

【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 07 C 237/26	(2006.01)
C 07 D 295/04	(2006.01)
C 07 D 295/18	(2006.01)
C 07 D 295/14	(2006.01)
C 07 D 221/18	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
C 07 D 261/20	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 K 31/65	(2006.01)
C 07 C 231/10	(2006.01)
C 07 C 231/18	(2006.01)

【F I】

C 07 C 237/26	C S P
C 07 D 295/04	
C 07 D 295/18	A
C 07 D 295/14	Z
C 07 D 295/14	A
C 07 D 221/18	
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 31/04	
C 07 D 261/20	
A 61 P 35/00	
A 61 P 43/00	1 0 5
A 61 P 37/06	
A 61 P 29/00	
A 61 P 3/10	
A 61 P 27/02	
A 61 P 11/00	
A 61 P 15/00	
A 61 K 31/65	
C 07 C 231/10	
C 07 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

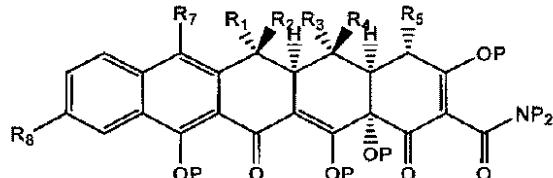
【補正の内容】

【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<sub>1</sub>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<sub>A</sub>；=O；C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub>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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub>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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；または-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>D</sub>；または-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>E</sub>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、ヘテロアリールチオ部分であり。

R<sub>7</sub>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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>G</sub>；または-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>G</sub>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、ヘテロアリールチオ部分であり。

R<sub>8</sub>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<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>H</sub>；または-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>H</sub>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<sub>7</sub>は水素、-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>（例えば、-N(Me)<sub>2</sub>）または-NHMeである、請求項1に記載の化合物。

### 【請求項3】

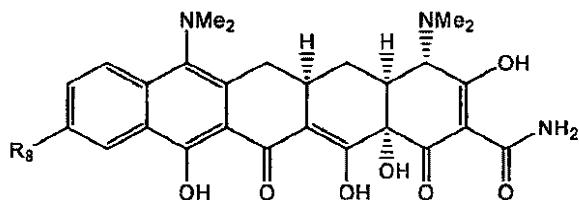
R<sub>8</sub>は水素、ハロゲン（例えば、臭素）、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、アシル、-CHO、ヒドロキシメチル、複素環式脂肪族、炭素環式脂肪族、アミノ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノ、-NHR<sub>H</sub>、-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>、アミノメチル、-CH<sub>2</sub>N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>（好ましくは、2つのR<sub>H</sub>部分は、複素環式構造を形成する）、-CH<sub>2</sub>NHR<sub>H</sub>、-CON(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>、-CONHR<sub>H</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>、-COR<sub>H</sub>、-OR<sub>H</sub>、-SR<sub>H</sub>、-CH<sub>2</sub>R<sub>H</sub>、-CH<sub>2</sub>OR<sub>H</sub>（好ましくは、R<sub>H</sub>は水素で

ある)、-CH<sub>2</sub>SR<sub>H</sub>(好ましくは、R<sub>H</sub>は水素である)、-CH<sub>2</sub>NHR<sub>H</sub>(好ましくは、R<sub>H</sub>は水素である)、-CH<sub>2</sub>N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>(好ましくは、R<sub>H</sub>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。

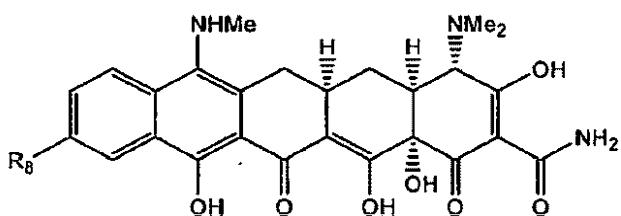
## 【請求項4】

式:

