

【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 07C 237/26	(2006.01)
C 07D 221/18	(2006.01)
C 07D 239/70	(2006.01)
C 07D 237/26	(2006.01)
C 07D 241/38	(2006.01)
C 07D 209/58	(2006.01)
C 07D 235/02	(2006.01)
C 07D 263/52	(2006.01)
C 07D 307/77	(2006.01)
A 61K 31/65	(2006.01)
A 61P 31/04	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)
C 07C 231/14	(2006.01)
C 07C 319/20	(2006.01)
C 07C 323/61	(2006.01)
C 07B 53/00	(2006.01)

【F I】

C 07C 237/26	C S P
C 07D 221/18	
C 07D 239/70	
C 07D 237/26	
C 07D 241/38	
C 07D 209/58	
C 07D 235/02	B
C 07D 263/52	
C 07D 307/77	
A 61K 31/65	
A 61P 31/04	
A 61P 43/00	1 2 3
C 07C 231/14	
C 07C 319/20	
C 07C 323/61	
C 07B 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

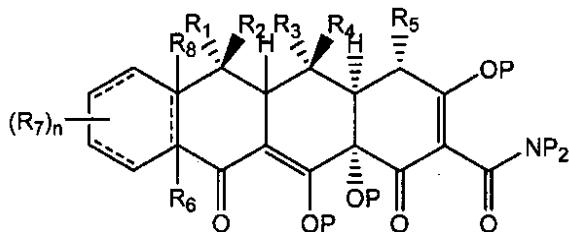
【補正方法】変更

【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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>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； $-OR_G$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_G$ ； $-CO_2R_G$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_G$ ； $-SOR_G$ ； $-SO_2R_G$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_G)_2$ ； $-NHCO(O)R_G$ ；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

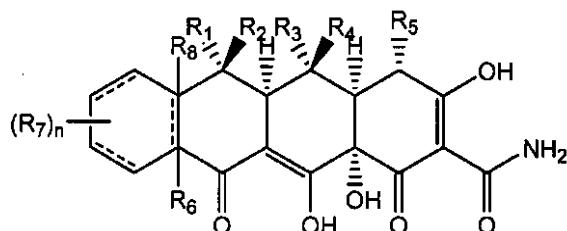
点線は、結合または結合不在を表わす、

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 2】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

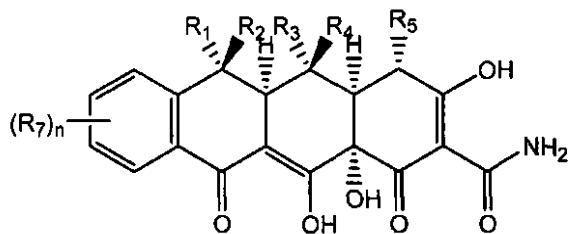
### 【化 2】



### 【請求項 3】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

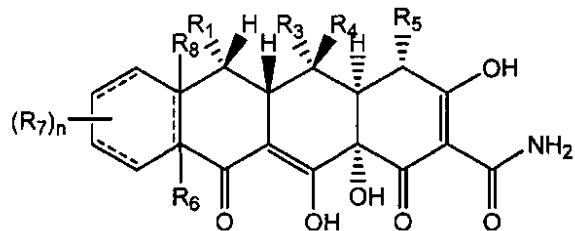
## 【化3】



## 【請求項4】

次式の請求項1に記載の化合物：

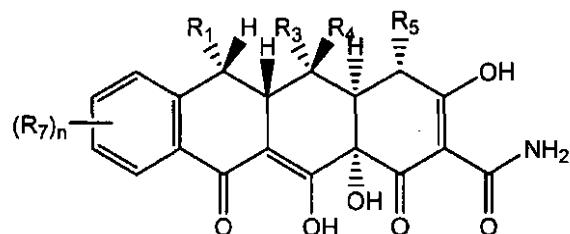
## 【化4】



## 【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； $-OR_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-N(R_C)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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； $-OR_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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。

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 1 0】

R<sub>2</sub> が、 - O R<sub>B</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

R<sub>2</sub> が、 - OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

R<sub>2</sub> が、 - H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

R<sub>2</sub> が、低級 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R<sub>2</sub> が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R<sub>3</sub> が、水素、 - OR<sub>C</sub>、または低級 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R<sub>3</sub> が、 - OR<sub>C</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R<sub>3</sub> が、 - OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R<sub>3</sub> が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R<sub>4</sub> が、水素、 - OR<sub>D</sub>、または低級 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

R<sub>4</sub> が、 - OR<sub>D</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

R<sub>4</sub> が、 - OH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

R<sub>4</sub> が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> が、それぞれ、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R<sub>3</sub> が、 - OR<sub>C</sub> であり、そして R<sub>4</sub> が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R<sub>3</sub> が、 - OH であり、そして R<sub>4</sub> が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R<sub>5</sub> が、 - N (R<sub>E</sub>)<sub>2</sub> または - OR<sub>E</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R<sub>E</sub> が、水素または低級 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R<sub>5</sub> が、 - N (R<sub>E</sub>)<sub>2</sub> であり、そして R<sub>E</sub> が、水素または低級 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

R<sub>5</sub> が、 - N (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R<sub>6</sub> および R<sub>8</sub> が、存在せず、そして R<sub>6</sub> および R<sub>8</sub> 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。

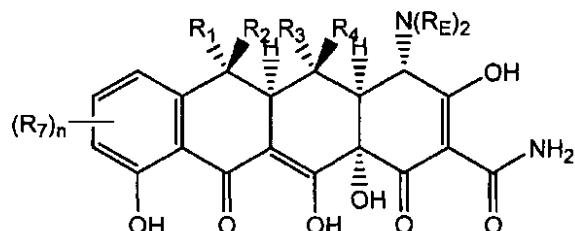
【請求項 3 1】

R<sub>6</sub> および R<sub>8</sub> が、それぞれ、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

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】



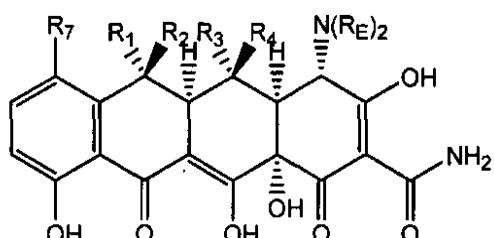
ここで、 $R_E$  は、水素または低級 ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル基からなる群から選択される；  
 $n$  は、0 ~ 3 (それらの数を含めて) の範囲の整数である。

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：

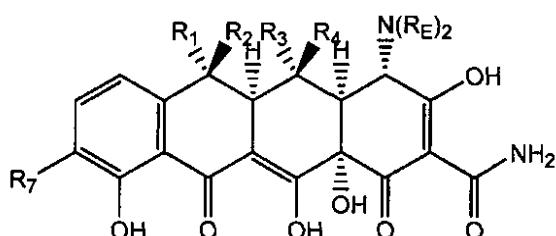
## 【化 7】



## 【請求項 3 4】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

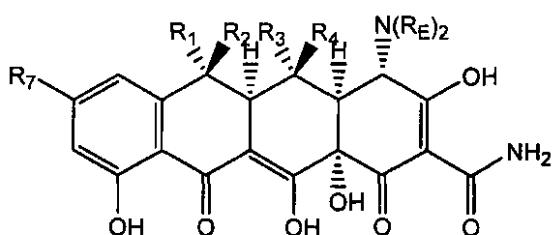
## 【化 8】



## 【請求項 3 5】

次式の請求項 1 に記載の化合物：

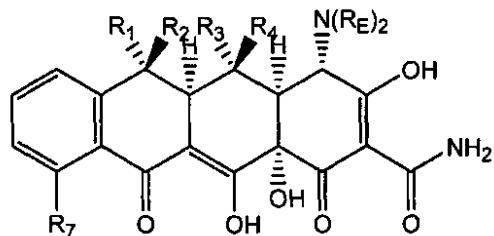
## 【化 9】



## 【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<sub>7</sub>が、-OR<sub>G</sub>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<sub>7</sub>が、-SR<sub>G</sub>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<sub>7</sub>が、-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>または-NHC(O)R<sub>G</sub>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<sub>7</sub>が、-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>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<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>R<sub>G</sub>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<sub>7</sub>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。

