

【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28年8月4日(2016.8.4)

【公表番号】特表2015-523368(P2015-523368A)  
 【公表日】平成27年8月13日(2015.8.13)  
 【年通号数】公開・登録公報2015-051  
 【出願番号】特願2015-520686(P2015-520686)  
 【国際特許分類】

C 0 7 F 9/38 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/663 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 33/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/50 (2006.01)  
 C 0 7 F 9/572 (2006.01)  
 C 0 7 F 9/6506 (2006.01)  
 C 0 7 F 9/653 (2006.01)

【 F I 】

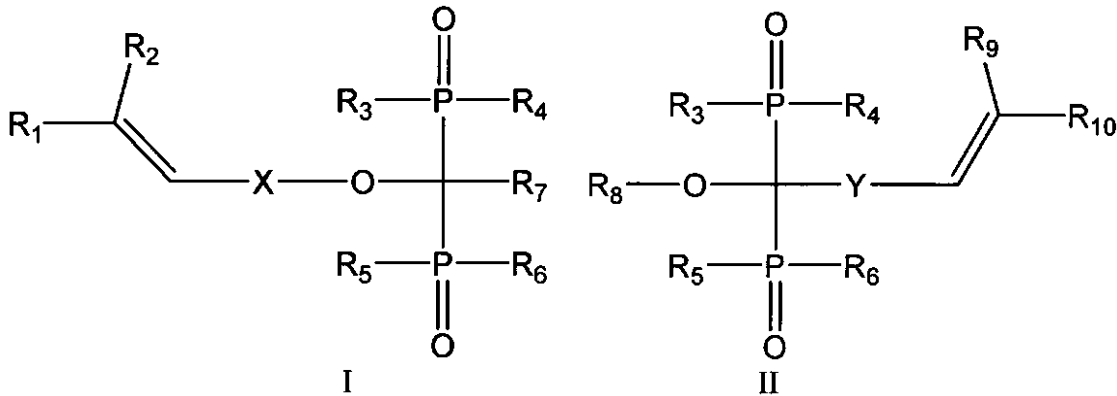
C 0 7 F 9/38 C S P E  
 A 6 1 K 31/663  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 9/06  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 31/00 1 7 1  
 A 6 1 P 33/00  
 A 6 1 P 33/00 1 7 1  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 5/50  
 C 0 7 F 9/572 A  
 C 0 7 F 9/6506  
 C 0 7 F 9/653

【手続補正書】  
 【提出日】平成28年6月13日(2016.6.13)  
 【手続補正1】  
 【補正対象書類名】特許請求の範囲  
 【補正対象項目名】全文  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】  
 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 I または式 II の化合物：

## 【化 25】



であって、式中、

X は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；Y は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sub>1</sub> は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリアル、ヘテロアリアル、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換され；

R<sub>2</sub> は、H、または任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環もしくはヘテロアリアル環を含む飽和もしくは不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリアル、ヘテロアリアル、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換され；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリアル、ヘテロアリアル、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、アリアル、ヘテロアリアルまたは S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換され；

R<sub>8</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリアル、ヘテロアリアル、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任

意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、アリール、ヘテロアリールまたはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub>で置換され;

R<sub>9</sub>は任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub>で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub>で置換され;

R<sub>10</sub>は、H、または任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環もしくはヘテロアリール環を含む飽和もしくは不飽和(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub>で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub>で置換され;

各R<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルもしくはアリールであり;または、R<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し;

各R<sub>c</sub>およびR<sub>d</sub>は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルもしくはアリールであり;または、R<sub>c</sub>およびR<sub>d</sub>はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し;

各R<sub>m</sub>およびR<sub>n</sub>は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルもしくはアリールであり;または、R<sub>m</sub>およびR<sub>n</sub>はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し;

各R<sub>p</sub>およびR<sub>q</sub>は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルもしくはアリールであり;または、R<sub>p</sub>およびR<sub>q</sub>はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し;

任意のR<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>、R<sub>m</sub>、R<sub>n</sub>、R<sub>p</sub>またはR<sub>q</sub>のアリールは、任意に1個以上の(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>s</sub>R<sub>t</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>s</sub>R<sub>t</sub>で置換され、各R<sub>s</sub>およびR<sub>t</sub>は互いに独立してHまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルである;

式Iもしくは式IIの化合物、またはそれらの塩。

【請求項2】

前記化合物が式Iの化合物である請求項1記載の化合物、またはその塩。

【請求項3】

前記化合物が式IIの化合物である請求項1記載の化合物、またはその塩。

【請求項4】

R<sub>1</sub>が不飽和(C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>)アルキル鎖である請求項2記載の化合物、またはその塩。

【請求項5】

Xが  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_mCH(CH_3)$  であり、mが1~2の整数である請求項2記載の化合物、またはその塩。

