

【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2月9日(2006.2.9)

【公表番号】特表2005-539009(P2005-539009A)
【公表日】平成17年12月22日(2005.12.22)
【年通号数】公開・登録公報2005-050
【出願番号】特願2004-526000(P2004-526000)
【国際特許分類】

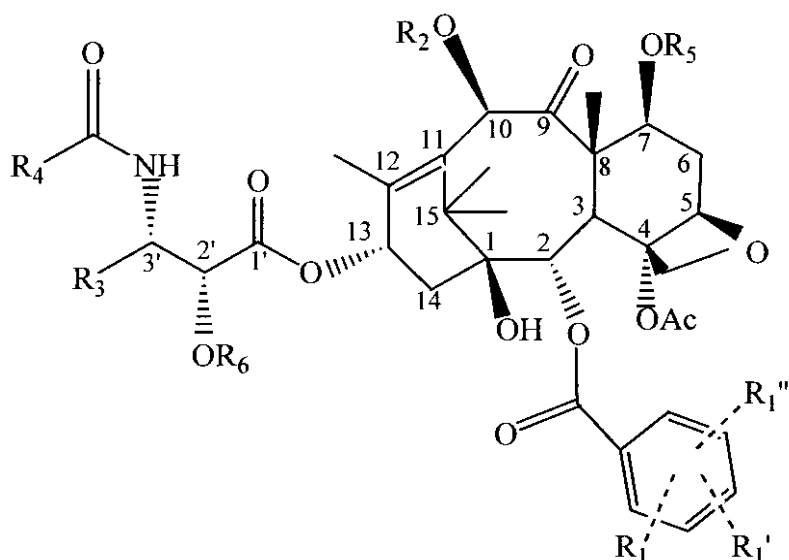
C 0 7 D 305/14 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 33/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/337 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 305/14 C S P
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 33/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 43/00 1 0 5
A 6 1 K 31/337

【手続補正書】
【提出日】平成17年11月22日(2005.11.22)
【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】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R_1 は、H、電子求引基、または、電子供与基であり； R_1' および R_1'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_2 は、Hであり；

R_3 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環であり；

R_4 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、アリール、複素環、 $-OC(CH_3)_3$ であるか、または、C-3'位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、1～10個の炭素原子を有する前記アルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；

R_5 は、結合基であり；および、

R_6 は、Hであるか、または、C-2'位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル、複素環またはアリールエステル、複素環またはアリールカルバメート、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）である、前記化合物。

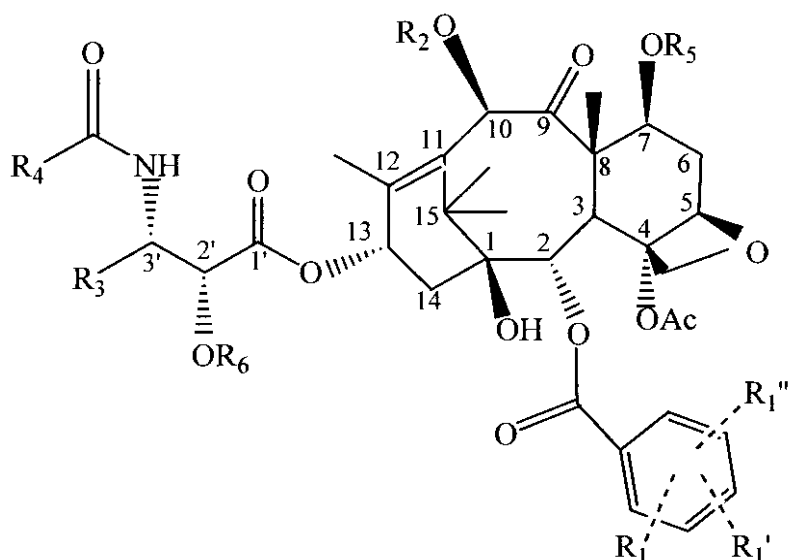
【請求項 2】

R_3 は、 $-CH=C(CH_3)_2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

式 (I)：

【化 2】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R_2 は、結合基であり；

R_1 は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_3 は、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルケニル、または、複素環であり；

R_4 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、アリール、複素環、 $-OC(CH_3)_3$ であるか、または、C-3'位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、1～10個の炭素原子を有する前記アルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；

R_5 は、Hであるか、または、C-7位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）であり；および、

R_6 は、Hであるか、または、C-2'位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（

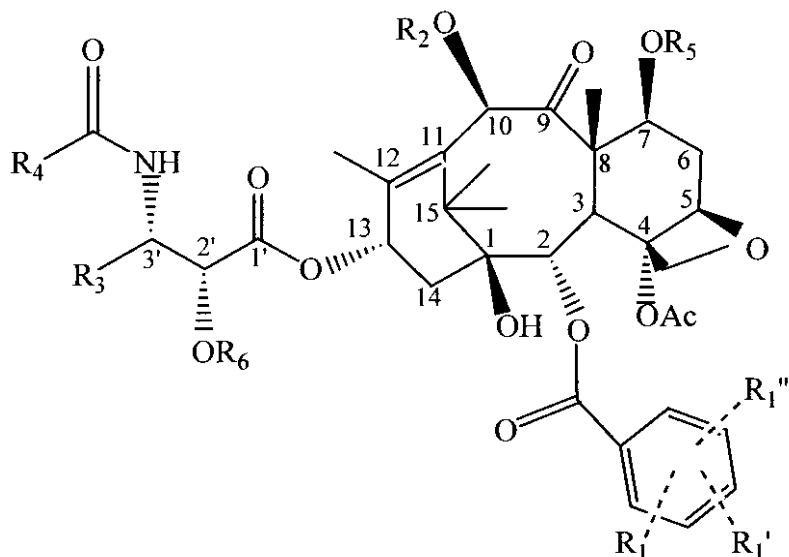
式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、 H 、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、 $6 \sim 10$ 個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである)であり、

