

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年11月2日(2006.11.2)

【公表番号】特表2006-503048(P2006-503048A)

【公表日】平成18年1月26日(2006.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2006-004

【出願番号】特願2004-536644(P2004-536644)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 0 1

C 0 7 D 471/04 1 0 7 K

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月11日(2006.9.11)

【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

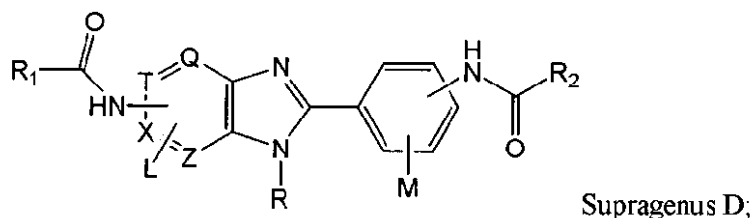
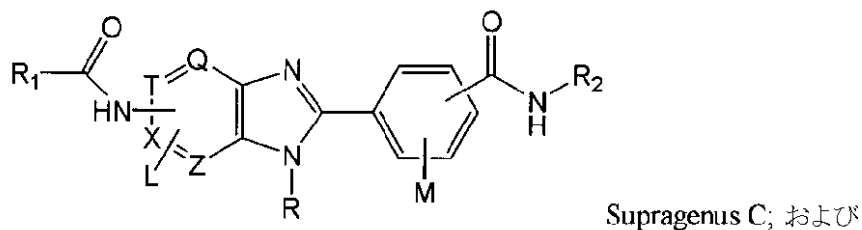
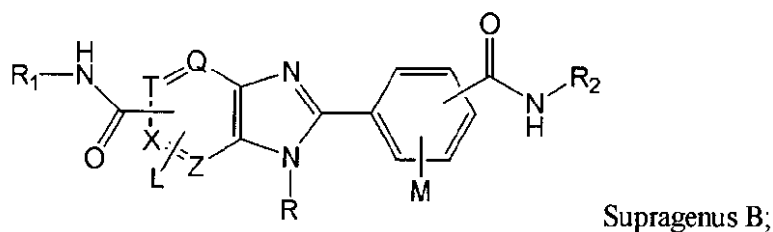
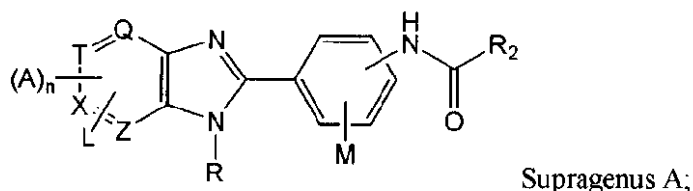
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次の式のいずれか1つで表される化合物またはその塩。

【化 1】



(式中、

Q、T、XおよびZは、それぞれ独立に、NまたはCより選択され、Q、T、XおよびZの1つはNであり、

Aは、H、ハロゲン、およびCONHR₁からなる群より選択され、

nは1～4の数であり、

LおよびMは、それぞれ独立に、H、アルキル、アルコキシ、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CF₃、OCF₃、CONH₂、CONHR、およびNHCOR₁からなる群より選択され、

Rは、H、C₁～C₅アルキル、ベンジル、p-フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記C₁～C₅アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R₁およびR₂は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、C₃～C₉シクロアルキル、置換C₃～C₉シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を1～3個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、OCH₃、COOH、COOR'COR'、CN、CF₃、OCF₃、NO₂、NR'R'、NHCOR'、およびCONR'R'からなる群より選択され、かつ

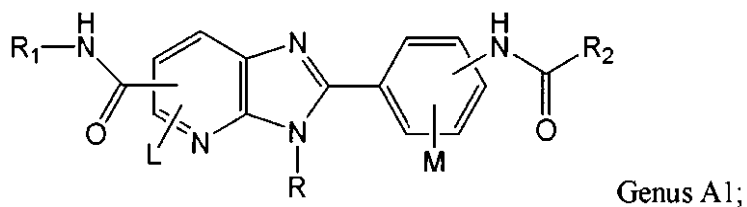
R'は、H、アルキル、置換アルキル、C₃～C₉シクロアルキル、置換C₃～C₉シ

クロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ～ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。)

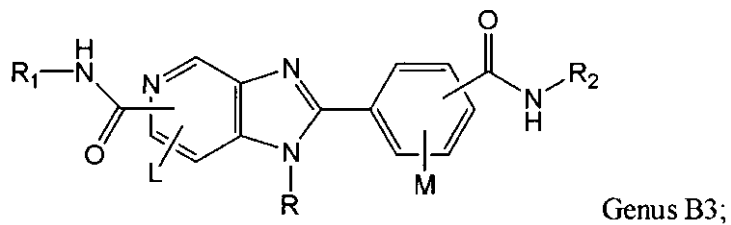
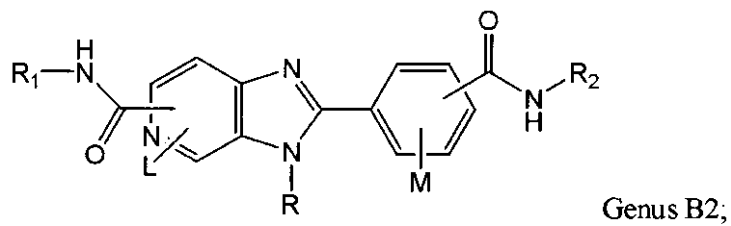
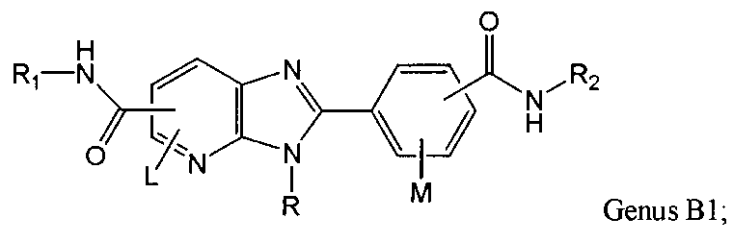
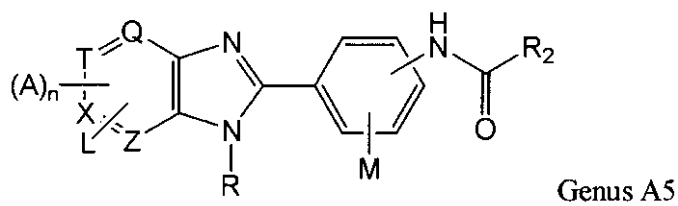
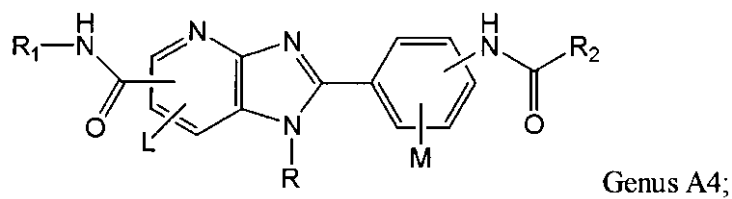
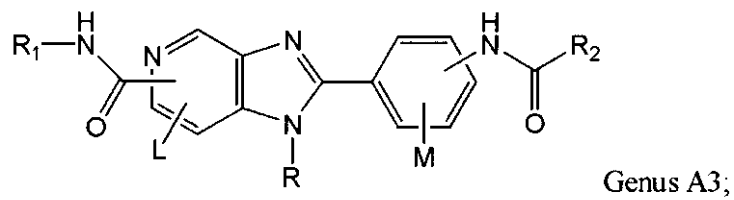
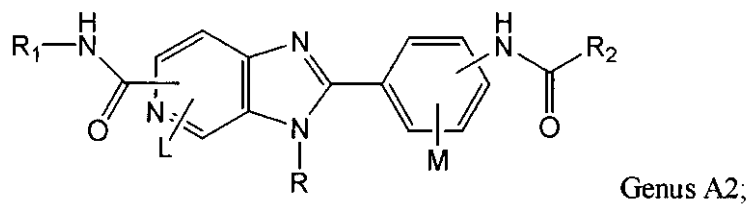
【請求項 2】