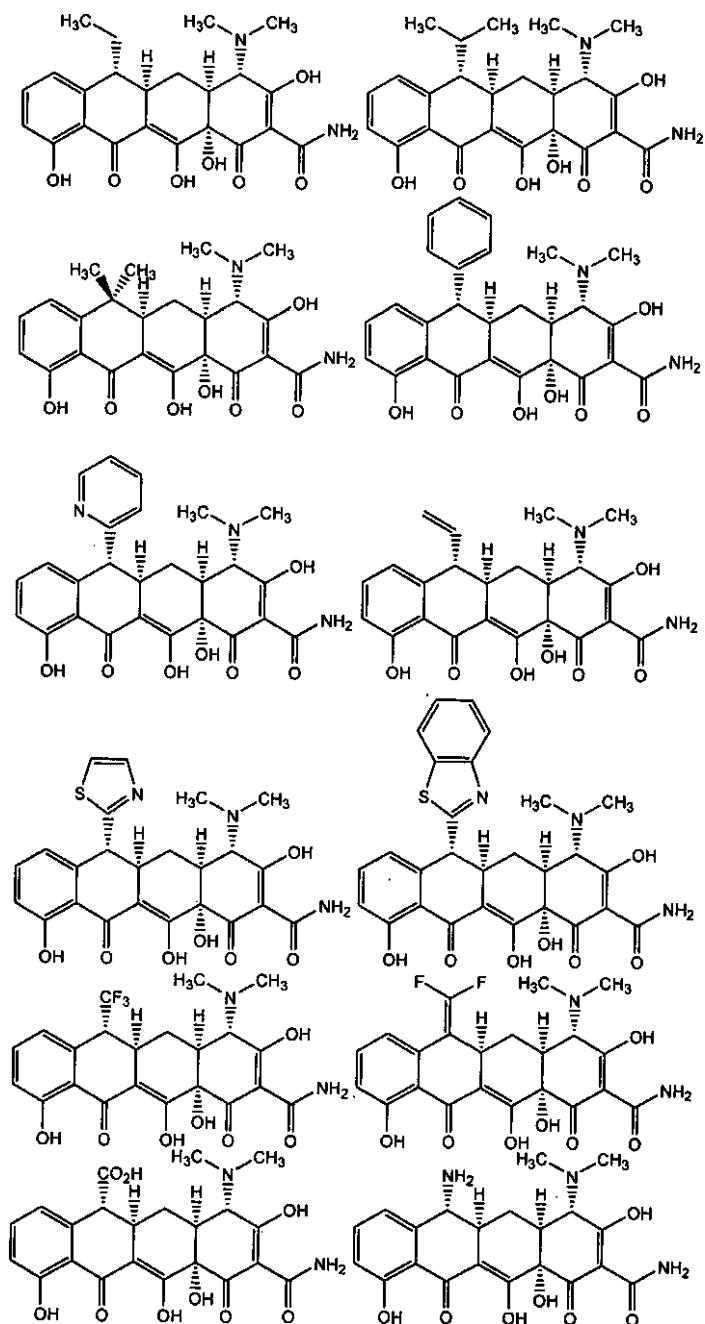
## 【請求項46】

R<sub>7</sub>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】

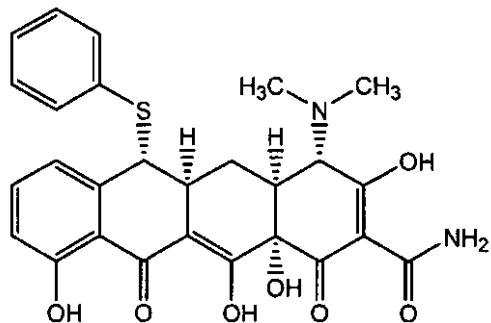
以下からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物：

## 【化11】



および

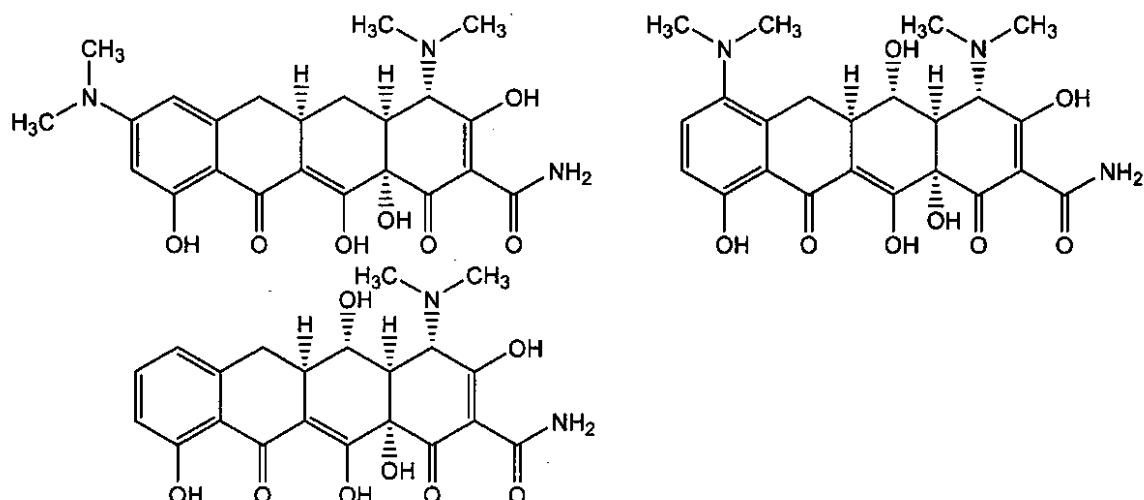
## 【化12】



## 【請求項48】

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：

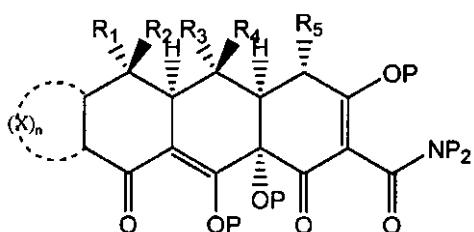
【化 1 3】



【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<sub>1</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>A</sub> 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<sub>2</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>B</sub> 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<sub>3</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>

; - CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>C</sub>; - SOR<sub>C</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>; - NHCO(O)R<sub>C</sub>;あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; - OR<sub>D</sub>; = O; - C(=O)R<sub>D</sub>; - CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>D</sub>; - SOR<sub>D</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>; - NHCO(O)R<sub>D</sub>;あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; - OR<sub>E</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>E</sub>;または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である;ここで、R<sub>E</sub>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、-O-、-S-、-NR<sub>7</sub>-、-C(R<sub>7</sub>)<sub>2</sub>-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。

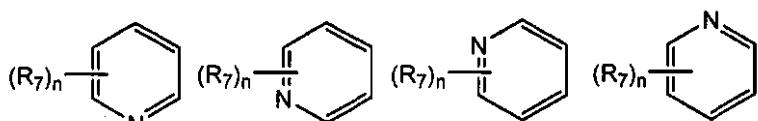
### 【請求項50】

### 【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】



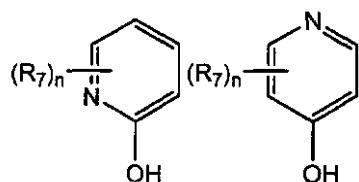
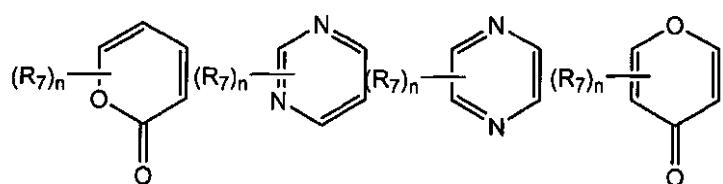
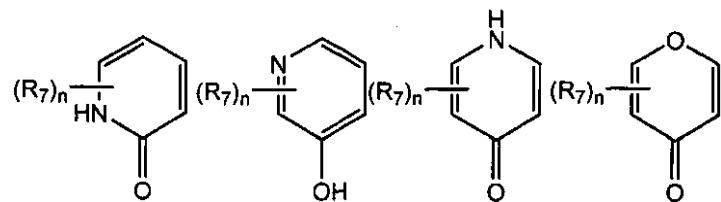
### 【請求項51】

