0)

R₁ は、-CO₂R_A である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 1)

R₁ は、-CO₂H である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 2)

R₁ は、-CO₂Me である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 3)

R₁ は、C₁-C₆ アルキルである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 4)

R₁ は、メチルである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 5)

R₁ は、エチルである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 6)

R₁ は、フェニルである、項目 1 6 3 に記載の化合物。

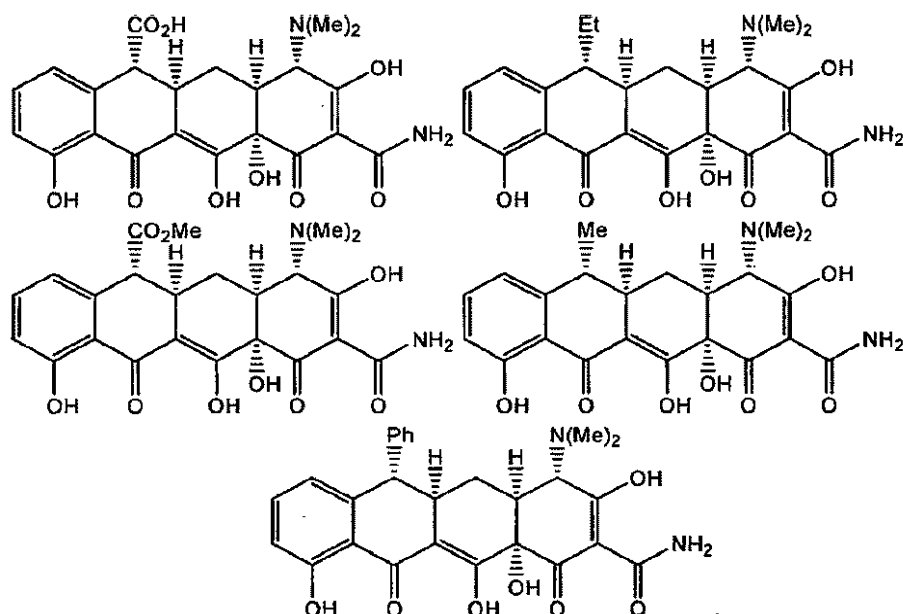
(項目 1 7 7)

全ての P は、水素である、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 8)

式：

【化 2 6】

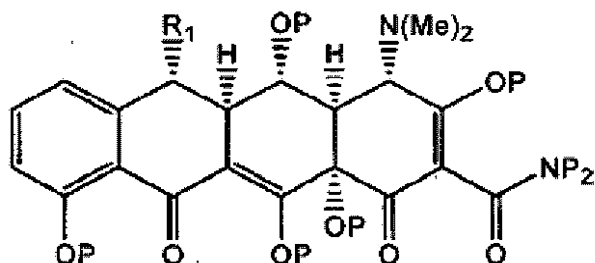


のうちの1つの、項目 1 6 3 に記載の化合物。

(項目 1 7 9)

式：

【化 2 7】



の化合物であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、ハロゲン、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールおよびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 1 8 0)

R_1 は、置換または非置換アリールである、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 1)

R₁ は、置換または非置換フェニルである、項目 179 に記載の化合物。

(項目 182)

R₁ は、非置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 183)

R₁ は、一置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 184)

R₁ は、パラ置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 185)

R₁ は、二置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 186)

R₁ は、置換または非置換ヘテロアリールである、項目 179 に記載の化合物。

(項目 187)

R₁ は、水素である、項目 179 に記載の化合物。

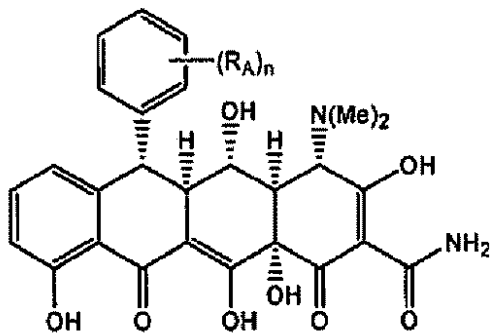
(項目 188)

全ての P は、水素である、項目 179 に記載の化合物。

(項目 189)