前記上位属 (Supragenus) A - D が次式で表される、請求項 1 に記載の 化合物またはその塩。

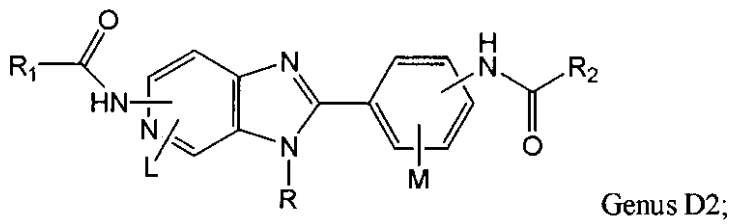
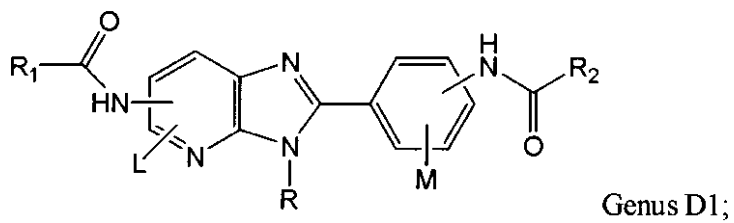
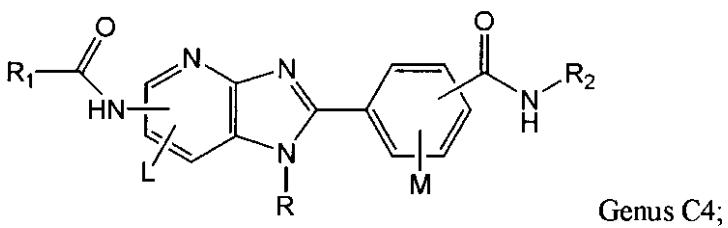
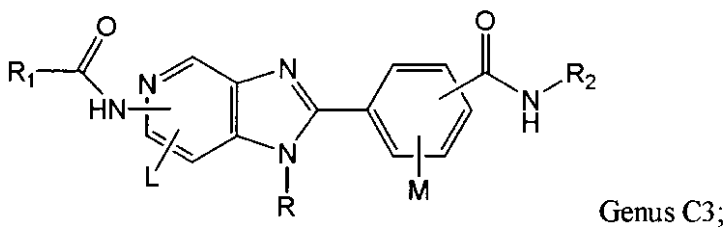
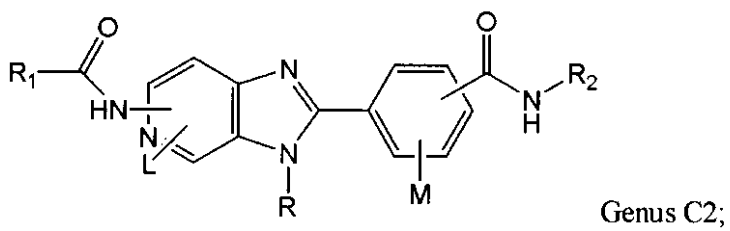
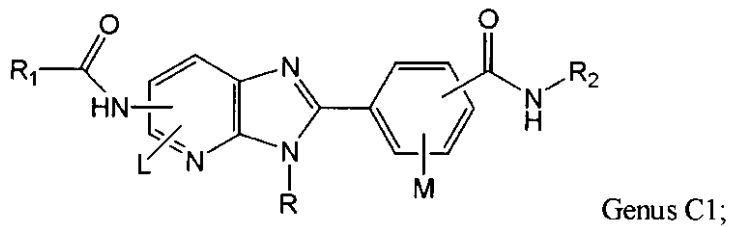
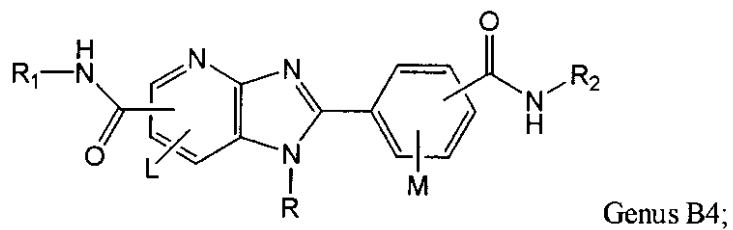
【化 2】



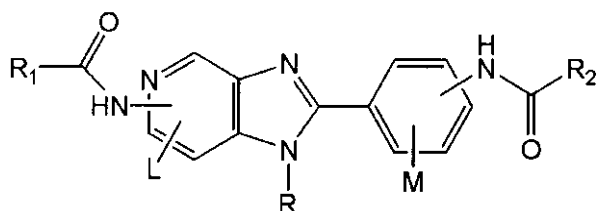
【化 3】



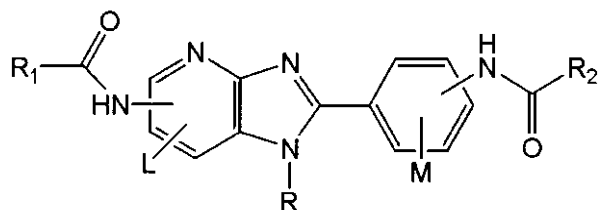
【化 4】



【化 5】



Genus D3; および



Genus D4;

(式中、

Q、T、XおよびZは、それぞれ独立に、NまたはCより選択され、Q、T、XおよびZの1つはNであり、

Aは、H、およびハロゲンからなる群より選択され、

nは1～4の数であり、

LおよびMは、それぞれ独立に、H、アルキル、アルコキシ、アリール、置換アリール、ヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、アルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 CF_3 、 OCF_3 、 CONH_2 、 CONHR 、および NHCOR_1 からなる群より選択され、

Rは、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルキル、ベンジル、p-フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_9$ シクロアルキル、置換 $\text{C}_3 \sim \text{C}_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を1～3個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、 OCH_3 、 COOH 、 COR' 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $\text{NR}'\text{R}'$ 、 NHCOR' 、および $\text{CONR}'\text{R}'$ からなる群より選択され、かつ