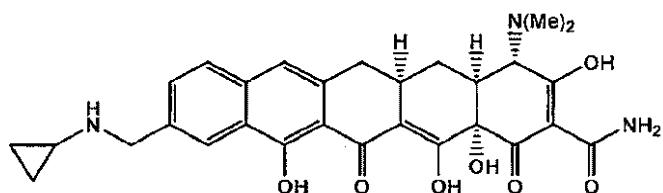
## 【化2】



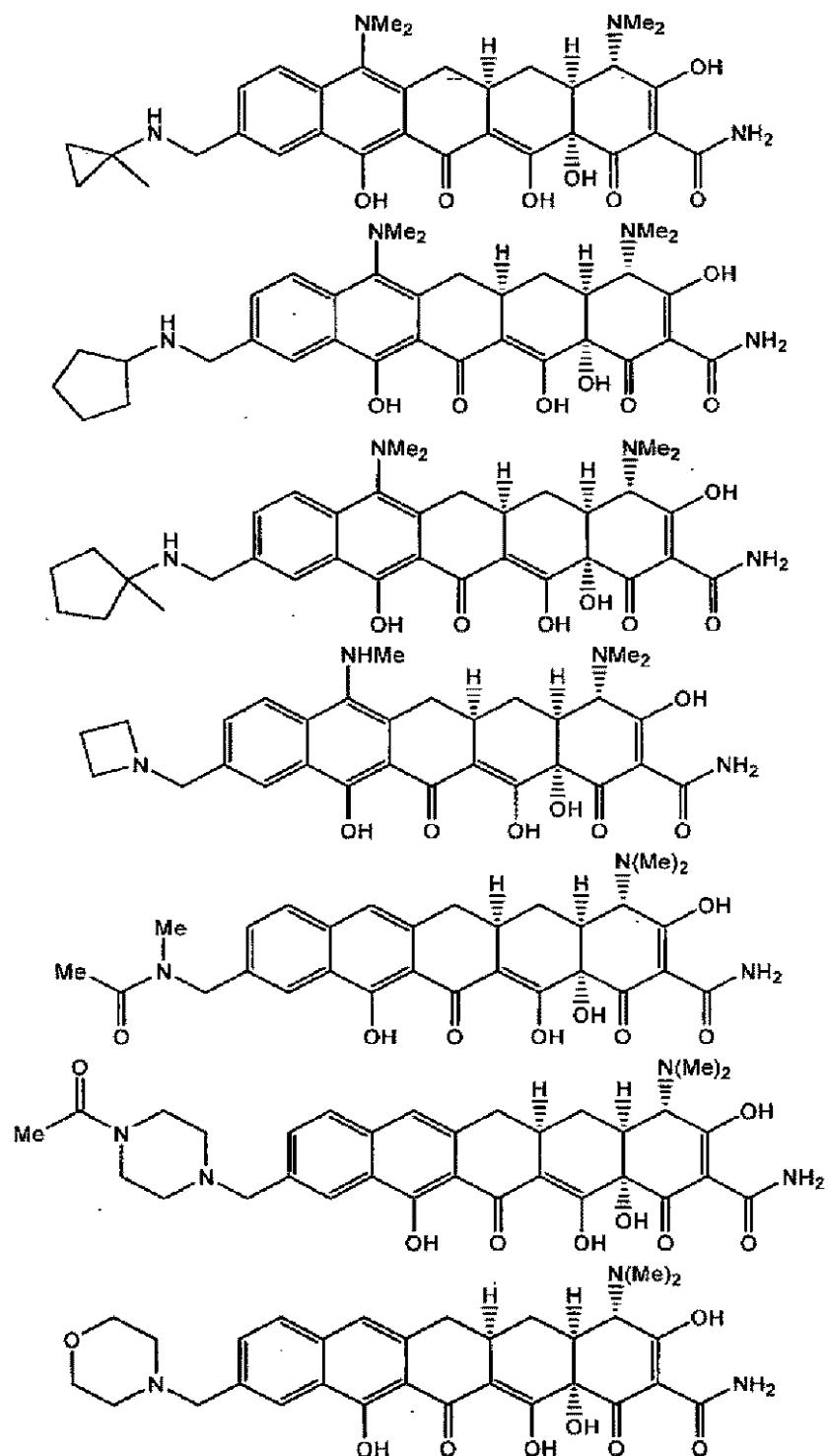
## 【化3】



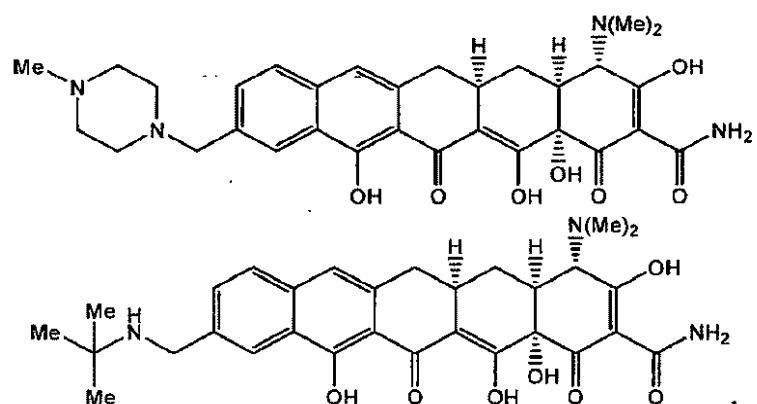
## 【化4】



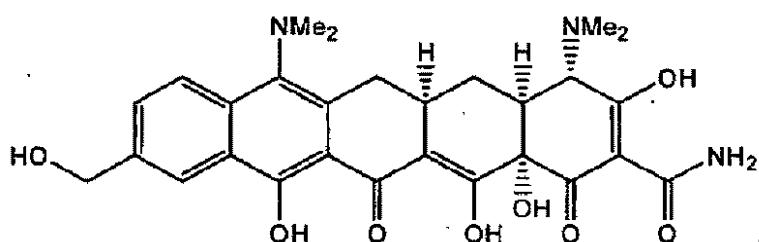
【化 5】



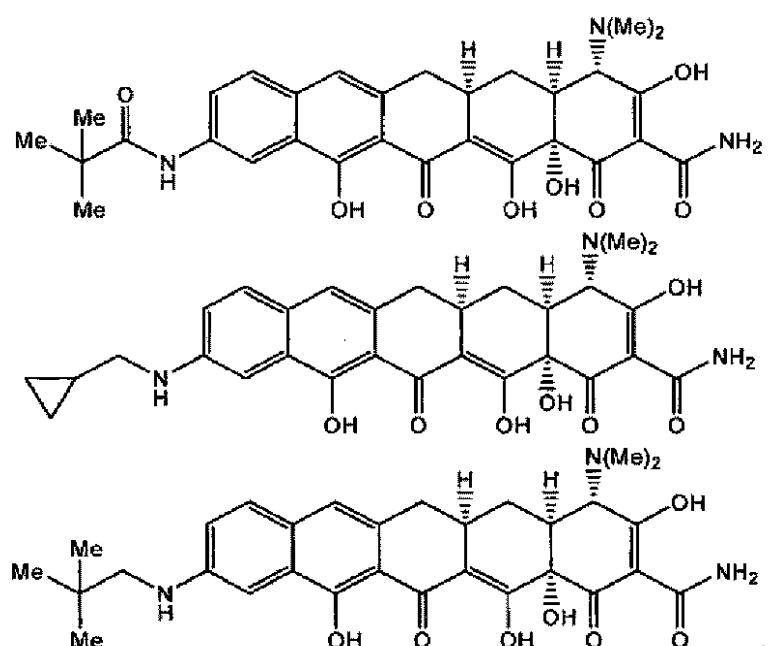
【化6】



【化7】

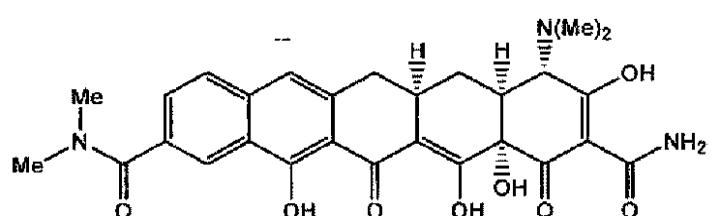


【化8】



または

【化9】

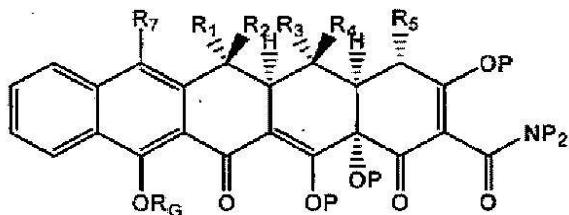


の、請求項1に記載の化合物。

## 【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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHCO(O)R_C$ ；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； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHCO(O)R_D$ ；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、

才部分であり、

$R_5$  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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>E</sub>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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>G</sub>；または-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>G</sub>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)  $R_1$  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<sub>E</sub>)<sub>2</sub>（例えば、-N(Me)<sub>2</sub>）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<sub>G</sub>)<sub>2</sub>（例えば、-N(Me)<sub>2</sub>）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。

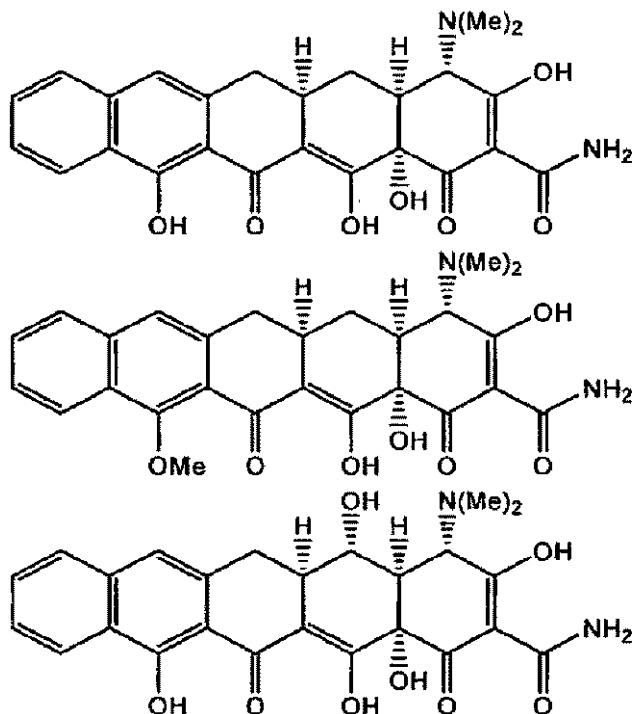
#### 【請求項11】

$R_G$  は水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>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。

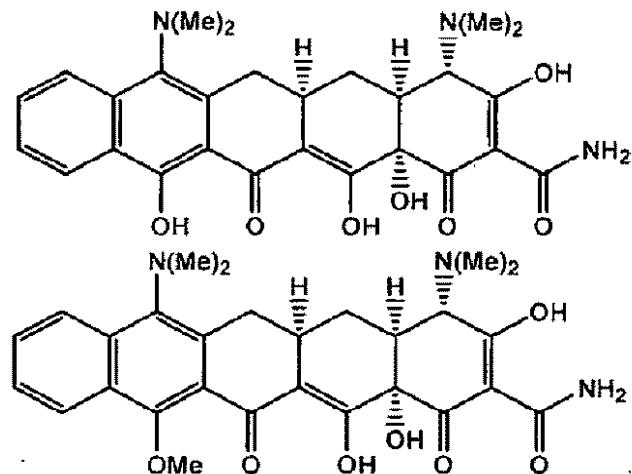
#### 【請求項12】

式：

## 【化11】



## 【化12】



のうちの 1 つの、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 13】

医薬組成物であって、請求項 1 から 1\_2 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 14】

感染の治療において使用するための、請求項 1 から 1\_2 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 15】

前記感染は、グラム陽性菌、グラム陰性菌、リケッチャ、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 1\_4 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】

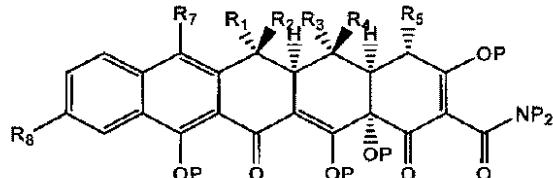
発明の要約

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<sub>1</sub> 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<sub>A</sub>；=O；C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub> 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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub> 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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；または-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub> 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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；または-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>E</sub>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<sub>7</sub>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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>G</sub>；または-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>G</sub>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<sub>8</sub>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<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>H</sub>；または-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>H</sub>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<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、全て水素である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目1に記載の化合物。

(項目4)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目1に記載の化合物。

(項目5)

R<sub>1</sub> は水素であり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> は水素であり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> は水素であり、R<sub>3</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7)

R<sub>5</sub> は -N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub> 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<sub>5</sub> は -N(Me)<sub>2</sub> 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<sub>7</sub> 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<sub>7</sub> は -N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub> 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<sub>7</sub> は -N(Me)<sub>2</sub> 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<sub>7</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> は -CH<sub>0</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>8</sub> は -NHR<sub>H</sub> 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<sub>8</sub> は -N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub> 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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>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<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>NHR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>ON(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>ONHR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>O<sub>2</sub>R<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>OR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>OR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>SR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>SR<sub>H</sub>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<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>SOR<sub>H</sub>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<sub>H</sub>は水素である、項目38に記載の化合物。

(項目40)

R<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>HSR<sub>H</sub>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<sub>H</sub>は水素である、項目40に記載の化合物。

(項目42)

R<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>NHR<sub>H</sub>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<sub>H</sub>は水素である、項目42に記載の化合物。

(項目44)

R<sub>8</sub>は-C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>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<sub>H</sub>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、項目44に記載の化合物。

(項目46)

R<sub>8</sub>は置換または非置換アリールである、項目1、2、3、4、5または6に記載の化合物。

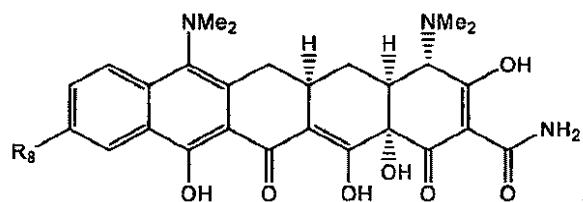
(項目47)

