

【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】令和2年8月6日(2020.8.6)

【公表番号】特表2019-524674(P2019-524674A)

【公表日】令和1年9月5日(2019.9.5)

【年通号数】公開・登録公報2019-036

【出願番号】特願2018-568296(P2018-568296)

【国際特許分類】

C 07 D 307/28	(2006.01)
C 07 D 493/22	(2006.01)
C 07 D 493/04	(2006.01)
C 07 D 493/18	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 F 7/18	(2006.01)
A 61 K 31/357	(2006.01)
C 07 B 53/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 307/28	C S P
C 07 D 493/22	
C 07 D 493/04	1 0 6 A
C 07 D 493/18	
A 61 P 43/00	1 1 1
C 07 F 7/18	S
C 07 F 7/18	V
A 61 K 31/357	
C 07 B 53/00	G

【手続補正書】

【提出日】令和2年6月29日(2020.6.29)

【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】

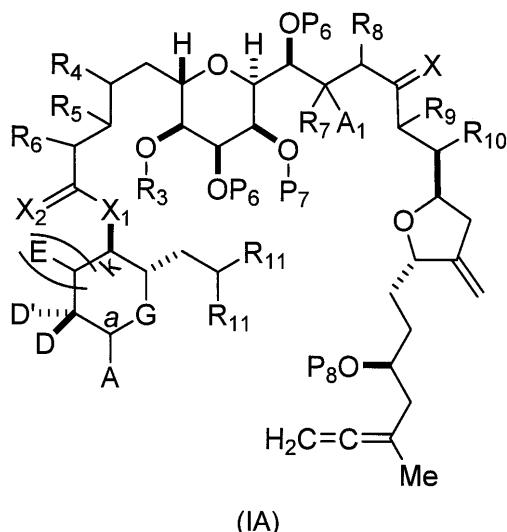
【請求項1】

ハリコンドリンマクロライドまたはその類縁体の合成において大環状中間体を調製する方法であって、前記方法は、式(I A)の中間体をR<sub>1</sub>OHおよびルイス酸と反応させることを含み、前記反応は、ハリコンドリンマクロライドまたはその類縁体の構造中に結合を形成することにより大環状中間体を生成し、

ここでR<sub>1</sub>は任意選択的に置換されたアシルであり；

ここで式(I A)の化合物は、

## 【化1】

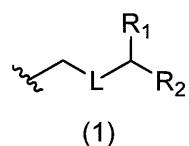


またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

D および D' の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しD および D' の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1~6</sub>飽和もしくはC<sub>2~6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、オキソ、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1~10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化2】



ここで

Lは、-(CH(OP<sub>2</sub>))-、-(C(OH)(OP<sub>2</sub>))-、または-C(O)-であり；

R<sub>1</sub>はHであるか、またはR<sub>1</sub>およびP<sub>1</sub>は合わさって結合を形成し；

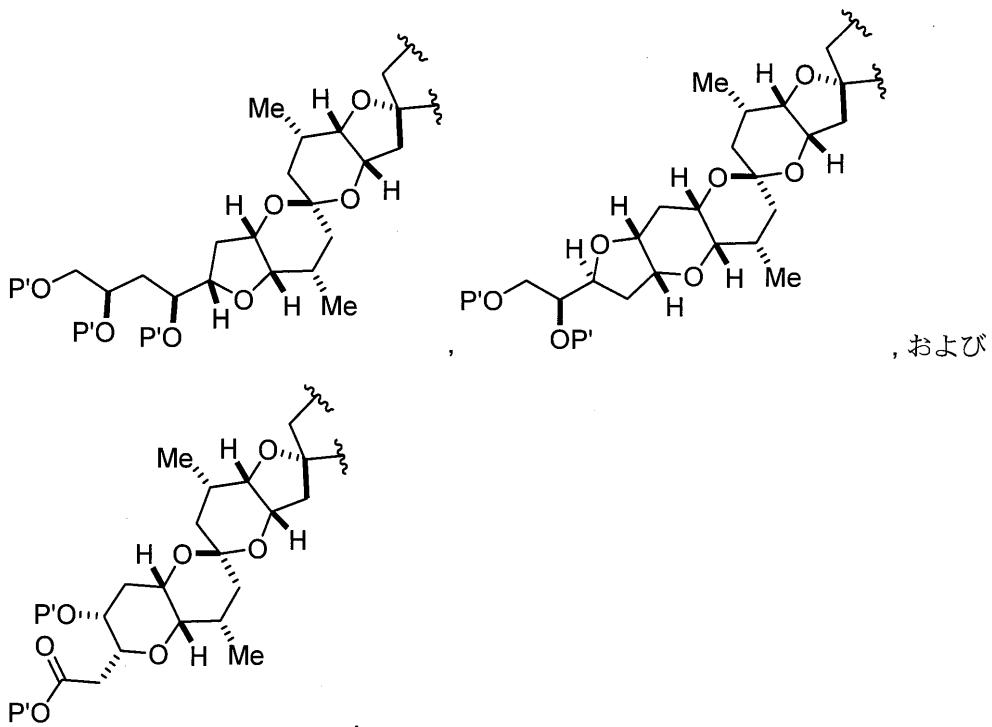
(i) R<sub>2</sub>はHであり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>であり、ここでP<sub>3</sub>はN-保護基であり、そして(a) P<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>4</sub>はN-保護基であり、または(b) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>5</sub>は、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり；またはP<sub>2</sub>およびP<sub>5</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル-ジオキソ、もしくはシリレン-ジオキソを形成し；あるいは

(iv) R<sub>2</sub>およびP<sub>2</sub>は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化3】



ここで各  $P'$  は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

E は、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

G は、O、S、 $\text{CH}_2$ 、または  $\text{NR}_N$  であり、ここで  $R_N$  は H、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各  $Q_1$  は独立して  $OR_A$ 、 $SR_A$ 、 $SO_2R_A$ 、 $OSO_2R_A$ 、 $NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)OR_A$ 、 $O(CO)R_A$ 、 $(CO)NR_BR_A$ 、または  $O(CO)NR_BR_A$  であり、ここで  $R_A$  および  $R_B$  の各々は、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル-アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または 2 であり；

k は 0 または 1 であり；

$X_1$  は  $-\text{CH}(Y)-$ 、 $-\text{CH}_2-$ 、または  $-\text{O}-$  であり；

$X_2$  は =O であるか、または  $X_2$  はそれが付く炭素原子と一緒にになって  $- (\text{C}(\text{R}_X)_2) -$  であり；ここで各  $R_X$  は独立して H、 $-OR_{X1}$ 、または  $-SR_{X1}$  であり、但し少なくとも 1 つの  $R_X$  は、存在する場合、 $-OR_{X1}$  または  $-SR_{X1}$  であるという条件であり；ここで各  $R_{X1}$  は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方の  $R_{X1}$  は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し、但し  $X_1$  が  $-\text{O}-$  であるとき、 $X_2$  は =O であるという条件であり；

Y は  $SO_2R_c$  または  $COOR_c$  であり、ここで Y が  $SO_2R_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして Y が  $COOR_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H であり；

あるいはR<sub>3</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub>ならびにR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の一方は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りのR<sub>4</sub>またはR<sub>6</sub>はHであり；

A<sub>1</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさってオキソを形成し、P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>8</sub>はHであり；

あるいは

A<sub>1</sub>はHもしくはOP'であり、そして

(a) P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれぞれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(b) P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHもしくはOP'であり；

(i) 各P<sub>6</sub>は独立してHもしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方のP<sub>6</sub>はそれぞれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；Xは=Oであるか、またはXはそれが付く炭素原子と合わさって-(CH(OP<sub>9</sub>))-を形成し、ここでP<sub>9</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり；そして各R<sub>11</sub>は-OP<sub>10</sub>であるか、または両方のR<sub>11</sub>は合わさってオキソを形成し、ここでP<sub>10</sub>はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

(ii) 両方のP<sub>6</sub>およびXは、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタールを形成し、P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHまたはOP'であり；そして各R<sub>11</sub>は-OP<sub>10</sub>であるか、または両方のR<sub>11</sub>は合わさってオキソを形成し、ここでP<sub>10</sub>はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；あるいは

(iii) 両方のP<sub>6</sub>および両方のR<sub>11</sub>は、それらが付く原子と一緒にになって、合わさってアセタールを形成し；そしてXは=Oであるか、またはXはそれが付く炭素原子と合わさって-(CH(OP<sub>9</sub>))-を形成し、ここでP<sub>9</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり；

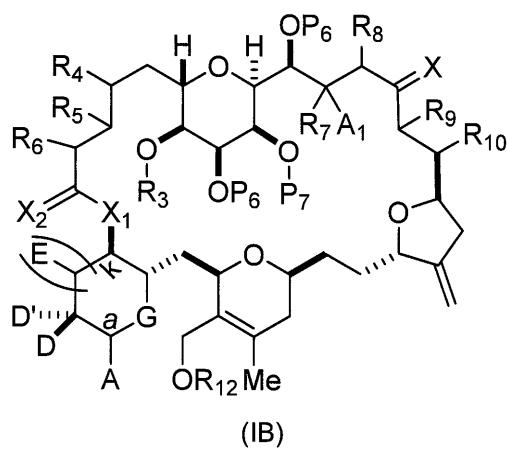
R<sub>9</sub>はH、OP'、もしくはYであり、そしてR<sub>10</sub>はHであり；またはR<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し；

各P'は、存在する場合、独立して、Hまたはヒドロキシル保護基であり；そして

P<sub>8</sub>はHまたはシリルであり；そして

ここでハロコンドリンマクロライドまたはその類縁体の合成における大環状中間体は、式(I B)の化合物

【化4】



またはその塩もしくは互変異性体である、方法。

【請求項2】

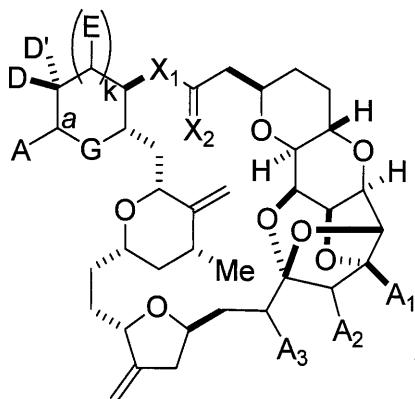
前記ルイス酸は親酸素性ルイス酸である、請求項1に記載の方法。

## 【請求項3】

前記親酸素性ルイス酸は、三フッ化ホウ素またはその溶媒和物である、請求項2に記載の方法。

## 【請求項4】

## 【化5】



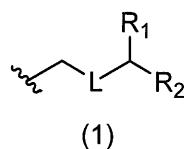
ハリコンドリンマクロライドまたはその類縁体

またはその塩を調製する方法であって、

ここで

DおよびD'の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD'の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>飽和もしくはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、オキソ、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1~10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化6】