【化18】



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19】



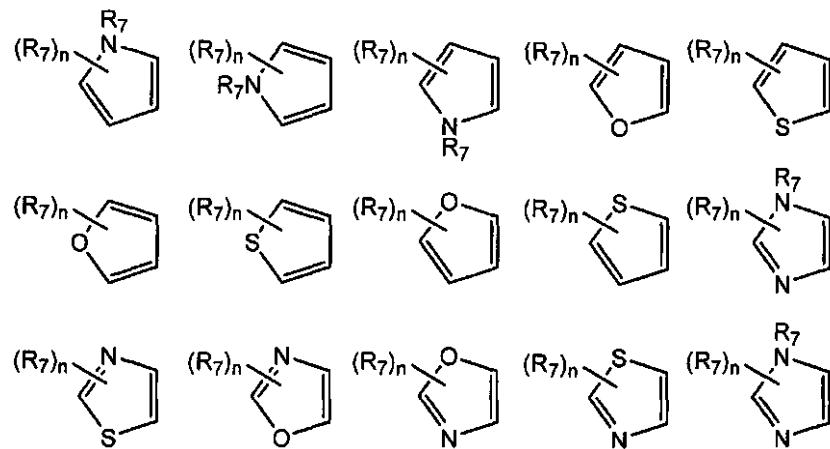
【請求項52】

【化20】



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：

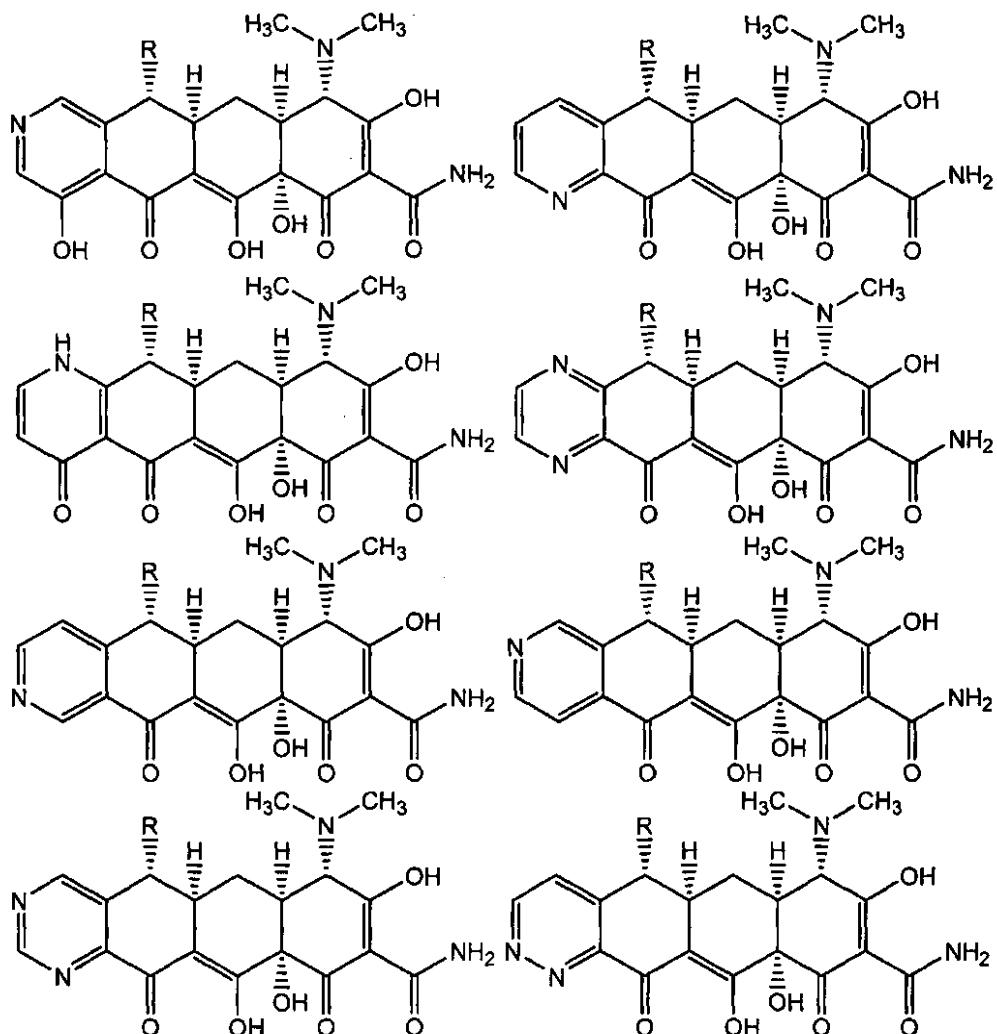
【化21】



【請求項53】

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22】



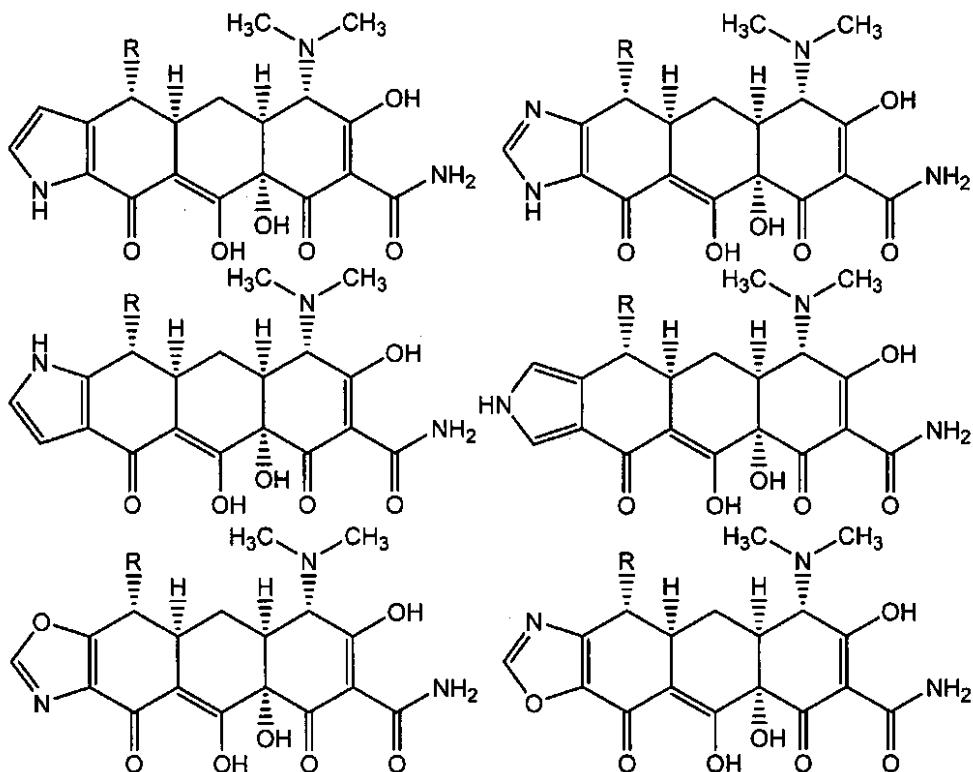
ここで、Rは、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R'；-CO<sub>2</sub>R'；-CN；-SCN；-SR'；-SOR'；-SO<sub>2</sub>R'；-NO<sub>2</sub>；-N(R')<sub>2</sub>；-NHCO(O)R'；あるいは-C(R')<sub>3</sub>である；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54】

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23】

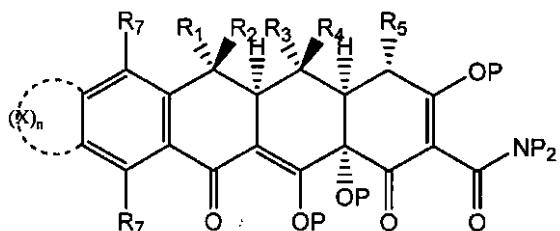


ここで、Rは、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R'；-CO<sub>2</sub>R'；-CN；-SCN；-SR'；-SOR'；-SO<sub>2</sub>R'；-NO<sub>2</sub>；-N(R')<sub>2</sub>；-NHCO(O)R'；あるいは-C(R')<sub>3</sub>である；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55】

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24】



ここで、R<sub>1</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>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<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>B</sub> 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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub> 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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>D</sub> 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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub> 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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>G</sub>；あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>G</sub> 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；またはヘテロアリールチオ部分である；