ただし、 R_3 が $-CH=C(CH_3)_2$ である場合、 R_4 は、アリールまたは $-OC(CH_3)_3$ ではない、前記化合物。

【請求項4】

式(I)：

【化3】



式(I)

で示される化合物であって、式中：

R_5 は、結合基であり；

R_1 は、 H 、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、 H 、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_3 は、 $2 \sim 10$ 個の炭素原子を有するアルケニル、 $3 \sim 10$ 個の炭素原子を有するシクロアルケニル、または、複素環であり；

R_4 は、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有するアルキル、 $2 \sim 10$ 個の炭素原子を有するアルケニル、 $3 \sim 10$ 個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、アリール、複素環、 $-OC(CH_3)_3$ であるか、または、 $C-3'$ 位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有する前記アルキル、 $2 \sim 10$ 個の炭素原子を有するアルケニル、 $3 \sim 10$ 個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；

R_2 は、 H であるか、または、 $C-10$ 位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、 $2 \sim 10$ 個の炭素原子を有する）、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、 $2 \sim 10$ 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、 X は、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、 H 、 $1 \sim 10$ 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、 $6 \sim 10$ 個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）であり；および、

R_6 は、 H であるか、または、 $C-2'$ 位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはア

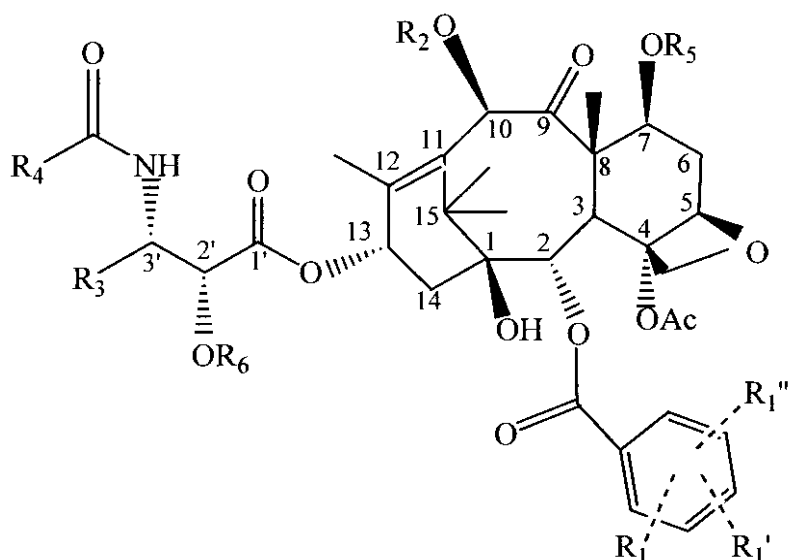
リールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - O C O X で示されるカルバメート基（式中、X は、窒素含有複素環基である）、または、式 - O C O N R₁₀ R₁₁ で示されるカルバメート基（式中、R₁₀ および R₁₁ は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）であり、

ただし、R₃ が - C H = C (C H₃)₂ である場合、R₄ は、アリールまたは - O C (C H₃)₃ ではない、前記化合物。

【請求項5】

式 (I) :

【化4】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R₆ は、結合基であり；

R₁ は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R₁' および R₁'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R₃ は、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルケニル、または、複素環であり；

R₄ は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、アリール、複素環、- O C (C H₃)₃ であるか、または、C - 3' 位で - C O N H - 基と一緒に、1～10個の炭素原子を有する前記アルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；

R₂ は、Hであるか、または、C - 10 位で酸素原子と一緒に、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状

もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCO X$ で示されるカルバメート基（式中、 X は、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート基（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、 H 、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）であり；および、

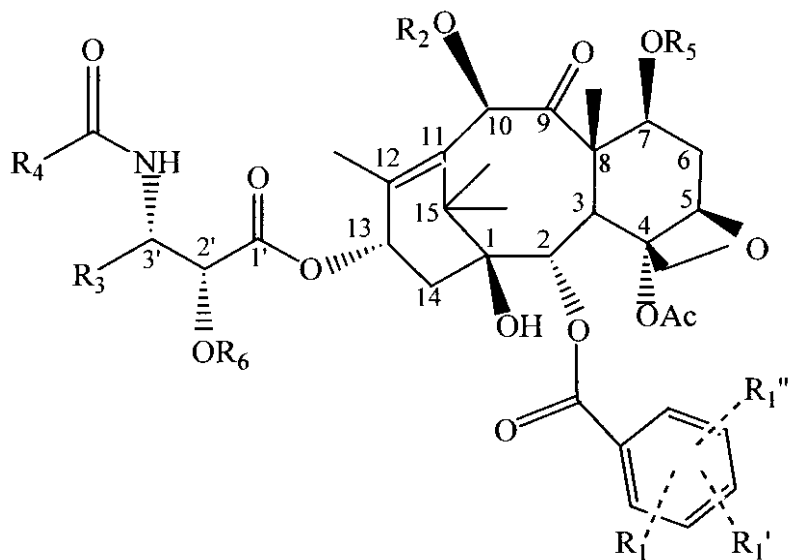
R_5 は、 H であるか、または、 $C-7$ 位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 $-OCO X$ で示されるカルバメート基（式中、 X は、窒素含有複素環基である）、または、式 $-OCONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート基（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、 H 、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）であり、