R' は、H、アルキル、置換アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_9$ シクロアルキル、置換 $\text{C}_3 \sim \text{C}_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。)

【請求項 3】

前記多環式脂肪族基が、アダマンチル、ビスシクロヘプチル、カンホリル、ビスシクロ[2, 2, 2]オクタニル、およびノルボルニルからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

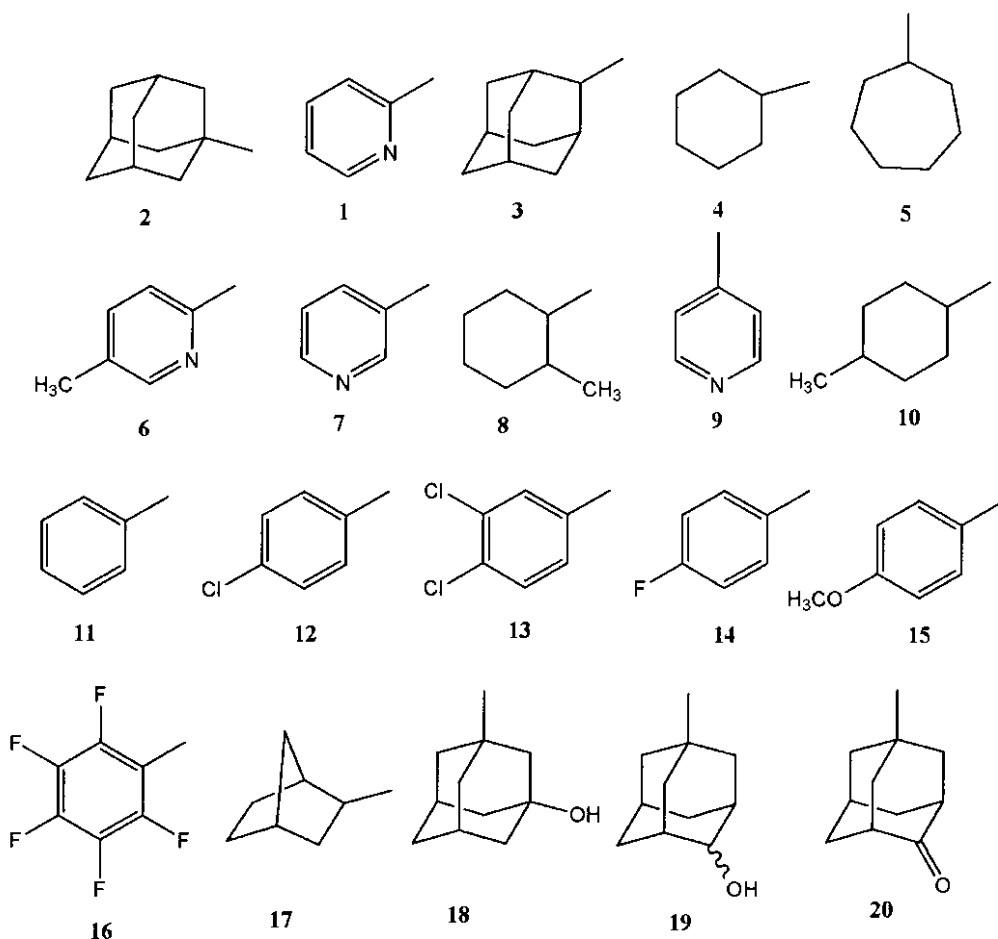
前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールが、ピリジン、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、ピリミジン、ピラジン、フラン、チオフェン、イソオキサゾール、ピロール、ピリダジン、1, 2, 3-トリアジン、1, 2, 4-トリアジン、1, 3

、5-トリアジン、ピラゾール、イミダゾール、インドール、キノリン、イソキノリン、ベンゾチオフィン、ベンゾフラン、パラチアジン、ピラン、クロメン、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、モルホリン、チオモルホリン、および対応する複素環からなる群より選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項5】

R₁ および R₂ が、それぞれ独立に、以下のものから選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