R<sub>8</sub>は置換または非置換ヘテロアリールである、項目1、2、3、4、5または6に記載の化合物。

(項目48)

式：

【化 2】

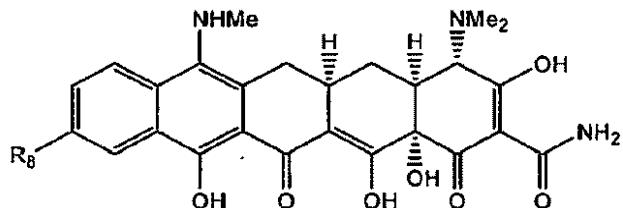


の、項目 1 に記載の化合物。

(項目 49)

式:

【化 3】

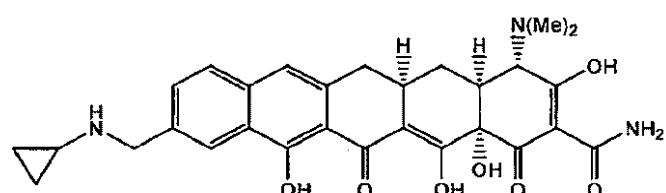


の、項目 1 に記載の化合物。

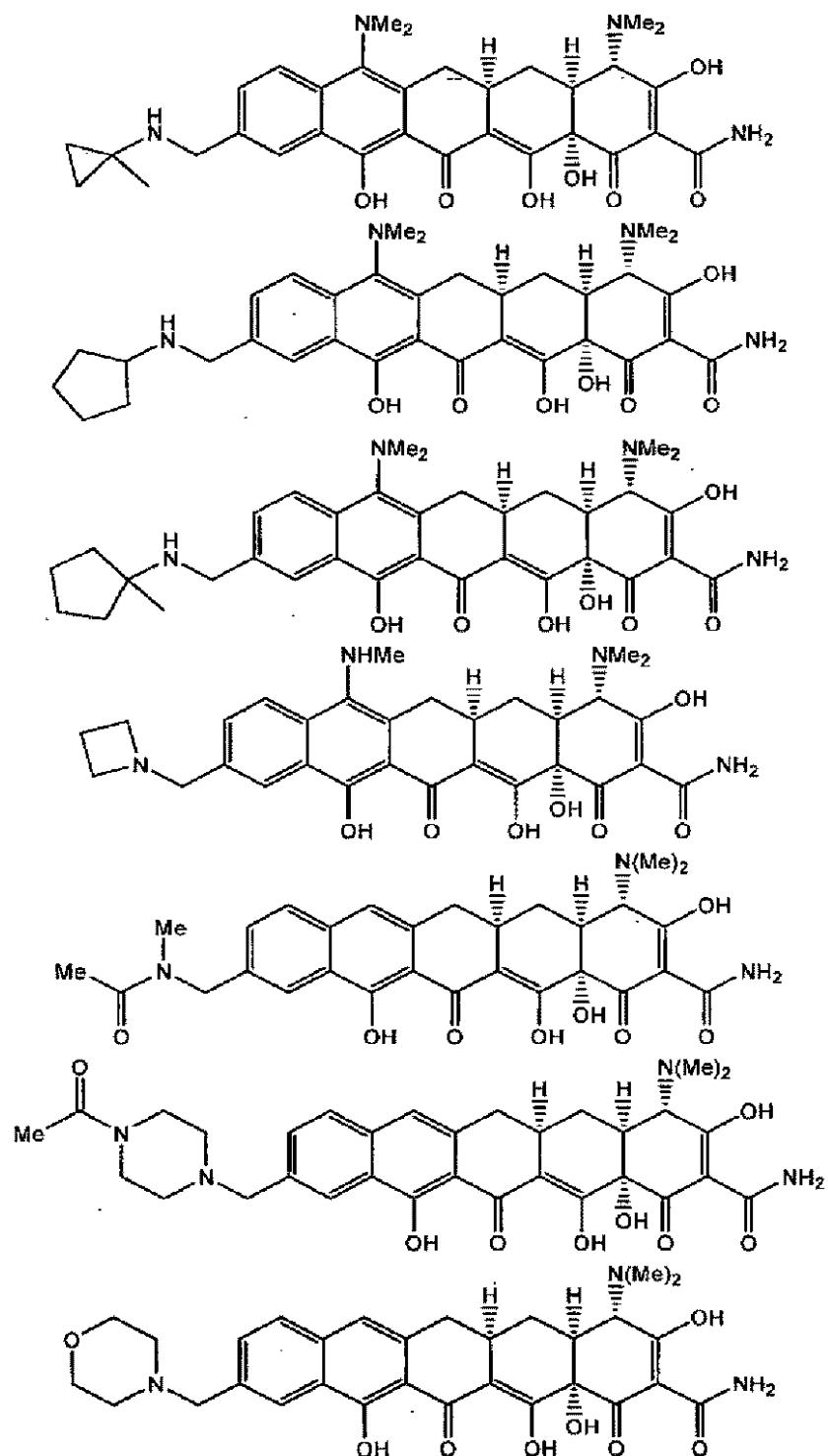
(項目 50)

式:

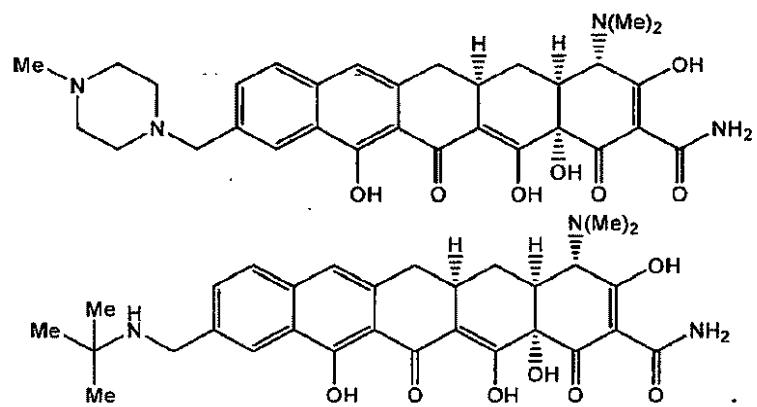
【化 4】



【化 5】



【化6】

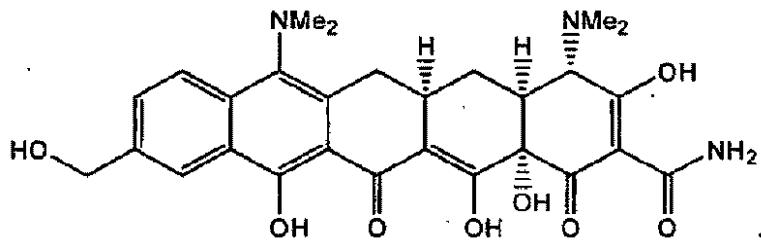


のうちの 1 つの、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5 1)

式：

【化7】

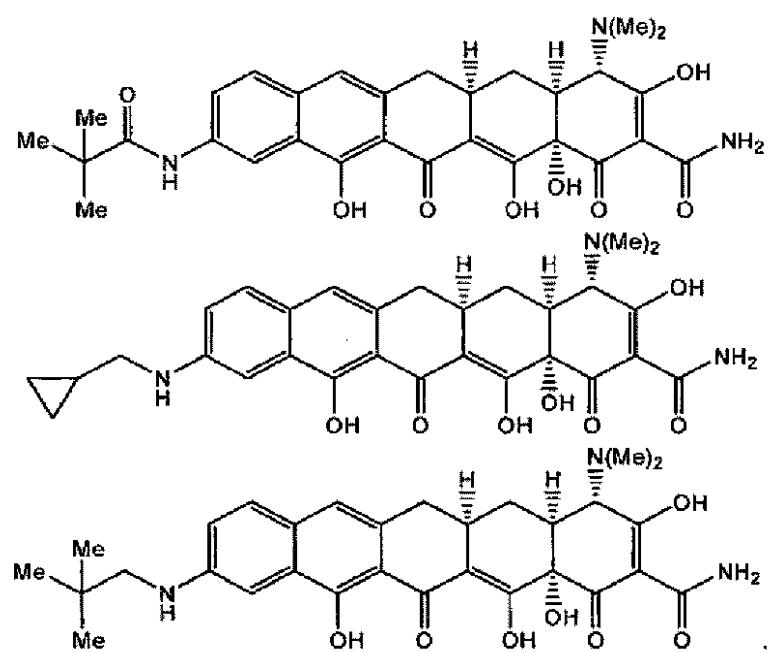


の、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5 2)

式：

【化8】

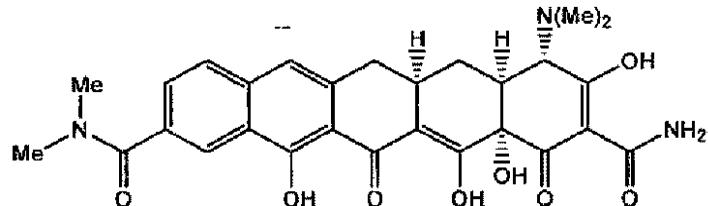


のうちの 1 つの、項目 1 に記載の化合物。

(項目 53)

式:

【化 9】

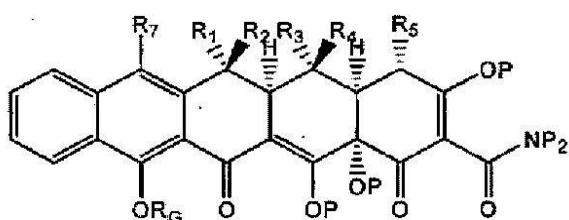


の、項目 1 に記載の化合物。

(項目 54)

式:

【化 10】



の化合物であつて、

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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHCO(O)R_C$ ；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<sub>4</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；または-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>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<sub>F</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>F</sub>または-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>F</sub>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<sub>7</sub>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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>G</sub>；または-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>G</sub>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<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、全て水素である、項目54に記載の化合物。

(項目56)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目57)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目58)

R<sub>1</sub>は水素であり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目54に記載の化合物。

(項目59)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>は水素であり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目44に記載の化合物。

(項目60)

R<sub>3</sub>は-OHである、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目61)

R<sub>5</sub>は-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目62)

R<sub>5</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目63)

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、およびR<sub>4</sub>は全て水素、およびR<sub>5</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目64)

R<sub>7</sub>は水素である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目65)

R<sub>7</sub>は-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目66)

R<sub>7</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目67)

全てのPは水素である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目68)

R<sub>G</sub>は水素である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目69)

R<sub>G</sub>はメチルである、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目70)

R<sub>G</sub>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目71)

R<sub>G</sub>はアシルである、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目72)

R<sub>G</sub>はアセチルである、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物。

(項目73)

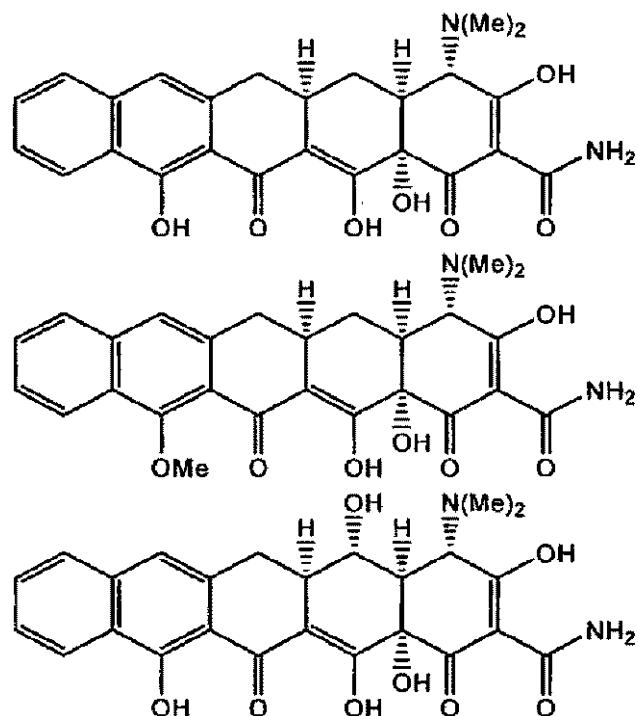
R<sub>G</sub>は酸素保護基である、項目54、55、56、57、58または59に記載の化合物

。

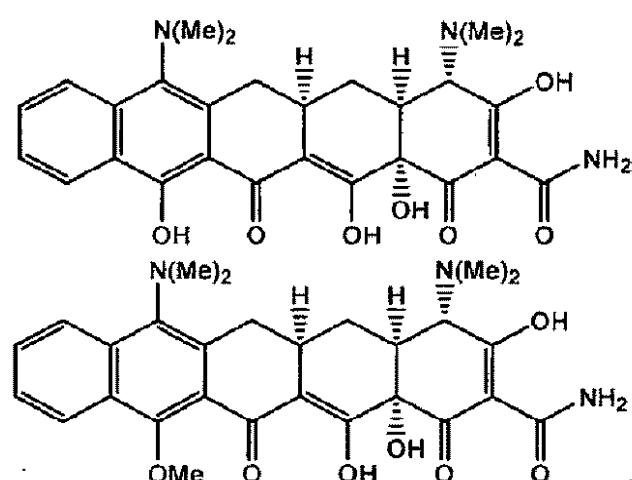
(項目74)

式：

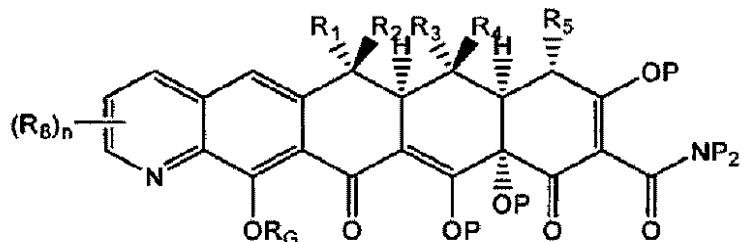
【化11】



【化12】

のうちの1つの、項目54に記載の化合物。(項目75)式：

【化13】

の化合物であって、式中、

R<sub>1</sub>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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub>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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub>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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；または-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>D</sub>；または-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>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<sub>F</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>F</sub>または-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>F</sub>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<sub>8</sub>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<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>H</sub>；または-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>H</sub>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<sub>G</sub>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76)

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、全て水素である、項目75に記載の化合物。

(項目77)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目78)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目79)

R<sub>1</sub>は水素であり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目80)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>は水素であり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目75に記載の化合物。

(項目81)

R<sub>5</sub>は、-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>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<sub>5</sub>は、-N(Me)<sub>2</sub>である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目83)

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は全て水素であり、R<sub>5</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目84)

Pは、全て水素である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目85)

R<sub>G</sub>は水素である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目86)

R<sub>G</sub>はメチルである、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目87)

R<sub>G</sub>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目88)

R<sub>G</sub>はアシルである、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目89)

R<sub>G</sub>はアセチルである、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目90)

R<sub>G</sub>は酸素保護基である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

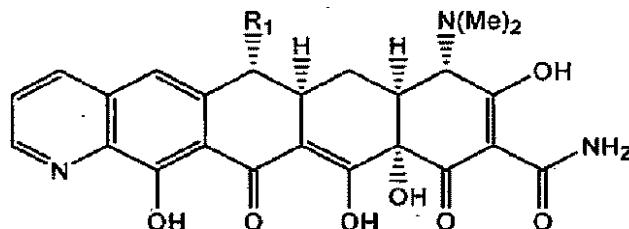
(項目91)

nは0である、項目75、76、77、78、79または80に記載の化合物。

(項目92)

式:

【化14】



の、項目75に記載の化合物。

(項目93)

R<sub>1</sub>は置換または非置換アリールである、項目92に記載の化合物。

(項目94)

R<sub>1</sub>は置換または非置換フェニルである、項目92に記載の化合物。

(項目95)

R<sub>1</sub>は非置換フェニルである、項目92に記載の化合物。

(項目96)

R<sub>1</sub>は一置換フェニルである、項目92に記載の化合物。

(項目97)

R<sub>1</sub>はパラ置換フェニルである、項目92に記載の化合物。

(項目98)

R<sub>1</sub>は二置換フェニルである、項目92に記載の化合物。

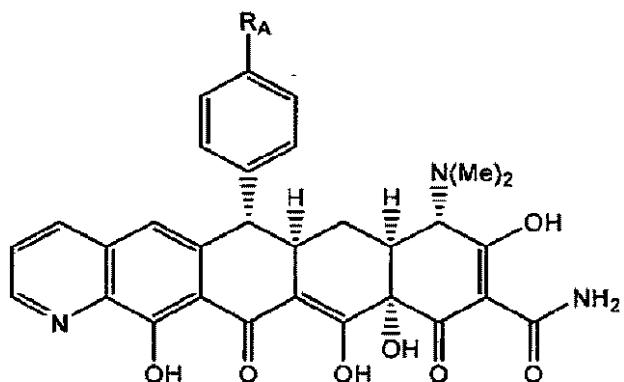
(項目99)

R<sub>1</sub>は置換または非置換ヘテロアリールである、項目92に記載の化合物。

(項目100)

式:

## 【化15】



の、項目92に記載の化合物。

(項目101)

R<sub>A</sub>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目100に記載の化合物。

(項目102)

R<sub>A</sub>はハロゲンである、項目100に記載の化合物。

(項目103)

R<sub>A</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>である、項目100に記載の化合物。

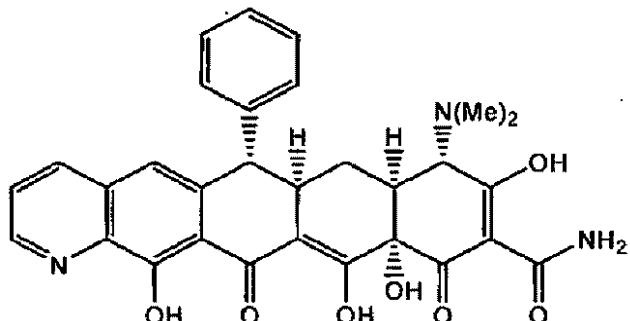
(項目104)