ここで

Lは、-(CH(OP<sub>2</sub>))-、-(C(OH)(OP<sub>2</sub>))-、または-C(O)-であり；

R<sub>1</sub>はHであるか、またはR<sub>1</sub>およびP<sub>1</sub>は合わさって結合を形成し；

(i) R<sub>2</sub>はHであり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

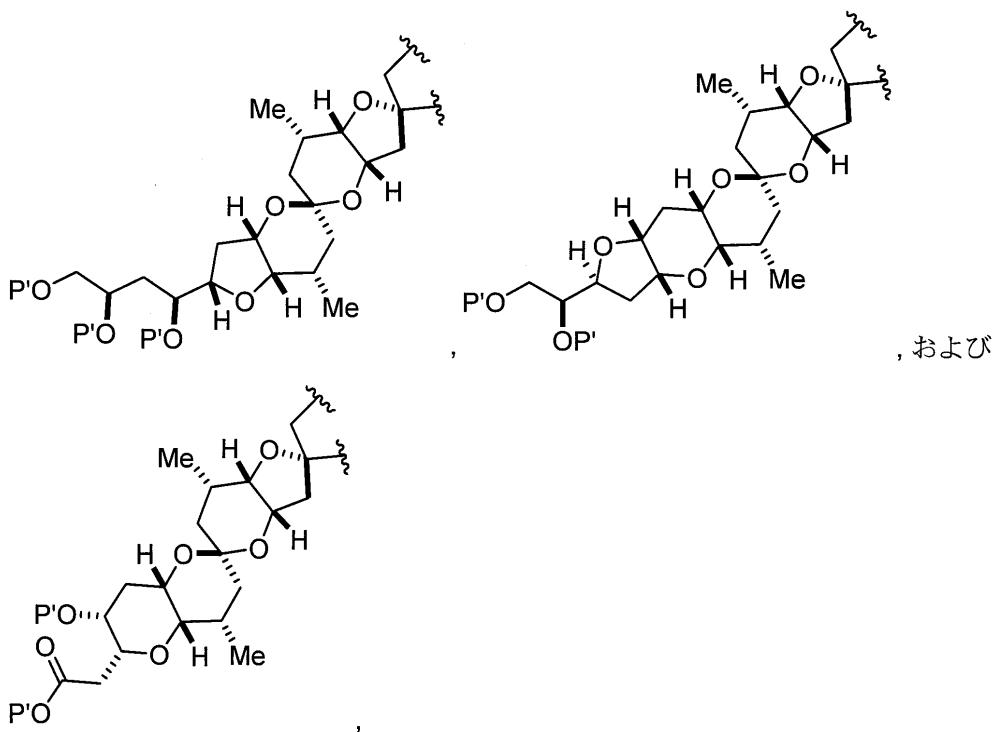
(ii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>であり、ここでP<sub>3</sub>はHまたはN-保護基であり、そして(a) P<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>4</sub>はN-保護基であり、または(b) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>は合わさってアルキリデンを形成し、または(c) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>の各々はHであり；

(iii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>5</sub>は、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり；またはP<sub>2</sub>およびP<sub>5</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル-ジオキソ、もしくはシリレン-ジオキソを形成し；あるいは

(iv) R<sub>2</sub>およびP<sub>2</sub>は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、また

は以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化7】



ここで各  $P'$  は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

$A_1$ 、 $A_2$ 、および  $A_3$  の各々は独立して H または  $OP''$  であり、ここで各  $P''$  は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

E は、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

G は、O、S、 $CH_2$ 、または  $NR_N$  であり、ここで  $R_N$  は H、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各  $Q_1$  は独立して  $OR_A$ 、 $SR_A$ 、 $SO_2R_A$ 、 $OSO_2R_A$ 、 $NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)OR_A$ 、 $O(CO)R_A$ 、 $(CO)NR_BR_A$ 、または  $O(CO)NR_BR_A$  であり、ここで  $R_A$  および  $R_B$  の各々は、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル-アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または 2 であり；

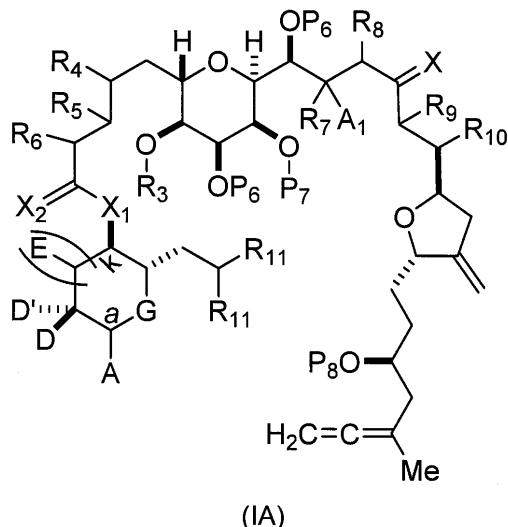
k は 0 または 1 であり；および

$X_1$  は  $-CH_2-$  または  $-O-$  であり、そして  $X_2$  は  $=O$  であり；

前記方法が、

(A) 式 (IA) の化合物および  $R_{1-2}OH$  から式 (IB) の化合物を生成すること、ここで  $R_{1-2}$  は任意選択的に置換されたアシルであり、式 (IA) の化合物は、以下の構造のもの、

## 【化8】

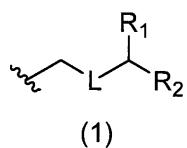


またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

DおよびD'の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD'の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>飽和もしくはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、オキソ、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1~10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化9】



ここで

Lは、-(CH(OP<sub>2</sub>))-、-(C(OH)(OP<sub>2</sub>))-、または-C(O)-であり；

R<sub>1</sub>はHであるか、またはR<sub>1</sub>およびP<sub>1</sub>は合わさって結合を形成し；

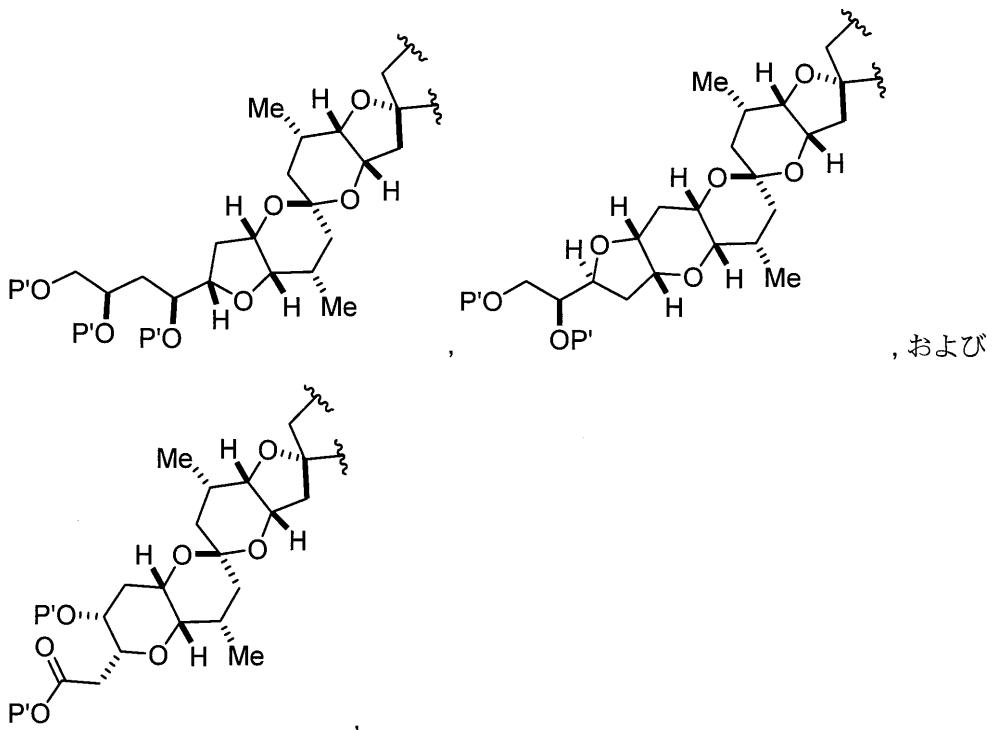
(i) R<sub>2</sub>はHであり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>であり、ここでP<sub>3</sub>はN-保護基であり、そして(a) P<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>4</sub>はN-保護基であり、または(b) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>5</sub>は、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり；またはP<sub>2</sub>およびP<sub>5</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル-ジオキソ、もしくはシリレン-ジオキソを形成し；あるいは

(iv) R<sub>2</sub>およびP<sub>2</sub>は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化10】



ここで各 P' は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

E は、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

G は、O、S、CH<sub>2</sub>、またはNR<sub>N</sub>であり、ここでR<sub>N</sub>はH、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各Q<sub>1</sub>は独立してOR<sub>A</sub>、SR<sub>A</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、OSO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)OR<sub>A</sub>、(CO)OR<sub>A</sub>、(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、またはO(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>であり、ここでR<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>の各々は、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル-アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または2 であり；

k は 0 または 1 であり；

X<sub>1</sub> は、-CH(Y)-、-CH<sub>2</sub>-、または-O- であり、そしてX<sub>2</sub> は=O であるか、またはX<sub>2</sub> はそれが付く炭素原子と一緒にになって-(C(R<sub>x</sub>)<sub>2</sub>)- であり；ここで各R<sub>x</sub> は独立してH、-OR<sub>x</sub><sub>1</sub>、または-SR<sub>x</sub><sub>1</sub> であり、但し少なくとも1つのR<sub>x</sub> は、存在する場合、-OR<sub>x</sub><sub>1</sub> または-SR<sub>x</sub><sub>1</sub> であるという条件であり；ここで各R<sub>x</sub><sub>1</sub> は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方のR<sub>x</sub><sub>1</sub> は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し、但しX<sub>1</sub> が-O- であるとき、X<sub>2</sub> は=O であるという条件であり；そしてここでY は SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> または COOR<sub>c</sub> であり、ここでY が SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> であるとき、R<sub>c</sub> は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そしてY が COOR<sub>c</sub> であるとき、R<sub>c</sub> は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