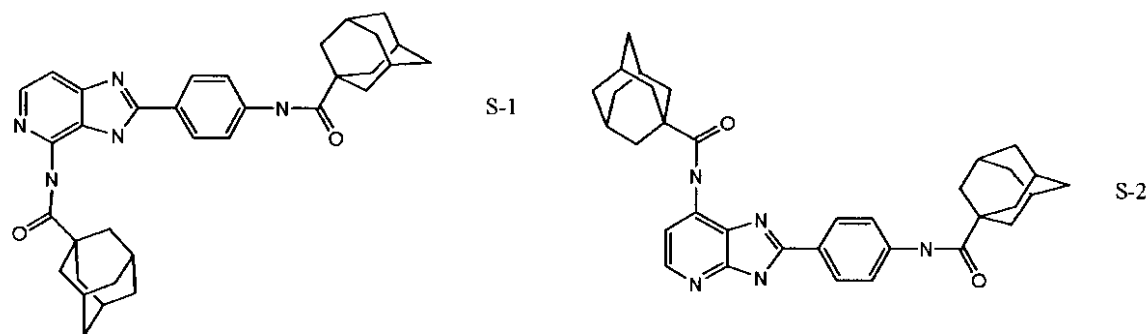
【化6】



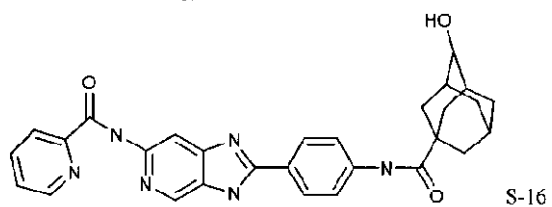
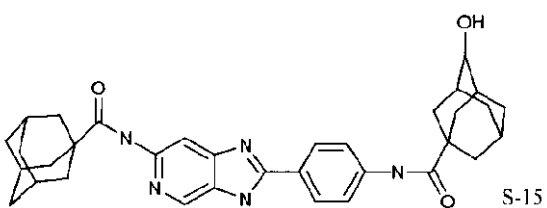
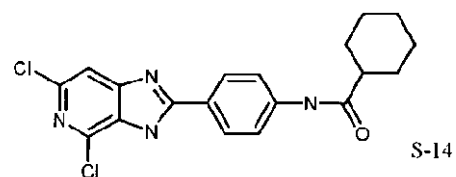
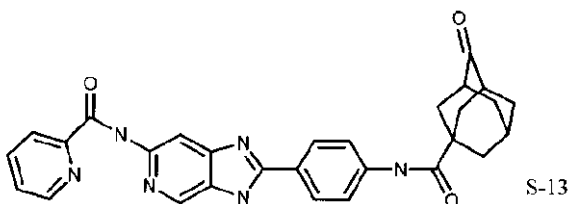
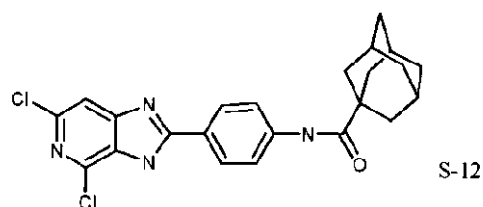
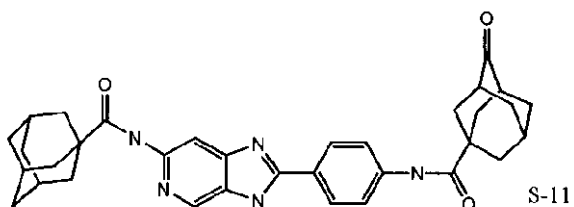
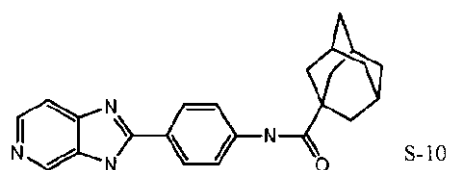
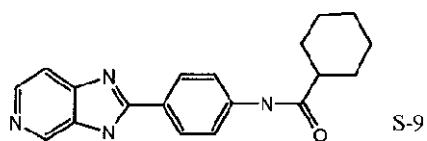
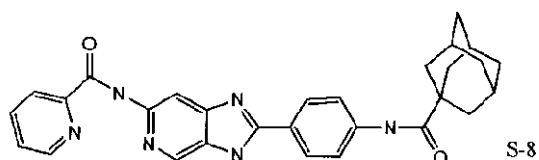
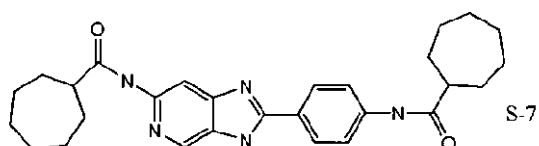
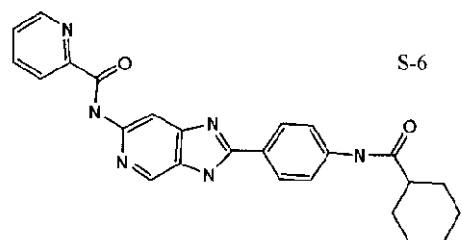
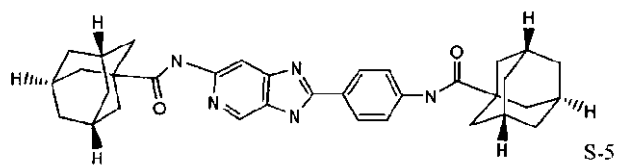
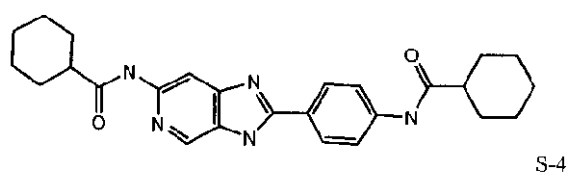
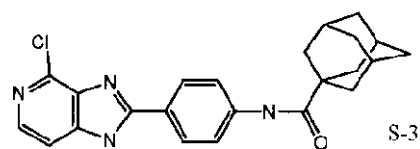
【請求項6】

以下のものからなる群より選択される化合物である、請求項1に記載の化合物またはその塩。

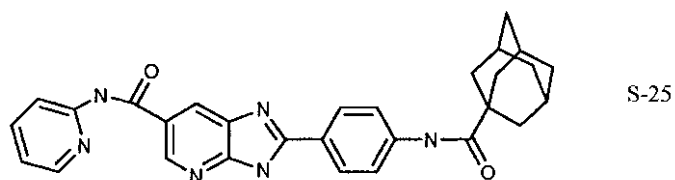
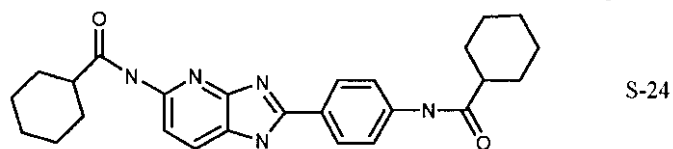
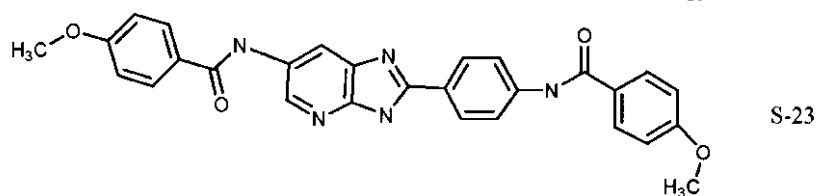
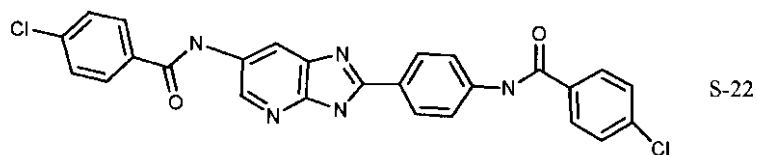
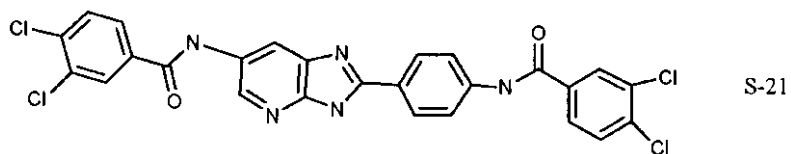
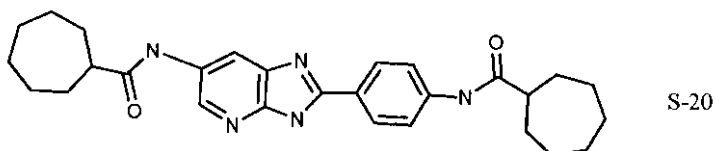
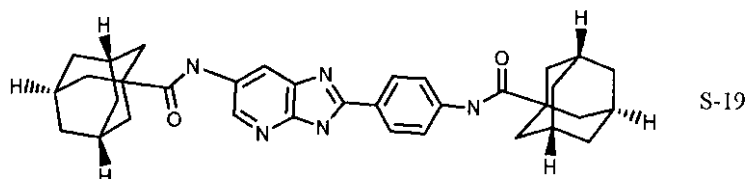
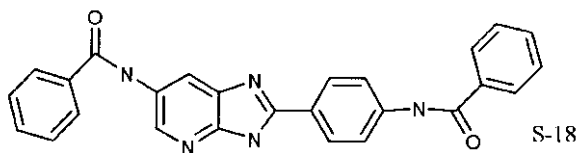
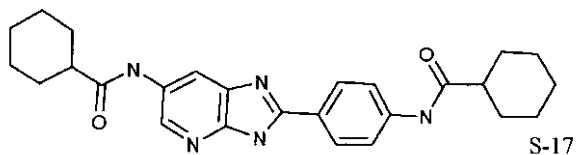
【化7】