R<sub>A</sub>は水素である、項目100に記載の化合物。

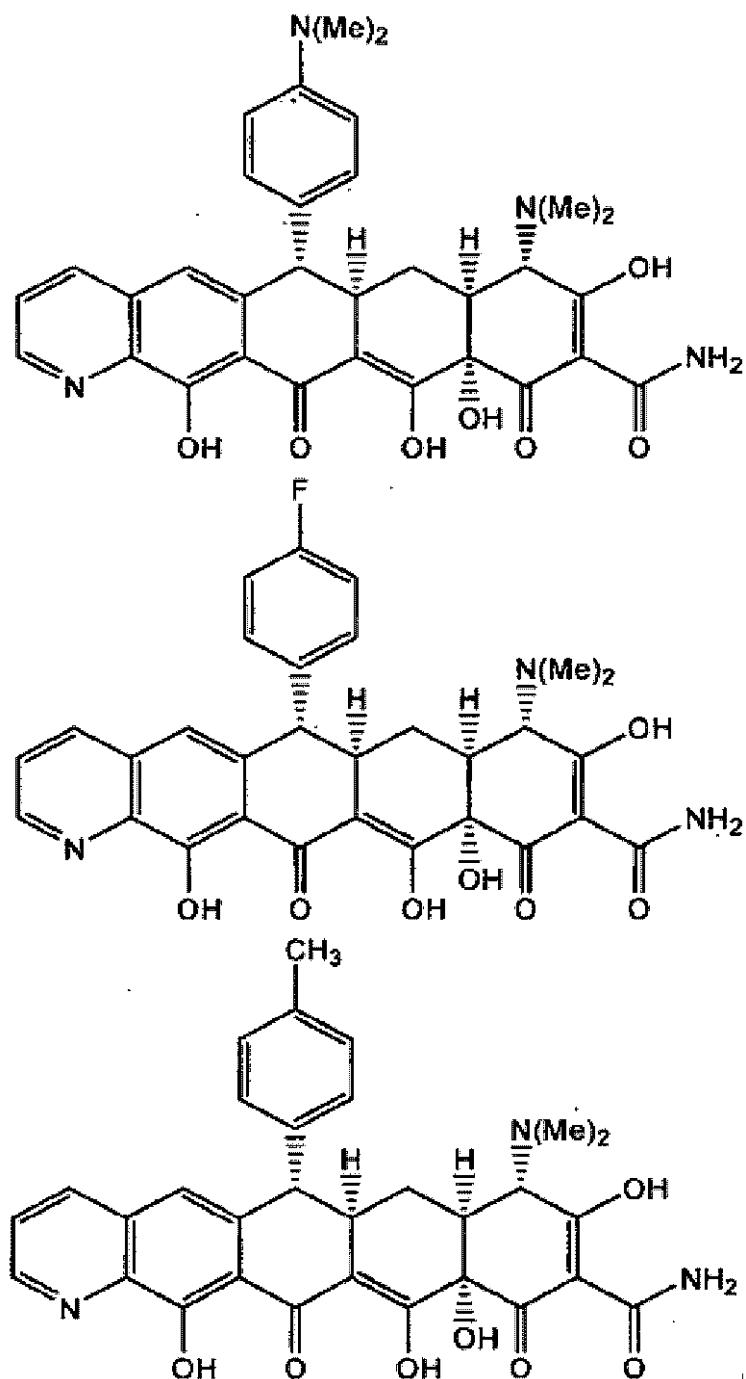
(項目105)

式：

## 【化16】



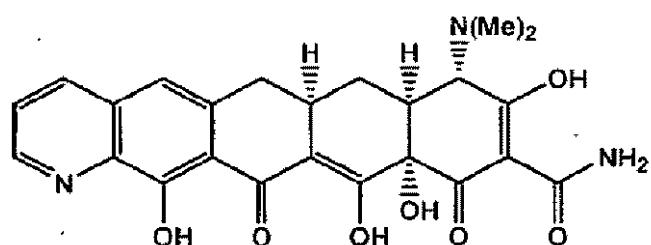
【化17】

のうちの1つの、項目100に記載の化合物。

(項目106)

式:

【化18】

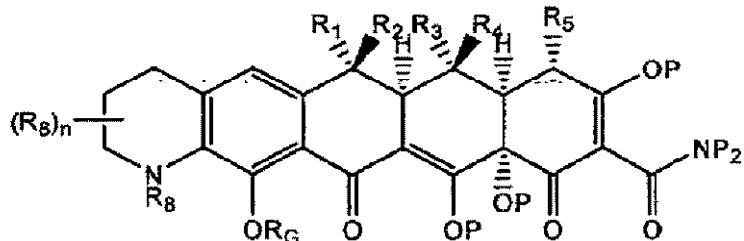


の 1 つである、項目 7 5 に記載の化合物。

(項目 1 0 7 )

式：

【化 1 9】



の 化 合 物 で あ つ て、

式 中、

R<sub>1</sub> 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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub> 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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub> 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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；または-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub> 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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；

- N ( R<sub>D</sub> )<sub>2</sub>; - NHC ( O ) R<sub>D</sub>; または - C ( R<sub>D</sub> )<sub>3</sub> であり、 R<sub>D</sub> 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<sub>5</sub> 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<sub>E</sub>; - CN; - SCN; - S R<sub>E</sub> または - N ( R<sub>E</sub> )<sub>2</sub> であり、 R<sub>E</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>H</sub>; = O; - C ( = O ) R<sub>H</sub>; - CO<sub>2</sub> R<sub>H</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>H</sub>; - SOR<sub>H</sub>; - SO<sub>2</sub> R<sub>H</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N ( R<sub>H</sub> )<sub>2</sub>; - NHC ( O ) R<sub>H</sub>; または - C ( R<sub>H</sub> )<sub>3</sub> であり、 R<sub>H</sub> 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<sub>G</sub> 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<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は、全て水素である、項目 107 に記載の化合物。

#### (項目 109)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 107 に記載の化合物。

#### (項目 110)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> は水素であり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 107 に記載の化合物。

#### (項目 111)

R<sub>1</sub> は水素であり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> は水素であり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 107 に記載の化合物。

#### (項目 112)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> は水素であり、R<sub>3</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub> は水素である、項目 107 に記載の化合物。

#### (項目 113)

R<sub>5</sub> は、- N ( R<sub>E</sub> )<sub>2</sub> である、項目 107、108、109、110、111 または 112 に記載の化合物。

#### (項目 114)

R<sub>5</sub> は、 - N (Me)<sub>2</sub> である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 115)

R<sub>1</sub>、 R<sub>2</sub>、 R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は全て水素であり、 R<sub>5</sub> は - N (Me)<sub>2</sub> である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 116)

P は、 全て水素である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 117)

R<sub>G</sub> は水素である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 118)

R<sub>G</sub> はメチルである、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 119)

R<sub>G</sub> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 120)

R<sub>G</sub> はアシルである、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 121)

R<sub>G</sub> はアセチルである、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 122)

R<sub>G</sub> は酸素保護基である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 123)

n は 0 である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

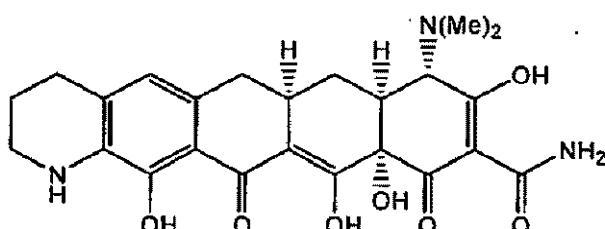
(項目 124)

全ての R<sub>8</sub> は水素である、 項目 107、 108、 109、 110、 111 または 112 に記載の化合物。

(項目 125)

式 :

【化 20】

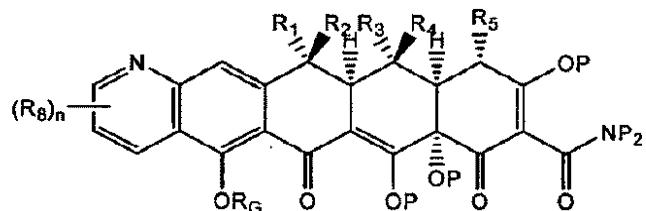


の 1 つである、 項目 107 に記載の化合物。

(項目 126)

式 :

## 【化21】



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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHCO(O)R_C$ ；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； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHCO(O)R_D$ ；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<sub>5</sub> 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<sub>F</sub>；-CN；-SCN；-S R<sub>F</sub> または -N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub> であり、R<sub>F</sub> 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<sub>8</sub> 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<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>H</sub>；または -C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub> であり、R<sub>H</sub> 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<sub>G</sub> 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127)

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は、全て水素である、項目126に記載の化合物。

(項目128)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub> は水素である、項目126に記載の化合物。

(項目129)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> は水素であり、R<sub>4</sub> は水素である、項目126に記載の化合物。

(項目130)

R<sub>1</sub> は水素であり、R<sub>2</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub> は水素であり、R<sub>4</sub> は水素である、項目126に記載の化合物。

(項目131)

R<sub>1</sub> はメチルであり、R<sub>2</sub> は水素であり、R<sub>3</sub> はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub> は水素である、項目126に記載の化合物。

(項目132)