R<sub>3</sub> およびR<sub>5</sub> は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>4</sub> およびR<sub>6</sub> の各々はH であり；あるいはR<sub>3</sub> はH またはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub> ならびにR<sub>4</sub> およびR<sub>6</sub> の一方

は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの R<sub>4</sub> または R<sub>6</sub> は H であり；

A<sub>1</sub> および R<sub>7</sub> は合わさってオキソを形成し、P<sub>7</sub> は H もしくはヒドロキシル保護基であり、そして R<sub>8</sub> は H であり；

あるいは

A<sub>1</sub> は H もしくは O P' であり、そして

(i) P<sub>7</sub> は H もしくはヒドロキシル保護基であり、そして R<sub>7</sub> および R<sub>8</sub> はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(ii) P<sub>7</sub> および R<sub>7</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>8</sub> は H もしくは O P' であり；

(i) 各 P<sub>6</sub> は独立して H もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の P<sub>6</sub> はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し； X は =O であるか、または X はそれが付く炭素原子と合わさって - (C H (O P<sub>9</sub>) ) - を形成し、ここで P<sub>9</sub> は H またはヒドロキシル保護基であり；そして各 R<sub>11</sub> は - O P<sub>10</sub> であるか、または両方の R<sub>11</sub> は合わさってオキソを形成し、ここで P<sub>10</sub> はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

(ii) 両方の P<sub>6</sub> および X は、それが付く原子と一緒にになって、合わさってケタールを形成し、P<sub>7</sub> および R<sub>7</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>8</sub> は H または O P' であり；そして各 R<sub>11</sub> は - O P<sub>10</sub> であるか、または両方の R<sub>11</sub> は合わさってオキソを形成し、ここで P<sub>10</sub> はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；あるいは

(iii) 両方の P<sub>6</sub> および両方の R<sub>11</sub> は、それらが付く原子と一緒にになって、合わさってアセタールを形成し；そして X は =O であるか、または X はそれが付く炭素原子と合わさって - (C H (O P<sub>9</sub>) ) - を形成し、ここで P<sub>9</sub> は H またはヒドロキシル保護基であり；

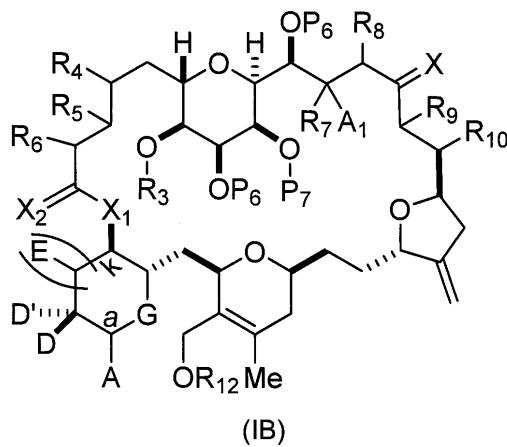
R<sub>9</sub> は H、O P' 、SO<sub>2</sub> R<sub>c</sub> 、または COOR<sub>c</sub> であり、そして R<sub>10</sub> は H であり；または R<sub>9</sub> および R<sub>10</sub> は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し；

各 P' は、存在する場合、独立して、H またはヒドロキシル保護基であり；そして P<sub>8</sub> は H またはシリルであり；

そして

式 (IB) の化合物は以下の構造のもの

【化 11】



またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

R<sub>12</sub> は任意選択的に置換されたアシルであり；

(B) 化合物 (IB) から前記のハリコンドリンマクロライドまたはその類縁体を生成することを含む、方法。

**【請求項 5】**

前記の式 (IB) の化合物を生成することは、式 (IA) の化合物を  $R_{1,2}OH$  およびルイス酸と反応させることを含む、請求項 4 に記載の方法。

**【請求項 6】**

前記ルイス酸は親酸素性ルイス酸である、請求項 5 に記載の方法。

**【請求項 7】**

前記のハリコンドリンマクロライドまたはその類縁体を生成することは、式 (IB) の化合物をアリル系還元剤と反応させることを含む、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の方法。

**【請求項 8】**

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H である；または、

$R_5$  および  $R_6$  は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、 $R_4$  は H であり、そして  $R_3$  はヒドロキシル保護基である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の方法。

**【請求項 9】**

$P_6$  はヒドロキシル保護基であり、そして X は =O であるか、または X はそれが付く炭素原子と合わさって - (CH(OP<sub>9</sub>))<sub>n</sub> - を形成する、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の方法。

**【請求項 10】**

$R_7$  および  $P_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  は H である；または、

$P_7$  はヒドロキシル保護基であり、そして  $R_7$  および  $R_8$  は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の方法。

**【請求項 11】**

$R_9$  は H または  $SO_2R_c$  であり、そして  $R_{10}$  は H である；および / または、

$P_8$  はシリルである；および / または、

各  $R_{11}$  は -OP<sub>10</sub> であり、ここで  $P_{10}$  はアルキルである；および / または、

G は O である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法。

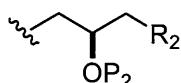
**【請求項 12】**

D は H である；および / または、

D' は OP<sub>1</sub> であり、ここで P<sub>1</sub> はアルキルである；および / または、

a で示される立体中心は (R) であり、そして A は以下の構造のものである；および / または、

**【化 12】**



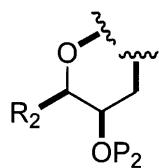
k は 0 であり、そして X<sub>1</sub> は -CH<sub>2</sub>- である；および / または、

R<sub>2</sub> は - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub> または - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub> であり、ここで n は 0 である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の方法。

**【請求項 13】**

A および D は合わさって以下の構造を形成し、

## 【化13】



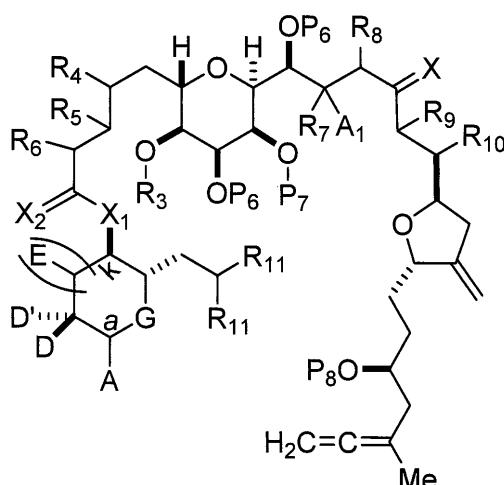
ここで酸素原子への結合は、式(IA)においてDが付く炭素原子に由来し、そしてここでR<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでnは2である；および／または、

kは1であり、そしてEは任意選択的に置換されたアルキルである；および／または、X<sub>1</sub>は-O-である、請求項1～11のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項14】

式(IA)の化合物、

## 【化14】



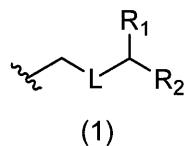
(IA)

またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

DおよびD'の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD'の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>飽和もしくはC<sub>2</sub>～<sub>6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、オキソ、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1～10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化15】



ここで

Lは、-CH(OP<sub>2</sub>)-、-C(OH)(OP<sub>2</sub>)-、または-C(O)-であり；

$R_1$  は H であるか、または  $R_1$  および  $P_1$  は合わさって結合を形成し；

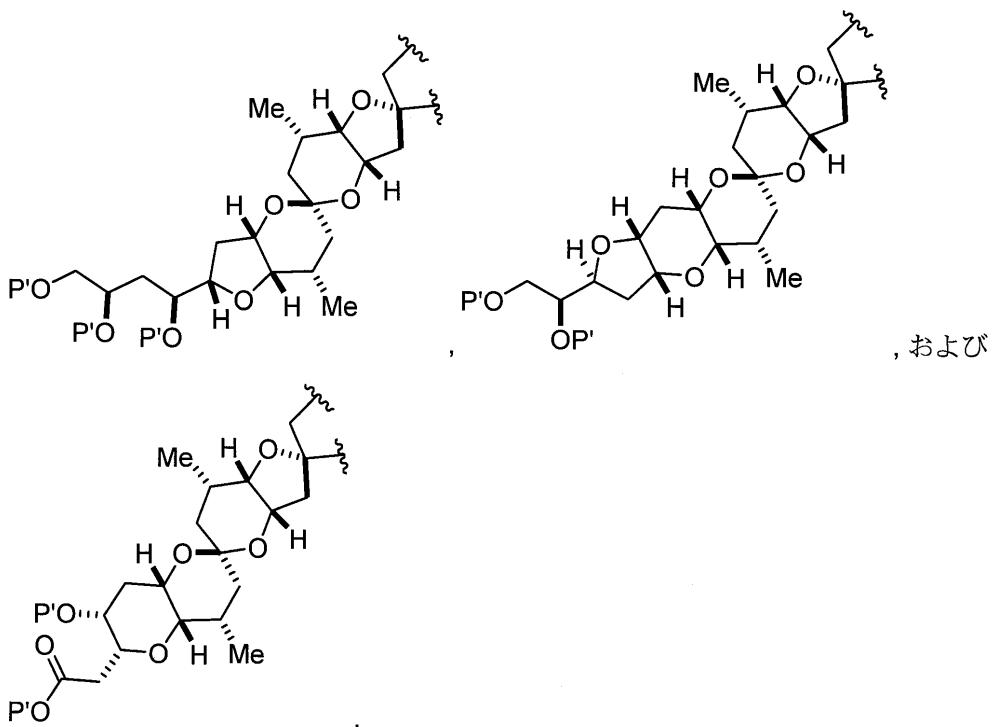
(i)  $R_2$  は H であり、ここで  $P_2$  は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii)  $R_2$  は  $-(CH_2)_nN P_3 P_4$  であり、ここで  $P_3$  は N - 保護基であり、そして (a)  $P_2$  は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $P_4$  は N - 保護基であり、または (b)  $P_2$  および  $P_4$  は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii)  $R_2$  は  $-(CH_2)_nOP_5$  であり、ここで  $P_2$  は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $P_5$  は、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり；または  $P_2$  および  $P_5$  は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル - ジオキソ、もしくはシリレン - ジオキソを形成し；あるいは