式：

【化 28】



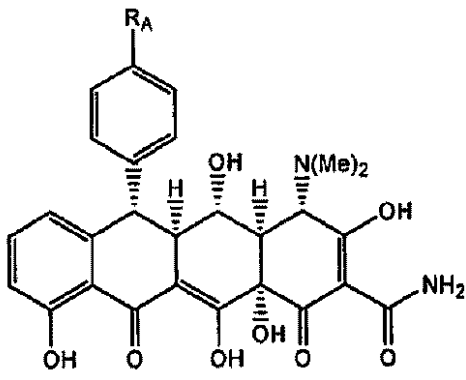
は、項目 179 に記載の化合物であって、

式中、n は、包括的に、1 から 5 の間の整数である、化合物。

(項目 190)

式：

【化 29】



の、項目 189 に記載の化合物。

(項目 191)

RA は、C₁ - C₆ アルキルである、項目 190 に記載の化合物。

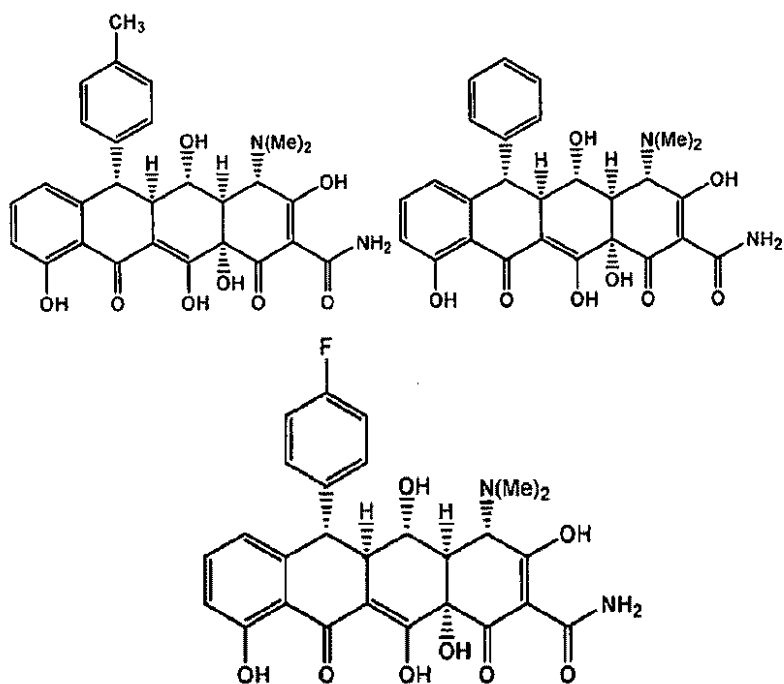
(項目 192)

RA は、ハロゲンである、項目 190 に記載の化合物。

(項 目 1 9 3)

式：

【化 3 0】

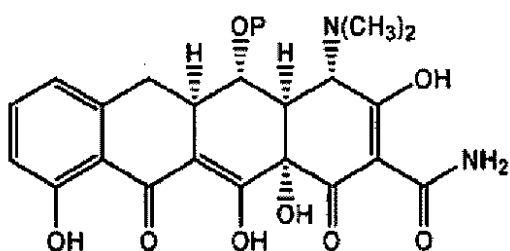


のうちの1つの、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項 目 1 9 4)

式：

【化 3 1】

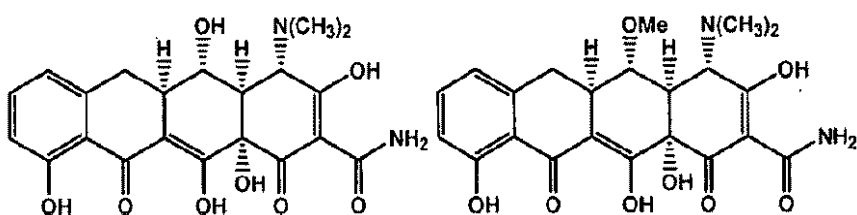


の、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項 目 1 9 5)

式：

【化 3 2】

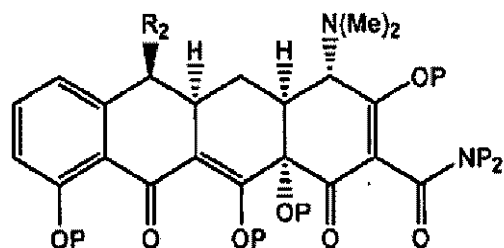


のうちの1つは、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項 目 1 9 6)

式：

【化 3 3】



の化合物であって、
式中、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各Pは、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールおよびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 1 9 7)

R_2 は、水素である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 1 9 8)

R_2 は、環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 1 9 9)