R<sub>5</sub> は、-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub> である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目133)

R<sub>5</sub> は、-N(Me)<sub>2</sub> である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目134)

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は全て水素であり、R<sub>5</sub> は -N(Me)<sub>2</sub> である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目135)

全てのRは、水素である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目136)

R<sub>G</sub>は水素である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目137)

R<sub>G</sub>はメチルである、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目138)

R<sub>G</sub>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目139)

R<sub>G</sub>はアシルである、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目140)

R<sub>G</sub>はアセチルである、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目141)

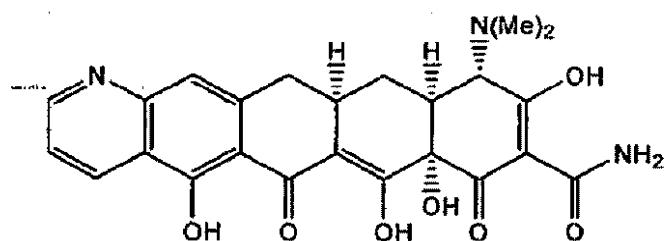
R<sub>G</sub>は酸素保護基である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目142)

nは0である、項目126、127、128、129、130または131に記載の化合物。

(項目143)

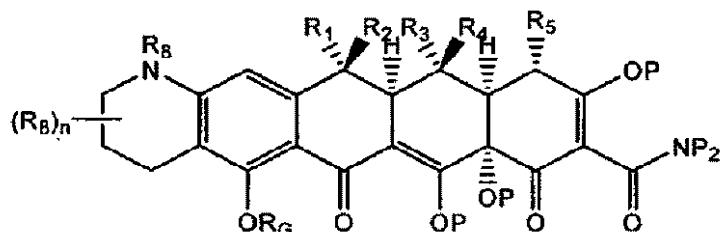
式：

【化22】

の1つである、項目126に記載の化合物。

(項目144)

式：

【化23】

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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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、

$R_B$  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； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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； $-OR_c$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_c$ ； $-CO_2R_c$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_c$ ； $-SOR_c$ ； $-SO_2R_c$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_c)_2$ ； $-NHCO(O)R_c$ ；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； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHCO(O)R_D$ ；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<sub>F</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>F</sub>または-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>であり、R<sub>F</sub>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<sub>8</sub>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<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>H</sub>；または-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>H</sub>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<sub>G</sub>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<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、全て水素である、項目144に記載の化合物。

(項目146)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目147)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目148)

R<sub>1</sub>は水素であり、R<sub>2</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>3</sub>は水素であり、R<sub>4</sub>は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目149)

R<sub>1</sub>はメチルであり、R<sub>2</sub>は水素であり、R<sub>3</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>4</sub>は水素である、項目144に記載の化合物。

(項目150)

R<sub>5</sub>は、-N(R<sub>F</sub>)<sub>2</sub>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<sub>5</sub>は、-N(Me)<sub>2</sub>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<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は全て水素であり、R<sub>5</sub>は-N(Me)<sub>2</sub>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<sub>G</sub>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<sub>G</sub>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<sub>G</sub> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 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<sub>G</sub> 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<sub>G</sub> 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<sub>G</sub> 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。

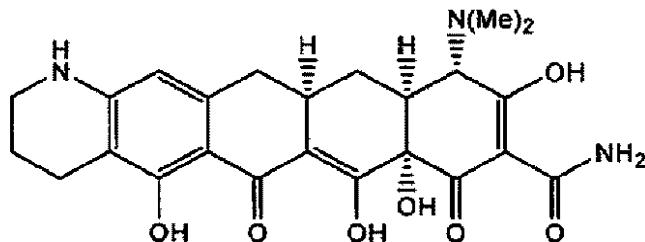
(項目 161)

全ての R<sub>G</sub> 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】

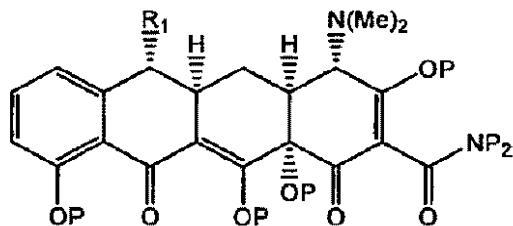


の 1 つである、項目 144 に記載の化合物。

(項目 163)

式 :

【化 25】



の 化 合 物 で あ っ て、

式 中、

R<sub>1</sub> 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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub> であり、R<sub>A</sub> 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164)

R<sub>1</sub>は水素である、項目163に記載の化合物。

(項目165)

R<sub>1</sub>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163に記載の化合物。

(項目166)

R<sub>1</sub>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163に記載の化合物。

(項目167)

R<sub>1</sub>は、置換または非置換アリールである、項目163に記載の化合物。

(項目168)

R<sub>1</sub>は、置換または非置換ヘテロアリールである、項目163に記載の化合物。

(項目169)

R<sub>1</sub>は、アシルである、項目163に記載の化合物。

(項目170)

R<sub>1</sub>は、-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>である、項目163に記載の化合物。

(項目171)

R<sub>1</sub>は、-CO<sub>2</sub>Hである、項目163に記載の化合物。

(項目172)

R<sub>1</sub>は、-CO<sub>2</sub>Meである、項目163に記載の化合物。

(項目173)

R<sub>1</sub>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目163に記載の化合物。

(項目174)

R<sub>1</sub>は、メチルである、項目163に記載の化合物。

(項目175)

R<sub>1</sub>は、エチルである、項目163に記載の化合物。

(項目176)

R<sub>1</sub>は、フェニルである、項目163に記載の化合物。

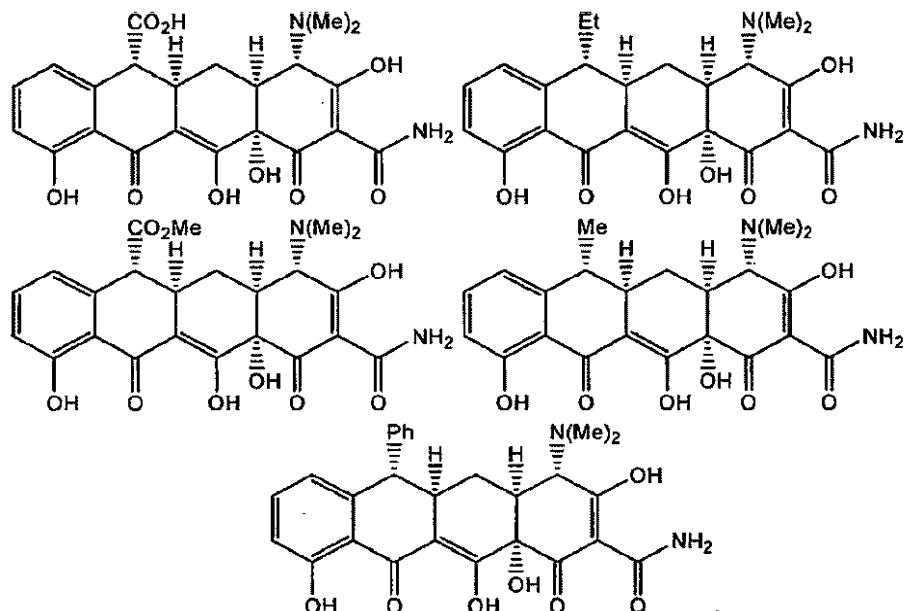
(項目177)

全てのPは、水素である、項目163に記載の化合物。

(項目178)

式：

## 【化26】

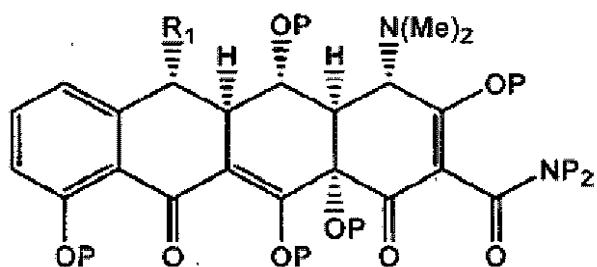


のうちの1つの、項目163に記載の化合物。

(項目179)

式:

## 【化27】



の化合物であって、

式中、

R<sub>1</sub>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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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る。

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180)

R<sub>1</sub>は、置換または非置換アリールである、項目179に記載の化合物。

(項目181)

R<sub>1</sub> 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)

R<sub>1</sub> は、非置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 183)

R<sub>1</sub> は、一置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 184)

R<sub>1</sub> 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)

R<sub>1</sub> は、二置換フェニルである、項目 181 に記載の化合物。

(項目 186)

R<sub>1</sub> 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)

R<sub>1</sub> は、水素である、項目 179 に記載の化合物。

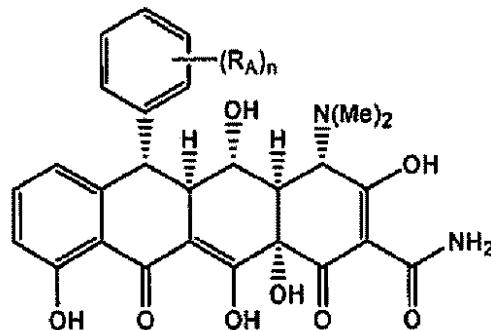
(項目 188)