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25】



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<sub>8</sub>-、-C(R<sub>8</sub>)<sub>2</sub>-からなる群から選択される；

R<sub>8</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>H</sub>；あるいは-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>H</sub>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。

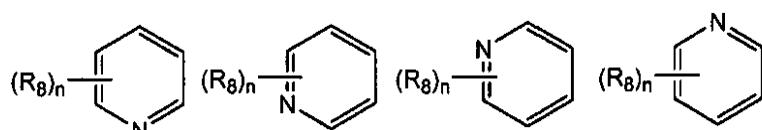
【請求項56】

【化26】



が、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27】



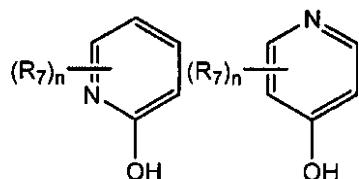
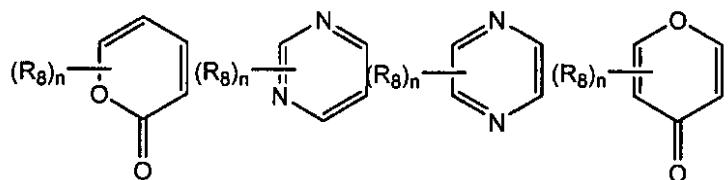
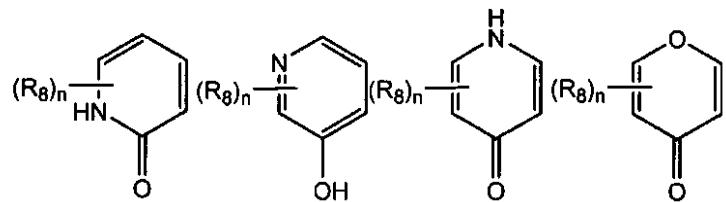
【請求項57】

【化28】



が、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29】



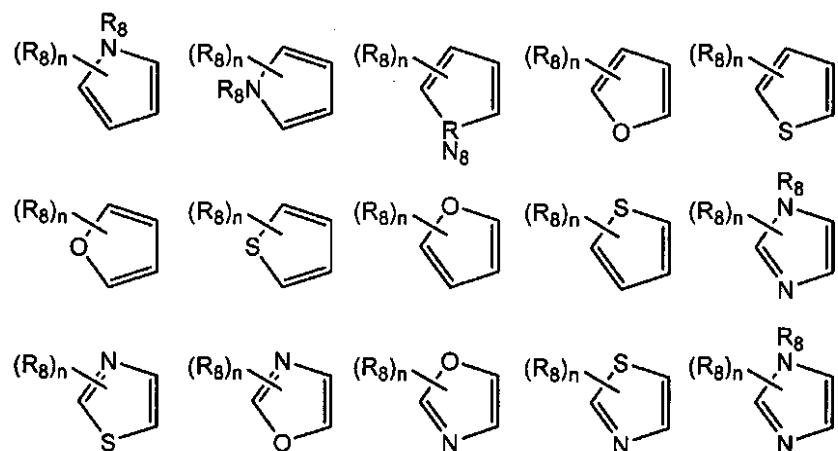
【請求項58】

【化30】



が、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：

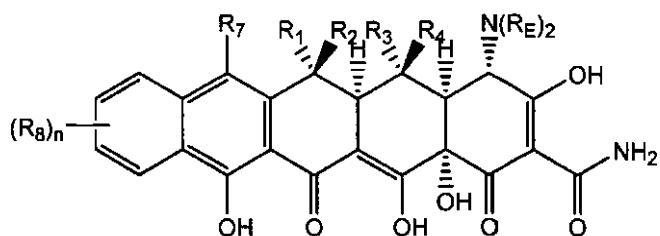
【化31】



【請求項59】

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：

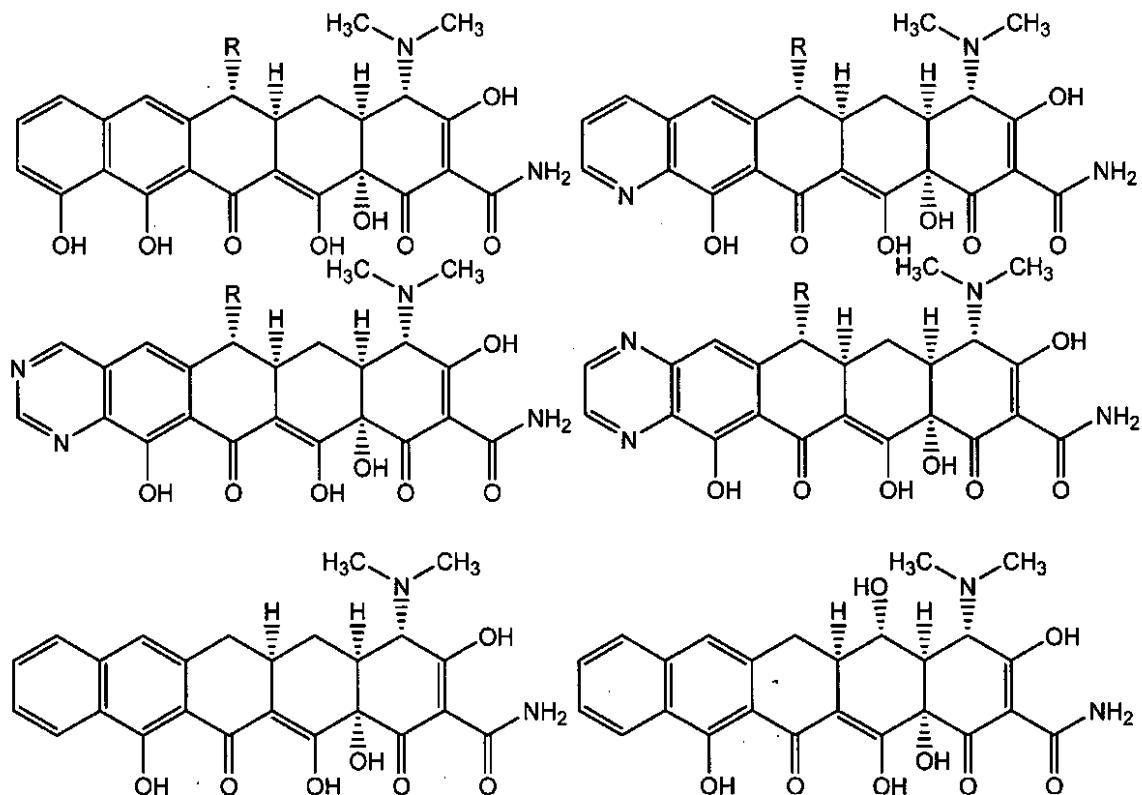
【化32】



【請求項60】

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 3】



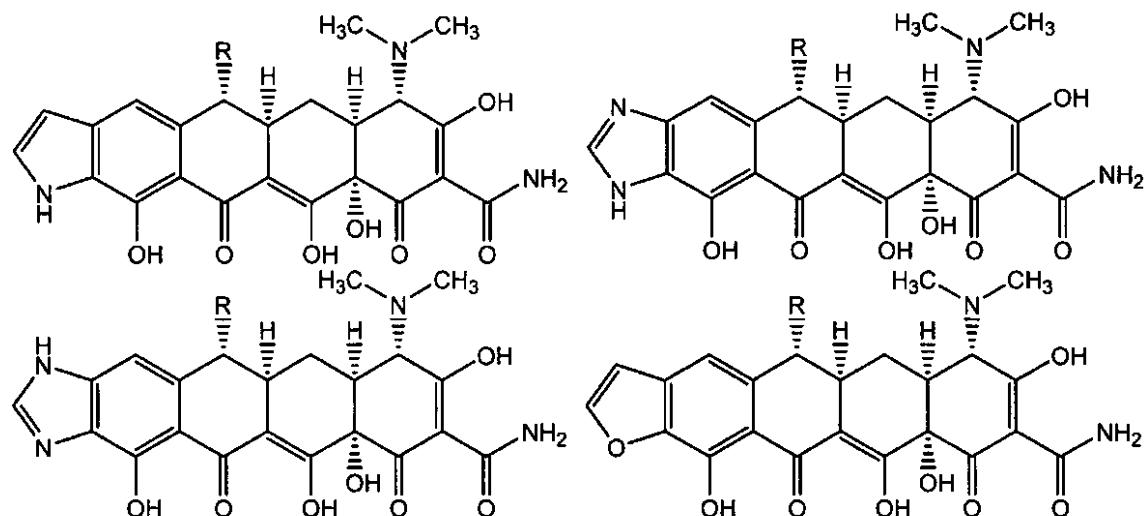
ここで、Rは、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R'；-CO<sub>2</sub>R'；-CN；-SCN；-SR'；-SOR'；-SO<sub>2</sub>R'；-NO<sub>2</sub>；-N(R')<sub>2</sub>；-NHCO(O)R'；あるいは-C(R')<sub>3</sub>である；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 1】