R_2 は、環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 0)

R_2 は、置換または非置換アリールである、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 1)

R_2 は、置換または非置換ヘテロアリールである、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 2)

R_2 は、アシルである、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 3)

R_2 は、 $-CO_2R_B$ である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 4)

R_2 は、 $-CO_2H$ である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 5)

R_2 は、 $-CO_2Me$ である、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 6)

R_2 は、 $C_1 - C_6$ アルキルである、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 7)

R_2 は、メチルである、項目 1 9 6 に記載の化合物。

(項目 2 0 8)

R₂ は、エチルである、項目 196 に記載の化合物。

(項目 209)

R₂ は、フェニルである、項目 196 に記載の化合物。

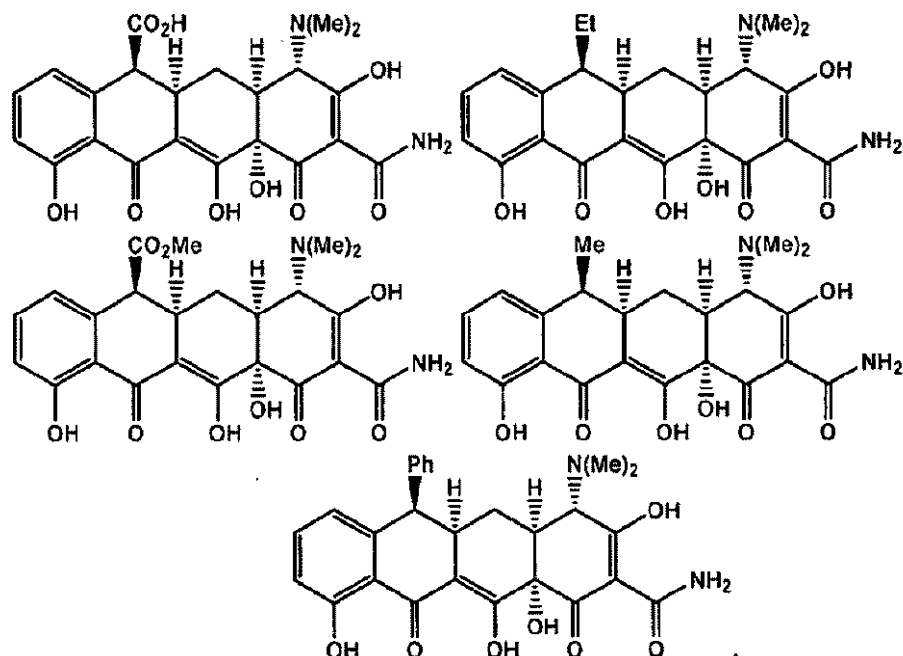
(項目 210)

全ての P は、水素である、項目 196 に記載の化合物。

(項目 211)

式：

【化 34】

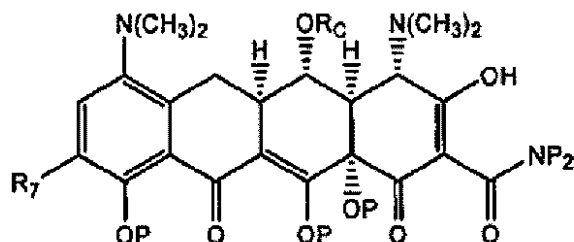


のうちの 1 つの、項目 196 に記載の化合物。

(項目 212)

式：

【化 35】



の化合物であって、

式中、

R_c は、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分またはヘテロアリール部分であり、

R₇ は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR_G；=O；-C(=O)R_G；-CO₂R_G；-CN；-SCN；-SR_G；-SOR_G；-SO₂R_G；-NO₂；-N(R_G)₂；-NHC(O)R_G；または-C(R_G)₃であり、R_Gの各発生は、

独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールおよびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 2 1 3)

R_c は、水素である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 4)

R_c は、 $C_1 - C_6$ アルキルである、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 5)

R_c は、メチルである、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 6)

R_c は、保護基である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 7)

全ての P は、水素である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 8)

R_7 は、水素である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 1 9)

R_7 は、 $-N(R_g)_2$ である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

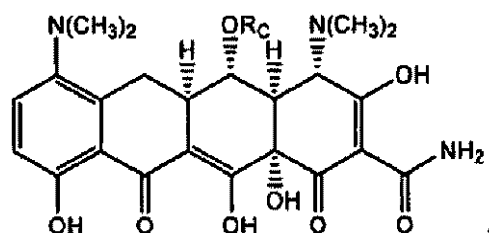
(項目 2 2 0)