【化 8】



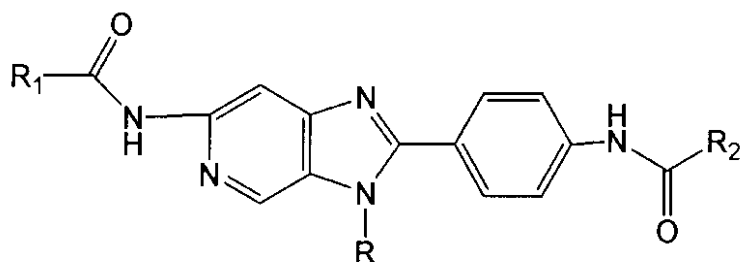
【化 9】



【請求項 7】

次の式で表される化合物またはその塩。

【化 10】



Subgenus D2a;

(式中、

R は、H、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ベンジル、p - フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_5$ アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ~ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

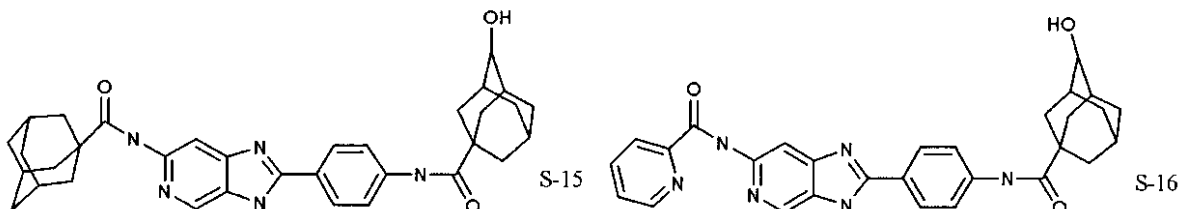
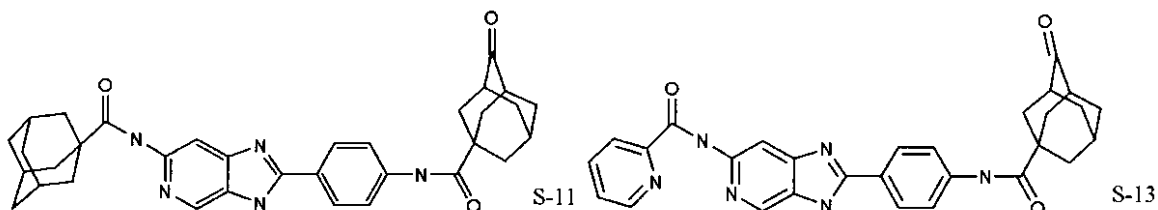
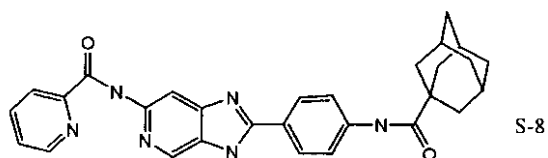
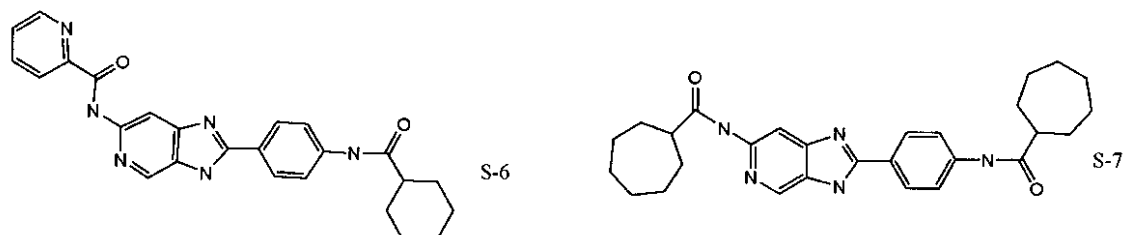
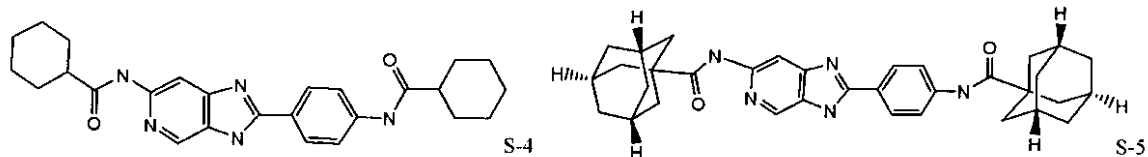
前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を 1 ~ 3 個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、 OCH_3 、 $COOH$ 、 $COOR'$ 、 COR' 、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $NR'R'$ 、 $NHCOR'$ 、および $CONR'R'$ からなる群より選択され、かつ

R' は、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ~ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。)

【請求項 8】

以下のものからなる群より選択される化合物である、請求項 7 に記載の化合物またはその塩。

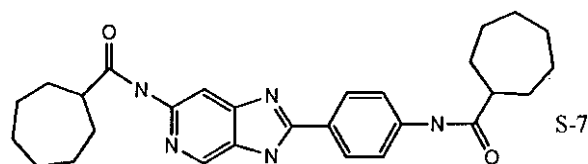
【化 1 1】



【請求項 9】

次の式で表される化合物またはその塩。

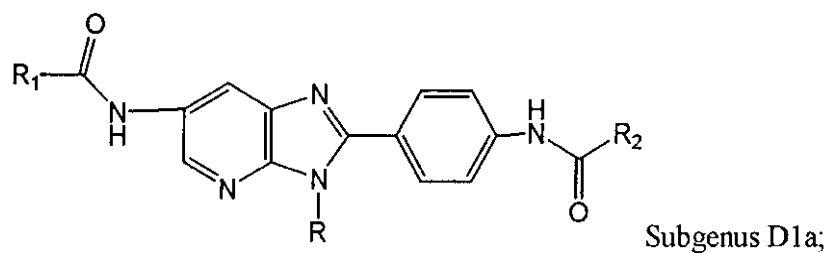
【化 1 2】



【請求項 10】

次の式で表される化合物またはその塩。

【化 1 3】



(式中、

R は、H、C₁ ~ C₅ アルキル、ベンジル、p - フルオロベンジル、およびジアルキル

アミノアルキルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_5$ アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

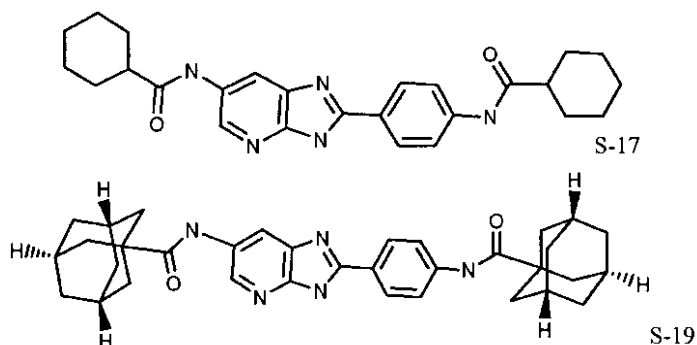
前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を1～3個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、 OCH_3 、 $COOH$ 、 $COOR'$ 、 COR' 、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $NR'R'$ 、 $NHCOR'$ 、および $CONR'R'$ からなる群より選択され、かつ