ただし、 R_3 が $-CH=C(CH_3)_2$ である場合、 R_4 は、アリールまたは $-OC(CH_3)_3$ ではない、前記化合物。

【請求項6】

式(I)：

【化5】



式(I)

で示される化合物であって、式中：

R_3 は、結合基であり；

R_1 は、 H 、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、 H 、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_4 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環、 $-OC(CH_3)_3$ であるか、または、 $C-3'$ 位で $-CONH$ -基と一緒にあって、1～10個の炭素原子を有する前記アルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメート

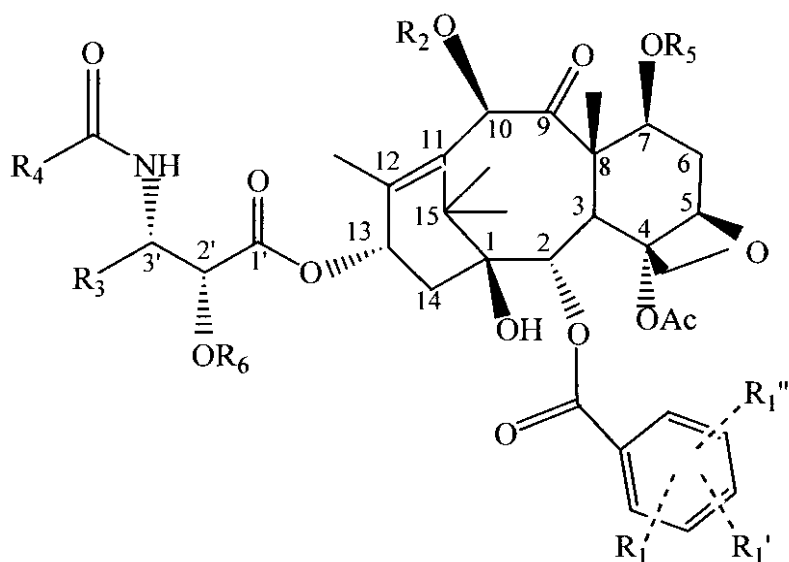
であり；および、

R_2 、 R_5 および R_6 は、同一または異なって、Hであるか、または、それぞれ C - 10、C - 7 および C - 2' 位で、酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1 ~ 10 個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2 ~ 10 個の炭素原子を有する）、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOX で示されるカルバメート基（式中、X は、窒素含有複素環基である）、または、式 - OCONR₁₀R₁₁ で示されるカルバメート基（式中、R₁₀ および R₁₁ は、同一または異なって、H、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6 ~ 10 個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）である、前記化合物。

【請求項 7】

式 (I) :

【化 6】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R_4 は、結合基であり；

R_1 は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_3 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有するアルキル、2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環であり；

R_2 、 R_5 および R_6 は、同一または異なって、Hであるか、または、それぞれ C - 10、C - 7 および C - 2' 位で、酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1 ~ 10 個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2 ~ 10 個の炭素原子を有する）、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOX で示されるカルバメート基（式中、X は、窒素含有複素環基である）、または、式 - OCONR₁₀R₁₁ で示されるカルバメート基（式中、R₁₀

。および R_{11} は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである)である、前記化合物。

【請求項8】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1～10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2～20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

Rおよび R_{12} は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、 R_{12} はHであってもよく；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} および R_{16} は、同一または異なって、Hであるか、または、1～4個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{17} および R_{18} は、Hまたはメチルであり；

nは、1～10の整数であり；

mは、1～10の整数であり、または、0であってもよく；および、

yは、1～20の整数であり、または、0であってもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

R_1 および/ R_1' または R_1'' および/ R_1''' で示される電子求引基は、F、 NO_2 、CN、Cl、 CHF_2 、および、 CF_3 からなる群より選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項13】

R_1 および/ R_1' および/ R_1'' で示される電子供与基は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-NR_7R_8$ 、および、 $-OR_9$ からなる群より選択され、ここで、 R_7 および R_8 は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

R_7 および / または R_8 は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 16】

R_7 および R_8 は、同一である、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 17】

$-NR_7R_8$ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三およびイソブチルのいずれかである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 18】

R_1 は、メタ位にあり、 R_1' および R_1'' の一方は、 $-OCH_3$ であり、他方は、H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

R_3 および R_4 の一方または両方は、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

R_3 および R_4 の一方または両方は、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】

OR_6 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO-$ モルホリノ、 $-OCO-$ ピペラジノ、 $-OCO-$ ピペリジノ、または、 $-OCO-N-$ メチルピペラジノである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 22】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 23】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 24】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-X$

S Z、-チオフェニル-X S Z、-イミダゾリル-X S Z、-モルホリノ-X S Z、-ピペラジノ-X S Z、-ピペリジノ-X S Z、-CO-フリル-X S Z、-CO-チオフェニル-X S Z、-CO-チアゾリル-X S Z、-CO-N-メチルピペラジノ-X S Z、-CO-モルホリノ-X S Z、-CO-ピペラジノ-X S Z、-CO-ピペリジノ-X S Z、または、-CO-N-メチルピペラジノ-X S Zであり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1～10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2～20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

RおよびR_{1 2}は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、R_{1 2}はHであってもよく；

R_{1 3}、R_{1 4}、R_{1 5}およびR_{1 6}は、同一または異なって、Hであるか、または、1～4個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{1 7}およびR_{1 8}は、Hまたはメチルであり；

nは、1～10の整数であり；

mは、1～10の整数であり、または、0であってもよく；および、

yは、1～20の整数であり、または、0であってもよい、請求項3に記載の化合物。

【請求項26】

R₁および/またはR_{1'}および/またはR_{1''}で示される電子求引基は、F、NO₂、CN、Cl、CHF₂、および、CF₃からなる群より選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項27】

