

【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18年7月13日(2006.7.13)

【公表番号】特表2006-500379(P2006-500379A)

【公表日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2006-001

【出願番号】特願2004-531045(P2004-531045)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 P 5/30 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

C 0 7 D 209/14 (2006.01)

C 0 7 D 209/30 (2006.01)

C 0 7 D 209/34 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 3 7

A 6 1 K 31/407

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

C 0 7 D 209/14

C 0 7 D 209/30

C 0 7 D 209/34 C S P

【手続補正書】

【提出日】平成18年5月1日(2006.5.1)

【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】

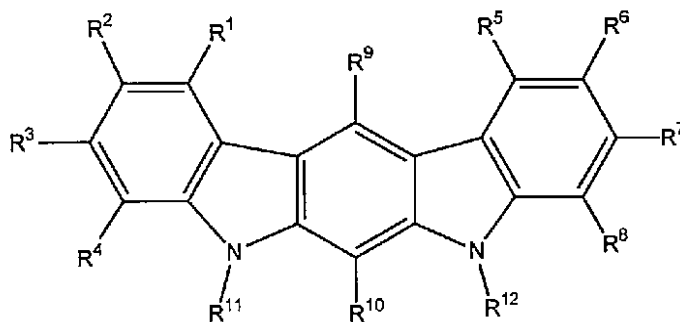
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】

(I)



の構造を有する化合物であって、ここで：

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アルカリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニルオキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオシカルボニル、ハロカルボニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルカルボナト、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリールカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - ($C_5 \sim C_{20}$ アリール) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルアミド、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルフィニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルフィニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルホニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2個の隣接(オルト)置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5員環、6員環、および縮合5員および/または6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個~4個の非水素置換基および0個~3個のヘテロ原子を有する；そして

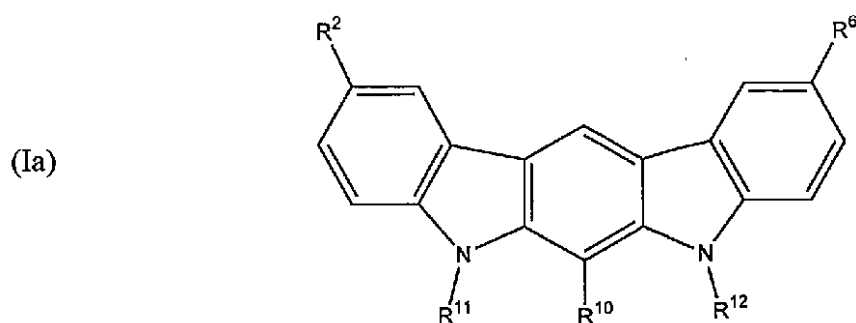
R^{11} および R^{12} は、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコシカルボニル、アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、($C_1 \sim C_{24}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、およびジ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル)アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルからなる群から選択されるが、

但し、少なくとも1個の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} は、水素以外のものである；そして R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 の各々が、水素、ハロ、アルキル、アルコキシおよびアリールから選択されるとき、 R^{11} および R^{12} は、水素およびアルキル以外のものである、化合物。

【請求項2】

前記化合物が、式(Ia)

【化2】



の構造を有するように、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 および R^9 が、水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^2 および R^6 が、別個に、水素、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{12}$

アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボナト、カルボキシ、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、アミノ、モノ - およびジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルアミド、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルフィニルおよび $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^2 および R^6 が、別個に、ハロ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナト、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルフィニルおよび $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^{10} が、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナトである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^{11} および R^{12} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、($C_1 \sim C_{12}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルおよびジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル)アミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルからなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^2 、 R^6 および R^{10} の少なくとも 1 個が、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナトである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 、 R^6 および R^{10} の少なくとも 1 個が、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボナトである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^2 および R^6 が、別個に、水素および $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルから選択される；

R^{10} が、ハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボナトである；そして

R^{11} および R^{12} が、別個に、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^2 および R^6 が、別個に、水素およびエトキシカルボニルから選択される；

R^{10} が、水素、メトキシ、エトキシカルボニル、エチルカルボナトまたは過フッ化 $C_1 \sim C_6$ アルキルである；そして

R^{11} および R^{12} が、水素である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R^2 、 R^6 および R^{10} が、エトキシカルボニルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^2 および R^6 が、エトキシカルボニルであり、そして R^{10} が、ヘプタフルオロ - (n - プロピル) である、請求項 10 に記載の化合物。

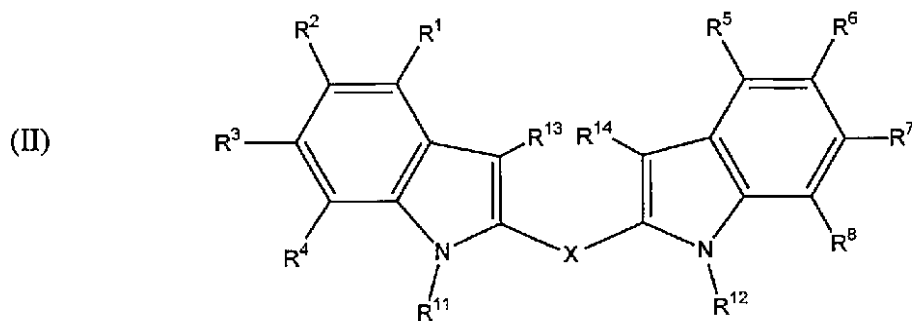
【請求項 13】

R^2 および R^6 が、エトキシカルボニルであり、そして R^{10} が、メトキシである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 14】