R' は、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。))

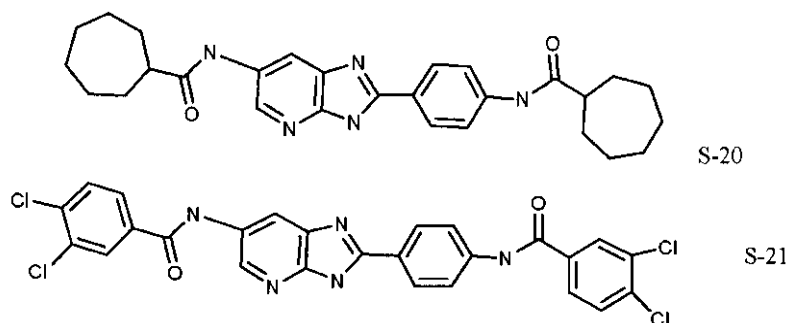
【請求項11】

以下のものからなる群より選択される化合物である、請求項10に記載の化合物またはその塩。

【化14】



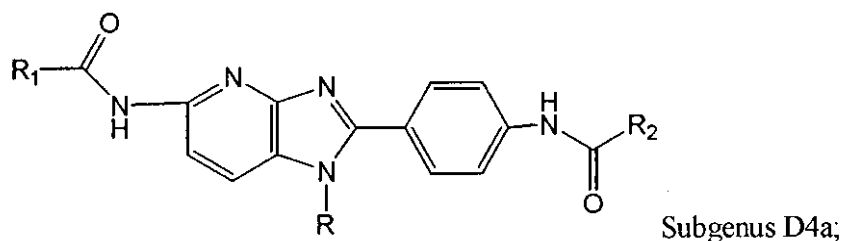
【化15】



【請求項12】

次の式で表される化合物またはその塩。

【化 16】



(式中、

R は、H、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ベンジル、p - フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_5$ アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ~ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

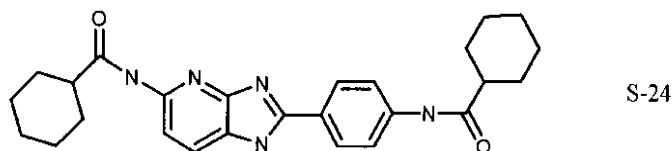
前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を 1 ~ 3 個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、 OCH_3 、 $COOH$ 、 $COOR'$ 、 COR' 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $NR'R'$ 、 $NHCOR'$ 、および $CONR'R'$ からなる群より選択され、かつ

R' は、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ~ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。))

【請求項 13】

次の式で表される化合物またはその塩。

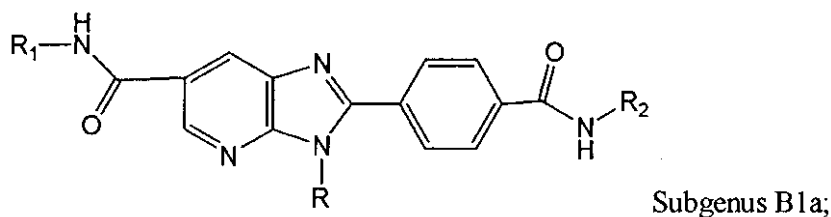
【化 17】



【請求項 14】

次の式で表される化合物またはその塩。

【化 18】



(式中、

R は、H、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ベンジル、p - フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_5$ アルキルは直鎖、分枝、または

環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ～ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

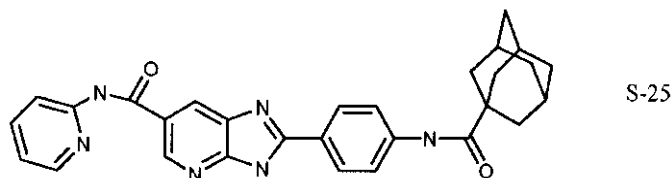
前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を 1 ～ 3 個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボニル、OH、 OCH_3 、 $COOH$ 、 $COOR'$ 、 COR' 、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $NR'R'$ 、 $NHCOR'$ 、および $CONR'R'$ からなる群より選択され、かつ

R' は、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ～ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。)

【請求項 15】

次の式で表される化合物またはその塩。

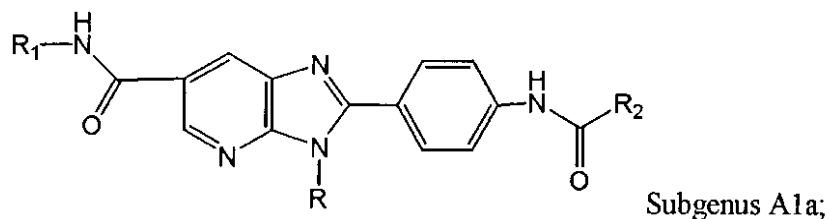
【化 19】



【請求項 16】

次の式で表される化合物またはその塩。

【化 20】



(式中、

R は、H、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、ベンジル、p-フルオロベンジル、およびジアルキルアミノアルキルからなる群より選択され、前記 $C_1 \sim C_5$ アルキルは直鎖、分枝、または環状アルキルからなる群より選択され、

R_1 および R_2 は、それぞれ独立に、H、アルキル、置換アルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、置換 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、多環式脂肪族基、置換多環式脂肪族基、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を 1 ～ 3 個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択され、

前記置換多環式脂肪族基、置換フェニル、置換ナフチル、および置換ヘテロアリールは置換基を 1 ～ 3 個含み、前記置換基は、H、ハロゲン、ポリハロゲン、アルコキシ基、置換アルコキシ、アルキル、置換アルキル、ジアルキルアミノアルキル、ヒドロキシアルキル

ル、カルボニル、OH、OCH₃、COOH、COOR'COR'、CN、CF₃、OCF₃、NO₂、NR'R'、NHCOR'、およびCONR'R'からなる群より選択され、かつ

R'は、H、アルキル、置換アルキル、C₃～C₉シクロアルキル、置換C₃～C₉シクロアルキル、多環式脂肪族、フェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群より選択され、前記ヘテロアリールおよび前記置換ヘテロアリールはヘテロ原子を1～3個含み、前記ヘテロ原子は、独立に、窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される。)

【請求項17】

アレルギー反応を治療または予防するための、および/または、哺乳動物においてサイトカインまたは白血球を阻害するための薬剤を調製するための、少なくとも1種の請求項1に記載の化合物またはその塩の使用。

【請求項18】

前記薬剤が、さらに、前記アレルギー反応に伴う症状の少なくとも1種の低減に活性である追加成分を少なくとも1種含む、請求項17に記載の使用。

【請求項19】

前記少なくとも1種の追加成分が、短時間作用型₂-アドレナリンアゴニスト、長時間作用型₂-アドレナリンアゴニスト、抗ヒスタミン薬、ホスホジエステラーゼ阻害剤、抗コリン作用剤、コルチコステロイド、炎症性メディエータ遊離抑制剤、およびロイコトリエン受容体アンタゴニストからなる群より選択される、請求項18に記載の使用。