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34】

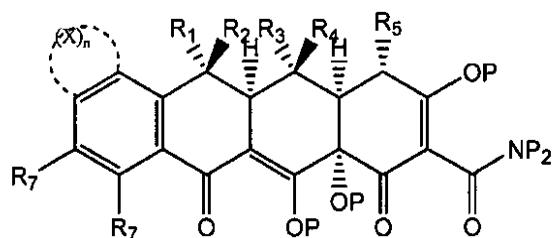


ここで、Rは、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R'；-CO<sub>2</sub>R'；-CN；-SCN；-SR'；-SOR'；-SO<sub>2</sub>R'；-NO<sub>2</sub>；-N(R')<sub>2</sub>；-NHCO(O)R'；あるいは-C(R')<sub>3</sub>である；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62】

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35】



ここで、R<sub>1</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置

換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub>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<sub>7</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>G</sub>；あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>G</sub>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36】



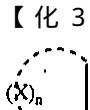
は、置換または非置換アリール、ヘテロアリール、炭素環または複素環部分を表わし、ここで、Xの各存在は、-O-、-S-、-NR<sub>8</sub>-、-C(R<sub>8</sub>)<sub>2</sub>-からなる群から選択される；

R<sub>8</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>H</sub>；=O；-C(=O)R<sub>H</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>H</sub>；-SOR<sub>H</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>H</sub>；あるいは-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>H</sub>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

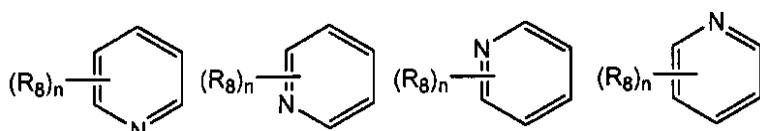
隣接X部分間の結合は、単結合または二重結合のいずれかである、化合物、ならびにそれらの誘導体、塩、プロドラッグ、異性体および互変異性体。

## 【請求項63】



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38】



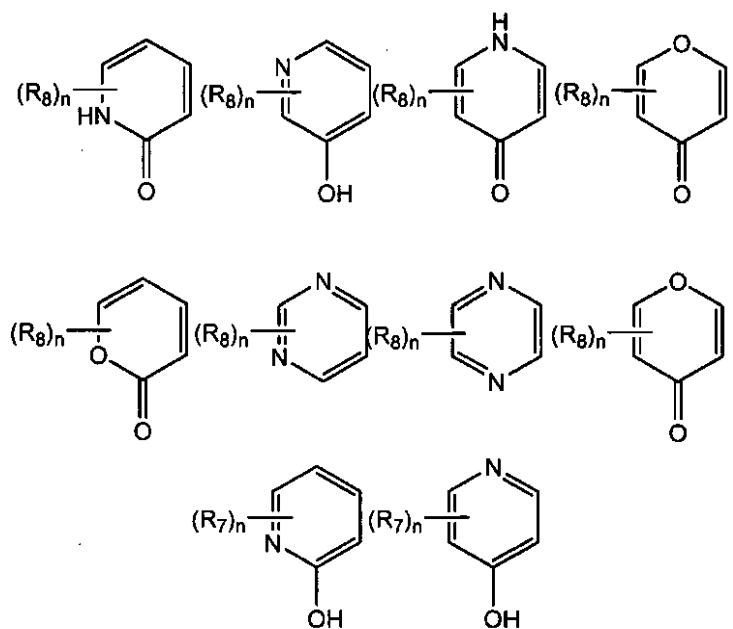
## 【請求項64】

## 【化39】



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40】



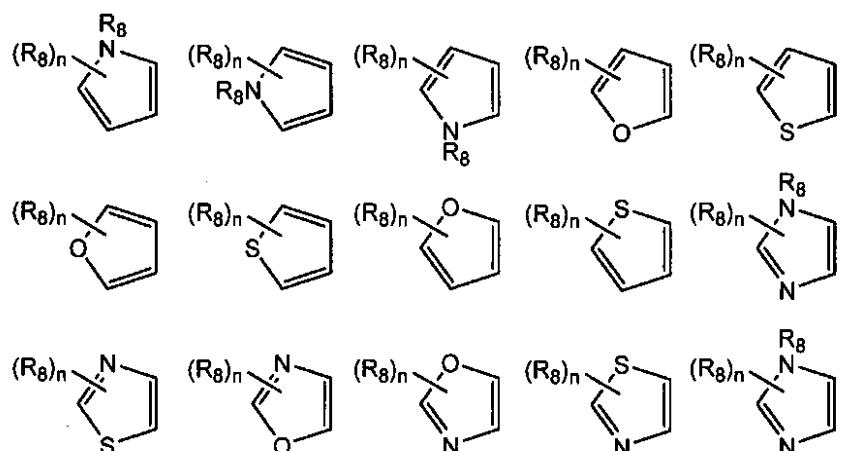
【請求項65】

【化41】



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：

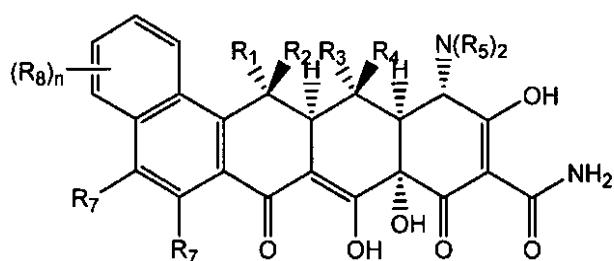
【化42】



【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：

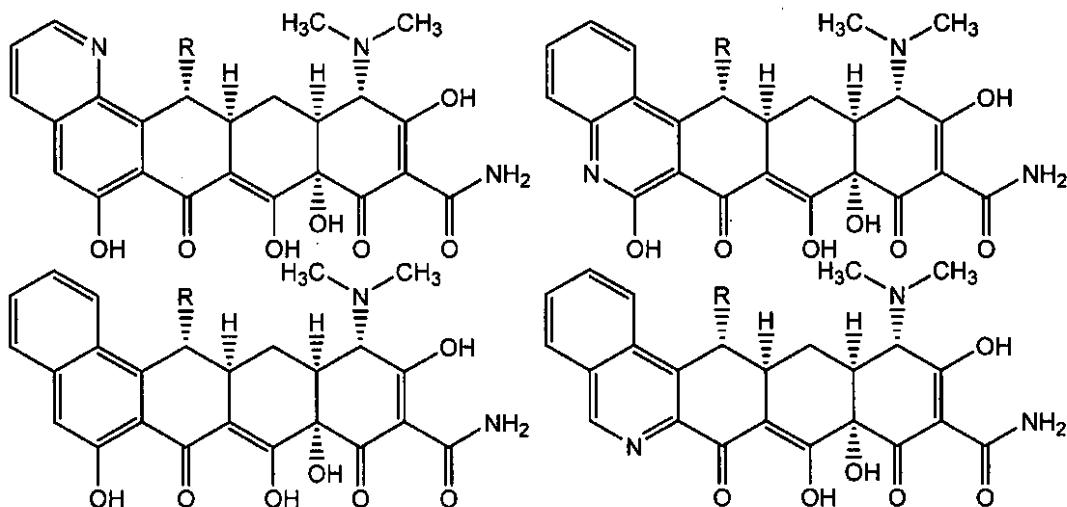
【化43】



## 【請求項 6 7】

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 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<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R'；-CO<sub>2</sub>R'；-CN；-SCN；-SR'；-SOR'；-SO<sub>2</sub>R'；-NO<sub>2</sub>；-N(R')<sub>2</sub>；-NHCO(O)R'；あるいは-C(R')<sub>3</sub>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。

