

【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20年7月10日(2008.7.10)

【公表番号】特表2008-500391(P2008-500391A)

【公表日】平成20年1月10日(2008.1.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-001

【出願番号】特願2007-527494(P2007-527494)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/26 (2006.01)

C 0 7 D 221/18 (2006.01)

C 0 7 D 239/70 (2006.01)

C 0 7 D 237/26 (2006.01)

C 0 7 D 241/38 (2006.01)

C 0 7 D 209/58 (2006.01)

C 0 7 D 235/02 (2006.01)

C 0 7 D 263/52 (2006.01)

C 0 7 D 307/77 (2006.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 C 231/14 (2006.01)

C 0 7 C 319/20 (2006.01)

C 0 7 C 323/61 (2006.01)

C 0 7 B 53/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 237/26 C S P

C 0 7 D 221/18

C 0 7 D 239/70

C 0 7 D 237/26

C 0 7 D 241/38

C 0 7 D 209/58

C 0 7 D 235/02 B

C 0 7 D 263/52

C 0 7 D 307/77

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 2 3

C 0 7 C 231/14

C 0 7 C 319/20

C 0 7 C 323/61

C 0 7 B 53/00 C

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月20日(2008.5.20)

【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

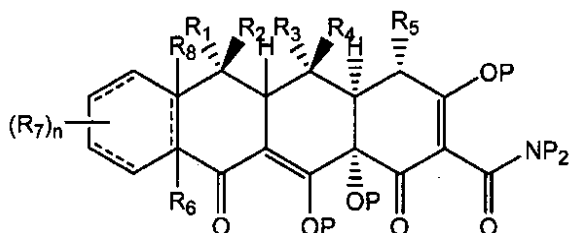
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：
【化 1】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

R_6 および R_8 は、もし、 R_6 および R_8 が結合する炭素原子間の点線が結合を表わすなら、存在せず、または、それぞれ別個に、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、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

各 P は、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである；

n は、 $0 \sim 8$ （それらの数を含めて）の範囲の整数である；そして

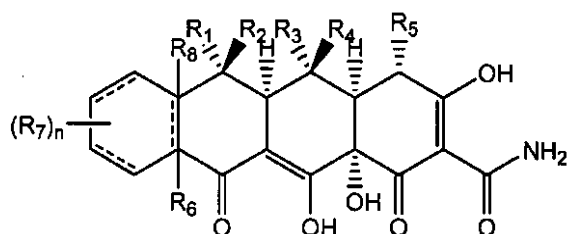
点線は、結合または結合不在を表わす、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 2】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

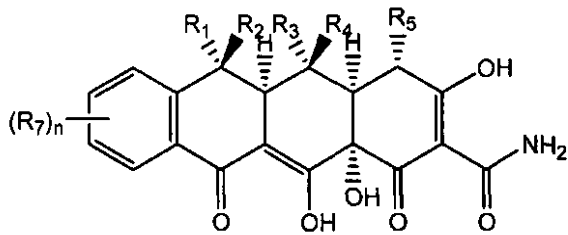
【化 2】



【請求項 3】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

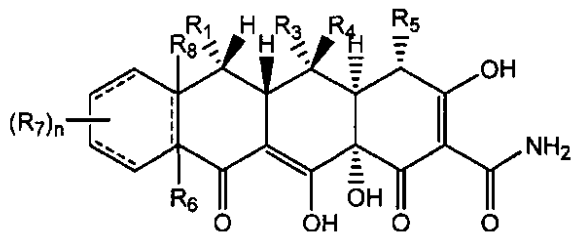
【化 3】



【請求項 4】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

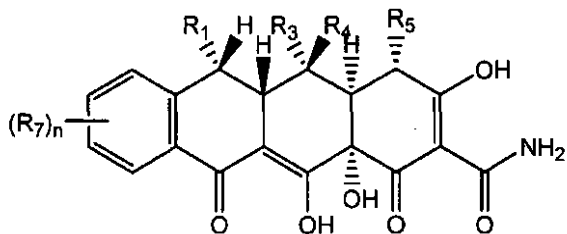
【化 4】



【請求項 5】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

【化 5】



【請求項 6】

R_1 が、水素；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； $-OR_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在が、別個に、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る、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_1 が、水素または低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R_1 が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R_2 が、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； $-OR_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_C の各存在が、別個に、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る、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R₂ が、-OR_B である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

R₂ が、-OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

R₂ が、-H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R₂ が、低級 (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

R₂ が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

R₃ が、水素、-OR_C、または低級 (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

R₃ が、-OR_C である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

R₃ が、-OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

R₃ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

R₄ が、水素、-OR_D、または低級 (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

R₄ が、-OR_D である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 21】

R₄ が、-OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 22】

R₄ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 23】

R₃ および R₄ が、それぞれ、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 24】

R₃ が、-OR_C であり、そして R₄ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 25】

R₃ が、-OH であり、そして R₄ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 26】

R₅ が、-N(R_E)₂ または -OR_E である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

R_E が、水素または低級 (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 28】

R₅ が、-N(R_E)₂ であり、そして R_E が、水素または低級 (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 29】

R₅ が、-N(CH₃)₂ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 30】

R₆ および R₈ が、存在せず、そして R₆ および R₈ が結合する炭素間の点線が、結合を表わす、請求項 1 に記載の化合物。

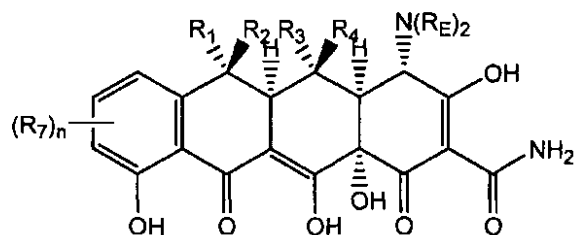
【請求項 31】

R₆ および R₈ が、それぞれ、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 32】

次式の請求項 1 に記載の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 6】



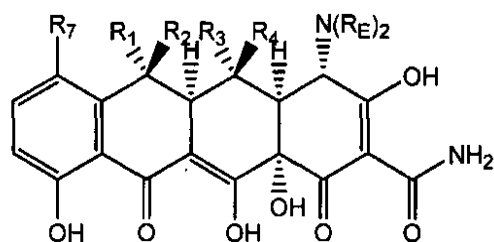
ここで、 R_E は、水素または低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキル基からなる群から選択される；
 n は、0 ~ 3 (それらの数を含めて) の範囲の整数である、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 3 3】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

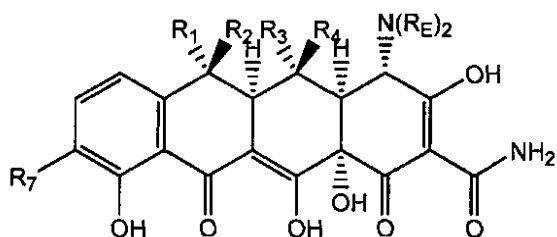
【化 7】



【請求項 3 4】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

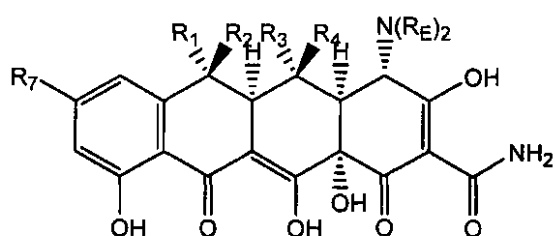
【化 8】



【請求項 3 5】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

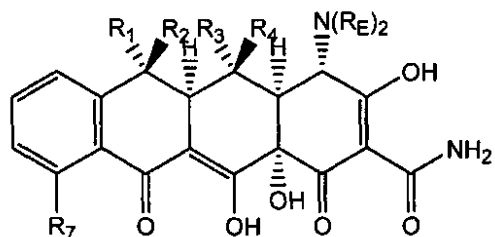
【化 9】



【請求項 3 6】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

【化 10】



【請求項 37】

n が、2である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 38】

n が、3である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 39】

n が、4である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 40】

R_7 が、 $-OR_G$ である、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 41】

R_7 が、 $-SR_G$ である、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 42】

R_7 が、 $-N(R_G)_2$ または $-NHC(O)R_G$ である、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 43】