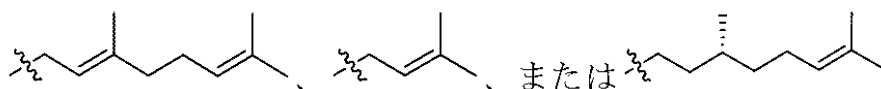
【請求項6】

$R_1$ が不飽和(C<sub>5</sub>-C<sub>15</sub>)アルキル鎖である請求項2記載の化合物、またはその塩。

【請求項7】

$R_1$ が、

【化26】



である請求項2記載の化合物、またはその塩。

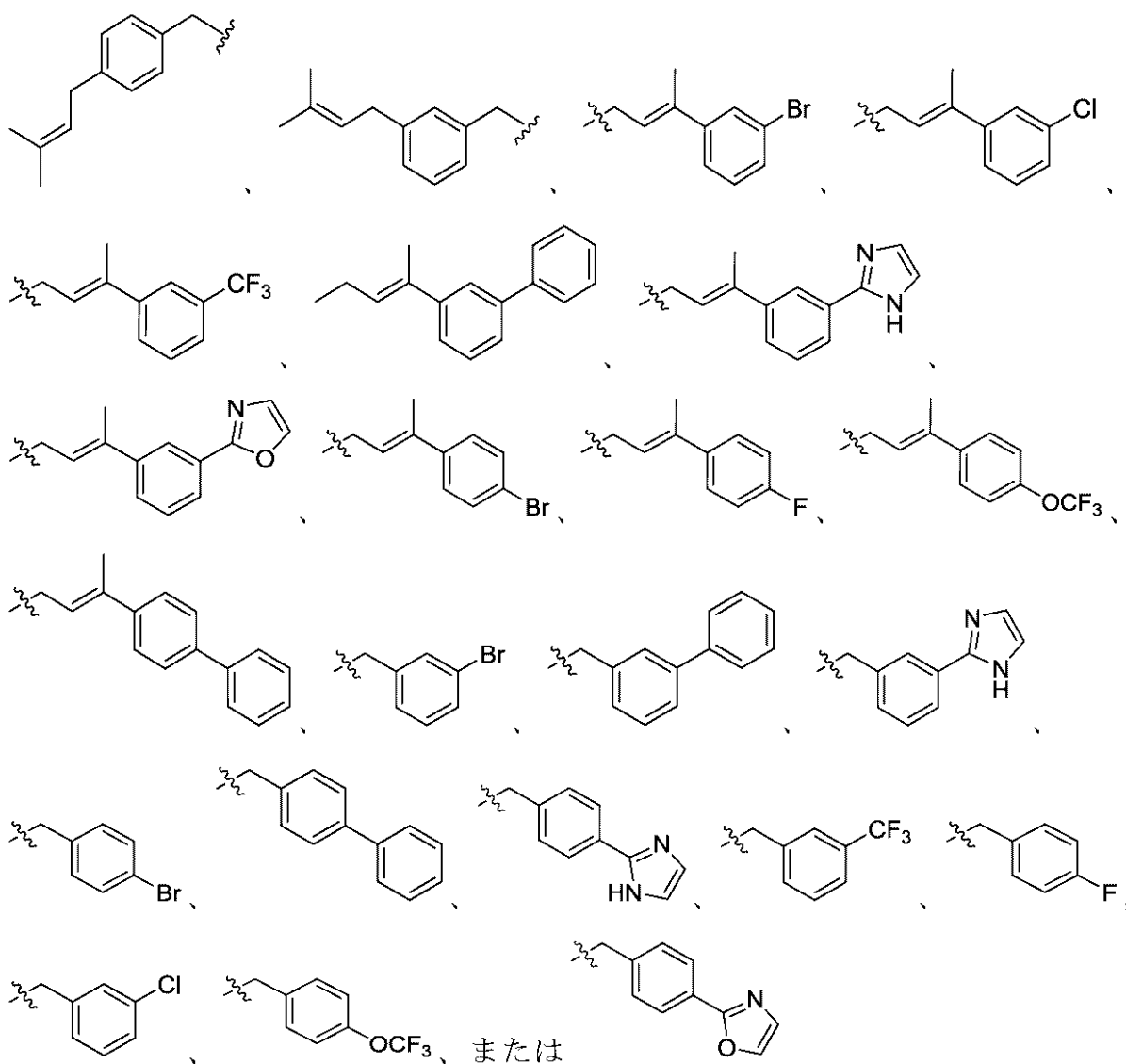
【請求項8】

$R_1$ がアルキル鎖に1個以上のアリール環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖である請求項2記載の化合物、またはその塩。

【請求項9】

$R_1$ が、

【化27】



である請求項2記載の化合物、またはその塩。

【請求項10】

$R_1$  がアルキル鎖にヘテロアリアル環を含む不飽和 ( $C_5 - C_{20}$ ) アルキル鎖である請求項 2 記載の化合物、またはその塩。

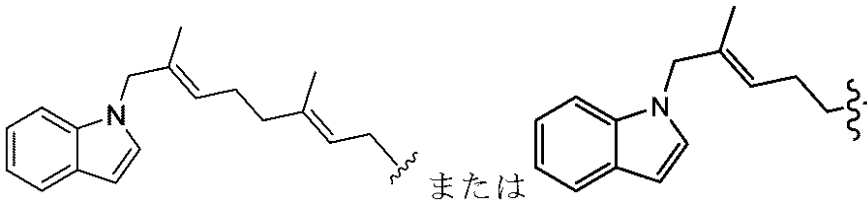
【請求項 11】

前記ヘテロアリアル環がインドリルである請求項 10 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 12】

$R_1$  が、

【化 28】



である請求項 2 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 13】

$R_2$  が H またはメチルである請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 14】

$R_2$  がメチルである請求項 13 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 15】

X が  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_m CH(CH_3)$  であり、m が 1 である請求項 14 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 16】

X が  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_m CH(CH_3)$  であり、m が 2 である請求項 14 記載の化合物、またはその塩。

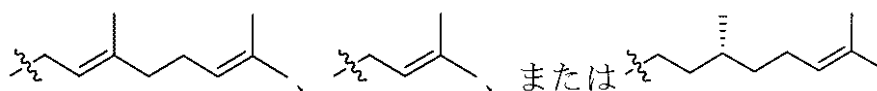
【請求項 17】

$R_7$  が飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖である請求項 2 ~ 14 のいずれかに記載の化合物、またはその塩。