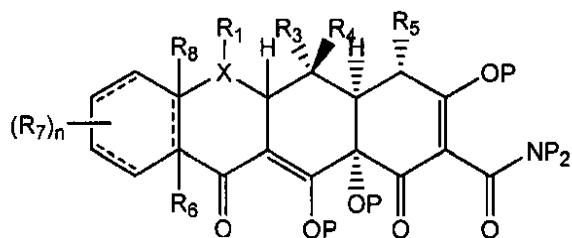
## 【請求項 6 8】

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 6 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 4 5】



ここで、Xは、N、SまたはOである；

R<sub>1</sub>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、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>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<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>G</sub>；あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>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<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

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。

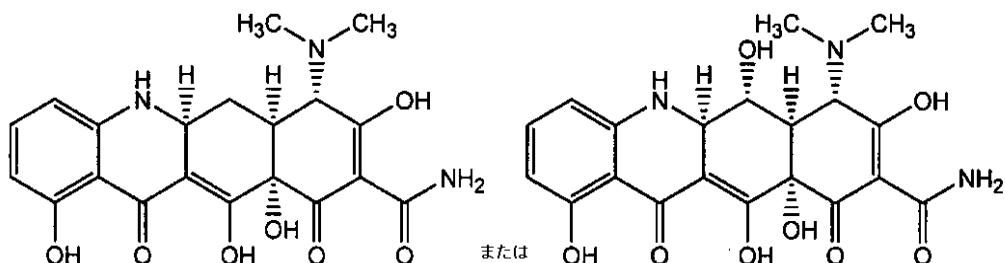
【請求項 7 0】

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、リケッチャ、クラミジア、および肺炎マイコプラズマからなる群から選択される、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、メチシリソニ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。

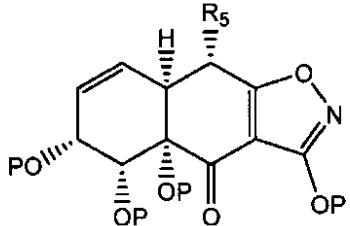
【請求項 7 9】

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、R<sub>5</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリー

ル；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub>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

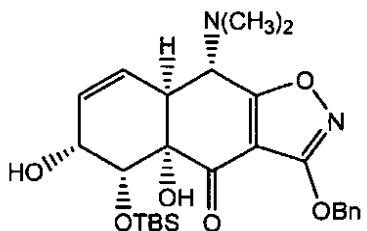
Pは、別個に、水素または保護基からなる群から選択される、

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：

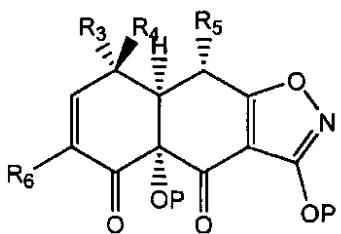
【化48】



【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<sub>3</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂

肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub>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<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

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<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>の各々が、別個に、水素；ハロゲン；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；または低級アルキル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)基からなる群から選択される、請求項82に記載の化合物。

#### 【請求項 8 4】

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>の両方が、水素である、請求項82に記載の化合物。

#### 【請求項 8 5】

R<sub>3</sub>が、メチルである；そしてR<sub>4</sub>が、水素である、請求項82に記載の化合物。

#### 【請求項 8 6】

R<sub>5</sub>が、-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である、請求項80または82に記載の化合物。

#### 【請求項 8 7】

R<sub>E</sub>が、水素または低級アルキル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)基からなる群から選択される、請求項86に記載の化合物。

#### 【請求項 8 8】

両方のR<sub>E</sub>が、メチル基である、請求項82に記載の化合物。

#### 【請求項 8 9】

R<sub>6</sub>が、水素である、請求項82に記載の化合物。

#### 【請求項 9 0】

R<sub>6</sub>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82に記載の化合物。

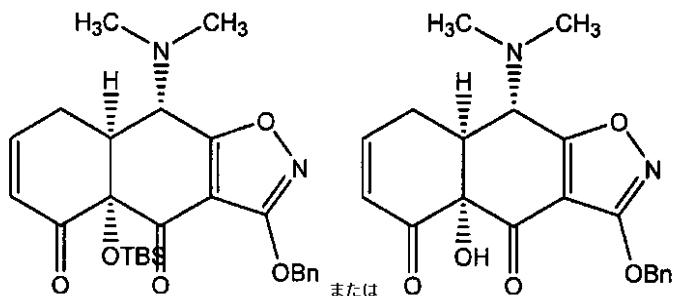
#### 【請求項 9 1】

R<sub>6</sub>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82に記載の化合物。

#### 【請求項 9 2】

次式の請求項82に記載の化合物：

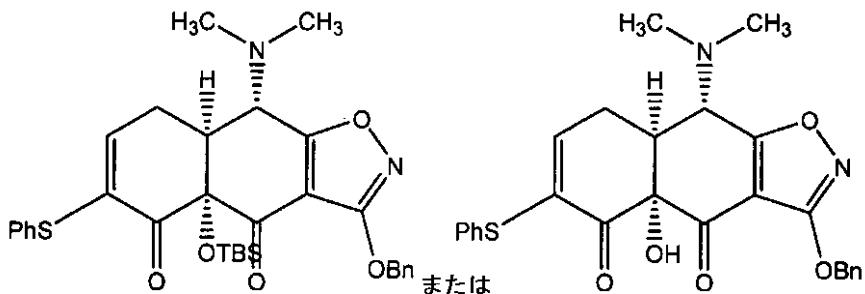
#### 【化50】



#### 【請求項 9 3】

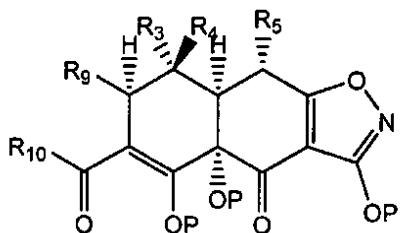
次式の請求項82に記載の化合物：

## 【化51】



## 【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52】



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<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>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<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>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<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>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。

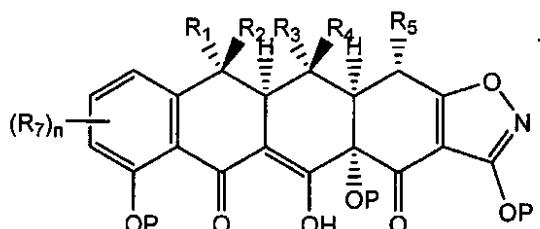
#### 【請求項 9 9】

$R_{10}$  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 10 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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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<sub>B</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>B</sub> ;あるいは - C ( R<sub>B</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>B</sub> 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<sub>3</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>C</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>C</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>C</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>C</sub> ; - SOR<sub>C</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>C</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>C</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>C</sub> ;あるいは - C ( R<sub>C</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>C</sub> 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<sub>4</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>D</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>D</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>D</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>D</sub> ; - SOR<sub>D</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>D</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>D</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>D</sub> ;あるいは - C ( R<sub>D</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>D</sub> 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<sub>5</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>E</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>E</sub> ; または - N ( R<sub>E</sub> )<sub>2</sub> である；ここで、R<sub>E</sub> 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；

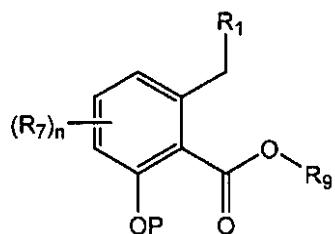
R<sub>7</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>G</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>G</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>G</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>G</sub> ; - SOR<sub>G</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>G</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>G</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>G</sub> ;あるいは - C ( R<sub>G</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>G</sub> 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54】

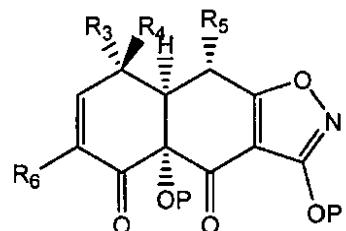


ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>およびnは、上で定義したとおりである；  
R<sub>9</sub>は、置換または非置換アリールまたはヘテロアリール基からなる群から選択される；そして

Pは、水素、低級(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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55】