R_7 が、 $-C(R_G)_3$ である、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 44】

R_7 が、 $-CH_2R_G$ である、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 45】

R_7 が、ハロゲンである、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

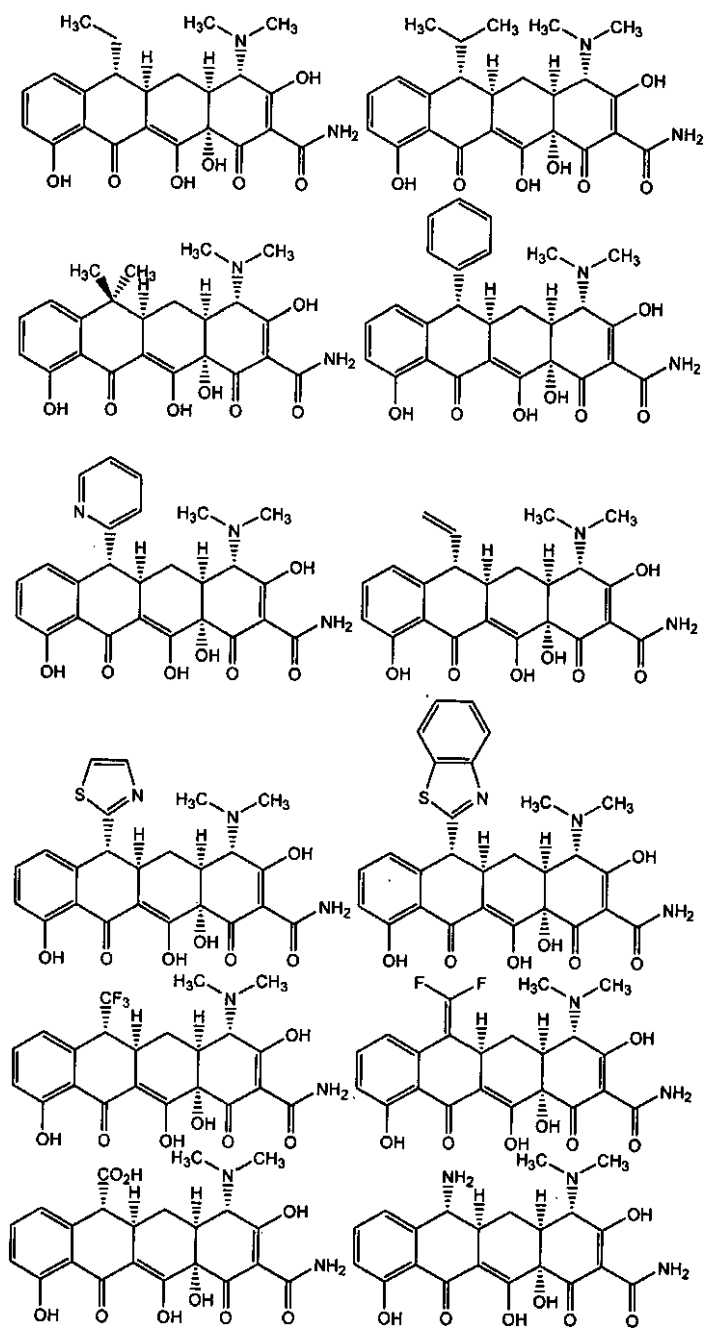
【請求項 46】

R_7 が、置換または非置換フェニル環ではない、請求項 33、34、35または36に記載の化合物。

【請求項 47】

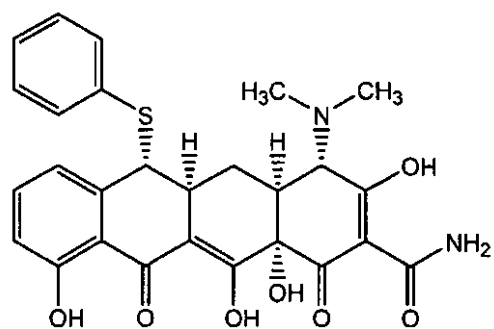
以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

【化 1 1】



および

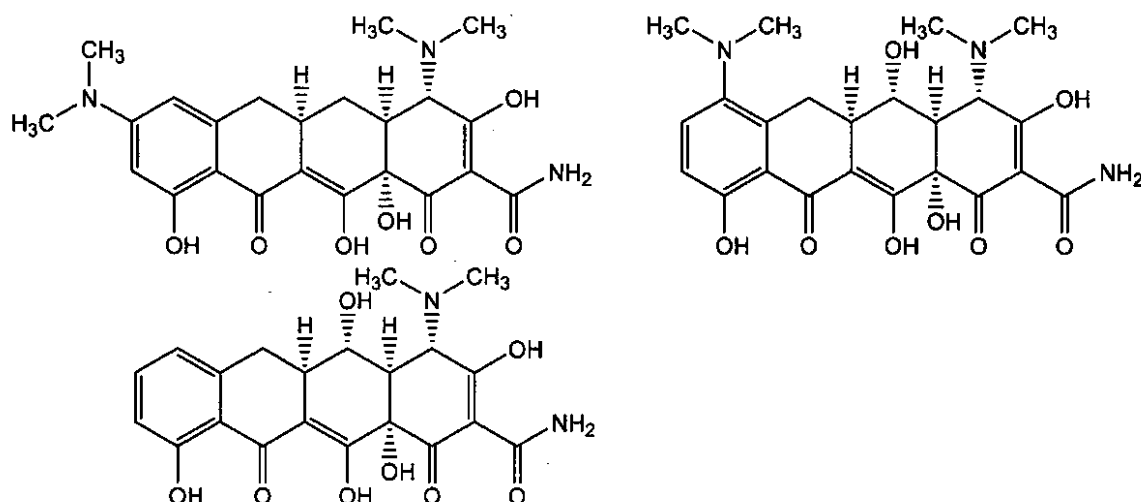
【化 1 2】



【請求項 4 8】

以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

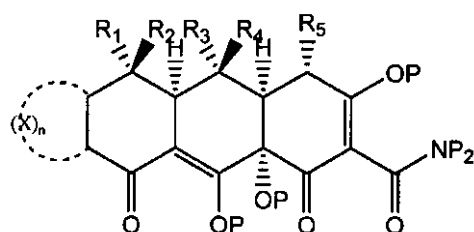
【化 1 3】



【請求項 4 9】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 1 4】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

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； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ；

; $-\text{CO}_2\text{R}_\text{C}$; $-\text{CN}$; $-\text{SCN}$; $-\text{SR}_\text{C}$; $-\text{SOR}_\text{C}$; $-\text{SO}_2\text{R}_\text{C}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{N}(\text{R}_\text{C})_2$; $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}_\text{C}$; あるいは $-\text{C}(\text{R}_\text{C})_3$ である; ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る;

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; $-\text{OR}_\text{D}$; $=\text{O}$; $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_\text{D}$; $-\text{CO}_2\text{R}_\text{D}$; $-\text{CN}$; $-\text{SCN}$; $-\text{SR}_\text{D}$; $-\text{SOR}_\text{D}$; $-\text{SO}_2\text{R}_\text{D}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{N}(\text{R}_\text{D})_2$; $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}_\text{D}$; あるいは $-\text{C}(\text{R}_\text{D})_3$ である; ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る;

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; $-\text{OR}_\text{E}$; $-\text{CN}$; $-\text{SCN}$; $-\text{SR}_\text{E}$; または $-\text{N}(\text{R}_\text{E})_2$ である; ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る;

各 P は、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである;

【化 15】



は、置換または非置換アリール、ヘテロアリール、炭素環または複素環部分を表わし、ここで、 X の各存在は、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NR}_7-$ 、 $-\text{C}(\text{R}_7)_2-$ からなる群から選択される; n は、1 ~ 5 (それらの数を含めて) の範囲の整数である; そして隣接 X 部分間の結合は、単結合または二重結合のいずれかである、

化合物、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。

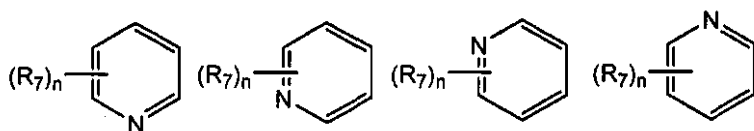
【請求項 50】

【化 16】



が、以下からなる群から選択される、請求項 49 に記載の化合物:

【化 17】



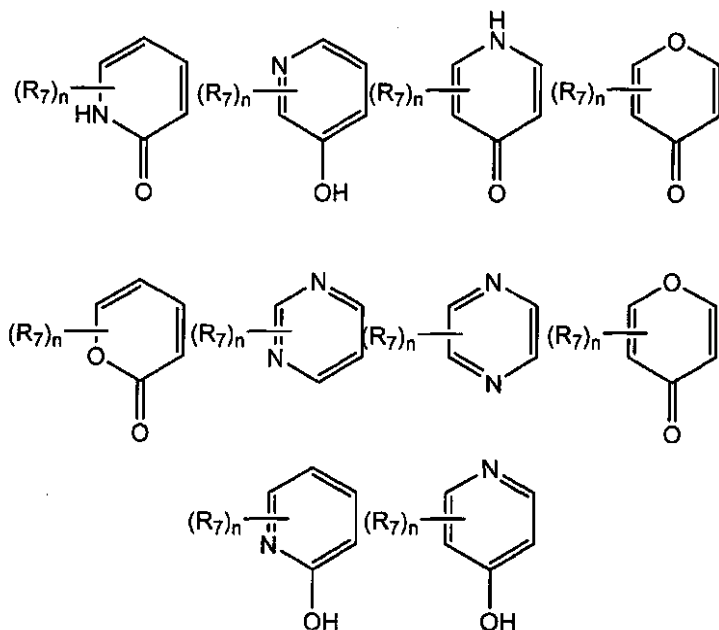
【請求項 51】

【化 1 8】



が、以下からなる群から選択される、請求項 4 9 に記載の化合物：

【化 1 9】



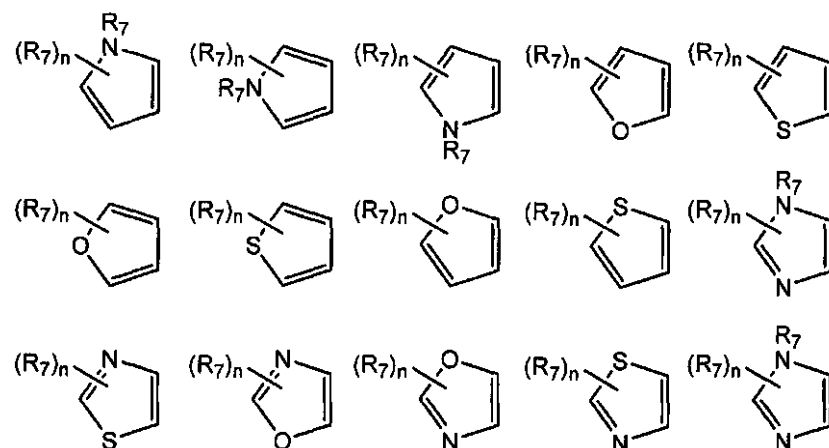
【請求項 5 2】

【化 2 0】



が、以下からなる群から選択される、請求項 4 9 に記載の化合物：

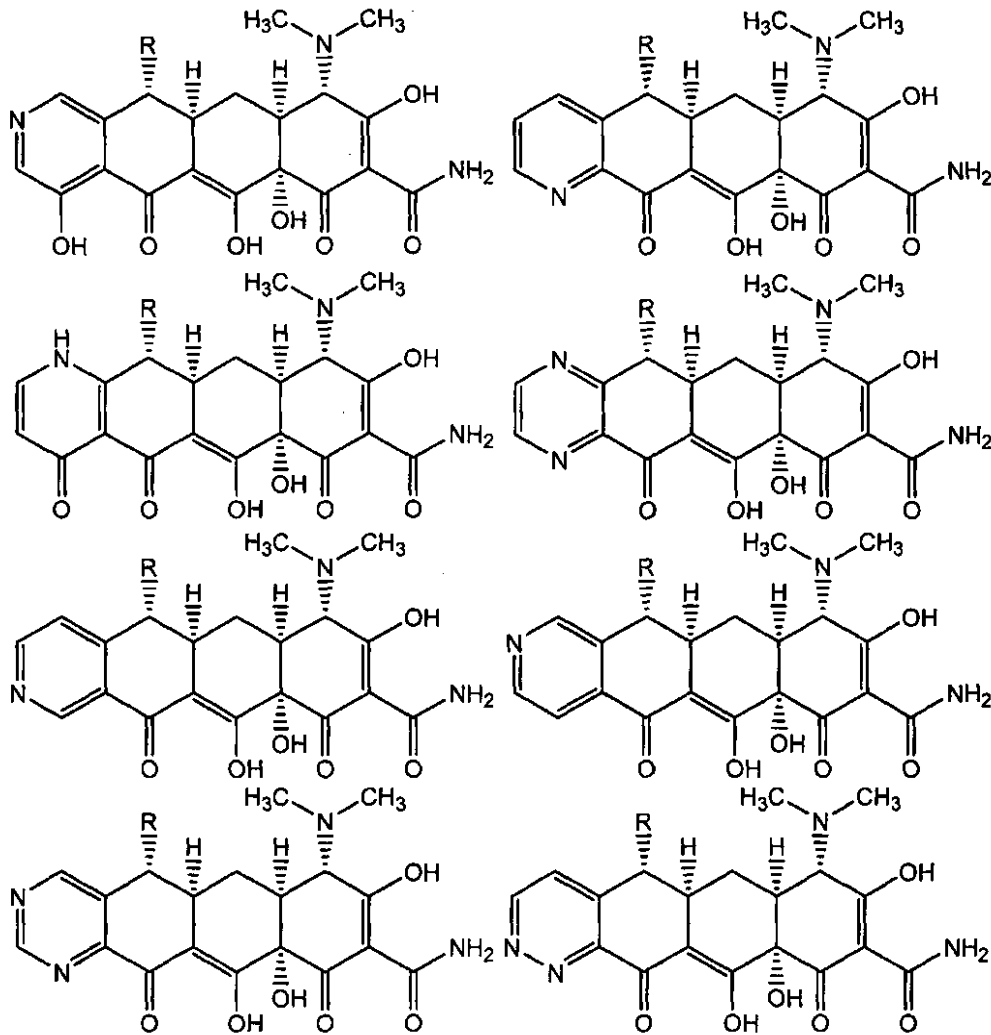
【化 2 1】



【請求項 5 3】

以下からなる群から選択される、請求項 4 9 に記載の化合物：

【化 2 2】

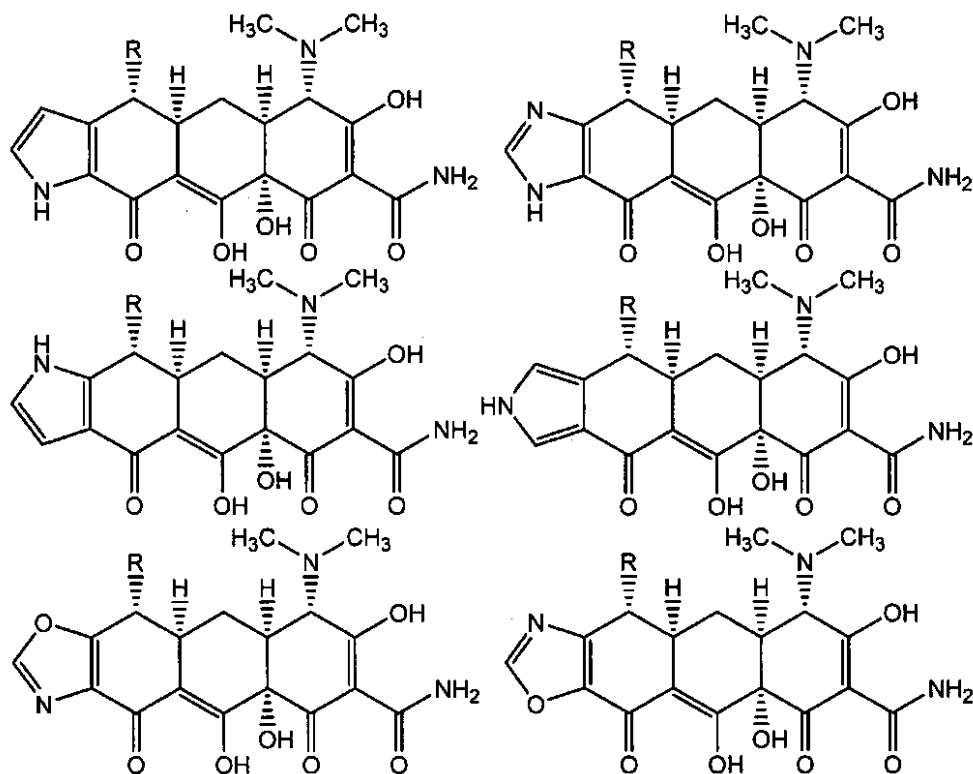


ここで、Rは、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-\text{OR}_A$ ； $=\text{O}$ ； $-\text{C}(=\text{O})\text{R}'$ ； $-\text{CO}_2\text{R}'$ ； $-\text{CN}$ ； $-\text{SCN}$ ； $-\text{SR}'$ ； $-\text{SOR}'$ ； $-\text{SO}_2\text{R}'$ ； $-\text{NO}_2$ ； $-\text{N}(\text{R}')_2$ ； $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}'$ ；あるいは $-\text{C}(\text{R}')_3$ である；ここで、R'の各存在は、別個に、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る、化合物。

【請求項 5 4】

以下からなる群から選択される、請求項 4 9 に記載の化合物：

【化 2 3】



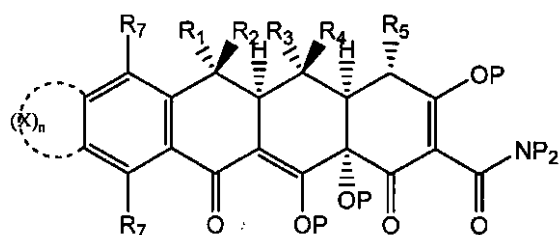
ここで、R は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R'$ ； $-CO_2R'$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR'$ ； $-SOR'$ ； $-SO_2R'$ ； $-NO_2$ ； $-N(R')_2$ ； $-NHC(O)R'$ ；あるいは $-C(R')_3$ である；ここで、 R' の各存在は、別個に、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る、

化合物。

【請求項 5 5】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 2 4】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで

、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

各 R_7 は、別個に、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

各 P は、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである；

【化 2 5】



は、置換または非置換アリール、ヘテロアリール、炭素環または複素環部分を表わし、ここで、X の各存在は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR_8-$ 、 $-C(R_8)_2-$ からなる群から選択される；