(iv)  $R_2$  および  $P_2$  は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化16】



ここで各  $P'$  は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

E は、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

G は、O、S、 $CH_2$ 、または  $NR_N$  であり、ここで  $R_N$  は H、N - 保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各  $Q_1$  は独立して  $OR_A$ 、 $SR_A$ 、 $SO_2R_A$ 、 $OSO_2R_A$ 、 $NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)OR_A$ 、 $(CO)OR_A$ 、 $O(CO)R_A$ 、 $(CO)NR_BR_A$ 、または  $O(CO)NR_BR_A$  であり、ここで  $R_A$  および  $R_B$  の各々は、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル - アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または 2 であり；

$k$  は 0 または 1 であり；

$X_1$  は  $-CH(Y)-$ 、 $-CH_2-$ 、または  $-O-$  であり；

$X_2$  は  $=O$  であるか、または  $X_2$  はそれが付く炭素原子と一緒にになって  $-(C(R_x)_2)-$  であり；ここで各  $R_x$  は独立して  $H$ 、 $-OR_{x1}$ 、または  $-SR_{x1}$  であり、但し少なくとも 1 つの  $R_x$  は、存在する場合、 $-OR_{x1}$  または  $-SR_{x1}$  であるという条件であり；ここで各  $R_{x1}$  は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方の  $R_{x1}$  は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し、但し  $X_1$  が  $-O-$  であるとき、 $X_2$  は  $=O$  であるという条件であり；

$Y$  は  $SO_2R_c$  または  $COOR_c$  であり、ここで  $Y$  が  $SO_2R_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして  $Y$  が  $COOR_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は  $H$  であり；あるいは  $R_3$  は  $H$  またはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  は  $H$  であり；

$A_1$  および  $R_7$  は合わさってオキソを形成し、 $P_7$  は  $H$  もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $R_8$  は  $H$  であり；

あるいは

$A_1$  は  $H$  もしくは  $OP''$  であり、そして

(i)  $P_7$  は  $H$  もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $R_7$  および  $R_8$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(ii)  $P_7$  および  $R_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  は  $H$  もしくは  $OP''$  であり；

(i) 各  $P_6$  は独立して  $H$  もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_6$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し； $X$  は  $=O$  であるか、または  $X$  はそれが付く炭素原子と一緒にあって  $-(CH(OP_9))-$  を形成し、ここで  $P_9$  は  $H$  またはヒドロキシル保護基であり；そして各  $R_{11}$  は  $-OP_{10}$  であるか、または両方の  $R_{11}$  は合わさってオキソを形成し、ここで  $P_{10}$  はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

(ii) 両方の  $P_6$  および  $X$  は、それが付く原子と一緒にあって、合わさってケタールを形成し、 $P_7$  および  $R_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  は  $H$  もしくは  $OP''$  であり；そして各  $R_{11}$  は  $-OP_{10}$  であるか、または両方の  $R_{11}$  は合わさってオキソを形成し、ここで  $P_{10}$  はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；あるいは

(iii) 両方の  $P_6$  および両方の  $R_{11}$  は、それが付く原子と一緒にあって、合わさってアセタールを形成し；そして  $X$  は  $=O$  であるか、または  $X$  はそれが付く炭素原子と一緒にあって  $-(CH(OP_9))-$  を形成し、ここで  $P_9$  は  $H$  またはヒドロキシル保護基であり；

$R_9$  は  $H$ 、 $OP''$ 、もしくは  $Y$  であり、そして  $R_{10}$  は  $H$  であり；または  $R_9$  および  $R_{10}$  は、それが付く原子と一緒にあって、合わさって二重結合を形成し；

各  $P''$  は、存在する場合、独立して、 $H$  またはヒドロキシル保護基であり；そして  $P_8$  は  $H$  またはシリルである、化合物。

#### 【請求項 15】

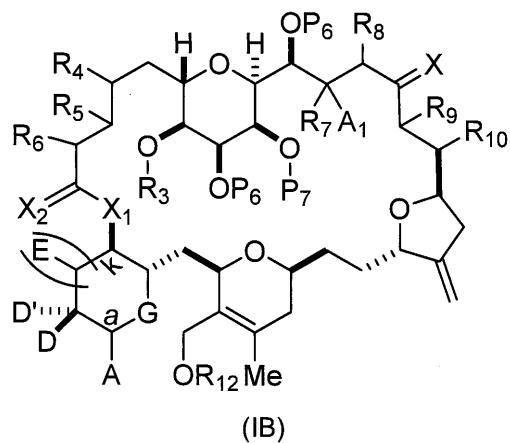
$P_8$  はシリルである；および / または、

各  $R_{11}$  は  $-OP_{10}$  であり、ここで  $P_{10}$  はアルキルである、請求項 14 に記載の化合物。

#### 【請求項 16】

式 (I B) の化合物、

## 【化17】

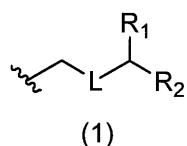


またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

DおよびD'の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD'の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>飽和もしくはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、オキソ、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1~10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化18】



ここで

Lは、-(CH(OP<sub>2</sub>))-、-(C(OH)(OP<sub>2</sub>))-、または-C(O)-であり；

R<sub>1</sub>はHであるか、またはR<sub>1</sub>およびP<sub>1</sub>は合わさって結合を形成し；

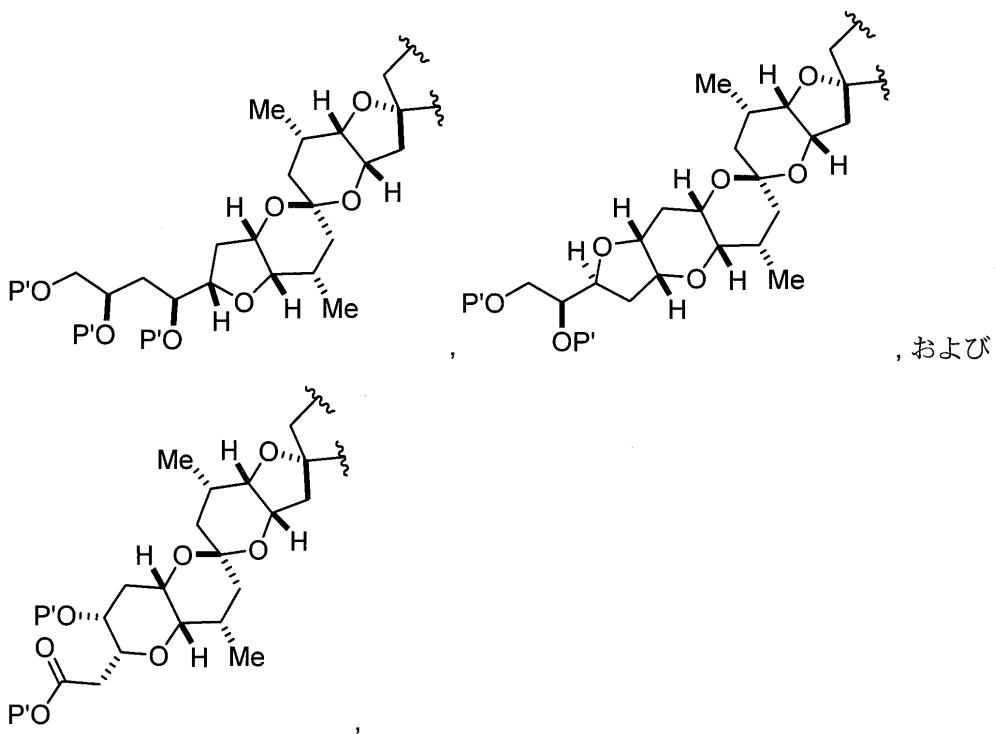
(i) R<sub>2</sub>はHであり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>であり、ここでP<sub>3</sub>はN-保護基であり、そして(a) P<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>4</sub>はN-保護基であり、または(b) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii) R<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>5</sub>は、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり；またはP<sub>2</sub>およびP<sub>5</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル-ジオキソ、もしくはシリレン-ジオキソを形成し；あるいは

(iv) R<sub>2</sub>およびP<sub>2</sub>は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化19】



ここで各 P' は独立して H またはヒドロキシル保護基であり；

E は、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

G は、O、S、CH<sub>2</sub>、またはNR<sub>N</sub>であり、ここでR<sub>N</sub>はH、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各Q<sub>1</sub>は独立してOR<sub>A</sub>、SR<sub>A</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、OSO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)OR<sub>A</sub>、(CO)OR<sub>A</sub>、O(CO)R<sub>A</sub>、(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、またはO(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>であり、ここでR<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>の各々は、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル-アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または2 であり；

k は 0 または 1 であり；

X<sub>1</sub> は -CH(Y)-、-CH<sub>2</sub>-、または-O- であり；

X<sub>2</sub> は =O であるか、またはX<sub>2</sub> はそれが付く炭素原子と一緒にになって -(C(R<sub>X</sub>)<sub>2</sub>)- であり；ここで各R<sub>X</sub> は独立してH、-OR<sub>X1</sub>、または-SR<sub>X1</sub> であり、但し少なくとも1つのR<sub>X</sub> は、存在する場合、-OR<sub>X1</sub> または-SR<sub>X1</sub> であるという条件であり；ここで各R<sub>X1</sub> は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方のR<sub>X1</sub> は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し、但しX<sub>1</sub> が-O- であるとき、X<sub>2</sub> は =O であるという条件であり；

Y は SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub> または COOR<sub>C</sub> であり、ここでY が SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub> であるとき、R<sub>C</sub> は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そしてY が COOR<sub>C</sub> であるとき、R<sub>C</sub> は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