ここで、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>の各々は、上で定義したとおりである；  
R<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；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101】

R<sub>1</sub>が、メチルである、請求項100に記載の方法。

## 【請求項102】

R<sub>9</sub>が、フェニルである、請求項100に記載の方法。

## 【請求項103】

R<sub>9</sub>が、置換フェニルである、請求項100に記載の方法。

## 【請求項104】

Pが、BOC保護基である、請求項100に記載の方法。

## 【請求項105】

Pが、ベンジルである、請求項100に記載の方法。

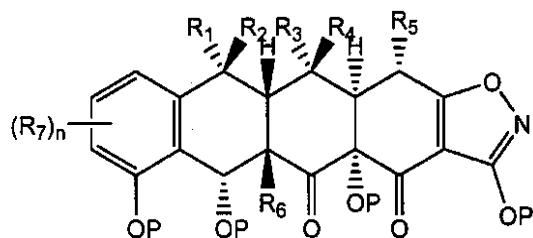
## 【請求項106】

Pが、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである、請求項100に記載の方法。

## 【請求項107】

次式の化合物を調製する方法：

## 【化56】



ここで、R<sub>1</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>A</sub>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<sub>2</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHC(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換また

は非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub>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、ヘテロアリールチオ部分である；

R<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

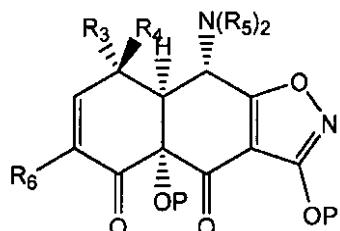
R<sub>7</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>G</sub>；あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>G</sub>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、ヘテロアリールチオ部分；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、次式のエノンと：

**【化57】**

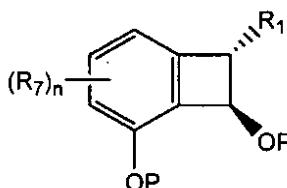


ここで、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>の各々は、上で定義したとおりである；

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58】**

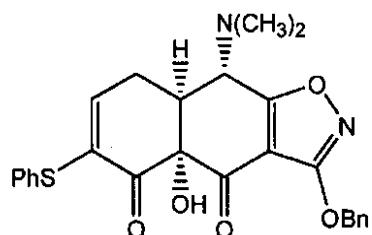


ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>、Pおよびnは、上で定義したとおりである、  
方法。

**【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：

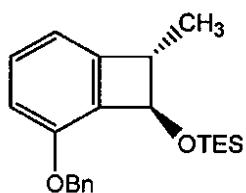
## 【化 5 9】



## 【請求項 109】

前記ベンゾシクロプロテノールが、次式である、請求項 107 に記載の方法：

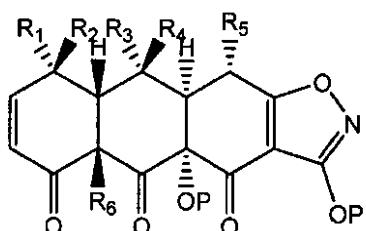
## 【化 6 0】



## 【請求項 110】

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リル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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、アシリル部分；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リル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール； $-OR_B$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_B$ ； $-CO_2R_B$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_B$ ； $-SOR_B$ ； $-SO_2R_B$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_B)_2$ ； $-NHCO(O)R_B$ ；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、アシリル部分；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リル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置

換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>D</sub>；-SOR<sub>D</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>D</sub>；あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>E</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>E</sub>；または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である；ここで、R<sub>E</sub>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<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；

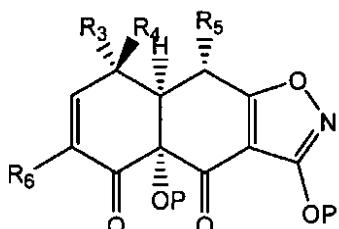
R<sub>7</sub>は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>G</sub>；=O；-C(=O)R<sub>G</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>G</sub>；-SOR<sub>G</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>G</sub>；あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>G</sub>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、0～3（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：

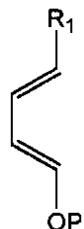
【化62】



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】

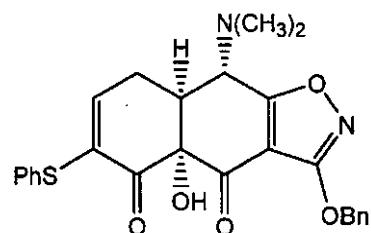


ここで、 $R_1$ 、 $P$  および  $n$  は、上で定義したとおりである、  
方法。

【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。

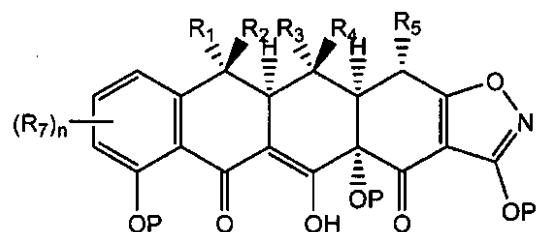
【請求項 1 1 2】

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； $-OR_A$ ； $=O$ ； $-C(=O)R_A$ ； $-CO_2R_A$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR_A$ ； $-SOR_A$ ； $-SO_2R_A$ ； $-NO_2$ ； $-N(R_A)_2$ ； $-NHCO(O)R_A$ ；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<sub>2</sub>R<sub>B</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>B</sub>; - SOR<sub>B</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>; - NHC(O)R<sub>B</sub>;あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>B</sub>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<sub>3</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール;-OR<sub>C</sub>;=O;-C(=O)R<sub>C</sub>; -CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>; -CN; -SCN; -SR<sub>C</sub>; -SOR<sub>C</sub>; -SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>; -NO<sub>2</sub>; -N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>; -NHC(O)R<sub>C</sub>;あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>C</sub>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<sub>4</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール;-OR<sub>D</sub>;=O;-C(=O)R<sub>D</sub>; -CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; -CN; -SCN; -SR<sub>D</sub>; -SOR<sub>D</sub>; -SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; -NO<sub>2</sub>; -N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>; -NHC(O)R<sub>D</sub>;あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール;-OR<sub>E</sub>; -CN; -SCN; -SR<sub>E</sub>;または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である;ここで、R<sub>E</sub>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;

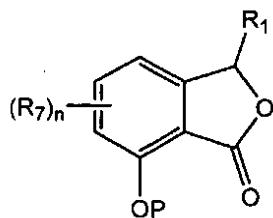
R<sub>7</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール;-OR<sub>G</sub>;=O;-C(=O)R<sub>G</sub>; -CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>; -CN; -SCN; -SR<sub>G</sub>; -SOR<sub>G</sub>; -SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>; -NO<sub>2</sub>; -N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>; -NHC(O)R<sub>G</sub>;あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>G</sub>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、0~3(それらの数を含めて)の範囲の整数である;

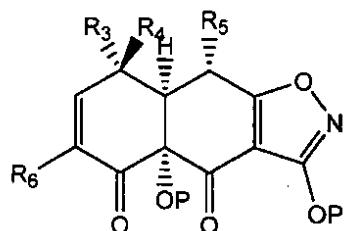
該方法は、塩基性条件下にて、次式のフタリドと:

## 【化66】



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67】



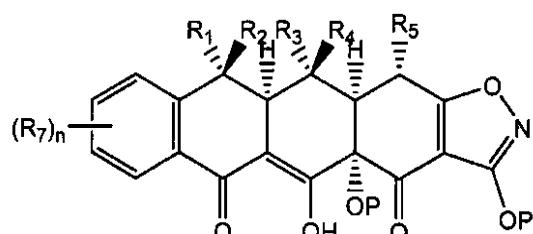
ここで、 $R_3$ 、 $R_4$ および $R_5$ の各々は、上で定義したとおりである；  
 $R_6$ は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、  
置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；そして

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114】

次式の化合物を合成する方法：

## 【化68】



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リル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>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、アシリル部分；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リル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；

- N ( R<sub>B</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>B</sub> ;あるいは - C ( R<sub>B</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>B</sub> 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<sub>3</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>C</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>C</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>C</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>C</sub> ; - SOR<sub>C</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>C</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>C</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>C</sub> ;あるいは - C ( R<sub>C</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>C</sub> 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<sub>4</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>D</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>D</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>D</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>D</sub> ; - SOR<sub>D</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>D</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>D</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>D</sub> ;あるいは - C ( R<sub>D</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>D</sub> 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<sub>5</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>E</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>E</sub> ; または - N ( R<sub>E</sub> )<sub>2</sub> である；ここで、R<sub>E</sub> 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；