R_8 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；あるいは $-C(R_H)_3$ である；ここで、 R_H の各存在は、別個に、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る；

n は、1 ~ 5（それらの数を含めて）の範囲の整数である；そして

隣接 X 部分間の結合は、単結合または二重結合のいずれかである、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

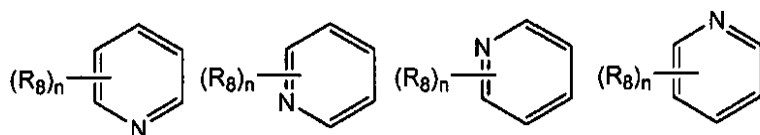
【請求項 5 6】

【化 2 6】



が、以下からなる群から選択される、請求項 5 5 に記載の化合物：

【化 2 7】



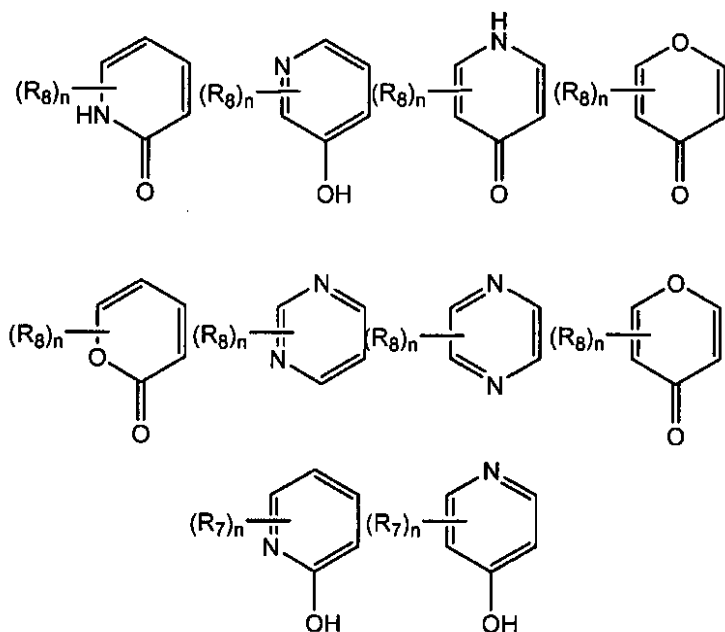
【請求項 5 7】

【化 2 8】



が、以下からなる群から選択される、請求項 5 5 に記載の化合物：

【化 2 9】



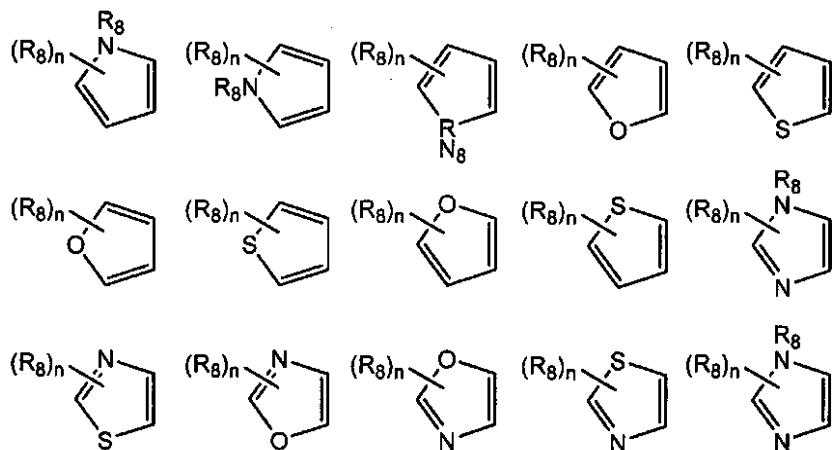
【請求項 5 8】

【化 3 0】



が、以下からなる群から選択される、請求項 5 5 に記載の化合物：

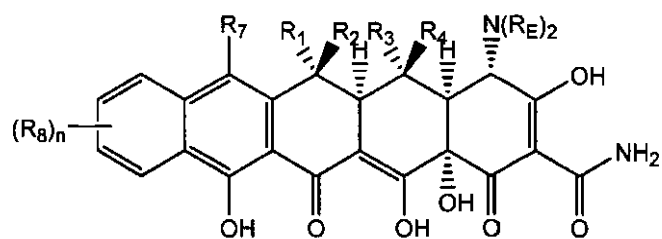
【化 3 1】



【請求項 5 9】

以下からなる群から選択される、請求項 5 5 に記載の化合物：

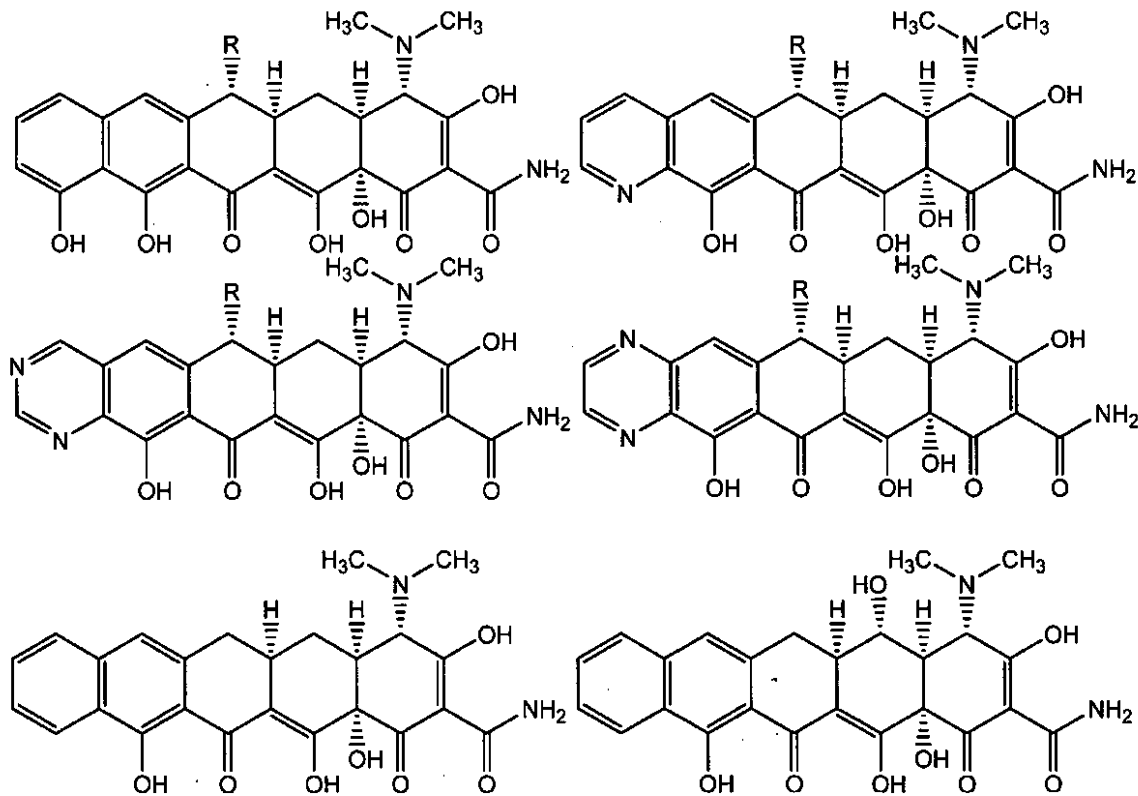
【化 3 2】



【請求項 6 0】

以下からなる群から選択される、請求項 55 に記載の化合物：

【化 33】

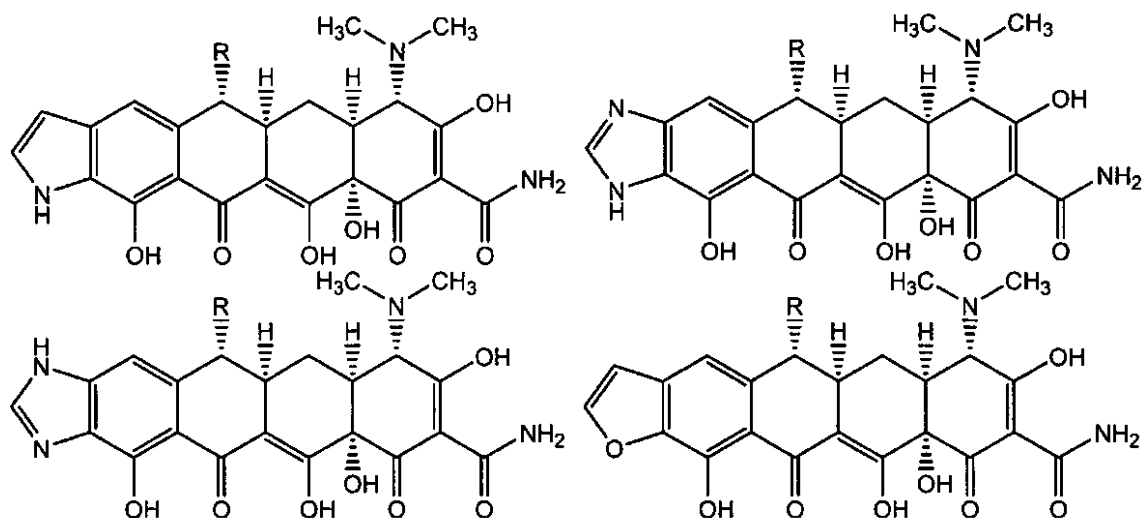


ここで、R は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R'$ ； $-CO_2R'$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR'$ ； $-SOR'$ ； $-SO_2R'$ ； $-NO_2$ ； $-N(R')_2$ ； $-NHC(O)R'$ ；あるいは $-C(R')_3$ である；ここで、 R' の各存在は、別個に、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る、化合物。