【請求項20】

前記少なくとも1種の追加成分が、薬剤として許容される希釈剤中で前記少なくとも1種の化合物またはその塩と組み合わせられている、請求項18または19に記載の使用。

【請求項21】

前記薬剤が、前記少なくとも1種の化合物またはその塩を1日当たり体重1kgにつき約0.01mg～約100mgの用量で与えるように調剤されている、請求項17～20のいずれか一項に記載の使用。

【請求項22】

前記薬剤が、前記用量を一定間隔をあけて分割して投与するように調剤されている、請求項21に記載の使用。

【請求項23】

前記一定間隔が一日である、請求項22に記載の使用。

【請求項24】

哺乳動物の喘息を治療または予防するための薬剤を調製するための、少なくとも1種の請求項1に記載の化合物またはその塩の使用。

【請求項25】

前記薬剤が、さらに、前記喘息に伴う症状の少なくとも1種の低減に活性である追加成分を少なくとも1種含む、請求項24に記載の使用。

【請求項26】

前記追加成分が、短時間作用型₂-アドレナリンアゴニスト、長時間作用型₂-アドレナリンアゴニスト、抗ヒスタミン薬、ホスホジエステラーゼ阻害剤、抗コリン作用剤、コルチコステロイド、炎症性メディエータ遊離抑制剤、およびロイコトリエン受容体アンタゴニストからなる群より選択される、請求項25に記載の使用。

【請求項27】

哺乳動物において細胞増殖を阻害するための薬剤を調製するための、少なくとも1種の請求項1に記載の化合物またはその塩の使用。

【請求項28】

前記薬剤が、さらに、前記細胞増殖に伴う症状の少なくとも1種の低減に活性である追加成分を少なくとも1種含む、請求項27に記載の使用。

【請求項29】

前記少なくとも１種の追加成分が、抗真菌薬、抗ウイルス剤、抗生物質、抗炎症剤、および抗癌剤からなる群より選択される、請求項２８に記載の使用。

【請求項３０】

前記少なくとも１種の追加成分が、アルキル化剤、代謝拮抗物質、ＤＮＡ切断剤、トポイソメラーゼⅠ阻害剤、トポイソメラーゼⅡ阻害剤、ＤＮＡ結合剤、および紡錘体毒からなる群より選択される、請求項２８に記載の使用。

【請求項３１】

前記少なくとも１種の追加成分が、薬剤として許容される希釈剤中で前記少なくとも１種の化合物またはその塩と組み合わせられている、請求項２８～３０のいずれか一項に記載の使用。

【請求項３２】

前記薬剤が、前記少なくとも１種の化合物またはその塩を１日当たり体重１ｋｇにつき約０．０１ｍｇ～約１００ｍｇの用量で与えるように調剤されている、請求項２７～３１のいずれか一項に記載の使用。

【請求項３３】

前記薬剤が、前記用量を一定間隔をあけて分割して投与するように調剤されている、請求項３２に記載の使用。

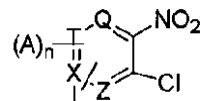
【請求項３４】

前記一定間隔が一日である、請求項３３に記載の使用。

【請求項３５】

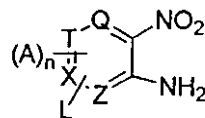
請求項１に記載の上位属（Supragenus）Ａの化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化２１】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

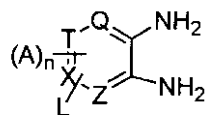
【化２２】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

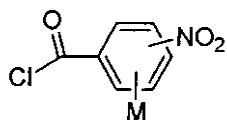
【化２３】



の第二の中間体を生成する工程；

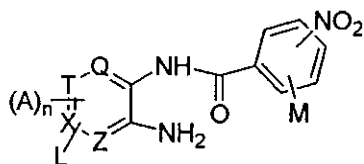
第二の中間体と式：

【化２４】



の化合物とを反応させ、式：

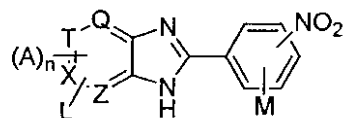
【化 2 5】



の第三の中間体を生成する工程；

酸を使用して第三の中間体を環化し、式：

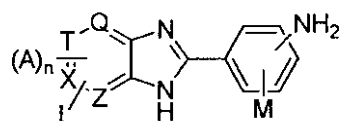
【化 2 6】



の第四の中間体を生成する工程；

第四の中間体を還元し、式：

【化 2 7】



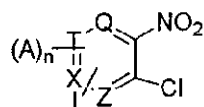
の第五の中間体を生成する工程；および

第五の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属（Supragenus）Aの化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 3 6】

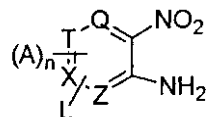
請求項 1 に記載の上位属（Supragenus）Aの化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化 2 8】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

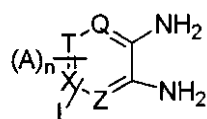
【化 2 9】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

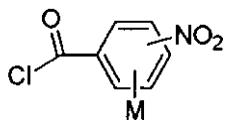
【化 3 0】



の第二の中間体を生成する工程；

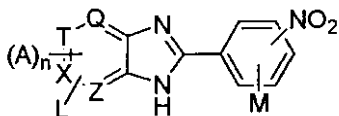
第二の中間体と式：

【化 3 1】



の化合物とを反応させ、式：

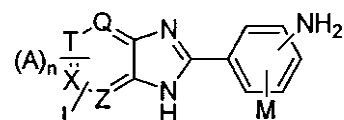
【化 3 2】



の第三の中間体を生成する工程；

第三の中間体を還元し、式：

【化 3 3】



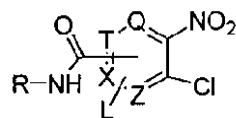
の第四の中間体を生成する工程；および

第四の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属（Supragenus）A の化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 3 7】

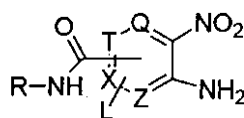
請求項 1 に記載の上位属（Supragenus）B の化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化 3 4】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

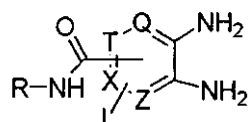
【化 3 5】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

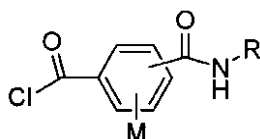
【化 3 6】



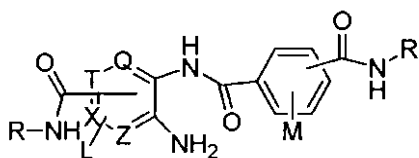
の第二の中間体を生成する工程；

第二の中間体と式：

【化 3 7】

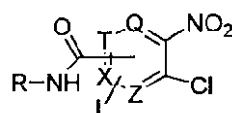


【化 3 8】

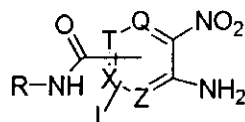


【請求項 38】

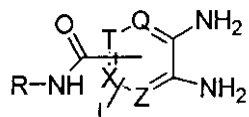
【化 3 9】



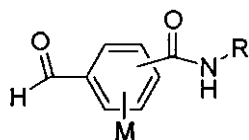
【化 4 0】



【化 4 1】

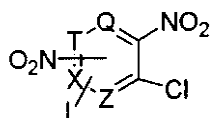


【化 4 2】



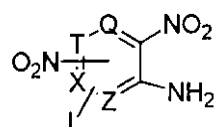
【請求項 39】

【化 4 3】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

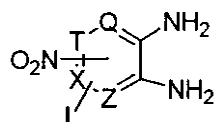
【化 4 4】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