R₁および/またはR_{1'}および/またはR_{1''}で示される電子供与基は、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-NR₇R₈、および、-OR₉からなる群より選択され、ここで、R₇およびR₈は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、R₉は、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項3に記載の化合物。

【請求項28】

R₁は、-OCH₃である、請求項3に記載の化合物。

【請求項29】

R₇および/またはR₈は、1～4個の炭素原子を有する、請求項27に記載の化合物。

【請求項30】

R₇およびR₈は、同一である、請求項27に記載の化合物。

【請求項31】

-NR₇R₈は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項27に記載の化合物。

【請求項32】

R₁は、メタ位にあり、R_{1'}およびR_{1''}の一方は、-OCH₃であり、他方は、Hである、請求項3に記載の化合物。

【請求項33】

R₃およびR₄の一方または両方は、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルであるか、または、R₄は、C-3'位で-CONH-基と一緒にあって、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベン

ゾフランイルまたはベンゾチオフェンイルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

R_3 および R_4 の一方または両方は、イソブテニル、プロペニル、チオフェンイル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で - CONH - 基と一緒にあって、イソブテニル、プロペニル、チオフェンイル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

OR_5 および / または OR_6 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO$ -モルホリノ、 $-OCO$ -ピペラジノ、 $-OCO$ -ピペリジノ、または、 $-OCO$ -N-メチルピペラジノである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 3 7】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 3 7 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフェンイル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフェンイル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Z は、H または SR であり；

X は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2 ~ 20 個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

R および R_{12} は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、 R_{12} は H であってもよく；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} および R_{16} は、同一または異なって、H であるか、または、1 ~ 4 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{17} および R_{18} は、H またはメチルであり；

n は、1 ~ 10 の整数であり；

m は、1 ~ 10 の整数であり、または、0 であってもよく；および、

y は、1 ~ 20 の整数であり、または、0 であってもよい、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

R_1 および / または R_1' および / または R_1'' で示される電子求引基は、F、 NO_2 、CN、Cl、 CHF_2 、および、 CF_3 からなる群より選択される、請求項 4 に記載の

化合物。

【請求項 4 1】

R_1 および / または R_1' および / または R_1'' で示される電子供与基は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-NR_7R_8$ 、および、 $-OR_9$ からなる群より選択され、ここで、 R_7 および R_8 は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

R_7 および / または R_8 は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項 4 1 に記載の化合物

。

【請求項 4 4】

R_7 および R_8 は、同一である、請求項 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

$-NR_7R_8$ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

R_1 は、メタ位にあり、 R_1' および R_1'' の一方は、 $-OCH_3$ であり、他方は、H である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 4 6 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R_3 および R_4 の一方または両方は、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒に、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R_3 および R_4 の一方または両方は、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒に、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

OR_2 および / または OR_6 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO-$ モルホリノ、 $-OCO-$ ピペラジノ、 $-OCO-$ ピペリジノ、または、 $-OCO-N-$ メチルピペラジノである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 5 1】

R_2 は、H である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性

の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 3】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 5 3 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Z は、H または SR であり；

X は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2 ~ 20 個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

R および R_{12} は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、 R_{12} は H であってもよく；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} および R_{16} は、同一または異なって、H であるか、または、1 ~ 4 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{17} および R_{18} は、H またはメチルであり；

n は、1 ~ 10 の整数であり；

m は、1 ~ 10 の整数であり、または、0 であってもよく；および、

y は、1 ~ 20 の整数であり、または、0 であってもよい、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 6】

R_1 および / または R_1' および / または R_1'' で示される電子求引基は、F、 NO_2 、CN、Cl、 CHF_2 、および、 CF_3 からなる群より選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 7】

R_1 および / または R_1' および / または R_1'' で示される電子供与基は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-NR_7R_8$ 、および、 $-OR_9$ からなる群より選択され、ここで、 R_7 および R_8 は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

R_7 および / または R_8 は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項 5 7 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

R₇ および R₈ は、同一である、請求項 57 に記載の化合物。

【請求項 61】

-NR₇R₈ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項 57 に記載の化合物。

【請求項 62】

R₁ は、メタ位にあり、R₁' および R₁" の一方は、-OCH₃ であり、他方は、H である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 63】

R₃ および R₄ の一方または両方は、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルであるか、または、R₄ は、C-3' 位で -CONH- 基と一緒にあって、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 64】

R₃ および R₄ の一方または両方は、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、R₄ は、C-3' 位で -CONH- 基と一緒にあって、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 65】

OR₂ および / または OR₅ によって形成されるカルバメートは、-OCONHCH₂CH₃、-OCONHCH₂CH₂CH₃、-OCO-モルホリノ、-OCO-ピペラジノ、-OCO-ピペリジノ、または、-OCO-N-メチルピペラジノである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 66】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 67】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 68】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 67 に記載の化合物。

【請求項 69】

前記結合基は、-(CR₁₃R₁₄)_m(CR₁₅R₁₆)_n(OCH₂CH₂)_ySZ、-CO(CR₁₃R₁₄)_m(CR₁₅R₁₆)_n(OCH₂CH₂)_ySZ、-(CR₁₃R₁₄)_m(CR₁₇=CR₁₈)(CR₁₅R₁₆)_m(OCH₂CH₂)_ySZ、-CO-(CR₁₃R₁₄)_m(CR₁₇=CR₁₈)(CR₁₅R₁₆)_m(OCH₂CH₂)_ySZ、-CONR₁₂(CR₁₃R₁₄)_m(CR₁₅R₁₆)_n(OCH₂CH₂)_ySZ、-フリル-XSZ、-オキサゾリル-XSZ、-チアゾリル-XSZ、-チオフェニル-XSZ、-イミダゾリル-XSZ、-モルホリノ-XSZ、-ピペラジノ-XSZ、-ピペリジノ-XSZ、-CO-フリル-XSZ、-CO-チオフェニル-XSZ、-CO-チアゾリル-XSZ、-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ、-CO-モルホリノ-XSZ、-CO-ピペラジノ-XSZ、-CO-ピペリジノ-