【請求項 61】

以下からなる群から選択される、請求項 55 に記載の化合物：

【化 3 4】



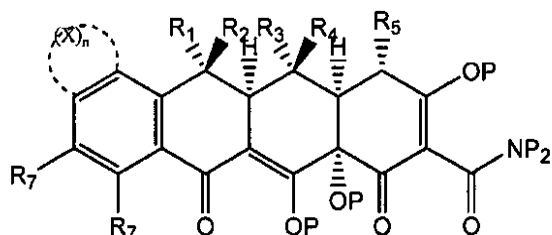
ここで、R は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R'$ ； $-CO_2R'$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR'$ ； $-SOR'$ ； $-SO_2R'$ ； $-NO_2$ ； $-N(R')_2$ ； $-NHC(O)R'$ ；あるいは $-C(R')_3$ である；ここで、 R' の各存在は、別個に、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る、

化合物。

【請求項 6 2】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 3 5】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置

換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

各Pは、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである；

【化 3 6】



は、置換または非置換アリール、ヘテロアリール、炭素環または複素環部分を表わし、ここで、Xの各存在は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR_8-$ 、 $-C(R_8)_2-$ からなる群から選択される；

R_8 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_H$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_H$ ； $-CO_2R_H$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_H$ ； $-SOR_H$ ； $-SO_2R_H$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_H)_2$ ； $-NHC(O)R_H$ ；あるいは $-C(R_H)_3$ である；ここで、 R_H の各存在は、別個に、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る；

nは、1～5（それらの数を含めて）の範囲の整数である；そして

隣接X部分間の結合は、単結合または二重結合のいずれかである、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

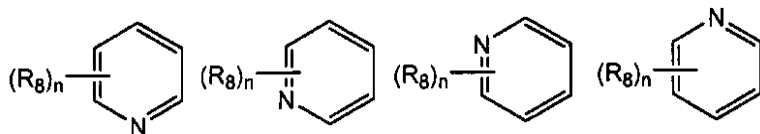
【請求項 6 3】

【化 3 7】



が、以下からなる群から選択される、請求項 6 2 に記載の化合物：

【化 3 8】



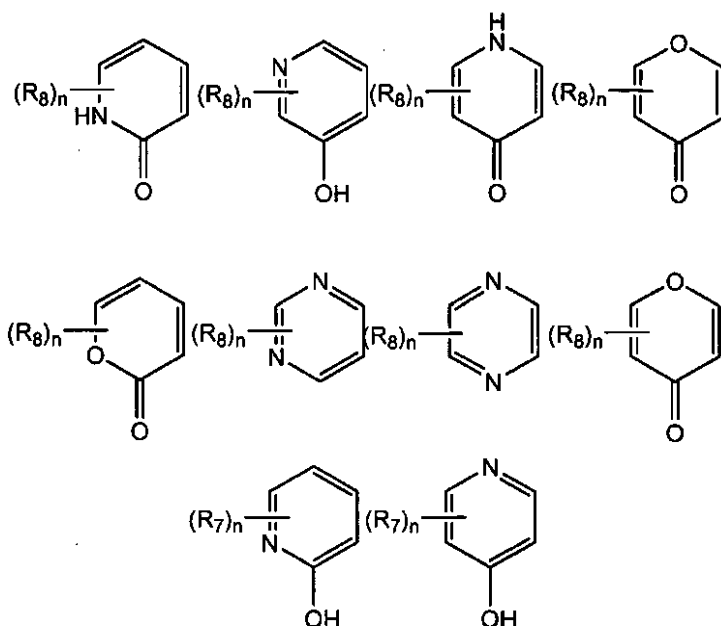
【請求項 6 4】

【化 3 9】



が、以下からなる群から選択される、請求項 6 2 に記載の化合物：

【化 4 0】



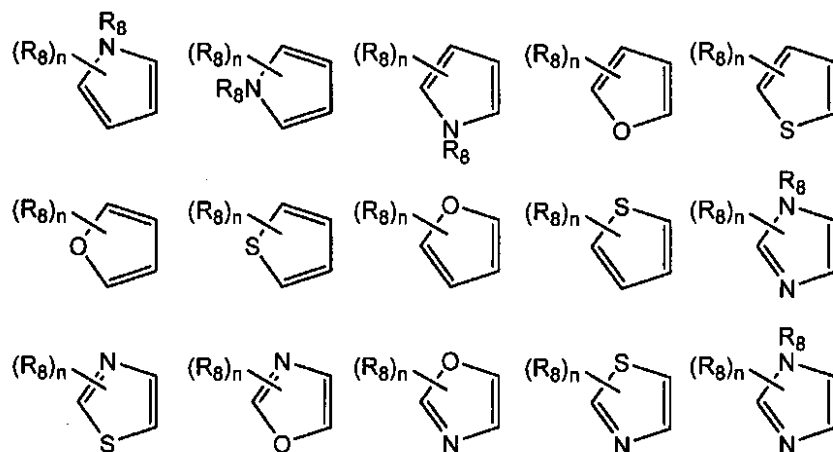
【請求項 65】

【化 4 1】



が、以下からなる群から選択される、請求項 62 に記載の化合物：

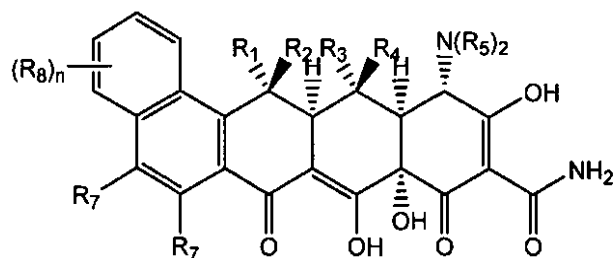
【化 4 2】



【請求項 66】

以下からなる群から選択される、請求項 62 に記載の化合物：

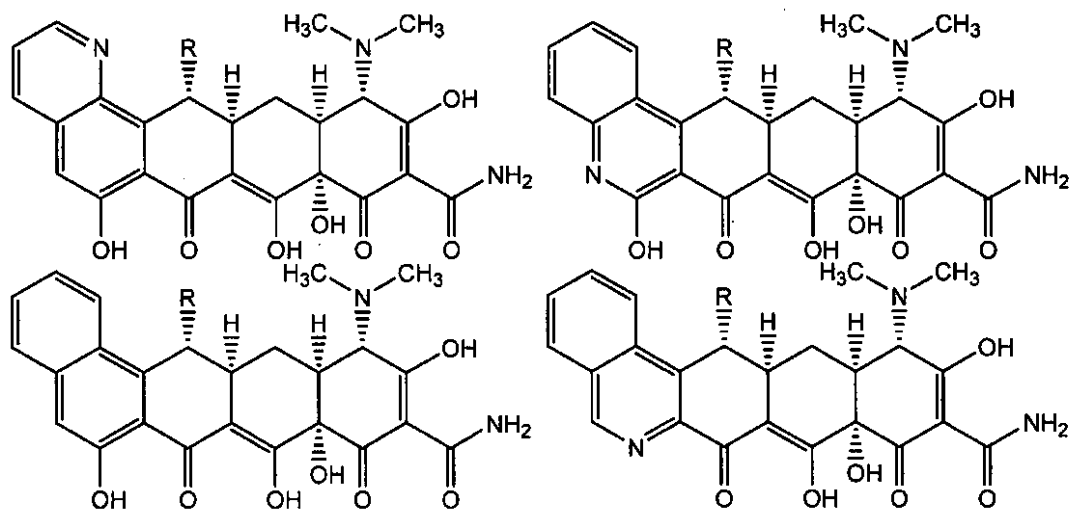
【化 4 3】



【請求項 67】

以下からなる群から選択される、請求項 62 に記載の化合物：

【化 44】



ここで、R 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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R'$ ； $-CO_2R'$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR'$ ； $-SOR'$ ； $-SO_2R'$ ； $-NO_2$ ； $-N(R')_2$ ； $-NHC(O)R'$ ；あるいは $-C(R')_3$ である；ここで、 R' の各存在は、別個に、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る、