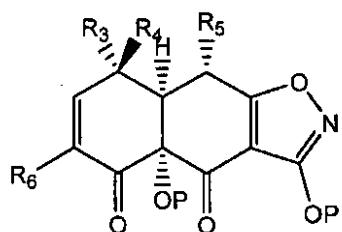
R<sub>7</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；- OR<sub>G</sub> ; = O ; - C ( = O ) R<sub>G</sub> ; - CO<sub>2</sub> R<sub>G</sub> ; - CN ; - SCN ; - SR<sub>G</sub> ; - SOR<sub>G</sub> ; - SO<sub>2</sub> R<sub>G</sub> ; - NO<sub>2</sub> ; - N ( R<sub>G</sub> )<sub>2</sub> ; - NHC ( O ) R<sub>G</sub> ;あるいは - C ( R<sub>G</sub> )<sub>3</sub> である；ここで、R<sub>G</sub> 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69】



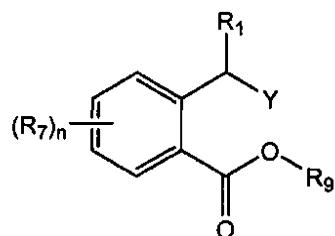
ここで、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>の各々は、上で定義したとおりである；

R<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；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70】



ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>およびnは、上で定義したとおりである；

R<sub>9</sub>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<sub>y</sub>)<sub>3</sub>であり、ここで、R<sub>y</sub>は、アルキルである、方法。

## 【請求項115】

R<sub>1</sub>が、水素である、請求項114に記載の方法。

## 【請求項116】

Yが、Brである、請求項114に記載の方法。

## 【請求項117】

Yが、Iである、請求項114に記載の方法。

## 【請求項118】

Yが、-Sn(Me)<sub>3</sub>である、請求項114に記載の方法。

## 【請求項119】

R<sub>9</sub>が、メチルである、請求項114に記載の方法。

## 【請求項120】

R<sub>9</sub>が、フェニルである、請求項114に記載の方法。

## 【請求項121】

R<sub>9</sub>が、置換フェニルである、請求項114に記載の方法。

## 【請求項122】

前記金属試薬が、リチウム試薬である、請求項114に記載の方法。

## 【請求項123】

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122に記載の方法。

## 【請求項124】

前記金属試薬が、亜鉛試薬である、請求項114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、グリニヤール試薬である、請求項 1 1 4 に記載の方法。

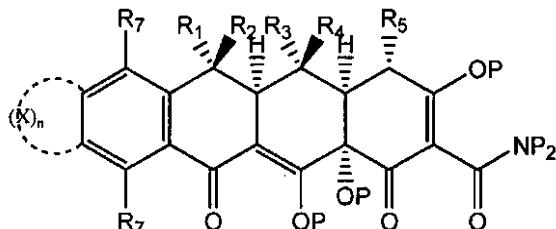
## 【請求項 1 2 7】

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<sub>1</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>A</sub>；=O；-C(=O)R<sub>A</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>A</sub>；-SOR<sub>A</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>A</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>A</sub>；あるいは-C(R<sub>A</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>A</sub> 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<sub>2</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>B</sub>；=O；-C(=O)R<sub>B</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>B</sub>；-SOR<sub>B</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>B</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>B</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>B</sub>；あるいは-C(R<sub>B</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>B</sub> 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<sub>3</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>C</sub>；=O；-C(=O)R<sub>C</sub>；-CO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-CN；-SCN；-SR<sub>C</sub>；-SOR<sub>C</sub>；-SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>；-NO<sub>2</sub>；-N(R<sub>C</sub>)<sub>2</sub>；-NHCO(O)R<sub>C</sub>；あるいは-C(R<sub>C</sub>)<sub>3</sub>である；ここで、R<sub>C</sub> 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<sub>4</sub> は、水素；ハロゲン；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族；環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族；置換または非置換、分枝または非分枝アシル；置換または非置換、分枝または非分枝アリール；置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール；-OR<sub>D</sub>；=O；-C(=O)R<sub>D</sub>

; - CO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>D</sub>; - SOR<sub>D</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>D</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>D</sub>)<sub>2</sub>; - NHCO(O)R<sub>D</sub>;あるいは-C(R<sub>D</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>D</sub>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<sub>5</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; - OR<sub>E</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>E</sub>;または-N(R<sub>E</sub>)<sub>2</sub>である;ここで、R<sub>E</sub>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、ヘテロアリールチオ部分である;

各R<sub>7</sub>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<sub>G</sub>; = O; - C(=O)R<sub>G</sub>; - CO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>G</sub>; - SOR<sub>G</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>G</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>G</sub>)<sub>2</sub>; - NHCO(O)R<sub>G</sub>;あるいは-C(R<sub>G</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>G</sub>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72】



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<sub>8</sub>-、-C(R<sub>8</sub>)<sub>2</sub>-からなる群から選択される;

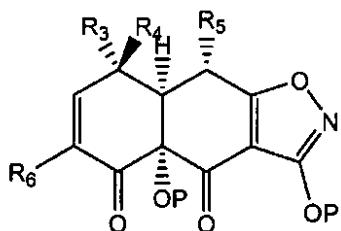
R<sub>8</sub>は、水素;ハロゲン;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝脂肪族;環式または非環式、置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロ脂肪族;置換または非置換、分枝または非分枝アシル;置換または非置換、分枝または非分枝アリール;置換または非置換、分枝または非分枝ヘテロアリール; - OR<sub>H</sub>; = O; - C(=O)R<sub>H</sub>; - CO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>; - CN; - SCN; - SR<sub>H</sub>; - SOR<sub>H</sub>; - SO<sub>2</sub>R<sub>H</sub>; - NO<sub>2</sub>; - N(R<sub>H</sub>)<sub>2</sub>; - NHCO(O)R<sub>H</sub>;あるいは-C(R<sub>H</sub>)<sub>3</sub>である;ここで、R<sub>H</sub>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て:

## 【化73】



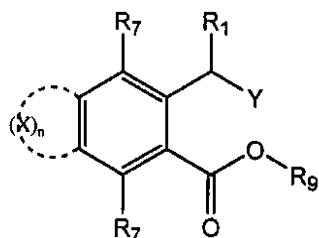
ここで、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>の各々は、上で定義したとおりである；

R<sub>6</sub>は、水素、ハロゲン、置換または非置換脂肪族、置換または非置換ヘテロ脂肪族、置換または非置換アルコキシ、-OH、-CN、-SCN、-SH、アルキルチオ、アリールチオ、-NO<sub>2</sub>、アミノ、アルキルアミノ、およびジアルキルアミノ基からなる群から選択される；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74】



ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>7</sub>、Xおよびnは、上で定義したとおりである；

R<sub>9</sub>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<sub>y</sub>)<sub>3</sub>であり、ここで、R<sub>y</sub>は、アルキルである、方法。

## 【請求項129】

R<sub>1</sub>が、水素である、請求項128に記載の方法。

## 【請求項130】

Yが、Brである、請求項128に記載の方法。

## 【請求項131】

Yが、Iである、請求項128に記載の方法。

## 【請求項132】

Yが、-Sn(Me)<sub>3</sub>である、請求項128に記載の方法。

## 【請求項133】

R<sub>9</sub>が、フェニルである、請求項128に記載の方法。

## 【請求項134】

R<sub>9</sub>が、置換フェニルである、請求項128に記載の方法。

## 【請求項135】

前記金属試薬が、リチウム試薬である、請求項128に記載の方法。

## 【請求項136】

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135に記載の方法。

## 【請求項137】

前記金属試薬が、亜鉛試薬である、請求項128に記載の方法。

## 【請求項138】

前記金属試薬が、マグネシウム試薬である、請求項128に記載の方法。

**【請求項 1 3 9】**

前記金属化トルエートが、グリニヤール試薬である、請求項 1 2 8 に記載の方法。

**【請求項 1 4 0】**

前記金属試薬が、0 原子価金属またはエト錯体である、請求項 1 2 8 に記載の方法。