X S Z、または、-CO-N-メチルピペラジノ-X S Zであり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1～10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2～20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

RおよびR_{1 2}は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、R_{1 2}はHであってもよく；

R_{1 3}、R_{1 4}、R_{1 5}およびR_{1 6}は、同一または異なって、Hであるか、または、1～4個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{1 7}およびR_{1 8}は、Hまたはメチルであり；

nは、1～10の整数であり；

mは、1～10の整数であり、または、0であってもよく；および、

yは、1～20の整数であり、または、0であってもよい、請求項6に記載の化合物。

【請求項70】

R₁および/またはR_{1'}および/またはR_{1''}で示される電子求引基は、F、NO₂、CN、Cl、CHF₂、および、CF₃からなる群より選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項71】

R₁および/またはR_{1'}および/またはR_{1''}で示される電子供与基は、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-NR₇R₈、および、-OR₉からなる群より選択され、ここで、R₇およびR₈は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、R₉は、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項6に記載の化合物。

【請求項72】

R₁は、-OCH₃である、請求項6に記載の化合物。

【請求項73】

R₇および/またはR₈は、1～4個の炭素原子を有する、請求項71に記載の化合物。

【請求項74】

R₇およびR₈は、同一である、請求項71に記載の化合物。

【請求項75】

-NR₇R₈は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項71に記載の化合物。

【請求項76】

R₁は、メタ位にあり、R_{1'}およびR_{1''}の一方は、-OCH₃であり、他方は、Hである、請求項6に記載の化合物。

【請求項77】

R₄は、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルであるか、または、C-3'位で-CONH-基と一緒にあって、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項6に記載の化合物。

【請求項78】

R₄は、イソブテニル、プロペニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、R₄は、C-3'位で-CONH-基と一緒にあって、イソブテニル、プロ

ペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 79】

OR₂ および / または OR₅ および / または OR₆ によって形成されるカルバメートは、
 - OCONHCH₂CH₃、- OCONHCH₂CH₂CH₃、- OCO - モルホリノ、
 - OCO - ピペラジノ、- OCO - ピペリジノ、または、- OCO - N - メチルピペラジノである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 80】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 81】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 82】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項 81 に記載の化合物。

【請求項 83】

前記結合基は、
 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、
 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、
 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、
 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、
 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、
 - フリル - XSZ、- オキサゾリル - XSZ、- チアゾリル - XSZ、
 - チオフェニル - XSZ、- イミダゾリル - XSZ、- モルホリノ - XSZ、
 - ピペラジノ - XSZ、- ピペリジノ - XSZ、- CO - フリル - XSZ、- CO - チオフェニル - XSZ、
 - CO - チアゾリル - XSZ、- CO - N - メチルピペラジノ - XSZ、
 - CO - モルホリノ - XSZ、- CO - ピペラジノ - XSZ、- CO - ピペリジノ - XSZ、
 または、- CO - N - メチルピペラジノ - XSZ であり、ここで、

Z は、H または SR であり；

X は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2 ~ 20 個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

R および R₁₂ は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、R₁₂ は H であってもよく；

R₁₃、R₁₄、R₁₅ および R₁₆ は、同一または異なって、H であるか、または、1 ~ 4 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R₁₇ および R₁₈ は、H またはメチルであり；

n は、1 ~ 10 の整数であり；

m は、1 ~ 10 の整数であり、または、0 であってもよく；および、

y は、1 ~ 20 の整数であり、または、0 であってもよい、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 84】

R₁ および / または R₁' および / または R₁" で示される電子求引基は、F、NO₂、CN、Cl、CHF₂、および、CF₃ からなる群より選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 85】

R₁ および / または R₁' および / または R₁" で示される電子供与基は、- OCH₃、
 - OCH₂CH₃、- NR₇R₈、および、- OR₉ からなる群より選択され、ここで、
 R₇ および R₈ は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐

状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 8 6】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 8 7】

R_7 および / または R_8 は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項 8 5 に記載の化合物

【請求項 8 8】

R_7 および R_8 は、同一である、請求項 8 5 に記載の化合物。

【請求項 8 9】

$-NR_7R_8$ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項 8 5 に記載の化合物。

【請求項 9 0】

R_1 は、メタ位にあり、 R_1' および R_1'' の一方は、 $-OCH_3$ であり、他方は、H である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9 1】

R_3 は、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9 2】

R_3 は、イソブテニル、プロベニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルである、請求項 7 に記載の化合物。