化合物。

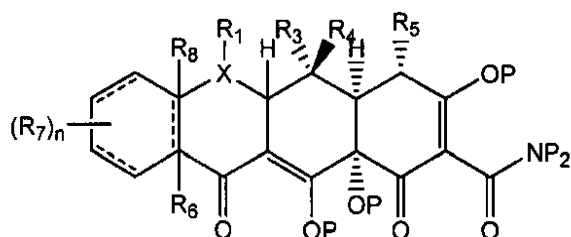
【請求項 68】

前記化合物が、(-) - テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、デメクロサイクリン、メタサイクリン、サンサイクリン、(-) - ドキシサイクリン、オーレオマイシン、テラマイシン、チゲサイクリン、およびミノサイクリンではない、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 69】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 45】



ここで、X は、N、S または O である；

R_1 は、存在しないか；水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；

ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

R_6 および R_8 は、もし、 R_6 および R_8 が結合する炭素原子間の点線が結合を表わすなら、存在せず、または、それぞれ別個に、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、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

各 P は、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである；

n は、0 ~ 8 (それらの数を含めて) の範囲の整数である ; そして
 点線は、結合または結合不在を表わす、
 化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

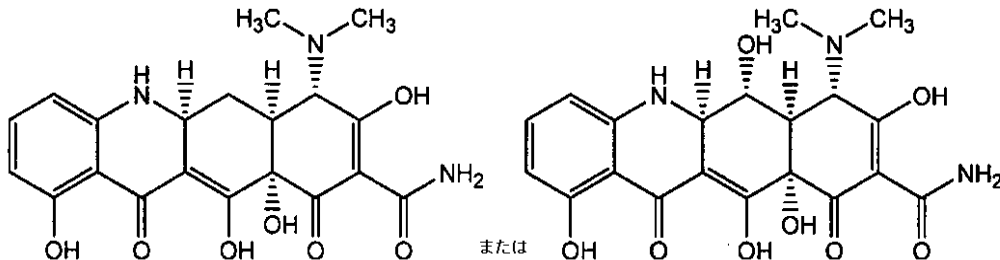
【請求項 7 0】

X が、N である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 1】

次式の請求項 6 9 に記載の化合物 :

【化 4 6】



【請求項 7 2】

請求項 1 に記載の化合物と薬学的に受容可能な賦形剤とを含有する、医薬組成物。

【請求項 7 3】

感染を治療するための組成物であって、該感染を治すのに十分な量の請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 7 4】

前記感染が、グラム陽性生物体により、引き起こされる、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 5】

前記感染が、グラム陰性生物体により、引き起こされる、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 6】

前記感染が、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、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 7】

前記感染が、テトラサイクリンに耐性である生物体により、引き起こされる、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 7 8】

前記感染が、メチシリンに耐性である生物体により、引き起こされる、請求項 7 3 に記載の組成物。

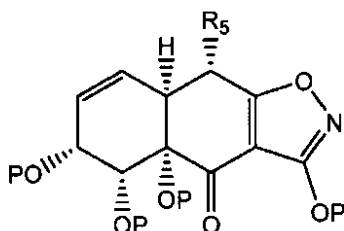
【請求項 7 9】

前記感染が、バンコマイシンに耐性である生物体により、引き起こされる、請求項 7 3 に記載の組成物。

【請求項 8 0】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体 :

【化 4 7】



ここで、R₅ は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリー

ル；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；そして

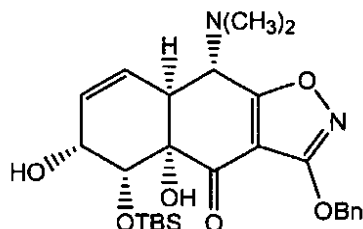
Pは、別個に、水素または保護基からなる群から選択される、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 81】

次式の請求項 80 に記載の化合物：

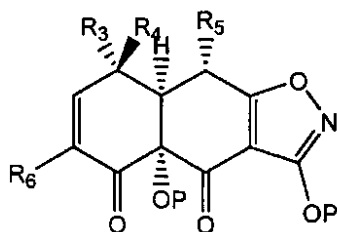
【化 48】



【請求項 82】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 49】



ここで、 R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂

肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

Pは、別個に、水素または保護基からなる群から選択される、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 8 3】

R_3 および R_4 の各々が、別個に、水素；ハロゲン； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ；または低級アルキル ($C_1 \sim C_6$) 基からなる群から選択される、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 4】

R_3 および R_4 の両方が、水素である、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 5】

R_3 が、メチルである；そして R_4 が、水素である、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 6】

R_5 が、 $-N(R_E)_2$ である、請求項 8 0 または 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 7】

R_E が、水素または低級アルキル ($C_1 \sim C_6$) 基からなる群から選択される、請求項 8 6 に記載の化合物。

【請求項 8 8】

両方の R_E が、メチル基である、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 8 9】

R_6 が、水素である、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 9 0】

R_6 が、 $-SAr$ であり、ここで、 Ar が、置換または非置換アリールまたはヘテロアリール部分である、請求項 8 2 に記載の化合物。

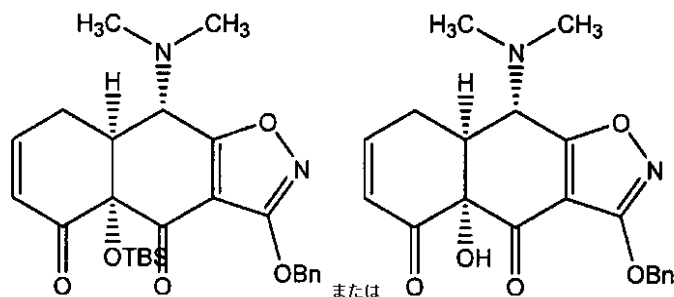
【請求項 9 1】

R_6 が、 $-SPh$ であり、ここで、 Ph が、置換または非置換フェニル部分である、請求項 8 2 に記載の化合物。

【請求項 9 2】

次式の請求項 8 2 に記載の化合物：

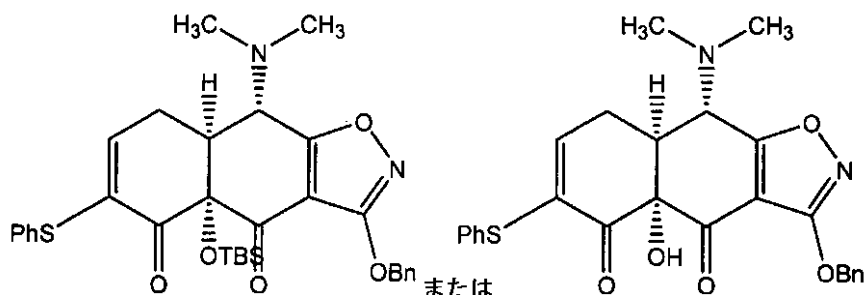
【化 5 0】



【請求項 9 3】

次式の請求項 8 2 に記載の化合物：

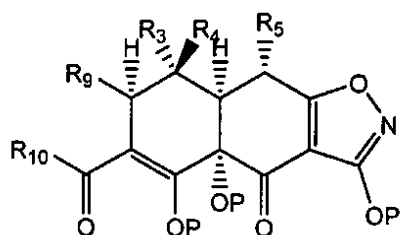
【化 5 1】



【請求項 9 4】

次式の化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体：

【化 5 2】



ここで、 R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

P は、水素または保護基である；

R_9 は、水素；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； $-OR_i$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_i$ ；あるいは $-N(R_i)_2$ である；ここで、 R_i の各存在は、別個に、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る；そして

R_{10} 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；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リール；あるいは置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール部分である、

化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

【請求項 9 5】

R_5 が、 $-N(R_E)_2$ であり、ここで、 R_E が、水素または低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキルである、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 6】

R_4 が、水素である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 7】

R_9 が、低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキル、アルケニル、またはアルキニル部分である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 8】

R_{10} が、置換または非置換アリール部分である、請求項 9 4 に記載の化合物。

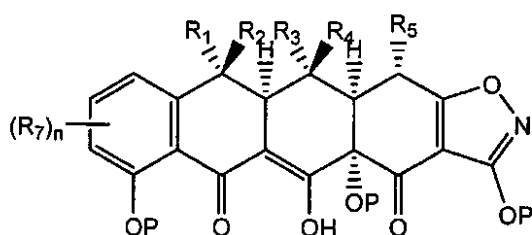
【請求項 9 9】

R_{10} が、置換または非置換フェニル環である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 1 0 0】

次式の化合物を合成する方法：

【化 5 3】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ；

- $N(R_B)_2$; - $NHC(O)R_B$; あるいは - $C(R_B)_3$ である ; ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る ;

R_3 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_C ; = O ; - $C(=O)R_C$; - CO_2R_C ; - CN ; - SCN ; - SR_C ; - SOR_C ; - SO_2R_C ; - NO_2 ; - $N(R_C)_2$; - $NHC(O)R_C$; あるいは - $C(R_C)_3$ である ; ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る ;

R_4 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_D ; = O ; - $C(=O)R_D$; - CO_2R_D ; - CN ; - SCN ; - SR_D ; - SOR_D ; - SO_2R_D ; - NO_2 ; - $N(R_D)_2$; - $NHC(O)R_D$; あるいは - $C(R_D)_3$ である ; ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る ;

R_5 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_E ; - CN ; - SCN ; - SR_E ; または - $N(R_E)_2$ である ; ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る ;