式 (II)

【化 3】



の構造を有する化合物であって、ここで：

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 は、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アルカリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニルオキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコキシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルカルボナト、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ- 置換アリールカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ- およびジ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換アミノ、モノ- およびジ- ($C_5 \sim C_{20}$ アリール) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルアミド、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルフィニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルフィニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルホニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択され、さらに、ここで、2 個の隣接 (オルト) 置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5 員環、6 員環、および縮合 5 員および / または 6 員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして 0 個 ~ 4 個の非水素置換基および 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有するが、但し、 R^2 および R^6 の両方ではなく 1 個は、アミノ、一置換アミノまたは二置換アミノであり得る；

R^{11} および R^{12} は、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコキシカルボニル、アミノ- 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、($C_1 \sim C_{24}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、およびジ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) アミノ- 置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルからなる群から選択される；

R^{13} および R^{14} は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 について定義したとおりであるが、但し、 R^{13} および R^{14} の少なくとも 1 個は、水素以外のものである；そして

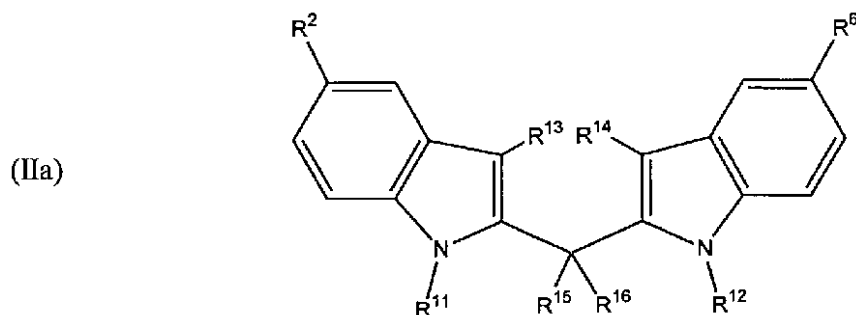
X は、O、S、アリーレン、ヘテロアリーレン、 $CR^{15}R^{16}$ または NR^{17} であり、ここで、 R^{15} および R^{16} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、または一緒になって、 $=CR^{18}R^{19}$ を形成し、ここで、 R^{18} および R^{19} は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、そして R^{17} は、 R^{11} および R^{12} について上で定義したとおりである、

化合物。

【請求項 15】

前記化合物が、式 (IIa)

【化 4】



の構造を有するように、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 および R^8 が、水素であり、そして X が、 $CR^{15}R^{16}$ である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

R^2 および R^6 が、別個に、水素、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボナト、カルボキシ、カルバモイル、モノ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、アミノ、モノ- およびジ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルアミド、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルフィニル および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

R^2 および R^6 が、別個に、ハロ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナト、カルバモイル、モノ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルフィニル および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

R^2 および R^6 の少なくとも 1 個が、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナトである、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^{11} および R^{12} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、アミノ-置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、($C_1 \sim C_{12}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル およびジ- ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) アミノ-置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルからなる群から選択される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{13} および R^{14} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ および $C_2 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルからなる群から選択される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{15} および R^{16} が、別個に、水素 および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択されるか、または一緒になって、 $=CR^{18}R^{19}$ を形成し、ここで、 R^{18} および R^{19} が、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 22】

R^2 および R^6 が、別個に、水素 および $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルから選択される

;

$R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ が、別個に、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される；

$R^{1\ 3}$ および $R^{1\ 4}$ が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_2 \sim C_6$ アルコシカルボニルから選択される；そして

$R^{1\ 5}$ および $R^{1\ 6}$ が、別個に、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択されるか、または一緒になって、 $=CH_2$ を形成する、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^2 および R^6 が、別個に、水素およびエトキシカルボニルから選択される；

$R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ が、水素である；

$R^{1\ 3}$ および $R^{1\ 4}$ が、別個に、水素、メチルおよびエトキシカルボニルから選択される；そして

$R^{1\ 5}$ および $R^{1\ 6}$ が、水素である、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

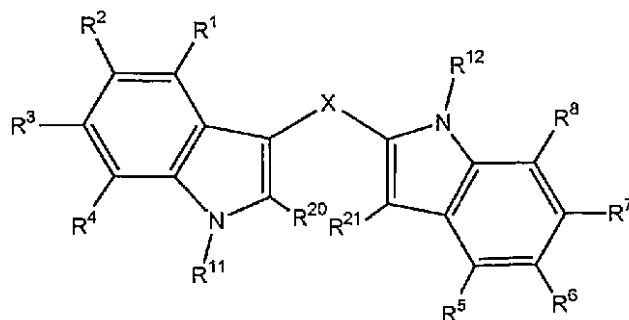
R^2 および R^6 が、エトキシカルボニルである、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

式 (III)

【化 5】

(III)



の構造を有する化合物であって、ここで：

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{20} および R^{21} は、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アルカリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニルオキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオシカルボニル、ハロカルボニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルカルボナト、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ- 置換アリールカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ- およびジ- ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換アミノ、モノ- およびジ- ($C_5 \sim C_{20}$ アリール) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルアミド、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルフィニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルフィニル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルスルホニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2 個の隣接 (オルト) 置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5 員環、6 員環、および縮合 5 員および / または 6 員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして 0 個 ~ 4 個の非水素置換基および 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する；

$R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ は、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコキシ

シカルボニル、アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{2,4}$ アルキル、($C_1 \sim C_{2,4}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{2,4}$ アルキル、およびジ - ($C_1 \sim C_{2,4}$ アルキル)アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{2,4}$ アルキルからなる群から選択される；そして

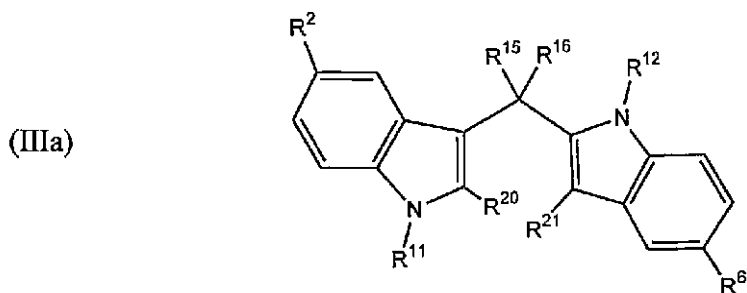
X は、O、S、アリーレン、ヘテロアリーレン、 $CR^{15}R^{16}$ または NR^{17} であり、ここで、 R^{15} および R^{16} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、または一緒になって、 $=CR^{18}R^{19}$ を形成し、ここで、 R^{18} および R^{19} は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、そして R^{17} は、 R^{11} および R^{12} について上で定義したとおりである、

化合物。

【請求項 26】

前記化合物が、式 (IIIa)

【化 6】



の構造を有するように、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 および R^8 が、水素であり、そして X が、 $CR^{15}R^{16}$ である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

R^2 および R^6 が、別個に、水素、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルコキシ、 $C_5 \sim C_{2,0}$ アリールオキシ、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルキルカルボニル、 $C_6 \sim C_{2,0}$ アリールカルボニル、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルコキシカルボニル、 $C_6 \sim C_{2,0}$ アリールオキシカルボニル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルカルボナト、カルボキシ、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル) - 置換カルバモイル、アミノ、モノ - およびジ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル) - 置換アミノ、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルキルアミド、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルフィニル および $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

R^2 および R^6 が、別個に、ハロ、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルキルカルボナト、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル) - 置換カルバモイル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルフィニル および $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

R^2 および R^6 の少なくとも 1 個が、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_{1,2}$ アルキルカルボナトである、請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R^{11} および R^{12} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{1,2}$ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル、($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル およびジ - ($C_1 \sim C_{1,2}$ アルキル)アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{1,2}$ アルキルからなる群から選択される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 31】

R^{15} および R^{16} が、別個に、水素および $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択されるか、または一緒になって、 $=CR^{18}R^{19}$ を形成し、ここで、 R^{18} および R^{19} が、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 32】

R^{13} および R^{14} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシおよび $C_2 \sim C_{12}$ アルコシカルボニルからなる群から選択される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 33】

R^2 および R^6 が、別個に、水素および $C_2 \sim C_6$ アルコシカルボニルから選択される；

R^{11} および R^{12} が、別個に、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される；

R^{15} および R^{16} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択されるか、または一緒になって、 $=CH_2$ を形成する；そして

R^{20} および R^{21} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_2 \sim C_6$ アルコシカルボニルから選択される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 34】

R^2 および R^6 が、別個に、水素およびエトキシカルボニルから選択される；

R^{11} および R^{12} が、水素である；

R^{15} および R^{16} が、水素である；そして

R^{20} および R^{21} が、別個に、水素、メチルおよびエトキシカルボニルから選択される、請求項 33 に記載の化合物。

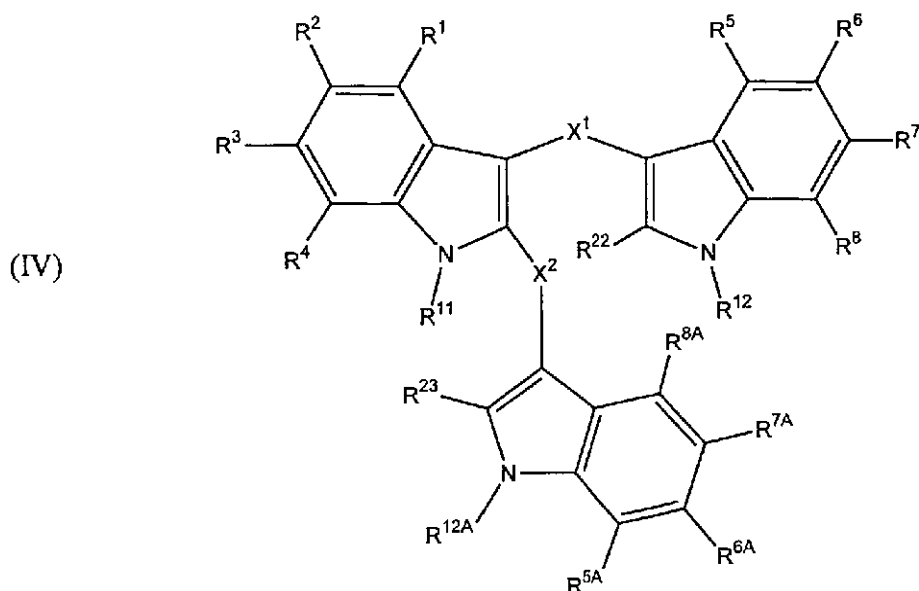
【請求項 35】

R^2 および R^6 が、エトキシカルボニルである、請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 36】

式 (IV)

【化 7】



の構造を有する化合物であって、ここで：

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{5A} 、 R^{6A} 、 R^{7A} 、 R^{8A} 、 R^{22} および R^{23} は、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アルカリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニルオキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルカルボナト、 $C_6 \sim C_{20}$ アリー

ルカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリアルカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - (C₅ ~ C₂₀ アリール) - 置換アミノ、C₂ ~ C₂₄ アルキルアミド、C₅ ~ C₂₀ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルフィニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルフィニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルホニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2個の隣接(オルト)置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5員環、6員環、および縮合5員および/または6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個~4個の非水素置換基および0個~3個のヘテロ原子を有する；そして

R^{1 1}、R^{1 2} および R^{1 2 A} は、別個に、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、C₂ ~ C₂₄ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、(C₁ ~ C₂₄ アルキルアミノ) - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキルからなる群から選択される；そして

X¹ および X² は、別個に、O、S、アリーレン、ヘテロアリーレン、C R^{1 5} R^{1 6} および N R^{1 7} から選択され、ここで、R^{1 5} および R^{1 6} は、水素、C₁ ~ C₆ アルキルであるか、または一緒になって、= C R^{1 8} R^{1 9} を形成し、ここで、R^{1 8} および R^{1 9} は、水素または C₁ ~ C₆ アルキルであり、そして R^{1 7} は、R^{1 1} および R^{1 2} について定義したとおりであるが、

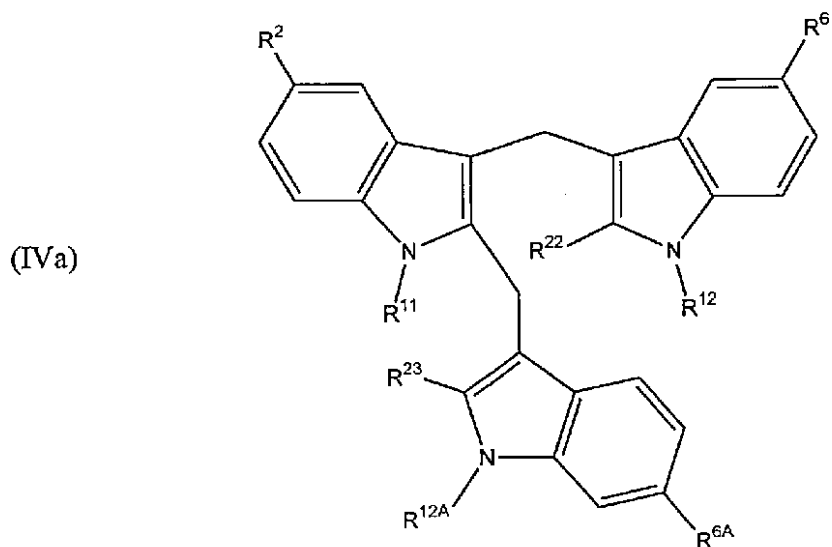
但し、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R^{5 A}、R^{6 A}、R^{7 A}、R^{8 A}、R^{2 2} および R^{2 3} の少なくとも1個は、水素以外のものである、

化合物。

【請求項37】

前記化合物が、式(IVa)

【化8】



の構造を有するように、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁷、R⁸、R^{5 A}、R^{7 A} および R^{8 A} が、水素であり、そして X¹ および X² が、CH₂ である、請求項36に記載の化合物であって：

但し、R²、R⁶、R^{6 A}、R^{1 1}、R^{1 2}、R^{1 2 A}、R^{2 2} および R^{2 3} の少なくとも1個は、水素以外のものである、

化合物。

【請求項 38】

R^2 、 R^6 、 R^{6A} 、 R^{22} および R^{23} が、別個に、ハロ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナト、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) - 置換カルバモイル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスフィニルおよび $C_1 \sim C_{12}$ アルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 39】

R^2 、 R^6 、 R^{6A} 、 R^{22} および R^{23} の少なくとも 1 個が、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコシカルボニルまたは $C_2 \sim C_{12}$ アルキルカルボナトである、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

R^{11} 、 R^{12} および R^{12A} が、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルコシカルボニル、アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、($C_1 \sim C_{12}$ アルキルアミノ) - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルおよびジ - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル) アミノ - 置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルからなる群から選択される、請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 41】

R^2 、 R^6 、 R^{6A} 、 R^{22} および R^{23} が、別個に、水素および $C_2 \sim C_6$ アルコシカルボニルから選択される；そして

R^{11} 、 R^{12} および R^{12A} が、別個に、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 42】

R^2 、 R^6 、 R^{6A} 、 R^{22} および R^{23} が、別個に、水素およびエトキシカルボニルから選択される；そして

R^{11} 、 R^{12} および R^{12A} が、水素である、請求項 41 に記載の化合物。

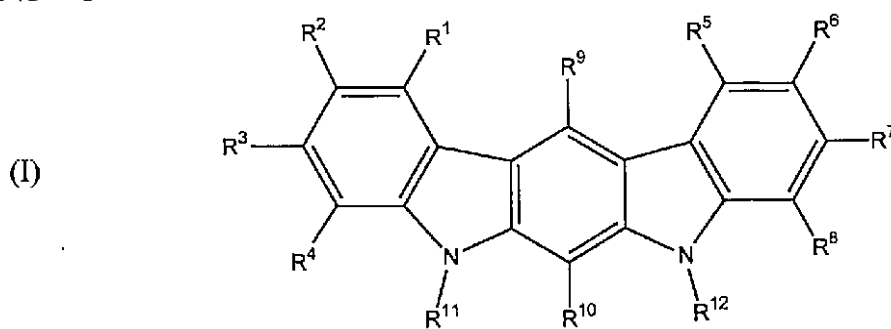
【請求項 43】

R^2 、 R^6 、 R^{6A} 、 R^{22} および R^{23} の少なくとも 1 個が、エトキシカルボニルである、請求項 42 に記載の化合物。

【請求項 44】

式 (I)