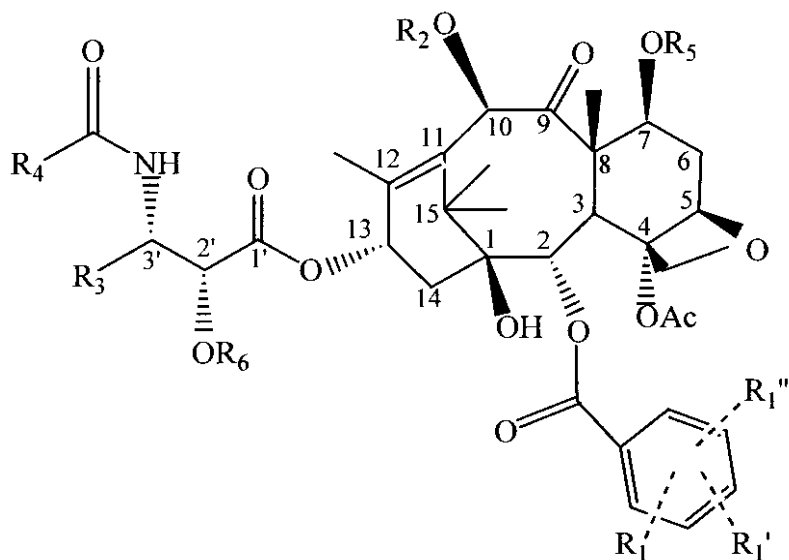
【請求項 9 3】

OR_2 および / または OR_5 および / または OR_6 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO-$ モルホリノ、 $-OCO-$ ピペラジノ、 $-OCO-$ ピペリジノ、または、 $-OCO-N-$ メチルピペラジノである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9 4】

式 (I) :

【化 7】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R_6 は、結合基であり；

R_1 は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_2 は、Hであるか、または、C - 10位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOX で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 - CONR₁₀R₁₁ で示されるカルバメート基（式中、R₁₀ および R₁₁ は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純または置換アリールである）であり；

R_3 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環であり；

R_4 は、1～10個の炭素原子を有するアルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、複素環であるか、または、C - 3'位で - CONH - 基と一緒にあって、1～10個の炭素原子を有する前記アルキル、2～10個の炭素原子を有するアルケニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；および、

R_5 は、Hであるか、または、C - 7位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOX で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 - CONR₁₀R₁₁ で示されるカルバメート基（式中、R₁₀ および R₁₁ は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純または置換アリールである）

である、前記化合物。

【請求項95】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項94に記載の化合物。

【請求項96】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項94に記載の化合物。

【請求項97】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項96に記載の化合物。

【請求項98】

前記結合基は、 - (CR₁₃R₁₄)_m (CR₁₅R₁₆)_n (OCH₂CH₂)_y S

Z、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフェニル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフェニル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1～10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2～20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

Rおよび R_{12} は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、 R_{12} はHであってもよく；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} および R_{16} は、同一または異なって、Hであるか、または、1～4個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R_{17} および R_{18} は、Hまたはメチルであり；

nは、1～10の整数であり；

mは、1～10の整数であり、または、0であってもよく；および、

yは、1～20の整数であり、または、0であってもよい、請求項94に記載の化合物

。

【請求項99】

R_1 および/または R_1' および/または R_1'' で示される電子求引基は、F、 NO_2 、CN、Cl、 CHF_2 、および、 CF_3 からなる群より選択される、請求項94に記載の化合物。

【請求項100】

R_1 および/または R_1' および/または R_1'' で示される電子供与基は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-NR_7R_8$ 、および、 $-OR_9$ からなる群より選択され、ここで、 R_7 および R_8 は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項94に記載の化合物。

【請求項101】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項94に記載の化合物。

【請求項102】

R_7 および/または R_8 は、1～4個の炭素原子を有する、請求項100に記載の化合物。

【請求項103】

R_7 および R_8 は、同一である、請求項100に記載の化合物。

【請求項104】

$-NR_7R_8$ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項100に記載の化合物。

【請求項105】

R_1 は、メタ位にあり、 R_1' および R_1'' の一方は、 $-OCH_3$ であり、他方は、Hである、請求項94に記載の化合物。

【請求項106】

R_3 および R_4 の一方または両方は、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロ

ペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で - CONH - 基と一緒にあって、プロペニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフェニルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 94 に記載の化合物。

【請求項 107】

R_3 および R_4 の一方または両方は、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で - CONH - 基と一緒にあって、イソブテニル、プロペニル、チオフェニル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 94 に記載の化合物。

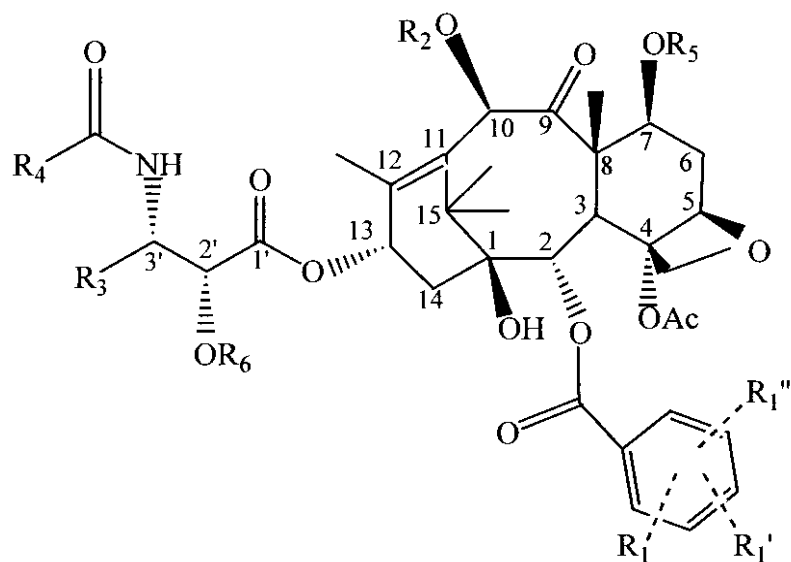
【請求項 108】

OR_2 および / または OR_5 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO$ -モルホリノ、 $-OCO$ -ピペラジノ、 $-OCO$ -ピペリジノ、または、 $-OCO$ -N-メチルピペラジノである、請求項 94 に記載の化合物。

【請求項 109】

式 (I) :