【請求項 18】

$R_7$  が、

【化 29】



である請求項 17 記載の化合物、またはその塩。

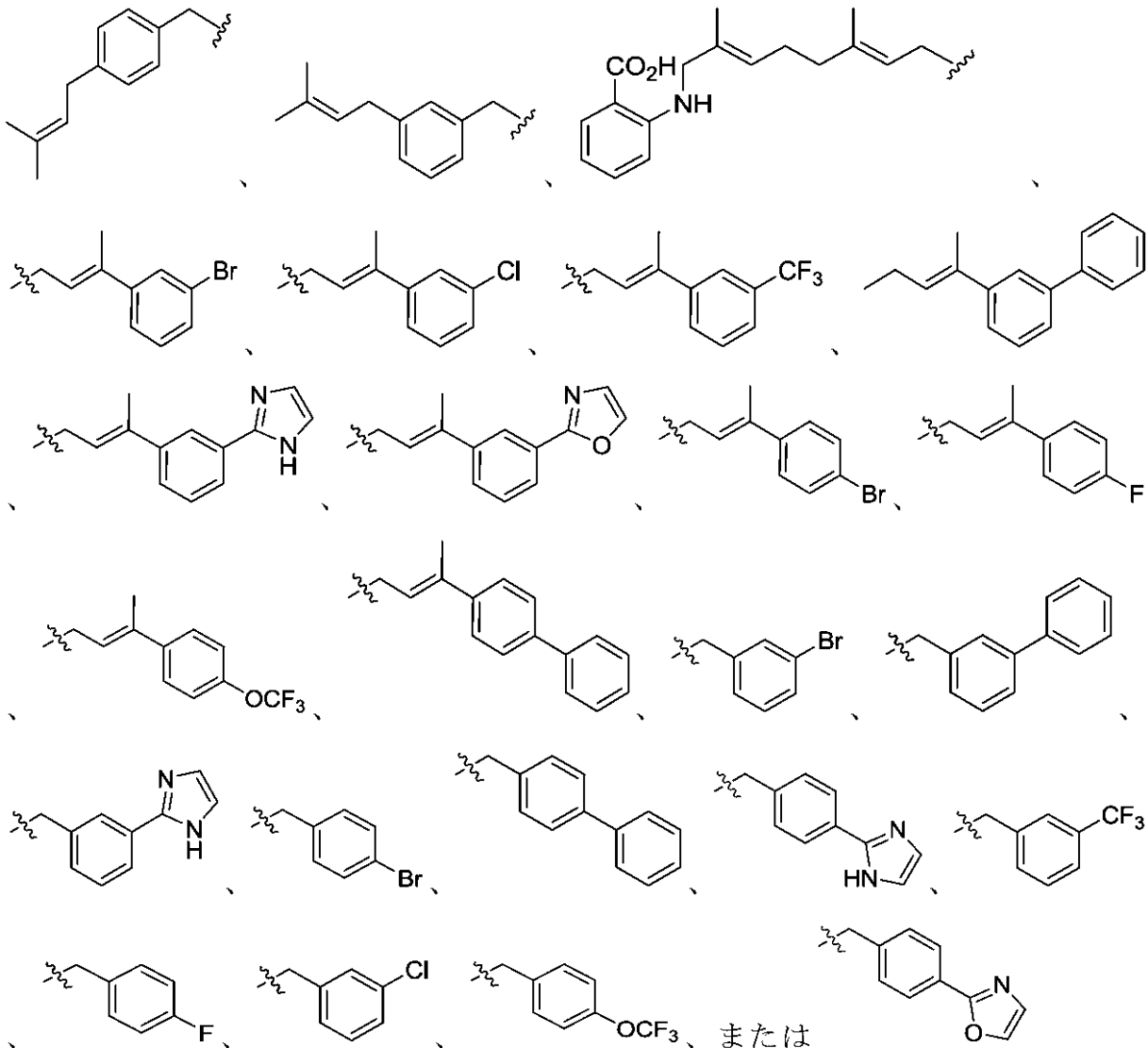
【請求項 19】

$R_7$  がアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖である請求項 2 ~ 14 のいずれかに記載の化合物、またはその塩。

【請求項 20】

$R_7$  が、

## 【化 3 0】



である請求項 19 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 21】

Y が  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_n CH(CH_3)$  であり、n が 1 ~ 2 の整数である請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 22】

R<sub>8</sub> が飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、該飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖が任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換される、請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 23】

R<sub>8</sub> が不飽和 (C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、該不飽和 (C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖が任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換される、請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

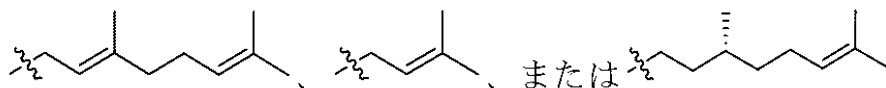
## 【請求項 24】

R<sub>8</sub> が不飽和 (C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である請求項 3 記載の化合物、またはその塩

。【請求項 25】

R<sub>8</sub> が、

【化 31】



である請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

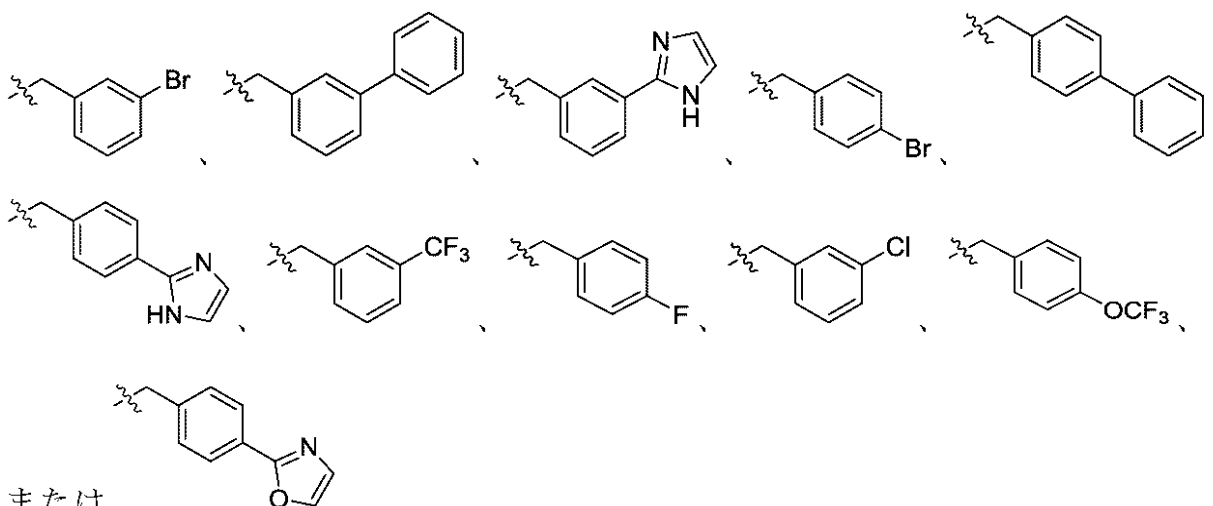
【請求項 26】

R<sub>8</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換される、請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 27】