R_7 は、 $-NHR_g$ である、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 2 1)

式：

【化 3 6】

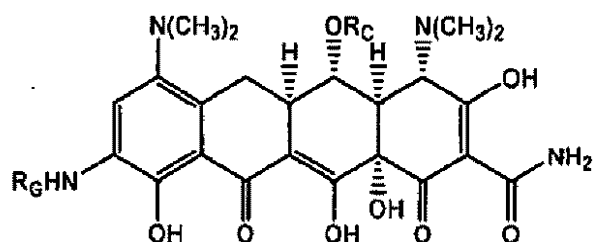


は、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 2 2)

式：

【化 3 7】

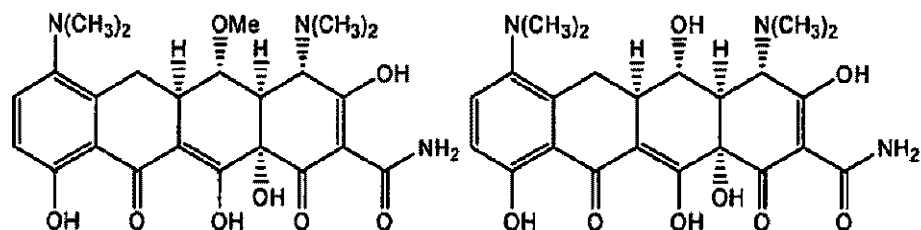


の、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 2 3)

式：

【化 3 8】

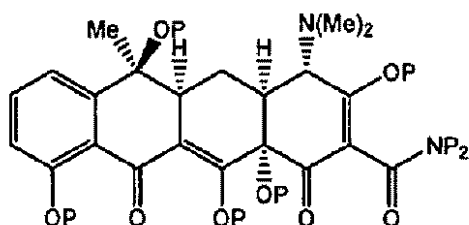


のうちの 1 つの、項目 2 1 2 に記載の化合物。

(項目 2 2 4)

式：

【化 3 9】



の化合物であって、

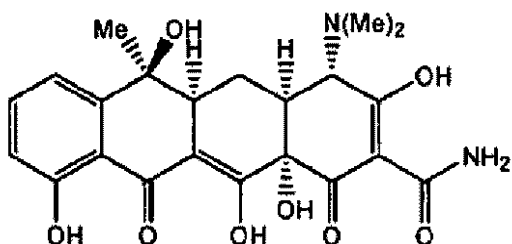
式中、

各 P は、独立して、水素、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、保護基、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、または置換または非置換ヘテロアリールおよびそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体である、化合物。

(項目 2 2 5)

式：

【化 4 0】



は、項目 2 2 4 に記載の化合物であって、

式中、全ての P は水素である、化合物。

(項目 2 2 6)

医薬組成物であって、項目 1 から 2 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物と医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

(項目 2 2 7)

感染の治療方法であって、前記感染を治癒するために、項目 1 から 2 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物の有効量を投与するステップ、を含む、方法。

(項目 2 2 8)

前記感染は、グラム陽性菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

(項目 2 2 9)

前記感染は、グラム陰性菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

(項目 2 3 0)

前記感染は、リケッチア、クラミジアおよび肺炎マイコプラズマからなる群から選択される菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

(項目 2 3 1)

前記感染は、テトラサイクリンに抵抗性のある菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

(項目 2 3 2)

前記感染は、メチシリンに抵抗性のある菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

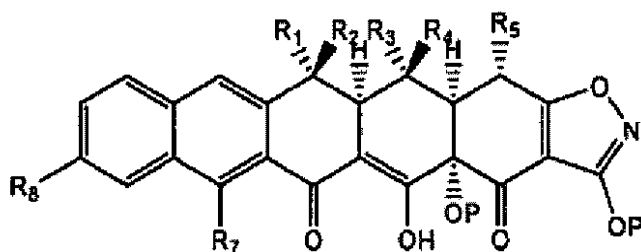
(項目 2 3 3)

前記感染は、バンコマイシンに抵抗性のある菌により引き起こされる、項目 2 2 7 に記載の方法。

(項目 2 3 4)

式：

【化 4 1】



の化合物を合成する方法であって、

式中、

R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；または $-C(R_A)_3$ であり、 R_A の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；または $-C(R_B)_3$ であり、 R_B の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分；ヘテロアリール部分；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオ；アリールチオ；アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ；