R<sub>3</sub> およびR<sub>5</sub> は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>4</sub> およびR<sub>6</sub> の各々はH であり；

あるいはR<sub>3</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub>ならびにR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の一方は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りのR<sub>4</sub>またはR<sub>6</sub>はHであり；

A<sub>1</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさってオキソを形成し、P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>8</sub>はHであり；

あるいは

A<sub>1</sub>はHもしくはOP'であり、そして

(a) P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれぞれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(b) P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHもしくはOP'であり；

(i) 各P<sub>6</sub>は独立してHもしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方のP<sub>6</sub>はそれぞれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；Xは=Oであるか、またはXはそれが付く炭素原子と合わさって-(CH(OP<sub>9</sub>))-を形成し、ここでP<sub>9</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり；あるいは

(ii) 両方のP<sub>6</sub>およびXは、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタールを形成し、P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHまたはOP'であり；

R<sub>9</sub>はH、OP'、もしくはYであり、そしてR<sub>10</sub>はHであり；またはR<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し；

各P'は、存在する場合、独立して、Hまたはヒドロキシル保護基であり；そしてR<sub>12</sub>は任意選択的に置換されたアシルである、化合物。

### 【請求項17】

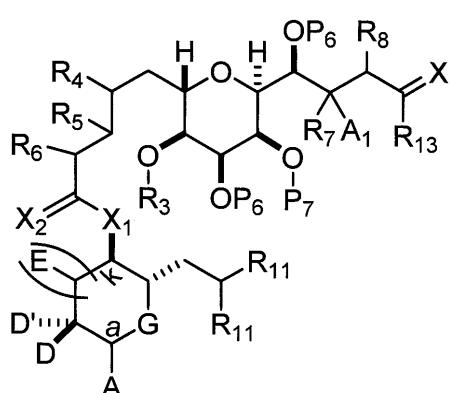
R<sub>9</sub>はHまたはSO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>であり、そしてR<sub>10</sub>はHである；および/または、

P<sub>6</sub>はヒドロキシル保護基であり、そしてXは=Oであるか、またはXはそれが付く炭素原子と合わさって-(CH(OP<sub>9</sub>))-を形成する、請求項14～16のいずれか一項に記載の化合物。

### 【請求項18】

式(I C)の化合物、

### 【化20】



(IC)

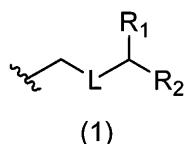
またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

DおよびD'の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD'の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>

$C_2 - C_6$  飽和もしくは  $C_2 - C_6$  不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、および  $Q_1$  からなる群から独立して選択される 1 ~ 10 個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

## 【化 2 1】



ここで

$L$  は  $- (C H (O P_2))$  - または  $- C (O) -$  であり；

$R_1$  は  $H$  であるか、または  $R_1$  および  $P_1$  は合わさって結合を形成し；

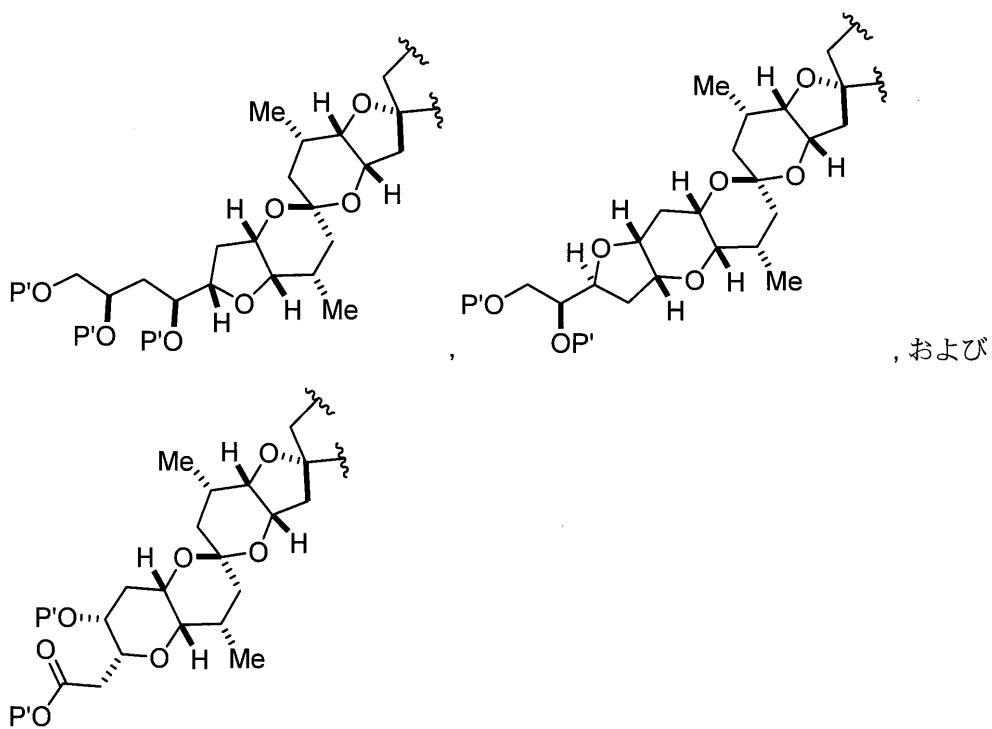
(i)  $R_2$  は  $H$  であり、ここで  $P_2$  は、ない、 $H$ 、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii)  $R_2$  は  $- (C H_2)_n N P_3 P_4$  であり、ここで  $P_3$  は  $N$  - 保護基であり、そして (a)  $P_2$  は、ない、 $H$ 、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $P_4$  は  $N$  - 保護基であり、または (b)  $P_2$  および  $P_4$  は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii)  $R_2$  は  $- (C H_2)_n O P_5$  であり、ここで  $P_2$  は、ない、 $H$ 、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして  $P_5$  は任意選択的に置換されたアルキルもしくはヒドロキシル保護基であり；または  $P_2$  および  $P_5$  は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル - ジオキソ、もしくはシリレン - ジオキソを形成し；あるいは

(iv)  $R_2$  および  $P_2$  は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

## 【化 2 2】



ここで各  $P'$  は独立してヒドロキシル保護基であり；

Eは、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

Gは、O、S、CH<sub>2</sub>、またはNR<sub>N</sub>であり、ここでR<sub>N</sub>はH、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各Q<sub>1</sub>は独立してOR<sub>A</sub>、SR<sub>A</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、OSO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)OR<sub>A</sub>、(CO)OR<sub>A</sub>、O(CO)R<sub>A</sub>、(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、またはO(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>であり、ここでR<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>の各々は、独立して、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル-アルキルであり；

nは、存在する場合、0、1、または2であり；

kは0または1であり；

X<sub>1</sub>は-CH(Y)-または-CH<sub>2</sub>-であり；

X<sub>2</sub>は=Oであるか、またはX<sub>2</sub>はそれが付く炭素原子と一緒にになって-(C(R<sub>X</sub>)<sub>2</sub>)-であり；ここで各R<sub>X</sub>は独立してH、-OR<sub>X</sub><sub>1</sub>、または-SR<sub>X</sub><sub>1</sub>であり、但し少なくとも1つのR<sub>X</sub>は、存在する場合、-OR<sub>X</sub><sub>1</sub>または-SR<sub>X</sub><sub>1</sub>であるという条件であり；ここで各R<sub>X</sub><sub>1</sub>は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方のR<sub>X</sub><sub>1</sub>は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し；

YはSO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>またはCOOR<sub>C</sub>であり、ここでYがSO<sub>2</sub>R<sub>C</sub>であるとき、R<sub>C</sub>は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そしてYがCOOR<sub>C</sub>であるとき、R<sub>C</sub>は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

R<sub>3</sub>およびR<sub>5</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の各々はHであり；あるいはR<sub>3</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub>ならびにR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りのR<sub>4</sub>またはR<sub>6</sub>はHであり；

(i) 各P<sub>6</sub>は独立してヒドロキシル保護基であるか、または両方のP<sub>6</sub>はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；

各R<sub>1</sub><sub>1</sub>は独立して-O<sub>P</sub><sub>1</sub><sub>0</sub>であり、または

両方のR<sub>1</sub><sub>1</sub>は合わさってオキソを形成し、ここでP<sub>1</sub><sub>0</sub>はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

あるいは

(ii) 両方のP<sub>6</sub>および両方のR<sub>1</sub><sub>1</sub>は、それが付く原子と一緒にになって、合わさってアセタールを形成し；

R<sub>1</sub><sub>3</sub>はHまたは-CH<sub>2</sub>P(O)(OR<sub>E</sub>)<sub>2</sub>であり、ここで各R<sub>E</sub>は、存在する場合、独立して、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

Xは=Oであるか、またはXはそれが付く炭素原子と合わさって-(CH(OP<sub>9</sub>))<sub>2</sub>を形成し、ここでP<sub>9</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり；

A<sub>1</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさってオキソを形成し、P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>8</sub>はHであり；

あるいは

A<sub>1</sub>はHもしくはOP<sub>1</sub><sub>0</sub>であり、そして

(i) P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(ii) P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHもしくはOP<sub>1</sub><sub>0</sub>である；

’’であり；

そして

各P’’は、存在する場合、独立して、Hまたはヒドロキシル保護基である、化合物

。

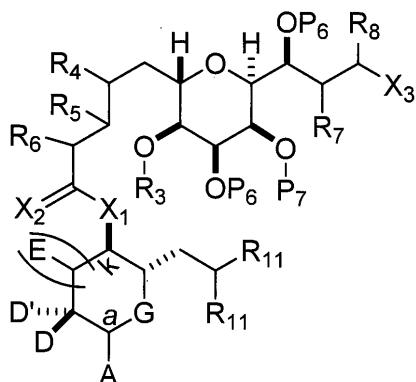
**【請求項19】**

A<sub>1</sub>はHである、請求項14～18のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項20】**

式(I E)の化合物、

**【化23】**



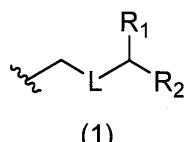
(IE)

またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

DおよびD’の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはOP<sub>1</sub>であり、但しDおよびD’の1つのみがOP<sub>1</sub>であるという条件であり、ここでP<sub>1</sub>は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そしてAは式(1)の基またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>飽和もしくはC<sub>2</sub>～<sub>6</sub>不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、およびQ<sub>1</sub>からなる群から独立して選択される1～10個の置換基を有し、式(1)の基は下記構造を有し、

**【化24】**



(1)

ここで

Lは-C(H(OP<sub>2</sub>))<sub>n</sub>-または-C(O)-であり；

R<sub>1</sub>はHであるか、またはR<sub>1</sub>およびP<sub>1</sub>は合わさって結合を形成し；

(i) R<sub>2</sub>はHであり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

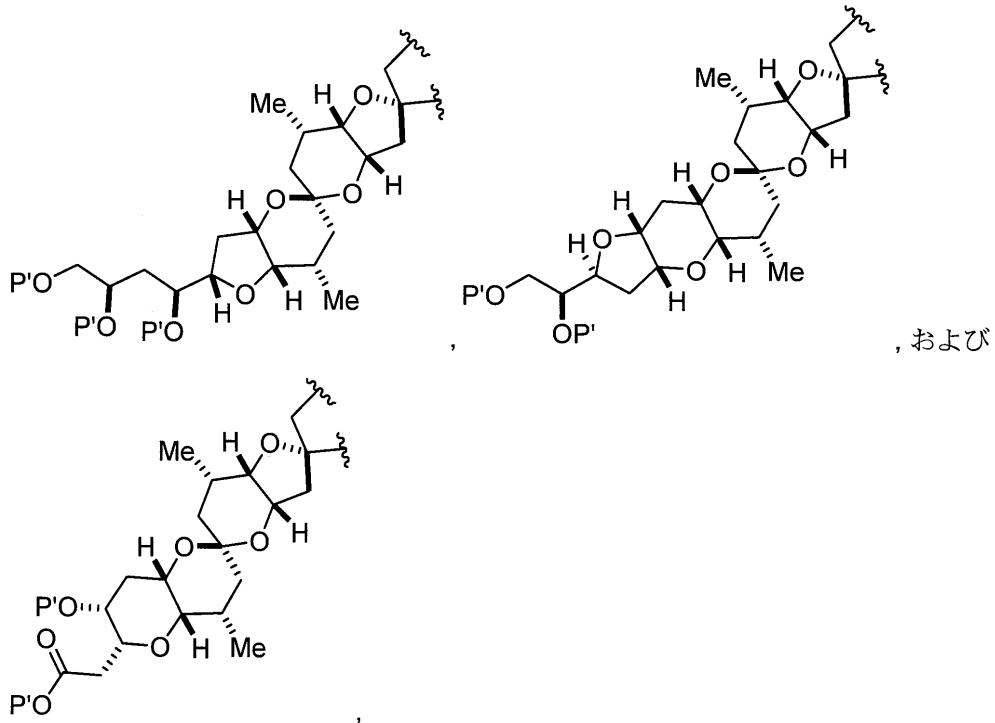
(ii) R<sub>2</sub>は-C(H<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>であり、ここでP<sub>3</sub>はN-保護基であり、そして(a) P<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>4</sub>はN-保護基であり、または(b) P<sub>2</sub>およびP<sub>4</sub>は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii) R<sub>2</sub>は-C(H<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでP<sub>2</sub>は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そしてP<sub>5</sub>は任意選択的に置換されたアルキルもしくはヒドロキシル保護基であり；またはP<sub>2</sub>およびP<sub>5</sub>は、

それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル - ジオキソ、もしくはシリレン - ジオキソを形成し；あるいは

(i v)  $R_2$  および  $P_2$  は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

【化 25】



ここで各  $P'$  は独立してヒドロキシル保護基であり；

$E$  は、 $H$ 、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

$G$  は、 $O$ 、 $S$ 、 $CH_2$ 、または $NR_N$ であり、ここで $R_N$ は $H$ 、 $N$ -保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各  $Q_1$  は独立して  $OR_A$ 、 $SR_A$ 、 $SO_2R_A$ 、 $OSO_2R_A$ 、 $NR_BR_A$ 、 $NR_BR_B$ 、 $(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)(CO)R_A$ 、 $NR_B(CO)NR_BR_A$ 、 $NR_B(CO)OR_A$ 、 $(CO)OR_A$ 、 $O(CO)R_A$ 、 $(CO)NR_BR_A$ 、または  $O(CO)NR_BR_A$  であり、ここで  $R_A$  および  $R_B$  の各々は、独立して、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル - アルキルであり；

$n$  は、存在する場合、0、1、または2であり；

$k$  は0または1であり；

$X_1$  は  $-CH(Y)$  - または  $-CH_2-$  であり、

$X_2$  は  $=O$  であるか、または  $X_2$  はそれが付く炭素原子と一緒にになって  $-(C(R_x)_2)-$  であり；ここで各  $R_x$  は独立して  $H$ 、 $-OR_{x1}$ 、または  $-SR_{x1}$  であり、但し少なくとも1つの  $R_x$  は、存在する場合、 $-OR_{x1}$  または  $-SR_{x1}$  であるという条件であり；ここで各  $R_{x1}$  は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方の  $R_{x1}$  は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し；

$Y$  は  $SO_2R_c$  または  $COOR_c$  であり、ここで  $Y$  が  $SO_2R_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして  $Y$  が  $COOR_c$  であるとき、 $R_c$  は、任意選択的に置換されたアルキ

ル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H であり；あるいは  $R_3$  は H またはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  は H であり；

$R_7$  および  $P_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  は H であり；または  $P_7$  はヒドロキシル保護基であり、そして  $R_7$  および  $R_8$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

(i) 各  $P_6$  は独立してヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_6$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；

各  $R_{11}$  は独立して  $-OP_{10}$  であり、または

両方の  $R_{11}$  は合わさってオキソを形成し、ここで  $P_{10}$  はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

あるいは

(ii) 両方の  $P_6$  および両方の  $R_{11}$  は、それが付く原子と一緒にになって、合わさってアセタールを形成し；

$X_3$  は、 $-CH_2OP_A$ 、 $-CH=CH_2$ 、または  $-CH(OP_A)CH_2OP_A$  であり、ここで各  $R_E$  は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり、そしてここで各  $P_A$  は独立して H もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_A$  は合わさって環状保護ジオールを形成する、化合物。

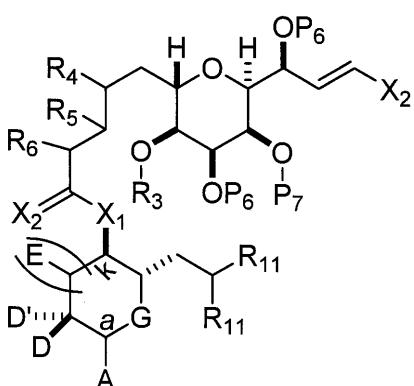
#### 【請求項 21】

各  $P_A$  は H であるか、または両方の  $P_A$  は合わさって環状保護ジオールを形成する、請求項 20 に記載の化合物。

#### 【請求項 22】

式 (IJ) の化合物であり、

#### 【化 26】

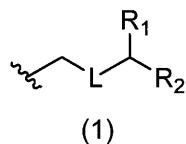


(IJ)

ここで

D および  $D'$  の各々は、独立して、H、任意選択的に置換されたアルキル、または  $OP_1$  であり、但し D および  $D'$  の 1 つのみが  $OP_1$  であるという条件であり、ここで  $P_1$  は、H、アルキル、またはヒドロキシル保護基であり；そして A は式 (1) の基または  $C_{1-6}$  飽和もしくは  $C_{2-6}$  不飽和の炭化水素骨格であり、前記骨格は、非置換であるか、またはシアノ、ハロ、アジド、および Q<sub>1</sub> からなる群から独立して選択される 1 ~ 10 個の置換基を有し、式 (1) の基は下記構造を有し、

## 【化27】



ここで

Lは- $(\text{CH}(\text{OP}_2))$ -または $\text{C}(\text{O})$ -であり；

$\text{R}_1$ はHであるか、または $\text{R}_1$ および $\text{P}_1$ は合わさって結合を形成し；

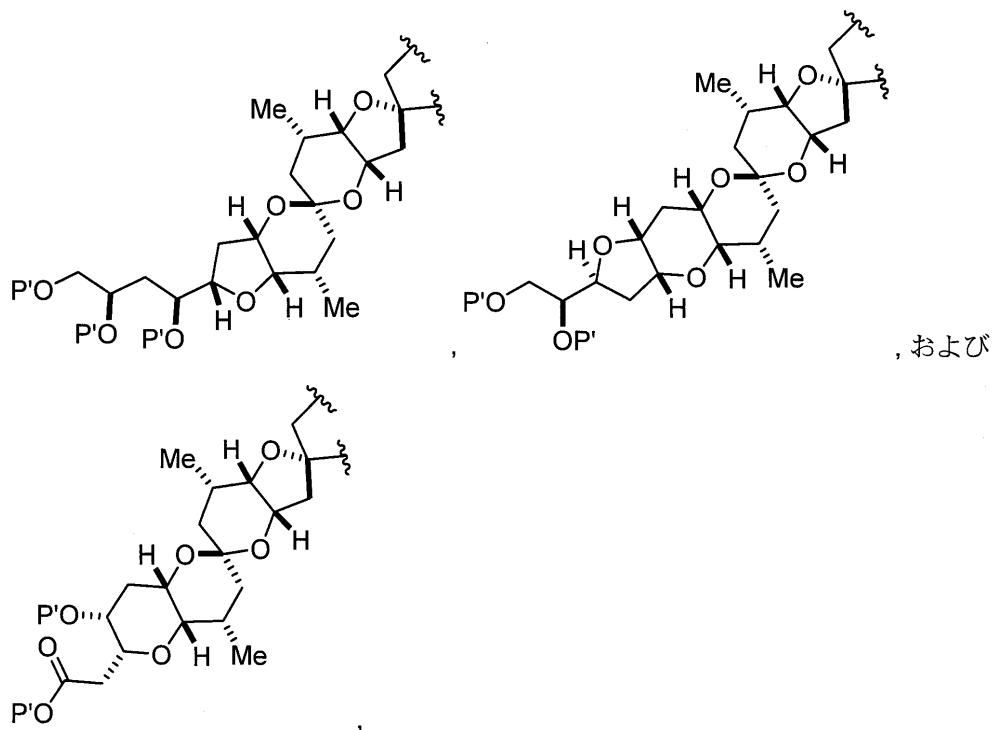
(i)  $\text{R}_2$ はHであり、ここで $\text{P}_2$ は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、またはヒドロキシル保護基であり；