R<sub>8</sub> が、

【化 32】



である請求項 19 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 28】

R<sub>8</sub> が飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

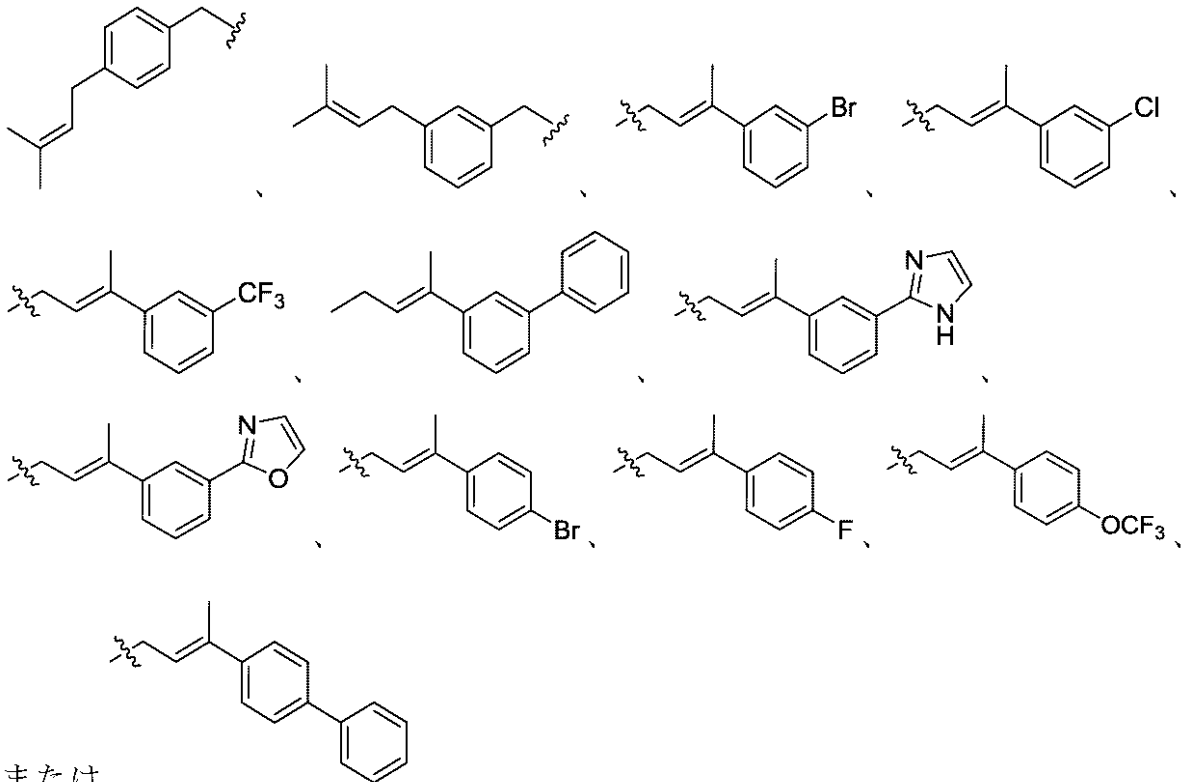
【請求項 29】

R<sub>8</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub> で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換される、請求項 3 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 30】

R<sub>8</sub> が、

## 【化 3 3】



または

である請求項 2 9 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 3 1】

R<sub>9</sub> が不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である請求項 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 3 2】

R<sub>9</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環を含む飽和または不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である請求項 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩

。

## 【請求項 3 3】

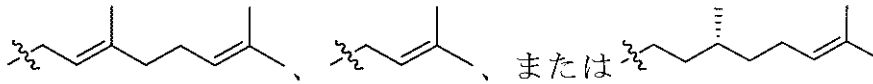
R<sub>9</sub> が、



## 【請求項 38】

R<sub>9</sub> が、

## 【化 36】



である請求項 37 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 39】

R<sub>10</sub> が H またはメチルである請求項 3 および 21 ~ 38 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 40】

R<sub>10</sub> がメチルである請求項 39 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 41】

Y が (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり、n が 1 である請求項 1 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 42】

Y が (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり、n が 2 である請求項 14 記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 43】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> がそれぞれ OH である請求項 1 ~ 42 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 44】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> がそれぞれ (NaO)<sub>2</sub>O である請求項 1 ~ 42 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 45】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> がそれぞれアルコキシである請求項 1 ~ 42 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

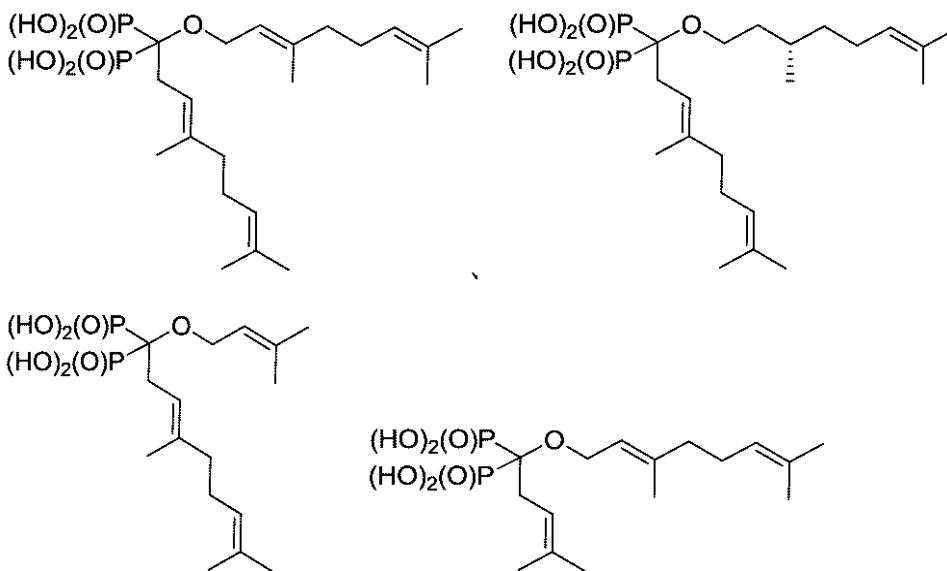
## 【請求項 46】

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> がそれぞれエトキシである請求項 1 ~ 42 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

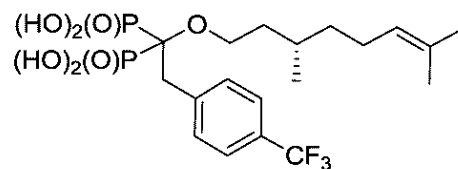
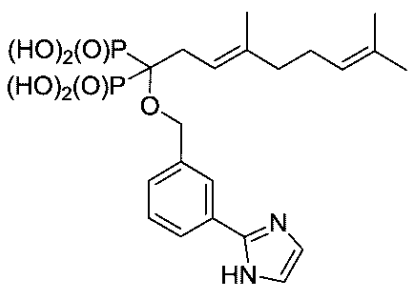
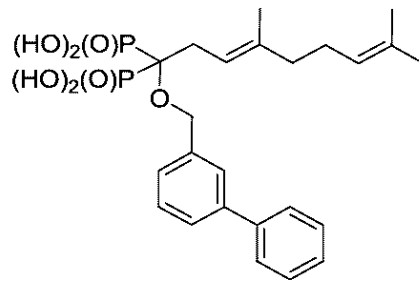
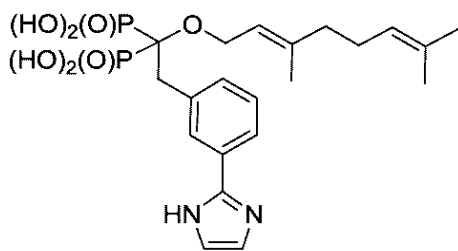
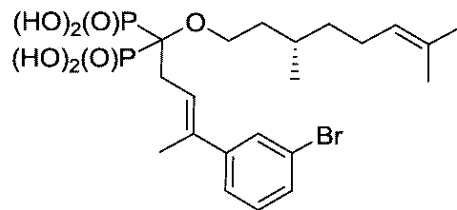
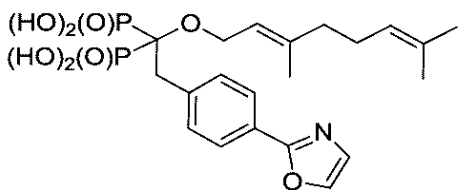
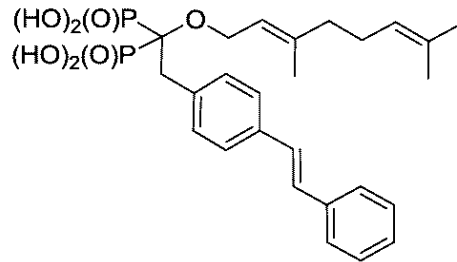
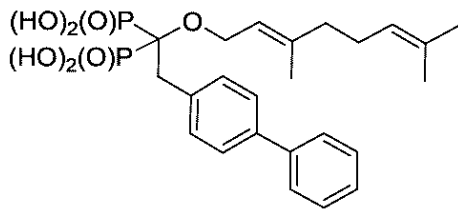
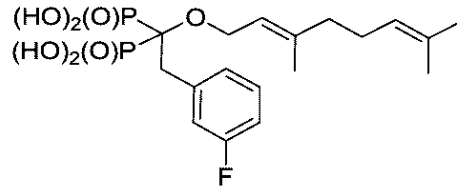
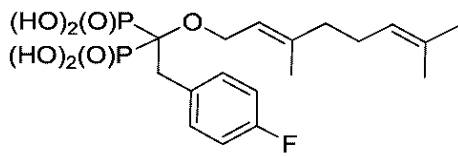
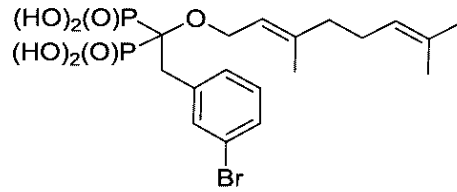
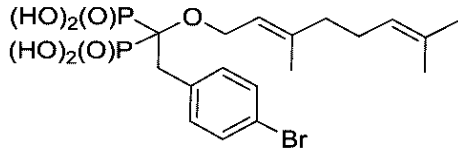
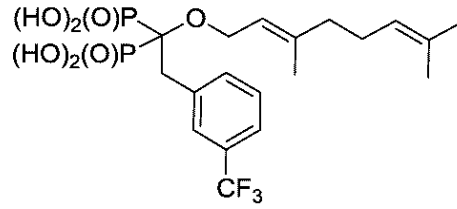
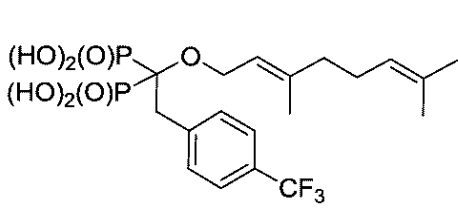
## 【請求項 47】