【化 8】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R_2 は、結合基であり；

R_1 は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_1' および R_1'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R_3 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有するアルキルまたはアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環であり；

R_4 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有するアルキル、2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、複素環であるか、または、C - 3' 位で - CONH - 基と一緒にあって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する前記アルキル、2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原

子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリアルまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；

R_5 は、Hであるか、または、C - 7位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリアルエーテル基、複素環またはアリアルエステル基、複素環またはアリアルカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1 ~ 10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2 ~ 10個の炭素原子を有する）、1 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - $OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 - $CONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、H、1 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6 ~ 10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリアルである）であり；および、

R_6 は、Hであるか、または、C - 2'位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリアルエーテル基、複素環またはアリアルエステル基、複素環またはアリアルカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1 ~ 10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2 ~ 10個の炭素原子を有する）、1 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - $OCOX$ で示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 - $CONR_{10}R_{11}$ で示されるカルバメート（式中、 R_{10} および R_{11} は、同一または異なって、H、1 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6 ~ 10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリアルである）である、前記化合物。

【請求項110】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項109に記載の化合物。

【請求項111】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項109に記載の化合物。

【請求項112】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項111に記載の化合物。

【請求項113】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1 ~ 10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2 ~ 20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

R および R₁₂ は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリアル、または、複素環であり、加えて、R₁₂ は H であってもよく；

R₁₃、R₁₄、R₁₅ および R₁₆ は、同一または異なって、H であるか、または、1 ~ 4 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R₁₇ および R₁₈ は、H またはメチルであり；

n は、1 ~ 10 の整数であり；

m は、1 ~ 10 の整数であり、または、0 であってもよく；および、

y は、1 ~ 20 の整数であり、または、0 であってもよい、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 114】

R₁ および / または R_{1'} および / または R_{1''} で示される電子求引基は、F、NO₂、CN、Cl、CHF₂、および、CF₃ からなる群より選択される、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 115】

R₁ および / または R_{1'} および / または R_{1''} で示される電子供与基は、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-NR₇R₈、および、-OR₉ からなる群より選択され、ここで、R₇ および R₈ は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリアルであり、R₉ は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 116】

R₁ は、-OCH₃ である、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 117】

R₇ および / または R₈ は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項 115 に記載の化合物。

【請求項 118】

R₇ および R₈ は、同一である、請求項 115 に記載の化合物。

【請求項 119】

-NR₇R₈ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項 115 に記載の化合物。

【請求項 120】

R₁ は、メタ位にあり、R_{1'} および R_{1''} の一方は、-OCH₃ であり、他方は、H である、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 121】

R₃ および R₄ の一方または両方は、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ペペリジノ、ペペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルであるか、または、R₄ は、C - 3' 位で -CONH - 基と一緒にあって、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ペペリジノ、ペペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 122】

R₃ および R₄ の一方または両方は、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、R₄ は、C - 3' 位で -CONH - 基と一緒にあって、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項 109 に記載の化合物。

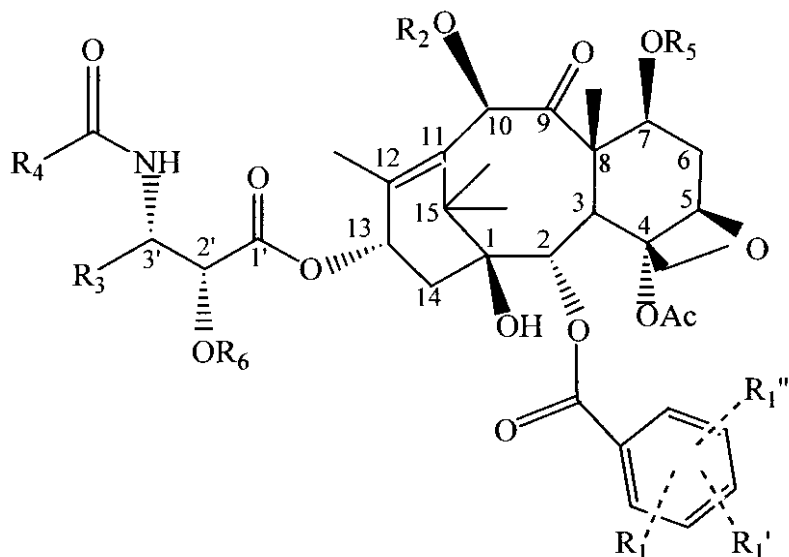
【請求項 1 2 3】

OR₅ および / または OR₆ によって形成されるカルバメートは、-OCONHCH₂CH₃、-OCONHCH₂CH₂CH₃、-OCO-モルホリノ、-OCO-ピペラジノ、-OCO-ピペリジノ、または、-OCO-N-メチルピペラジノである、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 1 2 4】

式 (I) :

【化 9】



式 (I)

で示される化合物であって、式中：

R₅ は、結合基であり；

R₁ は、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R₁' および R₁'' は、同一または異なって、H、電子求引基、または、電子供与基であり；

R₂ は、Hであるか、または、C - 10 位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1 ~ 10 個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2 ~ 10 個の炭素原子を有する）、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOX で示されるカルバメート基（式中、X は、窒素含有複素環基である）、または、式 - OCONR₁₀R₁₁ で示されるカルバメート（式中、R₁₀ および R₁₁ は、同一または異なって、H、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6 ~ 10 個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）；

R₃ は、1 ~ 10 個の炭素原子を有するアルキルまたはアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリール、または、複素環であり；

R₄ は、1 ~ 10 個の炭素原子を有するアルキル、2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルまたはシクロアルケニル、複素環であるか、または、C - 3' 位で - CONH - 基と一緒にあって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する前記アルキル、2 ~ 10 個の炭素原子を有するアルケニル、3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルもしくはシクロアルケニル、アリールまたは複素環のいずれかと、酸素原子とから形成されるカルバメートであり；および、