【化 9】



の構造を有する化合物の治療有効量を含む、医薬組成物であって、ここで：

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{10} は、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニル、 $C_5 \sim C_{20}$ アリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アルカリール、 $C_6 \sim C_{24}$ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフィドリル、 $C_1 \sim C_{24}$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキニルオキシ、 $C_5 \sim C_{20}$ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコシカルボニル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルキルカルボナト、 $C_6 \sim C_{20}$ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - ($C_1 \sim C_{24}$ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリールカルバモイル、チオカル

バモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - (C₅ ~ C₂₀ アリール) - 置換アミノ、C₂ ~ C₂₄ アルキルアミド、C₅ ~ C₂₀ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルフィニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルフィニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルホニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2個の隣接(オルト)置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5員環、6員環、および縮合5員および/または6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個~4個の非水素置換基および0個~3個のヘテロ原子を有する；そして

R^{1 1} および R^{1 2} は、別個に、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、C₂ ~ C₂₄ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、(C₁ ~ C₂₄ アルキルアミノ) - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキルからなる群から選択されるが、

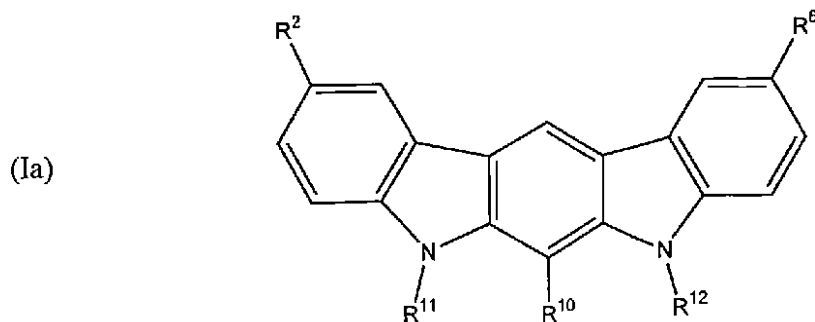
但し、少なくとも1個の R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R^{1 0}、R^{1 1} および R^{1 2} は、水素以外のものである、

組成物。

【請求項 4 5】

前記化合物が、式 (I a)

【化 1 0】



の構造を有するように、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁷、R⁸ および R⁹ が、水素である、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 6】

前記薬学的に受容可能な担体が、経口投与に適当であり、そして前記組成物が、経口剤形を含む、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 7】

前記経口剤形が、錠剤である、請求項 4 6 に記載の組成物。

【請求項 4 8】

前記経口剤形が、カプセル剤である、請求項 4 6 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

前記薬学的に受容可能な担体が、非経口投与に適当であり、そして前記組成物が、非経口投与可能な処方を含む、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 5 0】

前記薬学的に受容可能な担体が、経口投与に適当であり、そして前記組成物が、経口剤形を含む、請求項 4 5 に記載の組成物。

【請求項 5 1】

前記経口剤形が、錠剤である、請求項 5 0 に記載の組成物。

【請求項 5 2】

前記経口剤形が、カプセル剤である、請求項 50 に記載の組成物。

【請求項 53】

前記薬学的に受容可能な担体が、非経口投与に適当であり、そして前記組成物が、非経口投与可能な処方を含む、請求項 45 に記載の組成物。

【請求項 54】

薬学的に受容可能な担体と組み合わせて、請求項 14、15、25、26、36 および 37 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する、医薬組成物。

【請求項 55】

前記薬学的に受容可能な担体が、経口投与に適当であり、そして前記組成物が、経口剤形を含む、請求項 54 に記載の組成物。

【請求項 56】

前記経口剤形が、錠剤である、請求項 55 に記載の組成物。

【請求項 57】

前記経口剤形が、カプセル剤である、請求項 55 に記載の組成物。

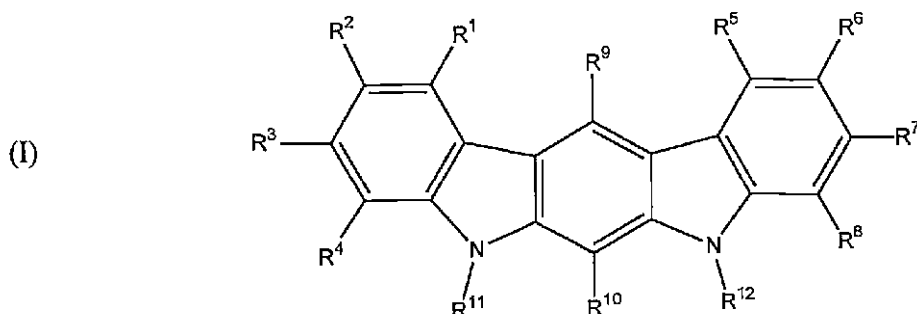
【請求項 58】

前記薬学的に受容可能な担体が、非経口投与に適当であり、そして前記組成物が、非経口投与可能な処方を含む、請求項 54 に記載の組成物。

【請求項 59】

哺乳動物個体の癌を予防または治療するための組成物であって、該組成物は、式 (I)