以下の化合物、またはその塩。

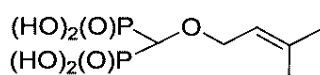
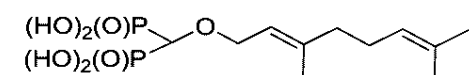
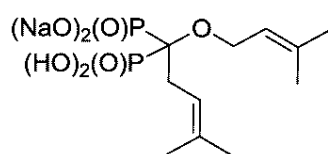
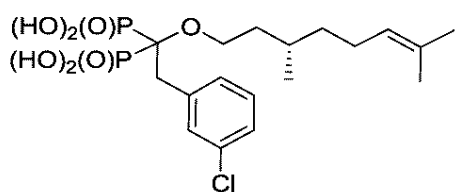
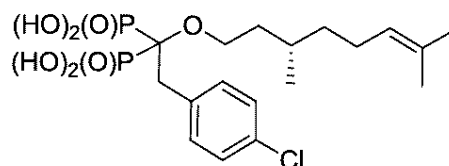
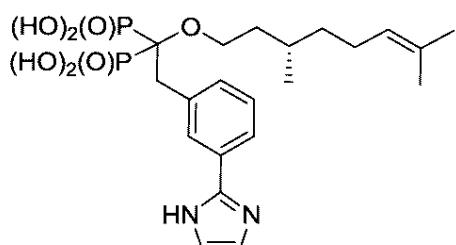
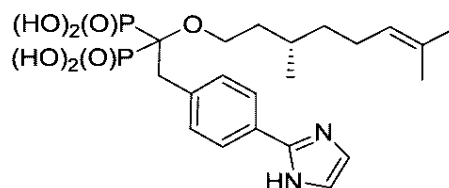
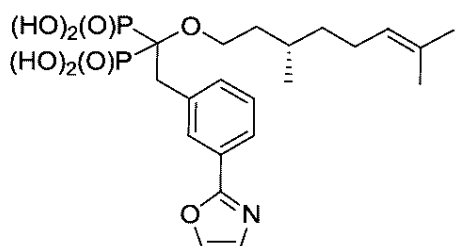
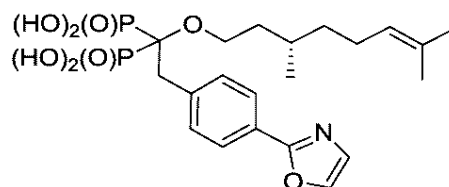
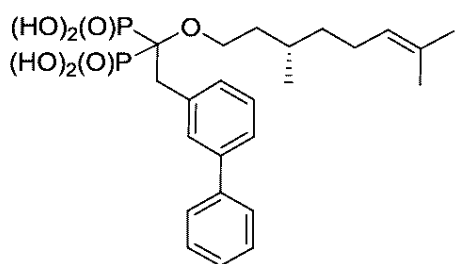
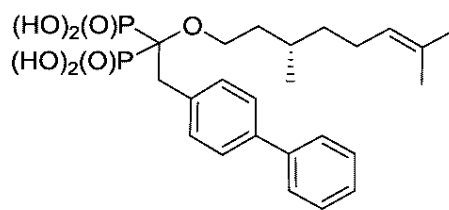
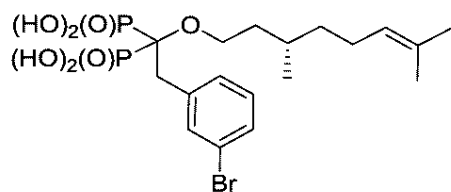
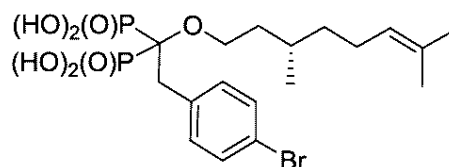
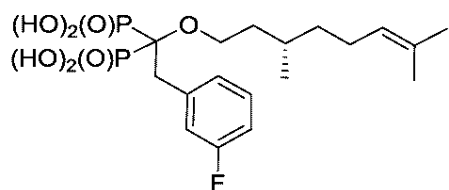
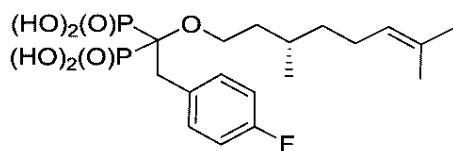
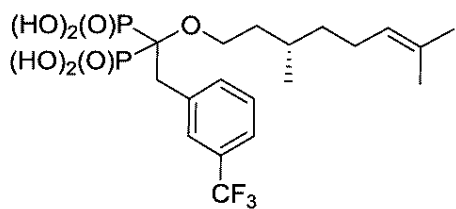
## 【化 37 - 1】