(ii)  $\text{R}_2$ は- $(\text{CH}_2)_n\text{NP}_3\text{P}_4$ であり、ここで $\text{P}_3$ はN-保護基であり、そして(a)  $\text{P}_2$ は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして $\text{P}_4$ はN-保護基であり、または(b)  $\text{P}_2$ および $\text{P}_4$ は合わさってアルキリデンを形成し；

(iii)  $\text{R}_2$ は- $(\text{CH}_2)_n\text{OP}_5$ であり、ここで $\text{P}_2$ は、ない、H、任意選択的に置換されたアルキル、もしくはヒドロキシル保護基であり、そして $\text{P}_5$ は任意選択的に置換されたアルキルもしくはヒドロキシル保護基であり；または $\text{P}_2$ および $\text{P}_5$ は、それが付く原子と一緒にになって、合わさってケタール、環状カーボネート、ジカルボニル-ジオキソ、もしくはシリレン-ジオキソを形成し；あるいは

(iv)  $\text{R}_2$ および $\text{P}_2$ は、合わさって、任意選択的に置換されたエチレン、または以下からなる群から選択される構造を形成し、

## 【化28】



ここで各 $\text{P}'$ は独立してヒドロキシル保護基であり；

Eは、H、任意選択的に置換されたアルキル、または任意選択的に置換されたアルコキシであり；

Gは、O、S、 $\text{CH}_2$ 、または $\text{NR}_N$ であり、ここで $\text{R}_N$ はH、N-保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

各 Q<sub>1</sub> は独立して OR<sub>A</sub>、SR<sub>A</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、OSO<sub>2</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)(CO)R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、NR<sub>B</sub>(CO)OR<sub>A</sub>、(CO)OR<sub>A</sub>、O(CO)R<sub>A</sub>、(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub>、または O(CO)NR<sub>B</sub>R<sub>A</sub> であり、ここで R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> の各々は、独立して、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アリール、ハロアリール、ヒドロキシアリール、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアリール、ハロアリールアルキル、アルキルハロアリール、(アルコキシアリール)アルキル、複素環式ラジカルまたは複素環式ラジカル - アルキルであり；

n は、存在する場合、0、1、または 2 であり；

k は 0 または 1 であり；

X<sub>1</sub> は -CH(Y)-、-CH<sub>2</sub>-、または -O- であり；

X<sub>2</sub> は =O であるか、または X<sub>2</sub> はそれが付く炭素原子と一緒にになって - (C(R<sub>X</sub>)<sub>2</sub>)<sub>2</sub> であり；ここで各 R<sub>X</sub> は独立して H、-OR<sub>X</sub><sub>1</sub>、または -SR<sub>X</sub><sub>1</sub> であり、但し少なくとも 1 つの R<sub>X</sub> は、存在する場合、-OR<sub>X</sub><sub>1</sub> または -SR<sub>X</sub><sub>1</sub> であるという条件であり；ここで各 R<sub>X</sub><sub>1</sub> は独立して任意選択的に置換されたアルキルであるか、または両方の R<sub>X</sub><sub>1</sub> は合わさって任意選択的に置換されたアルキレンを形成し、但し X<sub>1</sub> が -O- であるとき、X<sub>2</sub> は =O であるという条件であり；

Y は SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub> または COOR<sub>C</sub> であり、ここで Y が SO<sub>2</sub>R<sub>C</sub> であるとき、R<sub>C</sub> は、任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして Y が COOR<sub>C</sub> であるとき、R<sub>C</sub> は、任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；

R<sub>3</sub> および R<sub>5</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>4</sub> および R<sub>6</sub> の各々は H であり；あるいは R<sub>3</sub> は H またはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub> ならびに R<sub>4</sub> および R<sub>6</sub> の一方は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの R<sub>4</sub> または R<sub>6</sub> は H であり；

(i) 各 P<sub>6</sub> は独立してヒドロキシル保護基であるか、または両方の P<sub>6</sub> はそれぞれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；

各 R<sub>1</sub><sub>1</sub> は独立して -OP<sub>1</sub><sub>0</sub> であり、または

両方の R<sub>1</sub><sub>1</sub> は合わさってオキソを形成し、ここで P<sub>1</sub><sub>0</sub> はアルキルまたはヒドロキシル保護基であり；

あるいは

(ii) 両方の P<sub>6</sub> および両方の R<sub>1</sub><sub>1</sub> は、それぞれが付く原子と一緒にになって、合わさってアセタールを形成し；

各 P<sub>7</sub> は独立してヒドロキシル保護基であり；そして

X<sub>2</sub> はハロゲンまたは擬ハロゲンである、化合物。

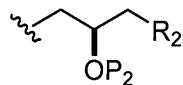
### 【請求項 2 3】

各 R<sub>1</sub><sub>1</sub> は -OP<sub>1</sub><sub>0</sub> であり、ここで P<sub>1</sub><sub>0</sub> はアルキルである、請求項 18 ~ 22 のいずれか一項に記載の化合物。

### 【請求項 2 4】

a で示される立体中心は (R) であり、そして A は以下の構造のものである；および / または、

### 【化 2 9】



k は 0 であり、そして X<sub>1</sub> は -CH<sub>2</sub>- である；および / または、

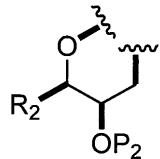
R<sub>2</sub> は -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub> または -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub> であり、ここで n は 0 で

ある、請求項1\_4～2\_3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項25】

AおよびDは合わさって以下の構造を形成し、

【化30】



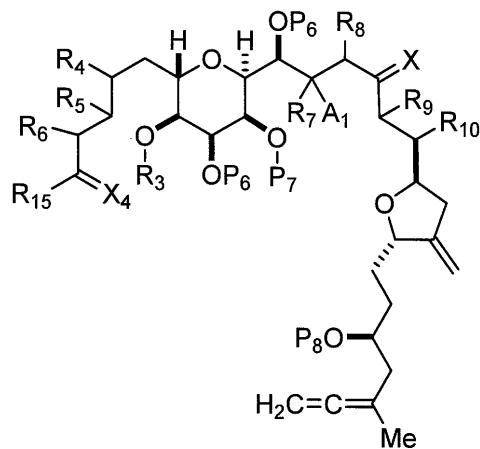
ここで酸素原子への結合は、式(I A)においてDが付く炭素原子に由来し、そしてここでR<sub>2</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NP<sub>3</sub>P<sub>4</sub>または-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OP<sub>5</sub>であり、ここでnは2である；および/または、

kは1であり、そしてEは任意選択的に置換されたアルキルである；および/または、X<sub>1</sub>は-O-である、請求項1\_4～2\_3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

式(I N)の化合物、

【化31】



(IN)

またはその塩もしくは互変異性体であり、

ここで

R<sub>3</sub>およびR<sub>5</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の各々はHであり；あるいはR<sub>3</sub>はHまたはヒドロキシル保護基であり、R<sub>5</sub>ならびにR<sub>4</sub>およびR<sub>6</sub>の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りのR<sub>4</sub>またはR<sub>6</sub>はHであり；

A<sub>1</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさってオキソを形成し、P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>8</sub>はHであり；

あるいは

A<sub>1</sub>はHもしくはOP<sub>7</sub>であり、そして

(i) P<sub>7</sub>はHもしくはヒドロキシル保護基であり、そしてR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

または

(ii) P<sub>7</sub>およびR<sub>7</sub>は合わさって結合を形成し、そしてR<sub>8</sub>はHもしくはOP<sub>7</sub>であり；

各P<sub>7</sub>は、存在する場合、独立して、Hまたはヒドロキシル保護基であり；

各 P<sub>6</sub> は独立して H もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の P<sub>6</sub> はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し、そして X は = O であるか、または X はそれが付く炭素原子と一緒にあって - ( C H ( O P<sub>9</sub> ) ) - を形成し、ここで P<sub>9</sub> は H またはヒドロキシル保護基であり；あるいは両方の P<sub>6</sub> および X は、それが付く原子と一緒にあって、合わさってケタールを形成し；ここで両方の P<sub>6</sub> および X が、それが付く原子と一緒にあって、合わさってケタールを形成するとき、P<sub>7</sub> および R<sub>7</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>8</sub> は H または O P' である；

R<sub>9</sub> は H、SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub>、または COOR<sub>c</sub> であり、そして R<sub>10</sub> は H であり、ここで R<sub>9</sub> が SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> であるとき、R<sub>c</sub> は任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして R<sub>9</sub> が COOR<sub>c</sub> であるとき、R<sub>c</sub> は任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルであり；あるいは R<sub>9</sub> および R<sub>10</sub> は、それが付く原子と一緒にあって、合わさって二重結合を形成し；

R<sub>15</sub> は H または -OP<sub>11</sub> であり、ここで P<sub>11</sub> は、H、ヒドロキシル保護基、または任意選択的に置換されたアルキルであり；

X<sub>4</sub> は = O であるか、またはそれが付く炭素原子と一緒にあって、-CH<sub>2</sub>- であり、但し R<sub>15</sub> が H であるとき、X<sub>4</sub> は = O であるという条件であり；そして

P<sub>8</sub> は H またはシリルである、化合物。

#### 【請求項 27】

R<sub>9</sub> は H または SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> であり、そして R<sub>10</sub> は H である；および / または、

P<sub>8</sub> はシリルである；および / または、

P<sub>6</sub> はヒドロキシル保護基であり、そして X は = O であるか、または X はそれが付く炭素原子と一緒にあって - ( C H ( O P<sub>9</sub> ) ) - を形成する；および / または、

A<sub>1</sub> は H である；および / または、

R<sub>3</sub> および R<sub>5</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>4</sub> および R<sub>6</sub> の各々は H である、請求項 26 に記載の化合物。