$;$ $-CO_2R_C$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_C$; $-SOR_C$; $-SO_2R_C$; $-NO_2$; $-N(R_C)_2$; $-NHC(O)R_C$; または $-C(R_C)_3$ であり、 R_C の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_4 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_D$; $=O$; $-C(=O)R_D$; $-CO_2R_D$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_D$; $-SOR_D$; $-SO_2R_D$; $-NO_2$; $-N(R_D)_2$; $-NHC(O)R_D$; または $-C(R_D)_3$ であり、 R_D の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

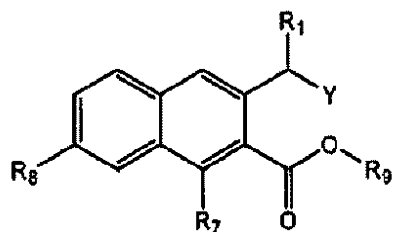
R_5 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_E$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_E$ または $-N(R_E)_2$ であり、 R_E の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_7 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_G$; $=O$; $-C(=O)R_G$; $-CO_2R_G$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_G$; $-SOR_G$; $-SO_2R_G$; $-NO_2$; $-N(R_G)_2$; $-NHC(O)R_G$; または $-C(R_G)_3$ であり、 R_G の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

R_8 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_H$; $=O$; $-C(=O)R_H$; $-CO_2R_H$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_H$; $-SOR_H$; $-SO_2R_H$; $-NO_2$; $-N(R_H)_2$; $-NHC(O)R_H$; または $-C(R_H)_3$ であり、 R_H の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、アシル部分、アリール部分; ヘテロアリール部分; アルコキシ; アリールオキシ; アルキルチオ; アリールチオ; アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールチオ部分であり、

P は、それぞれ、水素または保護基からなる群から独立して選択される、化合物を式:

【化 4 2】



のトルイル酸であって、

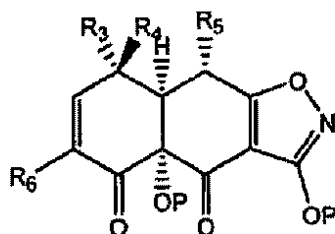
式中、 R_1 、 R_7 および R_8 は、上に定義される通りであり、

R_9 は、置換または非置換アリールあるいはヘテロアリール基からなる群から選択され

、
 Y は、 R_Y がアルキルである、ハロゲンまたは $Sn(R_Y)_3$ である、トルイル酸と金属試薬を、

式：

【化 4 3】



のエノンであって、

式中、 R_3 、 R_4 および R_5 のそれぞれは、上に定義される通りであり、

R_3 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 SH 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択され、

P は、水素または保護基からなる群から独立して選択される、エノンの存在下で、反応させることにより、合成する方法。

(項目 2 3 5)

R_1 は、水素である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 3 6)

R_1 は、メチルである、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 3 7)

Y は、 Br である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 3 8)

Y は、 I である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 3 9)

Y は、 $-Sn(Me)_3$ である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 0)

R_7 は、 $-OR_G$ である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 1)

R_7 は、 R_G が酸素保護基である、 $-OR_G$ である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 2)

R₈ は、ハロゲンである、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 3)

R₈ は、Br である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 4)

R₉ は、メチルである、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 5)

R₉ は、フェニルである、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 6)

R₉ は、置換フェニルである、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 7)

前記金属試薬は、リチウム試薬である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 8)

前記リチウム試薬は、n - ブチルリチウム、フェニルリチウム、t - ブチルリチウムおよびメシチルリチウムからなる群から選択される、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 4 9)

前記金属試薬は、亜鉛試薬である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 5 0)

前記金属試薬は、マグネシウム試薬である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 5 1)

金属化したトルイル酸は、グリニャール試薬である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 5 2)

前記金属試薬は、ゼロ価金属またはアート錯体である、項目 2 3 4 に記載の方法。

本発明は、テトラサイクリン類似体調製のための新しい合成アプローチを中心とする。これらの合成アプローチは、6 - ヒドロキシテトラサイクリンよりも酸および塩基に対してより安定である 6 - デオキシテトラサイクリンを調製するのに特に役立つ。先進的な臨床候補であるチゲサイクリンと同様に、臨床的に最も重要な 2 つのテトラサイクリンであるドキシサイクリンおよびミノサイクリンは、6 - デオキシテトラサイクリンクラスのメンバーである。