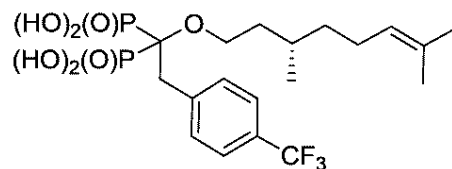
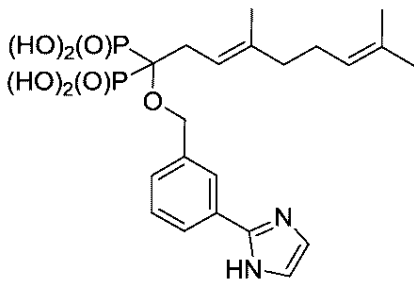
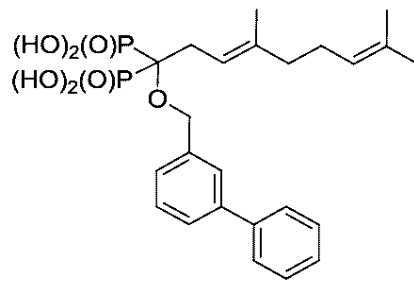
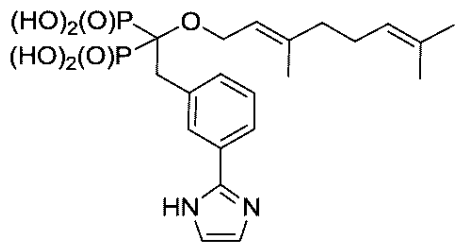
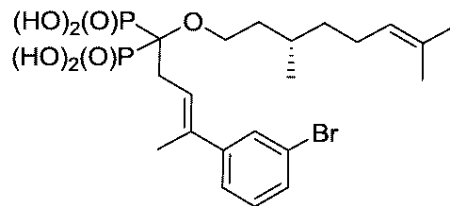
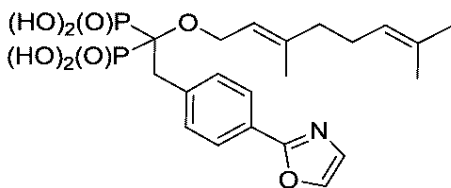
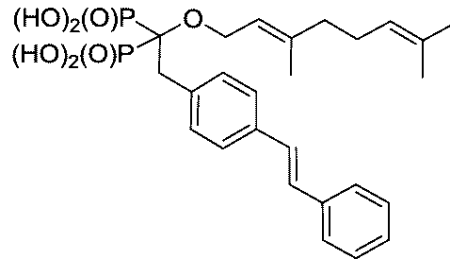
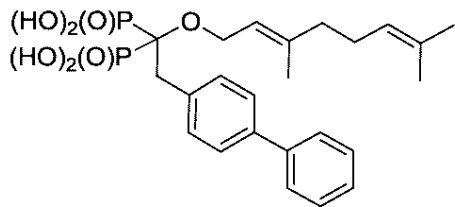
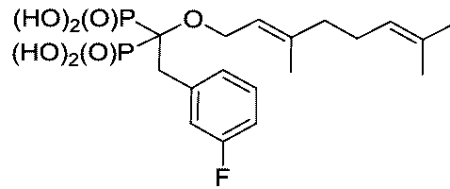
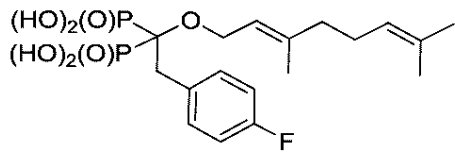
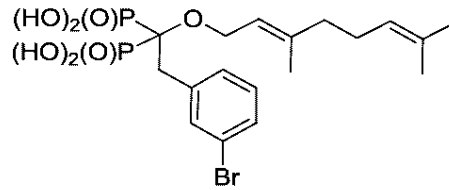
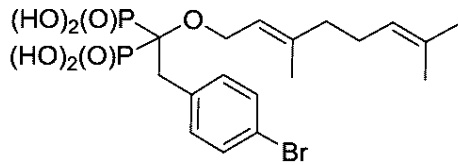
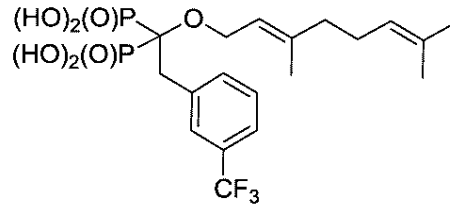
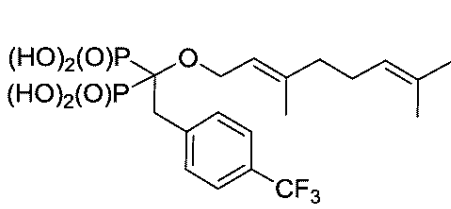
## 【化 3 7 - 2】



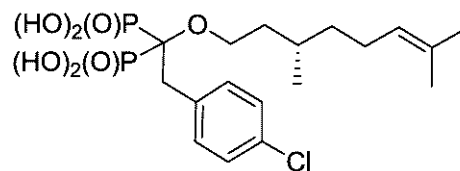
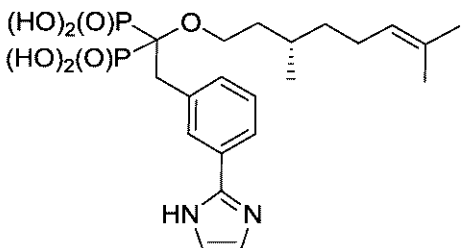
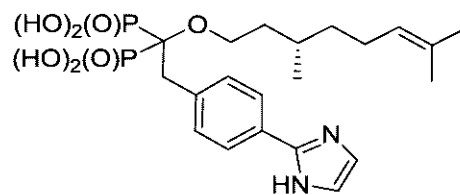
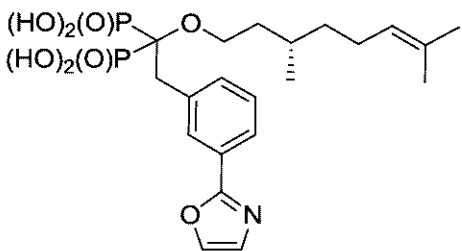
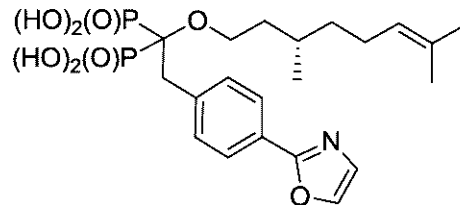
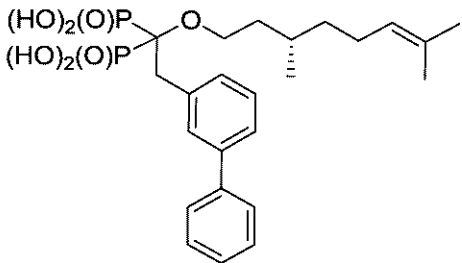
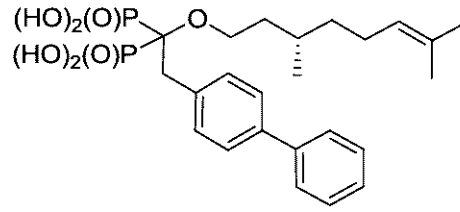
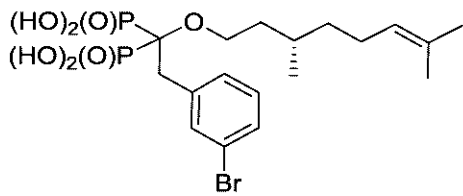
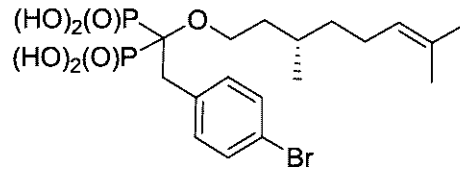
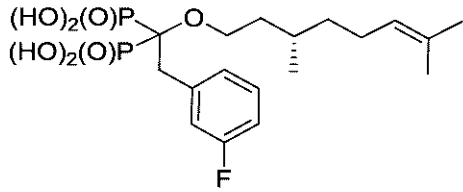
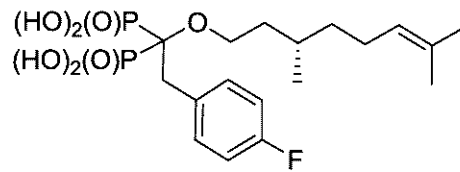
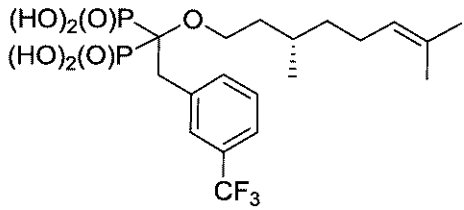
## 【化 3 7 - 3】