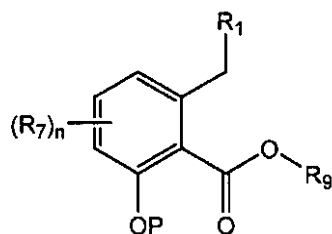
R_7 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_G ; = O ; - $C(=O)R_G$; - CO_2R_G ; - CN ; - SCN ; - SR_G ; - SOR_G ; - SO_2R_G ; - NO_2 ; - $N(R_G)_2$; - $NHC(O)R_G$; あるいは - $C(R_G)_3$ である ; ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る ;

P は、それぞれ、別個に、水素または保護基からなる群から選択される ; そして

n は、0 ~ 3 (それらの数を含めて) の範囲の整数である ;

該方法は、塩基性条件下にて、次式のトルアートと :

【化 5 4】



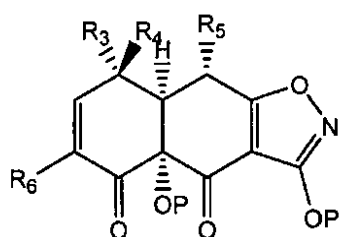
ここで、 R_1 、 R_7 および n は、上で定義したとおりである；

R_9 は、置換または非置換アリールまたはヘテロアリール基からなる群から選択される；そして

P は、水素、低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキル基、アシル基、および保護基からなる群から選択される；

次式のエノンとを反応させることによる；

【化 5 5】



ここで、 R_3 、 R_4 および R_5 の各々は、上で定義したとおりである；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；そして

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される、方法。

【請求項 1 0 1】

R_1 が、メチルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 2】

R_9 が、フェニルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 3】

R_9 が、置換フェニルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 4】

P が、BOC 保護基である、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 5】

P が、ベンジルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

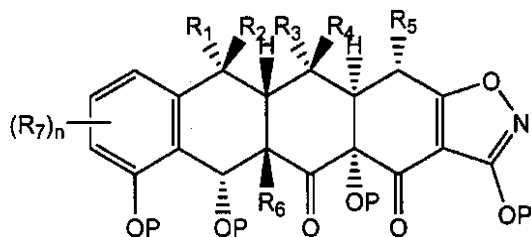
【請求項 1 0 6】

P が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 1 0 0 に記載の方法。

【請求項 1 0 7】

次式の化合物を調製する方法；

【化 5 6】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換また

は非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

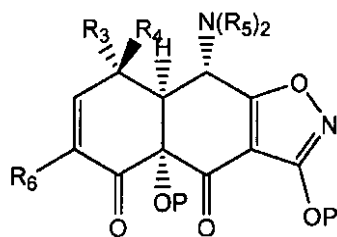
R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

P は、それぞれ、別個に、水素または保護基からなる群から選択される；そして

n は、 $0 \sim 3$ （それらの数を含めて）の範囲の整数である；

該方法は、次式のエノンと；

【化 5 7】

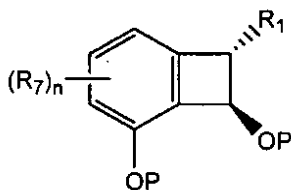


ここで、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 の各々は、上で定義したとおりである；

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される；

次式のベンゾシクロブテノールとを反応させることによる；

【化 5 8】

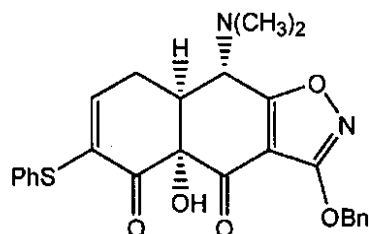


ここで、 R_1 、 R_7 、 P および n は、上で定義したとおりである、方法。

【請求項 108】

前記エノンが、次式である、請求項 107 に記載の方法；

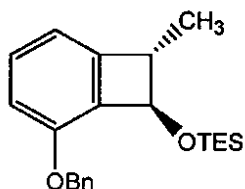
【化 5 9】



【請求項 1 0 9】

前記ベンゾシクロブテノールが、次式である、請求項 1 0 7 に記載の方法：

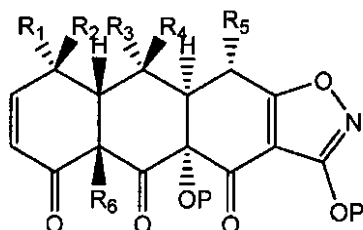
【化 6 0】



【請求項 1 1 0】

次式の化合物を調製する方法：

【化 6 1】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置

換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

R_4 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_D$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_D$ ； $-CO_2R_D$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_D$ ； $-SOR_D$ ； $-SO_2R_D$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_D)_2$ ； $-NHC(O)R_D$ ；あるいは $-C(R_D)_3$ である；ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る；

R_5 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_E$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_E$ ；または $-N(R_E)_2$ である；ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

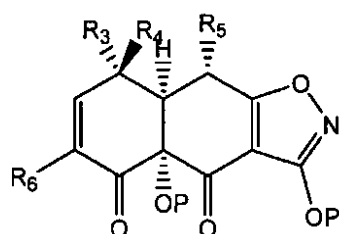
R_7 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHC(O)R_G$ ；あるいは $-C(R_G)_3$ である；ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る；

P は、それぞれ、別個に、水素および保護基からなる群から選択される；そして

n は、 $0 \sim 3$ （それらの数を含めて）の範囲の整数である；

該方法は、次式のエノンと；

【化62】

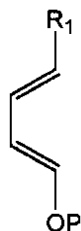


ここで、 R_3 、 R_4 、 R_5 および R_6 の各々は、上で定義したとおりである；

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される；

次式のジエンとを反応させることによる；

【化 6 3】

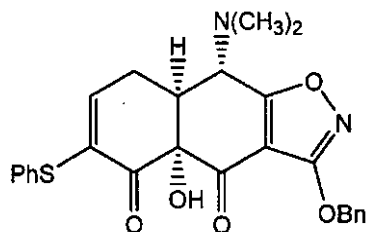


ここで、 R_1 、 P および n は、上で定義したとおりである、方法。

【請求項 1 1 1】

前記エノンが、次式：

【化 6 4】



である、請求項 1 1 0 に記載の方法。

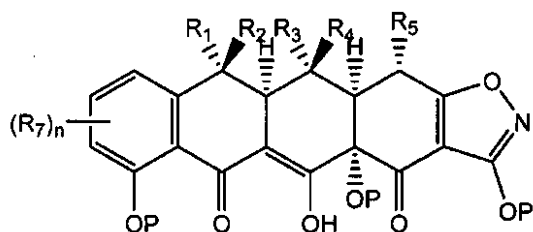
【請求項 1 1 2】

前記 R_1 が、低級 ($C_1 \sim C_6$) アルキルである、請求項 1 1 0 に記載の方法。

【請求項 1 1 3】

次式の化合物を合成する方法：

【化 6 5】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$

; $-CO_2R_B$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_B$; $-SOR_B$; $-SO_2R_B$; $-NO_2$; $-N(R_B)_2$; $-NHC(O)R_B$; あるいは $-C(R_B)_3$ である; ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る;

R_3 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_C$; $=O$; $-C(=O)R_C$; $-CO_2R_C$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_C$; $-SOR_C$; $-SO_2R_C$; $-NO_2$; $-N(R_C)_2$; $-NHC(O)R_C$; あるいは $-C(R_C)_3$ である; ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る;

R_4 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_D$; $=O$; $-C(=O)R_D$; $-CO_2R_D$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_D$; $-SOR_D$; $-SO_2R_D$; $-NO_2$; $-N(R_D)_2$; $-NHC(O)R_D$; あるいは $-C(R_D)_3$ である; ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る;

R_5 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_E$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_E$; または $-N(R_E)_2$ である; ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る;

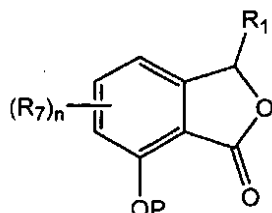
R_7 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_G$; $=O$; $-C(=O)R_G$; $-CO_2R_G$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_G$; $-SOR_G$; $-SO_2R_G$; $-NO_2$; $-N(R_G)_2$; $-NHC(O)R_G$; あるいは $-C(R_G)_3$ である; ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る;

P は、それぞれ、別個に、水素、低級アルキル基、アシル基または保護基からなる群から選択される;

n は、 $0 \sim 3$ (それらの数を含めて) の範囲の整数である;

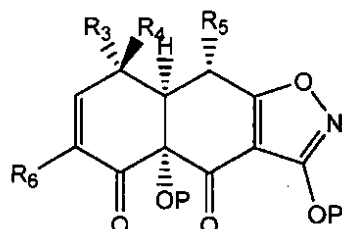
該方法は、塩基性条件下にて、次式のフタリドと:

【化 6 6】



ここで、 R_1 、 R_7 、 P および n は、上で定義したとおりである；
次式のエノンとを反応させることによる；

【化 6 7】



ここで、 R_3 、 R_4 および R_5 の各々は、上で定義したとおりである；

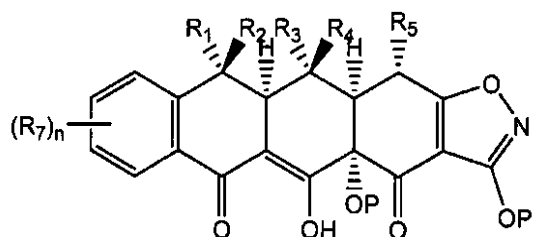
R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；そして

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される、
方法。

【請求項 1 1 4】

次式の化合物を合成する方法：

【化 6 8】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ；

- $N(R_B)_2$; - $NHC(O)R_B$; あるいは - $C(R_B)_3$ である ; ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る ;

R_3 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_C ; = O ; - $C(=O)R_C$; - CO_2R_C ; - CN ; - SCN ; - SR_C ; - SOR_C ; - SO_2R_C ; - NO_2 ; - $N(R_C)_2$; - $NHC(O)R_C$; あるいは - $C(R_C)_3$ である ; ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る ;

R_4 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_D ; = O ; - $C(=O)R_D$; - CO_2R_D ; - CN ; - SCN ; - SR_D ; - SOR_D ; - SO_2R_D ; - NO_2 ; - $N(R_D)_2$; - $NHC(O)R_D$; あるいは - $C(R_D)_3$ である ; ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る ;

R_5 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_E ; - CN ; - SCN ; - SR_E ; または - $N(R_E)_2$ である ; ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る ;

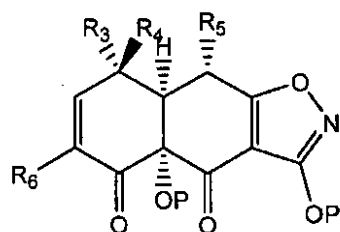
R_7 は、水素 ; ハロゲン ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族 ; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族 ; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル ; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール ; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール ; - OR_G ; = O ; - $C(=O)R_G$; - CO_2R_G ; - CN ; - SCN ; - SR_G ; - SOR_G ; - SO_2R_G ; - NO_2 ; - $N(R_G)_2$; - $NHC(O)R_G$; あるいは - $C(R_G)_3$ である ; ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る ;

P は、それぞれ、別個に、水素または保護基からなる群から選択される ;

n は、0 ~ 3 (それらの数を含めて) の範囲の整数である ;

該方法は、次式のエノンの存在下にて :

【化 6 9】

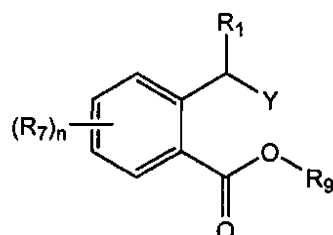


ここで、 R_3 、 R_4 および R_5 の各々は、上で定義したとおりである；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；そして

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される；
金属試薬と次式のトルアートとを反応させることによる；

【化 7 0】



ここで、 R_1 、 R_7 および n は、上で定義したとおりである；

R_9 は、置換または非置換アリールまたはヘテロアリール基からなる群から選択される；そして

Y は、ハロゲンまたは $Sn(R_y)_3$ であり、ここで、 R_y は、アルキルである、方法。

【請求項 1 1 5】

R_1 が、水素である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 1 6】

Y が、 Br である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 1 7】

Y が、 I である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 1 8】

Y が、 $-Sn(Me)_3$ である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 1 9】

R_9 が、メチルである、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 0】

R_9 が、フェニルである、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 1】

R_9 が、置換フェニルである、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 2】

前記金属試薬が、リチウム試薬である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 3】

前記リチウム試薬が、 n -ブチルリチウム、フェニルリチウム、 t -ブチルリチウム、メチルリチウム、およびメシチルリチウムからなる群から選択される、請求項 1 2 2 に記載の方法。

【請求項 1 2 4】

前記金属試薬が、亜鉛試薬である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 5】

前記金属試薬が、マグネシウム試薬である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 6】

前記金属化トルエートが、グリニャール試薬である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

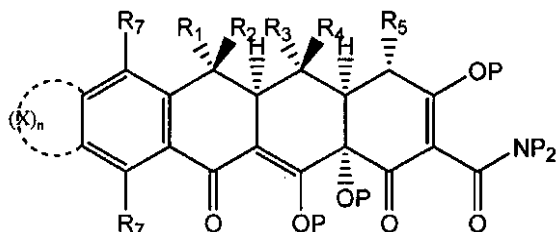
【請求項 1 2 7】

前記金属試薬が、0 原子価金属またはエート錯体である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 2 8】

次式の化合物を合成する方法：

【化 7 1】



ここで、 R_1 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHC(O)R_A$ ；あるいは $-C(R_A)_3$ である；ここで、 R_A の各存在は、別個に、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る；

R_2 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHC(O)R_B$ ；あるいは $-C(R_B)_3$ である；ここで、 R_B の各存在は、別個に、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る；

R_3 は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_C$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_C$ ； $-CO_2R_C$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_C$ ； $-SOR_C$ ； $-SO_2R_C$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHC(O)R_C$ ；あるいは $-C(R_C)_3$ である；ここで、 R_C の各存在は、別個に、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る；

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

; $-CO_2R_D$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_D$; $-SOR_D$; $-SO_2R_D$; $-NO_2$; $-N(R_D)_2$; $-NHC(O)R_D$; あるいは $-C(R_D)_3$ である; ここで、 R_D の各存在は、別個に、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る;

R_5 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_E$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_E$; または $-N(R_E)_2$ である; ここで、 R_E の各存在は、別個に、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る;

各 R_7 は、別個に、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_G$; $=O$; $-C(=O)R_G$; $-CO_2R_G$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_G$; $-SOR_G$; $-SO_2R_G$; $-NO_2$; $-N(R_G)_2$; $-NHC(O)R_G$; あるいは $-C(R_G)_3$ である; ここで、 R_G の各存在は、別個に、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る;

各 P は、別個に、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、あるいは置換または非置換ヘテロアリールである;

【化 7 2】



は、置換または非置換アリール、ヘテロアリール、炭素環または複素環部分を表わし、ここで、 X の各存在は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR_8-$ 、 $-C(R_8)_2-$ からなる群から選択される;

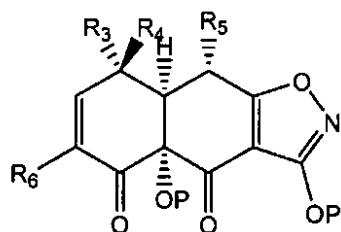
R_8 は、水素; ハロゲン; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族; 環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族; 置換または非置換、分枝または非分枝アシル; 置換または非置換、分枝または非分枝アリール; 置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; $-OR_H$; $=O$; $-C(=O)R_H$; $-CO_2R_H$; $-CN$; $-SCN$; $-SR_H$; $-SOR_H$; $-SO_2R_H$; $-NO_2$; $-N(R_H)_2$; $-NHC(O)R_H$; あるいは $-C(R_H)_3$ である; ここで、 R_H の各存在は、別個に、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る;

n は、1 ~ 5 (それらの数を含めて) の範囲の整数である; そして

隣接 X 部分間の結合は、単結合または二重結合のいずれかである;

該方法は、次式のエノンの存在下に於て;

【化 7 3】



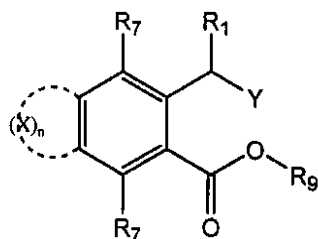
ここで、 R_3 、 R_4 および R_5 の各々は、上で定義したとおりである；

R_6 は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SH$ 、アルキルチオ、アリールチオ、 $-NO_2$ 、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；そして

P は、別個に、水素または保護基からなる群から選択される；

金属試薬と次式のトルアートとを反応させることによる；

【化 7 4】



ここで、 R_1 、 R_7 、X および n は、上で定義したとおりである；

R_9 は、置換または非置換アリールまたはヘテロアリール基からなる群から選択される；そして

Y は、ハロゲンまたは $Sn(R_y)_3$ であり、ここで、 R_y は、アルキルである、方法。

【請求項 1 2 9】

R_1 が、水素である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 0】

Y が、Br である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 1】

Y が、I である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 2】

Y が、 $-Sn(Me)_3$ である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 3】

R_9 が、フェニルである、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 4】

R_9 が、置換フェニルである、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 5】

前記金属試薬が、リチウム試薬である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 6】

前記リチウム試薬が、*n*-ブチルリチウム、フェニルリチウム、*t*-ブチルリチウム、メチルリチウム、およびメシチルリチウムからなる群から選択される、請求項 1 3 5 に記載の方法。

【請求項 1 3 7】

前記金属試薬が、亜鉛試薬である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 1 3 8】

前記金属試薬が、マグネシウム試薬である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

【請求項 139】

前記金属化トルエートが、グリニャール試薬である、請求項 128 に記載の方法。

【請求項 140】

前記金属試薬が、0 原子価金属またはエート錯体である、請求項 128 に記載の方法。