#### 【請求項 28】

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、それが付く原子と一緒にあって、合わさって二重結合を形成し、R<sub>4</sub> は H であり、そして R<sub>3</sub> はヒドロキシル保護基である、請求項 14 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【請求項 29】

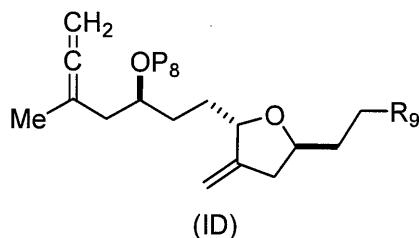
R<sub>7</sub> および P<sub>7</sub> は合わさって結合を形成し、そして R<sub>8</sub> は H である；または、

P<sub>7</sub> はヒドロキシル保護基であり、そして R<sub>7</sub> および R<sub>8</sub> は、それが付く原子と一緒にあって、合わさって二重結合を形成する、請求項 14 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物。

#### 【請求項 30】

式 (ID)

#### 【化 32】



ここで

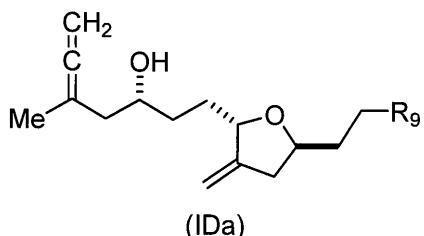
P<sub>8</sub> は H またはヒドロキシル保護基であり；そして

R<sub>9</sub> は SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> または COOR<sub>c</sub> であり、ここで R<sub>9</sub> が SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub> であるとき、R<sub>c</sub>

は任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして  $R_9$  が  $\text{COOR}_c$  であるとき、 $R_c$  は任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルである；

式 (IDa)

【化 3 3】

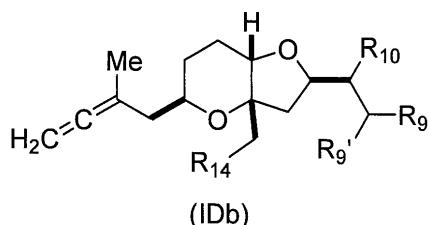


ここで

$R_9$  は  $\text{SO}_2\text{R}_c$  または  $\text{COOR}_c$  であり、ここで  $R_9$  が  $\text{SO}_2\text{R}_c$  であるとき、 $R_c$  は任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして  $R_9$  が  $\text{COOR}_c$  であるとき、 $R_c$  は任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルである；

式 (IDb)

【化 3 4】



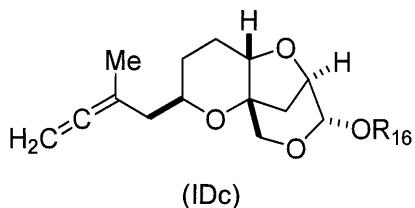
ここで

$R_9'$  および  $R_{10}$  は両方とも  $\text{H}$  であるか、または  $R_9'$  および  $R_{10}$  は合わさって二重結合を形成し； $R_{14}$  は、ヒドロキシル、ハロゲン、または擬ハロゲンであり；そして

$R_9$  は  $\text{SO}_2\text{R}_c$  または  $\text{COOR}_c$  であり、ここで  $R_9$  が  $\text{SO}_2\text{R}_c$  であるとき、 $R_c$  は任意選択的に置換されたアリールまたは任意選択的に置換されたエノール化不可能なアルキルであり、そして  $R_9$  が  $\text{COOR}_c$  であるとき、 $R_c$  は任意選択的に置換されたアルキル、任意選択的に置換されたアリール、または任意選択的に置換されたアリールアルキルである；

式 (IDc)

【化 3 5】

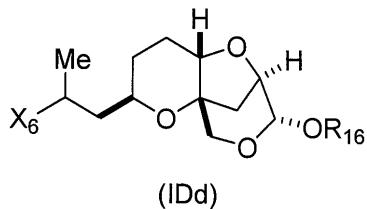


ここで

$R_{1-6}$  は、H、ヒドロキシル保護基、または任意選択的に置換されたアルキルである；または、

式 (IDd)

【化36】



ここで

$X_6$  は  $-C(R_{1-7})=CH_2$ 、または  $-C(O)-Me$  であり、ここで  $R_{1-7}$  は擬ハロゲンまたはハロゲンであり；そして

$R_{1-6}$  は、H、ヒドロキシル保護基、または任意選択的に置換されたアルキルである、化合物。

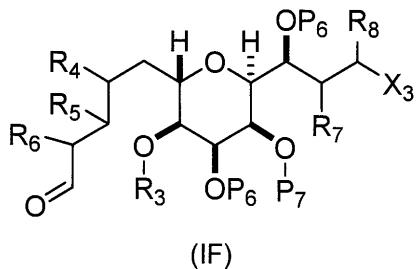
【請求項31】

$R_9$  は  $SO_2R_c$  である、請求項30に記載の化合物。

【請求項32】

式 (IF) の化合物であり、

【化37】



ここで

$X_3$  は  $-CH_2OP_A$ 、 $-CH_2OP_A$ 、 $-CH=CH_2$ 、または  $-CH(OP_A)CH_2OP_A$  であり；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々はHであり；あるいは  $R_3$  はHまたはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  はHであり；

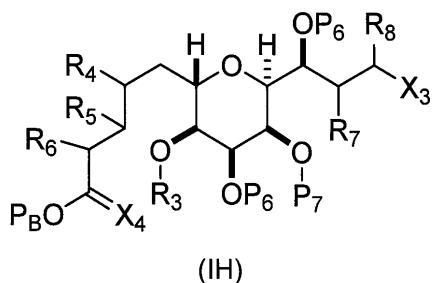
$R_7$  および  $P_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  はHであり；または  $P_7$  はヒドロキシル保護基であり、そして  $R_7$  および  $R_8$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；そして

各  $P_6$  は独立してヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_6$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成する、化合物。

【請求項33】

式 (IH) の化合物、

## 【化38】



またはその塩であり、

ここで

$X_3$  は  $-CH_2O$ 、 $-CH_2OP_A$ 、 $-CH=CH_2$ 、または  $-CH(OP_A)CH_2O$   
 $P_A$  であり；

$X_4$  は = O であるか、または  $X_4$  は、それが付く炭素原子と一緒にになって、合わさって  
 $-CH_2-$  を形成し；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H であり；  
あるいは  $R_3$  は H またはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  は H であり；

$R_7$  および  $P_7$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_8$  は H であり；または  $P_7$  はヒドロキシル保護基であり、そして  $R_7$  および  $R_8$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさって二重結合を形成し；

各  $P_6$  は独立してヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_6$  はそれが付く原子と一緒にになって合わさってケタールもしくはアセタールを形成し；

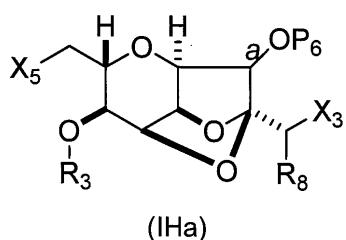
各  $P_A$  は独立して H もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_A$  は合わさって環状保護ジオールを形成し；そして

$P_B$  は、H、ヒドロキシル保護基、または任意選択的に置換されたアルキルである、化合物。

## 【請求項34】

式 (IH a) の化合物であり、

## 【化39】



ここで

a は炭素 - 酸素結合を

## 【化40】

または

として特定し、

$X_3$  は  $-CH_2O$ 、 $-CH_2OP_A$ 、 $-CH=CH_2$ 、または  $-CH(OP_A)CH_2O$   
 $P_A$  であり；

$X_5$  は  $-CH=CH_2$  または  $-CH(R_4)-CH(R_5)-CH(R_6)-C(X_4)OP_B$  であり；

$X_4$  は =O であるか、または  $X_4$  は、それが付く炭素原子と一緒にになって、合わさって  $-CH_2-$  を形成し；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H であり；あるいは  $R_3$  は H またはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  は H であり；

$P_6$  はヒドロキシル保護基であり；

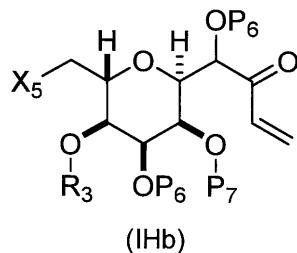
各  $P_A$  は独立して H もしくはヒドロキシル保護基であるか、または両方の  $P_A$  は合わさって環状保護ジオールを形成し；そして

$P_B$  は、H、ヒドロキシル保護基、または任意選択的に置換されたアルキルである、化合物。

#### 【請求項 3 5】

式(IHb)の化合物であり、

#### 【化 4 1】



ここで

$X_5$  は  $-CH=CH_2$  または  $-CH(R_4)-CH(R_5)-CH(R_6)-C(X_4)OP_B$  であり；

$X_4$  は =O であるか、または  $X_4$  は、それが付く炭素原子と一緒にになって、合わさって  $-CH_2-$  を形成し；

$R_3$  および  $R_5$  は合わさって結合を形成し、そして  $R_4$  および  $R_6$  の各々は H であり；あるいは  $R_3$  は H またはヒドロキシル保護基であり、 $R_5$  ならびに  $R_4$  および  $R_6$  の一方は、それが付く原子と一緒にになって、合わさって二重結合を形成し、そして残りの  $R_4$  または  $R_6$  は H であり；そして

$P_6$  および  $P_7$  の各々は独立してヒドロキシル保護基であるか、または 1 つの  $P_6$  および  $P_7$  は、それが付く原子と一緒にになって合わさってケタールを形成し、そして残りの  $P_6$  はヒドロキシル保護基であり；あるいは両方の  $P_6$  は、それが付く原子と一緒にになってケタールを形成し、そして  $P_7$  はヒドロキシル保護基である、化合物。

#### 【請求項 3 6】

1、2、3、5、7、7a、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、21、23、24、25、27、28、29、31、32、33、34、35、36、36b、36c、37、38、39、40、41、43、44、44a、45、47、47a、47b、47c、48、49、50、50a、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、62、63、66、67、68、69、70、71、72、73、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、および 87 からなる群から選択される化合物。