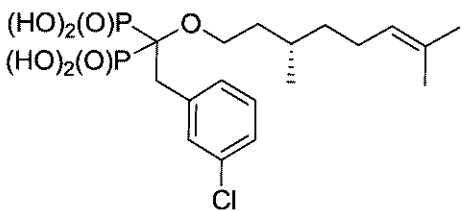
## 【化 3 7 - 4】



## 【化 3 7 - 5】



、もしくは



## 【請求項 4 8】

Xは  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_mCH(CH_3)$  であり；

m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 ~ 3 個のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され；

R<sub>2</sub> は、H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換される；

請求項 2 記載の化合物またはその塩。

【請求項 49】

X は (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり；

m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、該飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖が任意に 1 ~ 3 個のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され；

R<sub>2</sub> は、H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換される；

請求項 48 記載の化合物またはその塩。

【請求項 50】

X は (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり；

m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であり；

R<sub>2</sub> は H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である；

請求項 48 記載の化合物またはその塩。

【請求項 51】

R<sub>1</sub> が飽和または不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である請求項 50 記載の化合物、

またはその塩。

【請求項 5 2】

$R_1$  が飽和または不飽和 ( $C_5 - C_{15}$ ) アルキル鎖である請求項 5 1 記載の化合物、  
またはその塩。

【請求項 5 3】

$R_1$  が飽和または不飽和 ( $C_5 - C_{10}$ ) アルキル鎖である請求項 5 2 記載の化合物、  
またはその塩。

【請求項 5 4】

$X$  は  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_m CH(CH_3)$  であり；

$m$  は 1 ~ 2 の整数であり；

$R_1$  は飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であり；

$R_2$  はメチルであり；

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシであり；

$R_7$  はアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であって、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 または 2 個の ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換される；

請求項 4 8 記載の化合物またはその塩。

【請求項 5 5】

$X$  は  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_m CH(CH_3)$  であり；

$m$  は 1 ~ 2 の整数であり；

$R_1$  はアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であり；

$R_2$  は、H またはメチルであり；

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシであり；

$R_7$  は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であって、( $C_5 - C_{20}$ ) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2 NH_2$  で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイル、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2 NH_2$  で置換される；

請求項 4 8 記載の化合物またはその塩。

【請求項 5 6】

$X$  は  $(CH_2)_m$  または  $(CH_2)_m CH(CH_3)$  であり；

$m$  は 1 ~ 2 の整数であり；

$R_1$  は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であって、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイル、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2 NH_2$  で置換され；

$R_2$  は、H またはメチルであり；

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシであり；

$R_7$  は飽和または不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖である；

請求項 4 8 記載の化合物またはその塩。

## 【請求項 57】

Yは  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり；

nは1～2の整数であり；

各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり；

R<sub>8</sub>は、任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub>-C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>9</sub>は任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>10</sub>は、Hまたはメチルである；

請求項3記載の化合物またはその塩。

## 【請求項 58】

Yは  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり；

nは1～2の整数であり；

各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり；

R<sub>8</sub>は、任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub>-C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>9</sub>はH、または飽和もしくは不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、該飽和もしくは不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖は任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>10</sub>は、Hまたはメチルである；

請求項57記載の化合物またはその塩。

## 【請求項 59】

Yは  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり；

nは1～2の整数であり；

各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり；

R<sub>8</sub>は、任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub>-C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメト

キシ、 $\text{NH}_2$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルカノイル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルカノイルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $\text{NH}_2$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ で置換され；

$\text{R}_9$ はH、または飽和もしくは不飽和 $(\text{C}_1 - \text{C}_{20})$ アルキル鎖であって、該飽和もしくは不飽和 $(\text{C}_1 - \text{C}_{20})$ アルキル鎖は任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $\text{NH}_2$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ で置換され；

$\text{R}_{10}$ は、Hまたはメチルである；

請求項57記載の化合物またはその塩。

【請求項60】

任意のアリールがフェニルであり、任意のヘテロアリールが5～6個の環原子を含み、これらの環原子のうち1～4個はN、OおよびSから選択されるヘテロ原子であり、これらの環原子のいずれかは任意に1または2個の $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ、ハロ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されてもよい、請求項48～59のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項61】

請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩、および薬学的に許容な担体を含む医薬組成物。

【請求項62】

ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害するための組成物であって、請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含み、生体外または生体内において該ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼが、阻害有効量の該化合物またはその塩と接触させられることを特徴とする、組成物。

【請求項63】

前記化合物またはその塩がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも2倍選択性がある請求項62記載の組成物。

【請求項64】

前記化合物またはその塩がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも10倍選択性がある請求項62記載の組成物。

【請求項65】

前記化合物またはその塩がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも100倍選択性がある請求項62記載の組成物。

【請求項66】

がんを治療するための組成物であって、請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項67】

精巣機能を調節するための組成物であって、請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項68】

受精能を調節するための組成物であって、請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項69】

インスリン抵抗性を治療するための組成物であって、請求項1～60のいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項70】