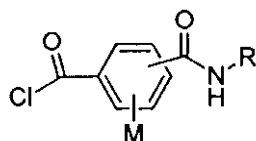
【化 4 5】



の第二の中間体を生成する工程；

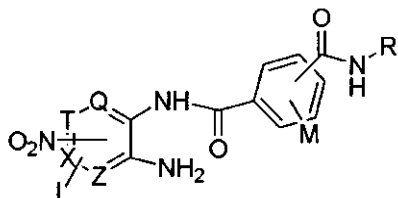
第二の中間体と式：

【化 4 6】



の化合物とを反応させ、式：

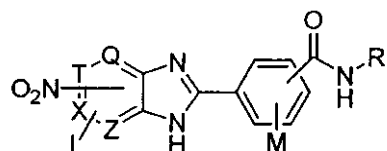
【化 4 7】



の第三の中間体を生成する工程；

酸を使用して第三の中間体を環化し、式：

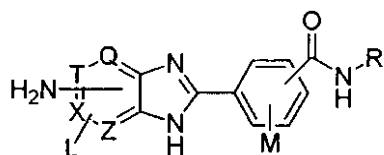
【化 4 8】



の第四の中間体を生成する工程；

第四の中間体を還元し、式：

【化 4 9】



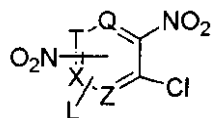
の第五の中間体を生成する工程；および

第五の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属（Supragenus）C の化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 4 0】

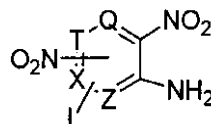
請求項 1 に記載の上位属 (Supragenus) C の化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化 5 0】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

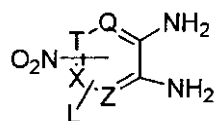
【化 5 1】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

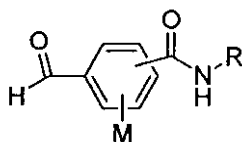
【化 5 2】



の第二の中間体を生成する工程；

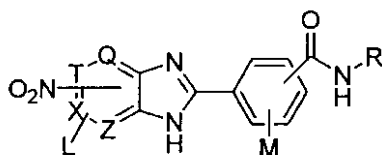
第二の中間体と式：

【化 5 3】



の化合物とを反応させ、式：

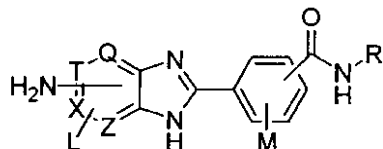
【化 5 4】



の第三の中間体を生成する工程；

第三の中間体を還元し、式：

【化 5 5】



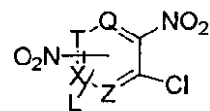
の第四の中間体を生成する工程；および

第四の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属 (Supragenus) C の化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 4 1】

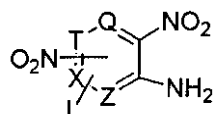
請求項 1 に記載の上位属 (Supragenus) D の化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化 5 6】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

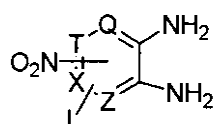
【化 5 7】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

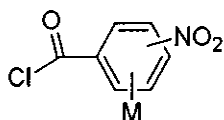
【化 5 8】



の第二の中間体を生成する工程；

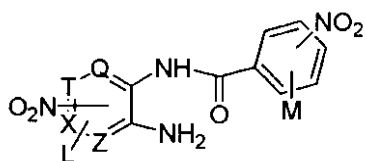
第二の中間体と式：

【化 5 9】



の化合物とを反応させ、式：

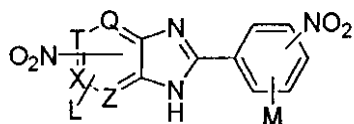
【化 6 0】



の第三の中間体を生成する工程；

酸を使用して第三の中間体を環化し、式：

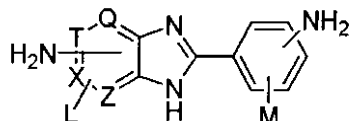
【化 6 1】



の第四の中間体を生成する工程；

第四の中間体を還元し、式：

【化 6 2】



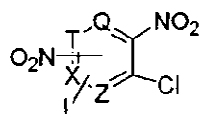
の第五の中間体を生成する工程；および

第五の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属（Supragenus）Dの化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 4 2】

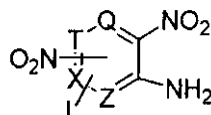
請求項 1 に記載の上位属（Supragenus）Dの化合物またはその塩の調製方法であって、式：

【化 6 3】



の化合物と水酸化アンモニウムとを反応させ、式：

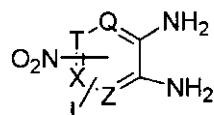
【化 6 4】



の第一の中間体を生成する工程；

第一の中間体と硫化ジアンモニウムとを反応させ、式：

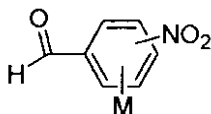
【化 6 5】



の第二の中間体を生成する工程；

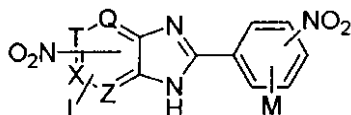
第二の中間体と式：

【化 6 6】



の化合物とを反応させ、式：

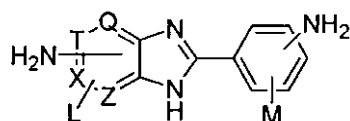
【化 6 7】



の第三の中間体を生成する工程；

第三の中間体を還元し、式：

【化 6 8】



の第四の中間体を生成する工程；および

第四の中間体と塩化アシルとを反応させ、上位属（Supragenus）Dの化合物またはその塩を生成する工程を含む方法。

【請求項 4 3】

哺乳動物において I g E 濃度の上昇に関連するアレルギー反応を治療または予防する、

細胞増殖を阻害する、および／または、サイトカインあるいは白血球を阻害するための薬剤組成物であって、

請求項 1 に記載の化合物またはその塩 1 種以上を含む組成物。

【請求項 4 4】

さらに、前記アレルギー反応に伴う症状の少なくとも 1 種、細胞増殖を低減する、および／または、サイトカインあるいは白血球の阻害に活性である追加成分を少なくとも 1 種含む、請求項 4 3 に記載の薬剤組成物。