R_6 は、Hであるか、または、C - 2'位で酸素原子と一緒にあって、複素環またはアリールエーテル基、複素環またはアリールエステル基、複素環またはアリールカルバメート基、直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエステル基（前記アルキルは、1～10個の炭素原子を有する）、直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエステル基（前記アルケニルは、2～10個の炭素原子を有する）、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルエーテル基、2～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルケニルエーテル基、式 - OCOXで示されるカルバメート基（式中、Xは、窒素含有複素環基である）、または、式 - CONR₁₀R₁₁で示されるカルバメート基（式中、R₁₀およびR₁₁は、同一または異なって、H、1～10個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル、または、6～10個の炭素原子を有する単純もしくは置換アリールである）である、前記化合物。

【請求項125】

前記結合基は、ジスルフィド結合、チオエーテル結合、酸不安定性の結合、光不安定性の結合、ペプチダーゼ不安定性の結合、または、エステラーゼ不安定性の結合を形成し得る基である、請求項124に記載の化合物。

【請求項126】

前記結合基は、ジスルフィド結合、または、チオエーテル結合を形成し得る基である、請求項124に記載の化合物。

【請求項127】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項126に記載の化合物。

【請求項128】

前記結合基は、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CO-(CR_{13}R_{14})_m(CR_{17}=CR_{18})(CR_{15}R_{16})_m(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-CONR_{12}(CR_{13}R_{14})_m(CR_{15}R_{16})_n(OCH_2CH_2)_ySZ$ 、 $-フリル-XSZ$ 、 $-オキサゾリル-XSZ$ 、 $-チアゾリル-XSZ$ 、 $-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-イミダゾリル-XSZ$ 、 $-モルホリノ-XSZ$ 、 $-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-ピペリジノ-XSZ$ 、 $-CO-フリル-XSZ$ 、 $-CO-チオフエンイル-XSZ$ 、 $-CO-チアゾリル-XSZ$ 、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-モルホリノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペラジノ-XSZ$ 、 $-CO-ピペリジノ-XSZ$ 、または、 $-CO-N-メチルピペラジノ-XSZ$ であり、ここで、

Zは、HまたはSRであり；

Xは、1～10個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキル、または、2～20個のエチレンオキシ反復単位を有するポリエチレングリコールのスペーサーであり；

RおよびR₁₂は、同一または異なって、1～10個の炭素原子を有する直鎖状アルキル、分岐状アルキルまたは環状アルキル、または、単純もしくは置換アリール、または、複素環であり、加えて、R₁₂はHであってもよく；

R₁₃、R₁₄、R₁₅およびR₁₆は、同一または異なって、Hであるか、または、1～4個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分岐状アルキルであり；

R₁₇およびR₁₈は、Hまたはメチルであり；

nは、1～10の整数であり；

mは、1～10の整数であり、または、0であってもよく；および、

yは、1～20の整数であり、または、0であってもよい、請求項124に記載の化合物。

【請求項129】

R₁および/またはR₁'および/またはR₁"で示される電子求引基は、F、NO₂、CN、Cl、CHF₂、および、CF₃からなる群より選択される、請求項124に記載

載の化合物。

【請求項130】

R_1 および / または R_1' および / または R_1'' で示される電子供与基は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-NR_7R_8$ 、および、 $-OR_9$ からなる群より選択され、ここで、 R_7 および R_8 は、同一または異なって、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキル基、または、単純もしくは置換アリールであり、 R_9 は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖状、分岐状もしくは環状アルキルである、請求項124に記載の化合物。

【請求項131】

R_1 は、 $-OCH_3$ である、請求項124に記載の化合物。

【請求項132】

R_7 および / または R_8 は、1 ~ 4 個の炭素原子を有する、請求項130に記載の化合物。

【請求項133】

R_7 および R_8 は、同一である、請求項130に記載の化合物。

【請求項134】

$-NR_7R_8$ は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、または、ジブチルアミノであり、ここで、ブチル部分は、第一、第二、第三またはイソブチルのいずれかである、請求項130に記載の化合物。

【請求項135】

R_1 は、メタ位にあり、 R_1' および R_1'' の一方は、 $-OCH_3$ であり、他方は、H である、請求項124に記載の化合物。

【請求項136】

前記結合基は、チオールまたはジスルフィド基を有する、直鎖状もしくは分岐状アルキル、アルケニル、シクロアルケニル、芳香環、複素環、または、ポリエチレングリコールを含む、請求項135に記載の化合物。

【請求項137】

R_3 および R_4 の一方または両方は、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、プロベニル、イソブテニル、ヘキセニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、フリル、ピロリル、チオフエンイル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジノ、ピペラジノ、オキサゾリル、インドリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチオフエンイルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項124に記載の化合物。

【請求項138】

R_3 および R_4 の一方または両方は、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルであるか、または、 R_4 は、C - 3' 位で $-CONH-$ 基と一緒にあって、イソブテニル、プロベニル、チオフエンイル、チアゾリルまたはフリルと、酸素原子とから形成されるカルバメートである、請求項124に記載の化合物。

【請求項139】

OR_2 および / または OR_6 によって形成されるカルバメートは、 $-OCONHCH_2CH_3$ 、 $-OCONHCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCO-$ モルホリノ、 $-OCO-$ ピペラジノ、 $-OCO-$ ピペリジノ、または、 $-OCO-N-$ メチルピペラジノである、請求項124に記載の化合物。

【請求項140】

R_2 は、H である、請求項94に記載の化合物。