【化 11】



の構造を有する化合物の治療有効量を含み：

ここで：

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹ および R¹⁰ は、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、C₂ ~ C₂₄ アルケニル、C₂ ~ C₂₄ アルキニル、C₅ ~ C₂₀ アリール、C₆ ~ C₂₄ アルカリール、C₆ ~ C₂₄ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフィド、C₁ ~ C₂₄ アルコキシ、C₂ ~ C₂₄ アルケニルオキシ、C₂ ~ C₂₄ アルキニルオキシ、C₅ ~ C₂₀ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、C₂ ~ C₂₄ アルコキシカルボニル、C₆ ~ C₂₀ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、C₂ ~ C₂₄ アルキルカルボナト、C₆ ~ C₂₀ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリールカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - (C₅ ~ C₂₀ アリール) - 置換アミノ、C₂ ~ C₂₄ アルキルアミド、C₅ ~ C₂₀ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルフィニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルフィニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルホニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2 個の隣接 (オルト) 置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5 員環、6 員環、および縮合 5 員および

ノまたは6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個～4個の非水素置換基および0個～3個のヘテロ原子を有する；そして

R^{11} および R^{12} は、別個に、水素、 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルコキシカルボニル、アミノ-置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、($C_1 \sim C_{24}$ アルキルアミノ)-置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキル、およびジ-($C_1 \sim C_{24}$ アルキル)アミノ-置換 $C_1 \sim C_{24}$ アルキルからなる群から選択されるが、

但し、少なくとも1個の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} および R^{12} は、水素以外のものである、

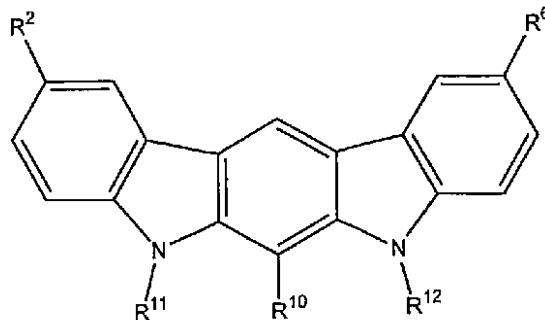
組成物。

【請求項60】

前記化合物が、式(Ia)

【化12】

(Ia)



の構造を有するように、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 および R^9 が、水素である、請求項59に記載の組成物。

【請求項61】

前記癌が、エストロゲン依存性癌である、請求項59に記載の組成物。

【請求項62】

前記癌が、乳癌、子宮頸癌、子宮癌、卵巣癌または子宮内膜癌である、請求項61に記載の組成物。

【請求項63】

前記癌が、乳癌である、請求項62に記載の組成物。

【請求項64】

前記癌が、卵巣癌である、請求項62に記載の組成物。

【請求項65】

前記癌が、転移性である、請求項61に記載の組成物。

【請求項66】

前記癌が、薬剤耐性癌である、請求項61に記載の組成物。

【請求項67】

前記癌が、多剤耐性を示す、請求項66に記載の組成物。

【請求項68】

前記癌が、非エストロゲン依存性癌である、請求項59に記載の組成物。

【請求項69】

前記癌が、前立腺癌、肝臓癌、肺癌、大腸癌または膵臓癌である、請求項68に記載の組成物。

【請求項70】

前記癌が、転移性である、請求項68に記載の組成物。

【請求項71】

前記癌が、薬剤耐性癌である、請求項68に記載の組成物。

【請求項72】

前記癌が、多剤耐性を示す、請求項71に記載の組成物。

【請求項 7 3】

前記癌が、エストロゲン依存性癌である、請求項 6 0 に記載の組成物。

【請求項 7 4】

前記癌が、乳癌、子宮頸癌、子宮癌、卵巣癌または子宮内膜癌である、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 5】

前記癌が、乳癌である、請求項 7 4 に記載の組成物。

【請求項 7 6】

前記癌が、卵巣癌である、請求項 7 4 に記載の組成物。

【請求項 7 7】

前記癌が、転移性である、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 8】

前記癌が、薬剤耐性癌である、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 9】

前記癌が、多剤耐性を示す、請求項 7 8 に記載の組成物。

【請求項 8 0】

前記癌が、非エストロゲン依存性癌である、請求項 6 0 に記載の組成物。

【請求項 8 1】

前記癌が、前立腺癌、肝臓癌、肺癌、大腸癌または膵臓癌である、請求項 8 0 に記載の組成物。

【請求項 8 2】

前記癌が、転移性である、請求項 8 0 に記載の組成物。

【請求項 8 3】

前記癌が、薬剤耐性癌である、請求項 8 0 に記載の組成物。

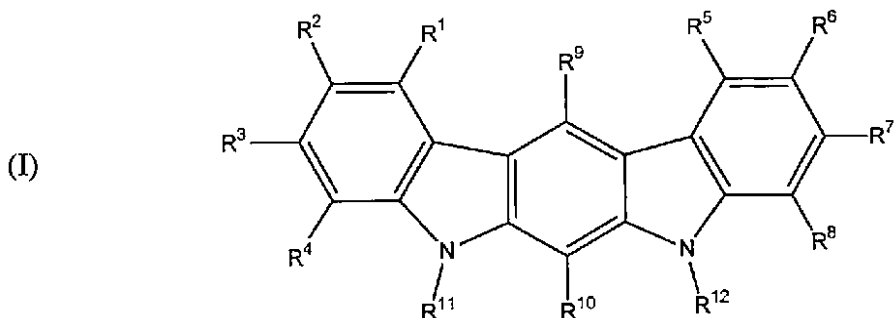
【請求項 8 4】

前記癌が、多剤耐性を示す、請求項 8 3 に記載の組成物。

【請求項 8 5】

エストロゲンに関連した病気、疾患または障害に罹りやすいかまたは罹っている個体を治療するための組成物であって、該組成物は、式 (I)