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】



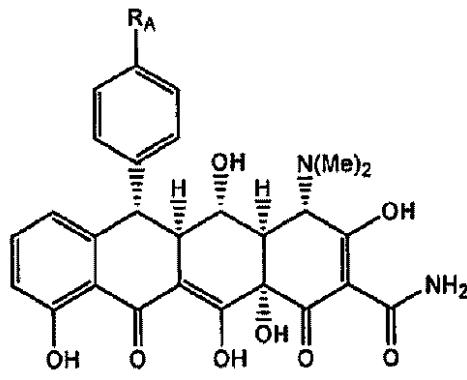
は、項目 179 に記載の化合物であって、

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)

R<sub>A</sub> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである、項目 190 に記載の化合物。

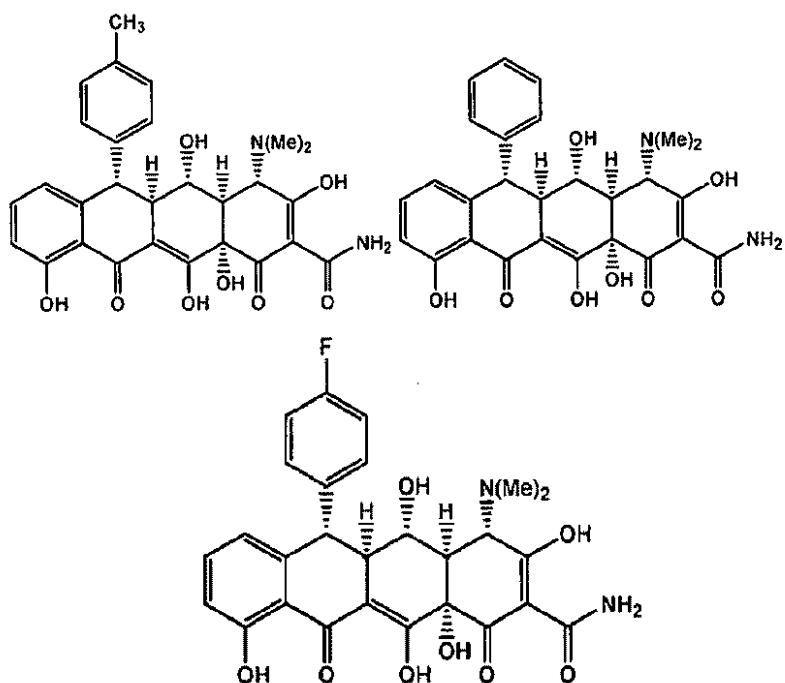
(項目 192)

R<sub>A</sub> は、ハロゲンである、項目 190 に記載の化合物。

(項目 193)

式:

【化30】

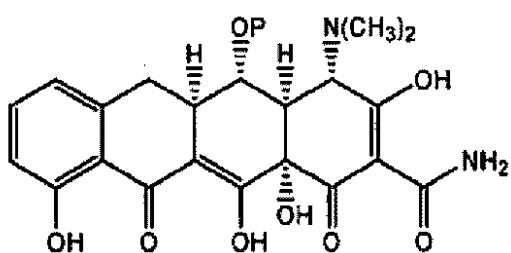


のうちの 1 つは、項目 179 に記載の化合物。

(項目 194)

式:

【化31】

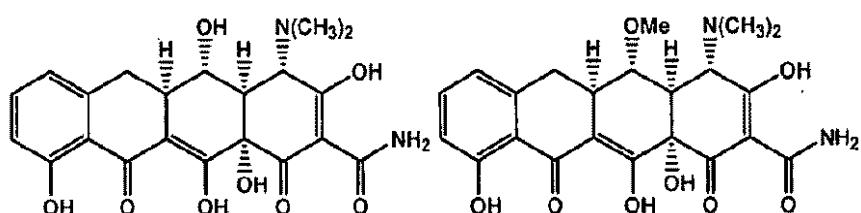


の、項目 179 に記載の化合物。

(項目 195)

式:

【化32】

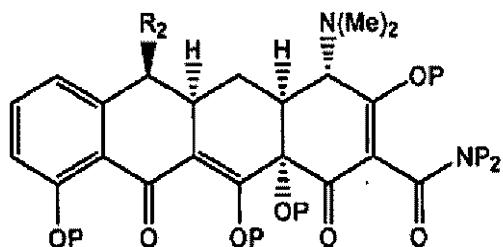


のうちの 1 つは、項目 179 に記載の化合物。

(項目 196)

式:

【化33】

の化合物であって、式中、

R<sub>2</sub>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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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197)R<sub>2</sub>は、水素である、項目196に記載の化合物。(項目198)R<sub>2</sub>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196に記載の化合物。(項目199)R<sub>2</sub>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196に記載の化合物。(項目200)R<sub>2</sub>は、置換または非置換アリールである、項目196に記載の化合物。(項目201)R<sub>2</sub>は、置換または非置換ヘテロアリールである、項目196に記載の化合物。(項目202)R<sub>2</sub>は、アシルである、項目196に記載の化合物。(項目203)R<sub>2</sub>は、-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>である、項目196に記載の化合物。(項目204)R<sub>2</sub>は、-CO<sub>2</sub>Hである、項目196に記載の化合物。(項目205)R<sub>2</sub>は、-CO<sub>2</sub>Meである、項目196に記載の化合物。(項目206)R<sub>2</sub>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目196に記載の化合物。(項目207)R<sub>2</sub>は、メチルである、項目196に記載の化合物。(項目208)

R<sub>2</sub> は、エチルである、項目 196 に記載の化合物。

(項目 209)

R<sub>2</sub> は、フェニルである、項目 196 に記載の化合物。

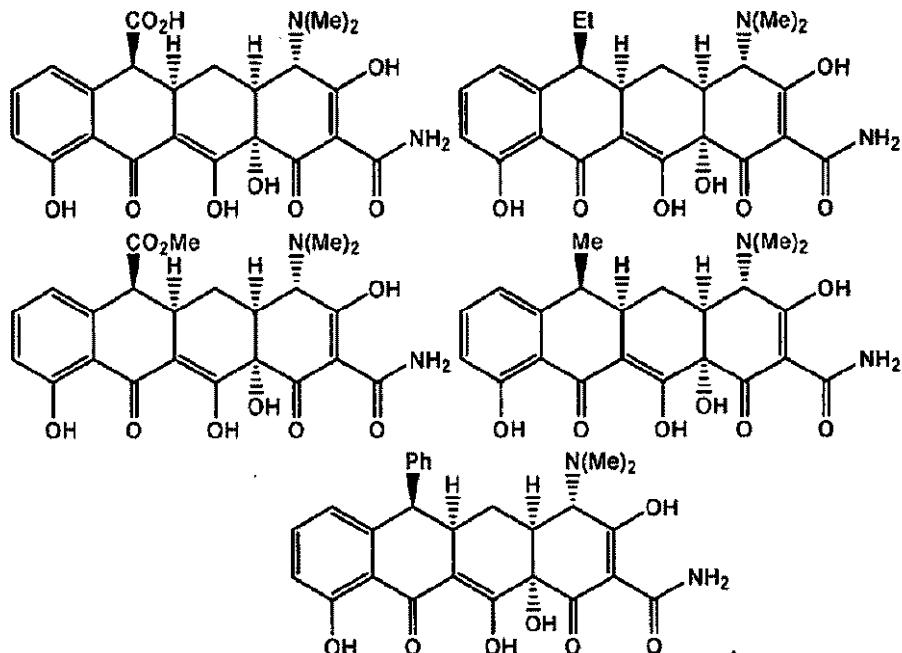
(項目 210)

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】

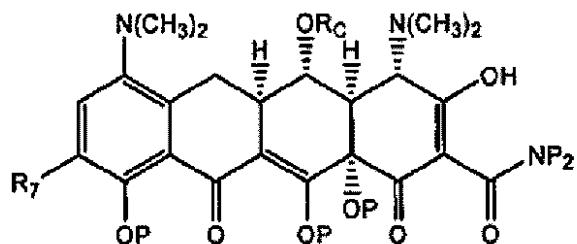


のうちの 1 つの、項目 196 に記載の化合物。

(項目 212)

式：

【化 35】



の化合物であって、

式中、

R<sub>c</sub> 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、

R<sub>7</sub> 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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>G</sub>；または-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub> であり、R<sub>G</sub> 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213)

R<sub>c</sub>は、水素である、項目212に記載の化合物。

(項目214)

R<sub>c</sub>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、項目212に記載の化合物。

(項目215)

R<sub>c</sub>は、メチルである、項目212に記載の化合物。

(項目216)

R<sub>c</sub>は、保護基である、項目212に記載の化合物。

(項目217)

全てのPは、水素である、項目212に記載の化合物。

(項目218)

R<sub>7</sub>は、水素である、項目212に記載の化合物。

(項目219)

R<sub>7</sub>は、-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>である、項目212に記載の化合物。