【化 1 3】



の構造を有する化合物の治療有効量を含み：

ここで：

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹ および R¹⁰ は、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、C₂ ~ C₂₄ アルケニル、C₂ ~ C₂₄ アルキニル、C₅ ~ C₂₀ アリール、C₆ ~ C₂₄ アルカリール、C₆ ~ C₂₄ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフィドリル、C₁ ~ C₂₄ アルコキシ、C₂ ~ C₂₄ アルケニルオキシ、C₂ ~ C₂₄ アルキニルオキシ、C₅ ~ C₂₀ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、C₂ ~ C₂₄ アルコキシカルボニル、C₆ ~ C₂₀ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、C₂ ~ C₂₄ アルキルカルボナト、C₆ ~ C₂₀ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリールカルバモイル、チオカル

バモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - (C₅ ~ C₂₀ アリール) - 置換アミノ、C₂ ~ C₂₄ アルキルアミド、C₅ ~ C₂₀ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルフィニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルフィニル、C₁ ~ C₂₄ アルキルスルホニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2個の隣接(オルト)置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5員環、6員環、および縮合5員および/または6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個~4個の非水素置換基および0個~3個のヘテロ原子を有する；そして

R¹¹ および R¹² は、別個に、水素、C₁ ~ C₂₄ アルキル、C₂ ~ C₂₄ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、(C₁ ~ C₂₄ アルキルアミノ) - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキル、およびジ - (C₁ ~ C₂₄ アルキル) アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₄ アルキルからなる群から選択されるが、

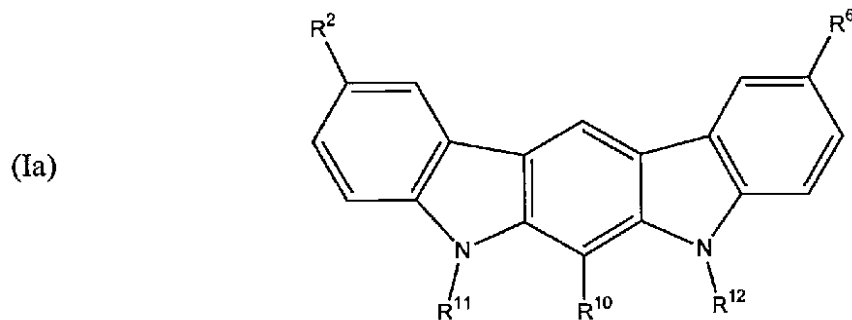
但し、少なくとも1個の R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹ および R¹² は、水素以外のものである、

組成物。

【請求項 86】

前記化合物が、式 (Ia)

【化 14】

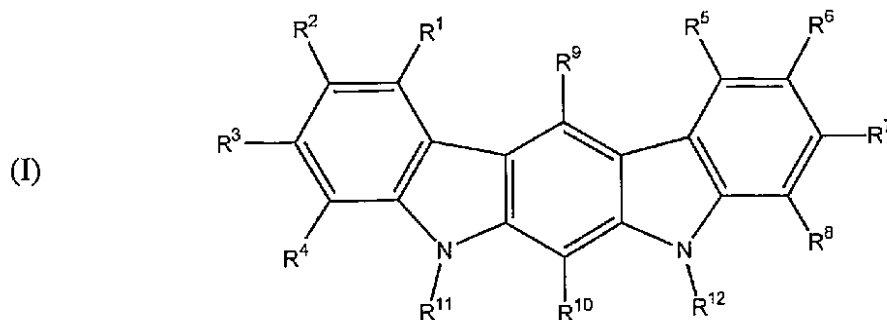


の構造を有するように、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁷、R⁸ および R⁹ が、水素である、請求項 85 に記載の組成物。

【請求項 87】

ウイルス感染に罹りやすいかまたは罹っている個体を治療するための組成物であって、該組成物は、式 (I)

【化 15】



の構造を有する化合物の治療有効量を含み：

ここで：

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹ および R¹⁰ は、水素、C₁

~ C₂₋₄ アルキル、C₂ ~ C₂₋₄ アルケニル、C₂ ~ C₂₋₄ アルキニル、C₅ ~ C₂₀ アリール、C₆ ~ C₂₋₄ アルカリール、C₆ ~ C₂₋₄ アラルキル、ハロ、ヒドロキシル、スルフヒドリル、C₁ ~ C₂₋₄ アルコキシ、C₂ ~ C₂₋₄ アルケニルオキシ、C₂ ~ C₂₋₄ アルキニルオキシ、C₅ ~ C₂₀ アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、C₂ ~ C₂₋₄ アルコキシカルボニル、C₆ ~ C₂₀ アリールオキシカルボニル、ハロカルボニル、C₂ ~ C₂₋₄ アルキルカルボナト、C₆ ~ C₂₀ アリールカルボナト、カルボキシ、カルボキシラト、カルバモイル、モノ - (C₁ ~ C₂₋₄ アルキル) - 置換カルバモイル、ジ - (C₁ ~ C₂₋₄ アルキル) - 置換カルバモイル、モノ - 置換アリールカルバモイル、チオカルバモイル、カルバミド、シアノ、イソシアノ、シアナト、イソシアナト、イソチオシアナト、アジド、ホルミル、チオホルミル、アミノ、モノ - およびジ - (C₁ ~ C₂₋₄ アルキル) - 置換アミノ、モノ - およびジ - (C₅ ~ C₂₀ アリール) - 置換アミノ、C₂ ~ C₂₋₄ アルキルアミド、C₅ ~ C₂₀ アリールアミド、イミノ、アルキルイミノ、アリールイミノ、ニトロ、ニトロソ、スルホ、スルホナト、C₁ ~ C₂₋₄ アルキルスルファニル、アリールスルファニル、C₁ ~ C₂₋₄ アルキルスルフィニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルフィニル、C₁ ~ C₂₋₄ アルキルスルホニル、C₅ ~ C₂₀ アリールスルホニル、ホスホノ、ホスホナト、ホスフィナト、ホスホ、ホスフィノ、およびそれらの組合せからなる群から別個に選択される置換基であり、さらに、ここで、2個の隣接(オルト)置換基は、結合して、環状構造を形成し得、該環状構造は、5員環、6員環、および縮合5員および/または6員環から選択され、ここで、該環状構造は、芳香族、脂環族、ヘテロ芳香族またはヘテロ脂肪族であり、そして0個~4個の非水素置換基および0個~3個のヘテロ原子を有する；そして

R¹⁻¹ および R¹⁻² は、別個に、水素、C₁ ~ C₂₋₄ アルキル、C₂ ~ C₂₋₄ アルコキシカルボニル、アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₋₄ アルキル、(C₁ ~ C₂₋₄ アルキルアミノ) - 置換 C₁ ~ C₂₋₄ アルキル、およびジ - (C₁ ~ C₂₋₄ アルキル) アミノ - 置換 C₁ ~ C₂₋₄ アルキルからなる群から選択されるが、

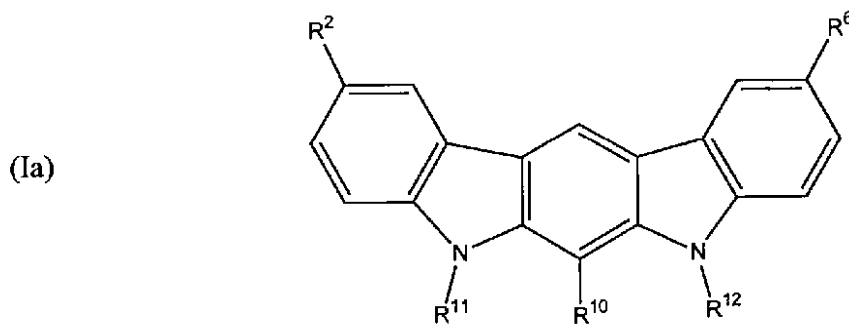
但し、少なくとも1個の R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹ および R¹² は、水素以外のものである、

組成物。

【請求項 88】

前記化合物が、式 (Ia)

【化 16】



の構造を有するように、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁷、R⁸ および R⁹ が、水素である、請求項 87 に記載の組成物。

【請求項 89】

前記ウイルス感染が、DNAウイルスにより引き起こされる、請求項 87 に記載の組成物。

【請求項 90】

前記DNAウイルスが、ヒトパピローマウイルスである、請求項 89 に記載の組成物。

【請求項 91】

前記ウイルス感染が、レトロウイルス感染である、請求項 87 に記載の組成物。

【請求項 9 2】

前記ウイルス感染が、DNAウイルスにより引き起こされる、請求項 8 8 に記載の組成物。

【請求項 9 3】

前記DNAウイルスが、ヒトパピローマウイルスである、請求項 9 2 に記載の組成物。

【請求項 9 4】

前記ウイルス感染が、レトロウイルス感染である、請求項 8 8 に記載の組成物。

【請求項 9 5】

6 - 置換 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 - b] カルバゾール化合物を合成する方法であって、無水物、塩化アシル、炭酸アルキル、炭酸アリール、クロロギ酸アルキルおよびクロロギ酸アリールからなる群から選択される反応剤の存在下にて、N - 保護 3 , 3 ' - ジインドリルメタンを有機リチウム試薬で処理する工程を包含する、方法。

【請求項 9 6】

前記有機リチウム試薬が、リチウム 2 , 2 , 6 , 6 - テトラメチルピペリジドまたはリチウムジイソプロピルアミドである、請求項 9 5 に記載の方法。

【請求項 9 7】

前記無水物が、構造 $R - (CO) - O - (CO) - R$ を有し、ここで、R が、アルキルまたは置換アルキルである、請求項 9 5 に記載の方法。

【請求項 9 8】

R が、アルキルである、請求項 9 7 に記載の方法。

【請求項 9 9】

R が、メチルである、請求項 9 8 に記載の方法。

【請求項 1 0 0】

R が、置換アルキルである、請求項 9 7 に記載の方法。

【請求項 1 0 1】

R が、フッ化アルキルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 2】

R が、過フッ化低級アルキルである、請求項 1 0 1 に記載の方法。

【請求項 1 0 3】

前記 6 - 置換 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 - b] カルバゾールが、6 - アルキルカルボナト - 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 - b] カルバゾールであるように、前記反応剤が、クロロギ酸アルキルである、請求項 9 5 に記載の方法。

【請求項 1 0 4】

前記 6 - 置換 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 - b] カルバゾールが、6 - ヒドロキシ - 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 - b] カルバゾールであるように、前記反応剤が、クロロギ酸アルキルであり、そして前記反応が、酸の存在下にて実行される、請求項 9 5 に記載の方法。

【請求項 1 0 5】

さらに、前記 6 - ヒドロキシ - 5 , 7 - ジヒドロインドロ [2 , 3 - b] カルバゾールをアルキル化剤と接触させて、6 - アルコキシ - 5 , 7 - ジヒドロ - インドロ [2 , 3 b] カルバゾールを得る工程を包含する、請求項 1 0 4 に記載の方法。