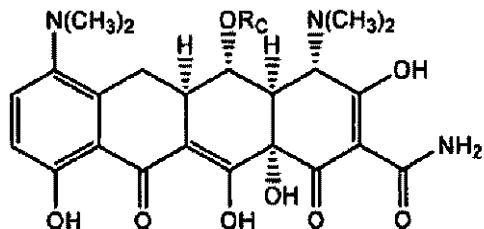
(項目220)

R<sub>7</sub>は、-NH R<sub>G</sub>である、項目212に記載の化合物。

(項目221)

式：

【化36】

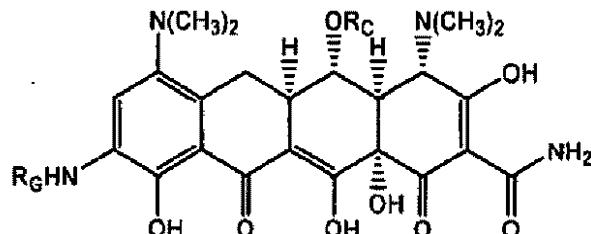


は、項目212に記載の化合物。

(項目222)

式：

【化37】

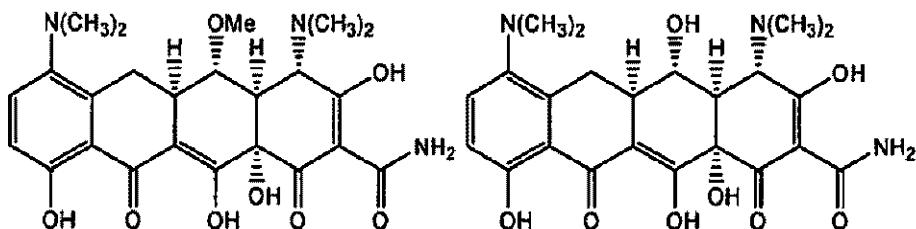


の、項目212に記載の化合物。

(項目223)

式：

## 【化38】

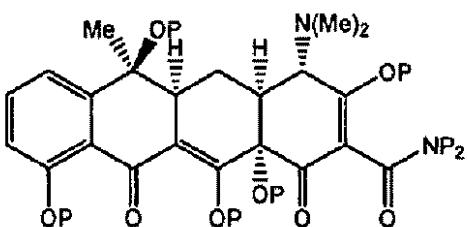


のうちの 1 つ、項目 212 に記載の化合物。

(項目 224)

式 :

## 【化39】



の化合物であって、

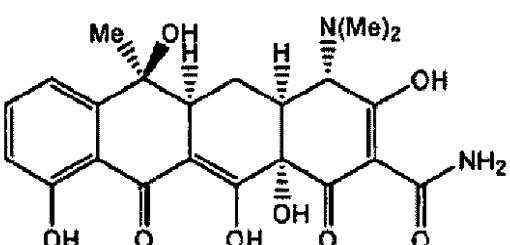
式中、

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 225)

式 :

## 【化40】



は、項目 224 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 226)

医薬組成物であって、項目 1 から 224 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 227)

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 225 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 228)

前記感染は、グラム陽性菌により引き起こされる、項目 227 に記載の方法。

(項目 229)

前記感染は、グラム陰性菌により引き起こされる、項目 227 に記載の方法。

(項目230)

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227に記載の方法。

(項目231)

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227に記載の方法。

(項目232)

前記感染は、メチシリソニンに抵抗性のある菌により引き起こされる、項目227に記載の方法。

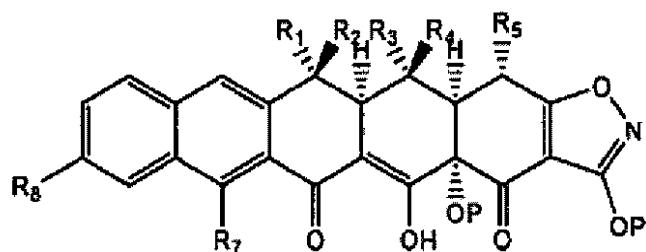
(項目233)

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227に記載の方法。

(項目234)

式：

【化41】



の化合物を合成する方法であって、

式中、

R<sub>1</sub> 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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；または-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub> 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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；または-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>であり、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub> 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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>

$\text{CO}_2\text{R}_C$ ;  $\text{CN}$ ;  $\text{SCN}$ ;  $\text{SR}_C$ ;  $\text{SOR}_C$ ;  $\text{SO}_2\text{R}_C$ ;  $\text{NO}_2$ ;  $\text{N}(\text{R}_C)_2$ ;  $\text{NHC(O)R}_C$ ; または  $\text{C}(\text{R}_C)_3$  であり、 $\text{R}_C$  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。

$\text{R}_4$  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； $\text{OR}_D$ ;  $=\text{O}$ ;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_D$ ;  $-\text{CO}_2\text{R}_D$ ;  $\text{CN}$ ;  $\text{SCN}$ ;  $\text{SR}_D$ ;  $\text{SOR}_D$ ;  $\text{SO}_2\text{R}_D$ ;  $\text{NO}_2$ ;  $\text{N}(\text{R}_D)_2$ ;  $\text{NHC(O)R}_D$ ; または  $\text{C}(\text{R}_D)_3$  であり、 $\text{R}_D$  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。

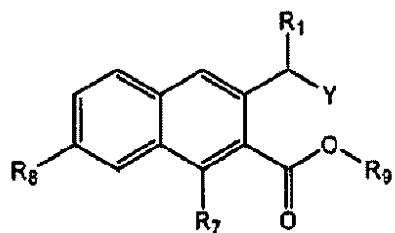
$\text{R}_5$  は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $\text{OR}_E$ ;  $\text{CN}$ ;  $\text{SCN}$ ;  $\text{SR}_E$  または  $\text{N}(\text{R}_E)_2$  であり、 $\text{R}_E$  の各発生は、独立して、水素、保護基、脂肪族部分、ヘテロ脂肪族部分、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、ヘテロアリールチオ部分であり。

$\text{R}_7$  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； $\text{OR}_G$ ;  $=\text{O}$ ;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_G$ ;  $-\text{CO}_2\text{R}_G$ ;  $\text{CN}$ ;  $\text{SCN}$ ;  $\text{SR}_G$ ;  $\text{SOR}_G$ ;  $\text{SO}_2\text{R}_G$ ;  $\text{NO}_2$ ;  $\text{N}(\text{R}_G)_2$ ;  $\text{NHC(O)R}_G$ ; または  $\text{C}(\text{R}_G)_3$  であり、 $\text{R}_G$  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。

$\text{R}_8$  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； $\text{OR}_H$ ;  $=\text{O}$ ;  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_H$ ;  $-\text{CO}_2\text{R}_H$ ;  $\text{CN}$ ;  $\text{SCN}$ ;  $\text{SR}_H$ ;  $\text{SOR}_H$ ;  $\text{SO}_2\text{R}_H$ ;  $\text{NO}_2$ ;  $\text{N}(\text{R}_H)_2$ ;  $\text{NHC(O)R}_H$ ; または  $\text{C}(\text{R}_H)_3$  であり、 $\text{R}_H$  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42】



のトルイル酸であって、

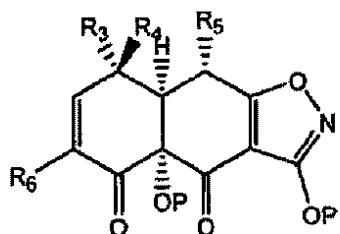
式中、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、上に定義される通りであり、

R<sub>9</sub>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<sub>Y</sub>がアルキルである、ハロゲンまたはSn(R<sub>Y</sub>)<sub>3</sub>である、トルイル酸と金屬試薬を、

式：

## 【化43】



のエノンであって、

式中、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>のそれぞれは、上に定義される通りであり、

R<sub>3</sub>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<sub>2</sub>、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235)

R<sub>1</sub>は、水素である、項目234に記載の方法。

(項目236)

R<sub>1</sub>は、メチルである、項目234に記載の方法。

(項目237)

Yは、Brである、項目234に記載の方法。

(項目238)

Yは、Iである、項目234に記載の方法。

(項目239)

Yは、-Sn(Me)<sub>3</sub>である、項目234に記載の方法。

(項目240)

R<sub>7</sub>は、-OR<sub>G</sub>である、項目234に記載の方法。

(項目241)

R<sub>7</sub>は、R<sub>G</sub>が酸素保護基である、-OR<sub>G</sub>である、項目234に記載の方法。

(項目242)

R<sub>8</sub>は、ハロゲンである、項目234に記載の方法。

(項目243)

R<sub>8</sub>は、Brである、項目234に記載の方法。

(項目244)

R<sub>9</sub>は、メチルである、項目234に記載の方法。

(項目245)

R<sub>9</sub>は、フェニルである、項目234に記載の方法。

(項目246)

R<sub>9</sub>は、置換フェニルである、項目234に記載の方法。

(項目247)

前記金属試薬は、リチウム試薬である、項目234に記載の方法。

(項目248)

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234に記載の方法。

(項目249)

前記金属試薬は、亜鉛試薬である、項目234に記載の方法。

(項目250)

前記金属試薬は、マグネシウム試薬である、項目234に記載の方法。

(項目251)

金属化したトルイル酸は、グリニヤール試薬である、項目234に記載の方法。

(項目252)

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234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グ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。