肥満症を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 1】

体重増加を調節するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 2】

破骨細胞機能を調節するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 3】

寄生虫感染症を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 4】

抗寄生虫効果を産生するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含み、生体内または体外で、寄生生物を有効量の該化合物またはその塩と接触させることを特徴とする、組成物。

【請求項 7 5】

心不整脈を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 6】

医学的治療または診断において使用するための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 7 7】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物におけるがんを治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 7 8】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における精巣機能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 7 9】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における受精能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 0】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物におけるインスリン抵抗性を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 1】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における肥満症を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 2】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における体重増加を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 3】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における破骨細胞機能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 4】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における寄生虫感染症を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 5】

請求項 1 ~ 60 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩の、動物における心不整脈を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

【請求項 8 6】

がんの予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 60 のいずれ

か 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 8 7】

インスリン抵抗性の予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 8 8】

肥満症の予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 8 9】

体重増加の予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 9 0】

寄生虫感染症の予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 9 1】

心不整脈の予防的処置または治療的処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩を含む、組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 5】

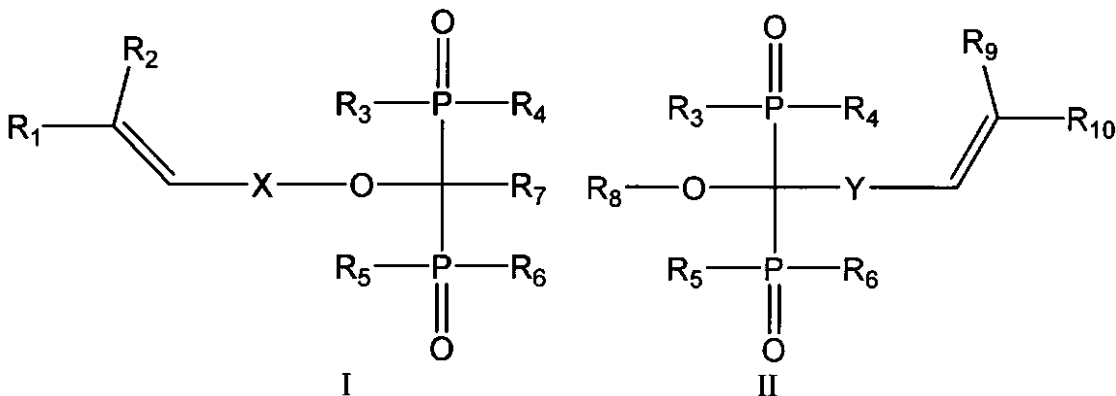
薬理的に許容できる担体と共に本明細書において記載される化合物を含む医薬組成物も提供する。生体外または生体内においてゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを、阻害有効量の明細書において記載される化合物と接触させることを含むゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害する方法も提供する。疾患を治療することを、その治療を必要とする動物（例えば、ヒト等の哺乳動物）に有効量の明細書において記載される化合物を投与することによって行うことを含む方法、または同じく、本明細書において記載される化合物の、疾患を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用、もしくは疾患の治療における化合物の使用も提供する。

特定の実施形態では、例えば以下が提供される：

(項目 1)

式 I または式 II の化合物：

【化 2 5】



であって、式中、

X は ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルであり；

Y は ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルであり；

R<sub>1</sub> は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和 ( C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub> ) アルキル鎖であって、( C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub> ) アルキルは任意に

1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_aR_b$ または $S(O)_2NR_cR_d$ で置換され；

$R_2$ は、H、または任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環もしくはヘテロアリール環を含む飽和もしくは不飽和 $(C_1 - C_{20})$ アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$ アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_aR_b$ または $S(O)_2NR_cR_d$ で置換され；

各 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ および $R_6$ は、互いに独立してOHまたは $(C_1 - C_6)$ アルコキシであり；

$R_7$ は任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和 $(C_1 - C_{20})$ アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$ アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_aR_b$ 、アリール、ヘテロアリールまたは $S(O)_2NR_cR_d$ で置換され；

$R_8$ は任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和 $(C_1 - C_{20})$ アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$ アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_aR_b$ 、アリール、ヘテロアリールまたは $S(O)_2NR_cR_d$ で置換され；

$R_9$ は任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和 $(C_1 - C_{20})$ アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$ アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$ アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_aR_b$ または $S(O)_2NR_cR_d$ で置換され；

$R_{10}$ は、H、または任意にアルキル鎖に1個以上のアリール環もしくはヘテロアリール環を含む飽和もしくは不飽和 $(C_1 - C_{20})$ アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$ アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_mR_n$ または $S(O)_2NR_pR_q$ で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の $(C_1 - C_6)$

) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> で置換され；

各 R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルもしくはアリールであり；または、R<sub>a</sub> および R<sub>b</sub> はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し；

各 R<sub>c</sub> および R<sub>d</sub> は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルもしくはアリールであり；または、R<sub>c</sub> および R<sub>d</sub> はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し；

各 R<sub>m</sub> および R<sub>n</sub> は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルもしくはアリールであり；または、R<sub>m</sub> および R<sub>n</sub> はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し；

各 R<sub>p</sub> および R<sub>q</sub> は互いに独立して、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルもしくはアリールであり；または、R<sub>p</sub> および R<sub>q</sub> はそれらが結合する窒素と共に互いに結合してピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノもしくはチオモルホリノ環を形成し；

任意の R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、R<sub>d</sub>、R<sub>m</sub>、R<sub>n</sub>、R<sub>p</sub> または R<sub>q</sub> のアリールは、任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>s</sub>R<sub>t</sub> または S(O)<sub>2</sub>NR<sub>s</sub>R<sub>t</sub> で置換され、各 R<sub>s</sub> および R<sub>t</sub> は互いに独立して H または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルである；

式 I もしくは式 I I の化合物、またはそれらの塩。

(項目 2)

前記化合物が式 I の化合物である項目 1 記載の化合物、またはその塩。

(項目 3)

前記化合物が式 I I の化合物である項目 1 記載の化合物、またはその塩。

(項目 4)

R<sub>1</sub> が不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 2 記載の化合物。

(項目 5)

X が (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり、m が 1 ~ 2 の整数である項目 2 記載の化合物。

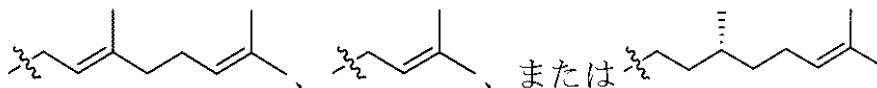
(項目 6)

R<sub>1</sub> が不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) アルキル鎖である項目 2 記載の化合物。

(項目 7)

R<sub>1</sub> が、

**【化 2 6】**



である項目 2 記載の化合物。

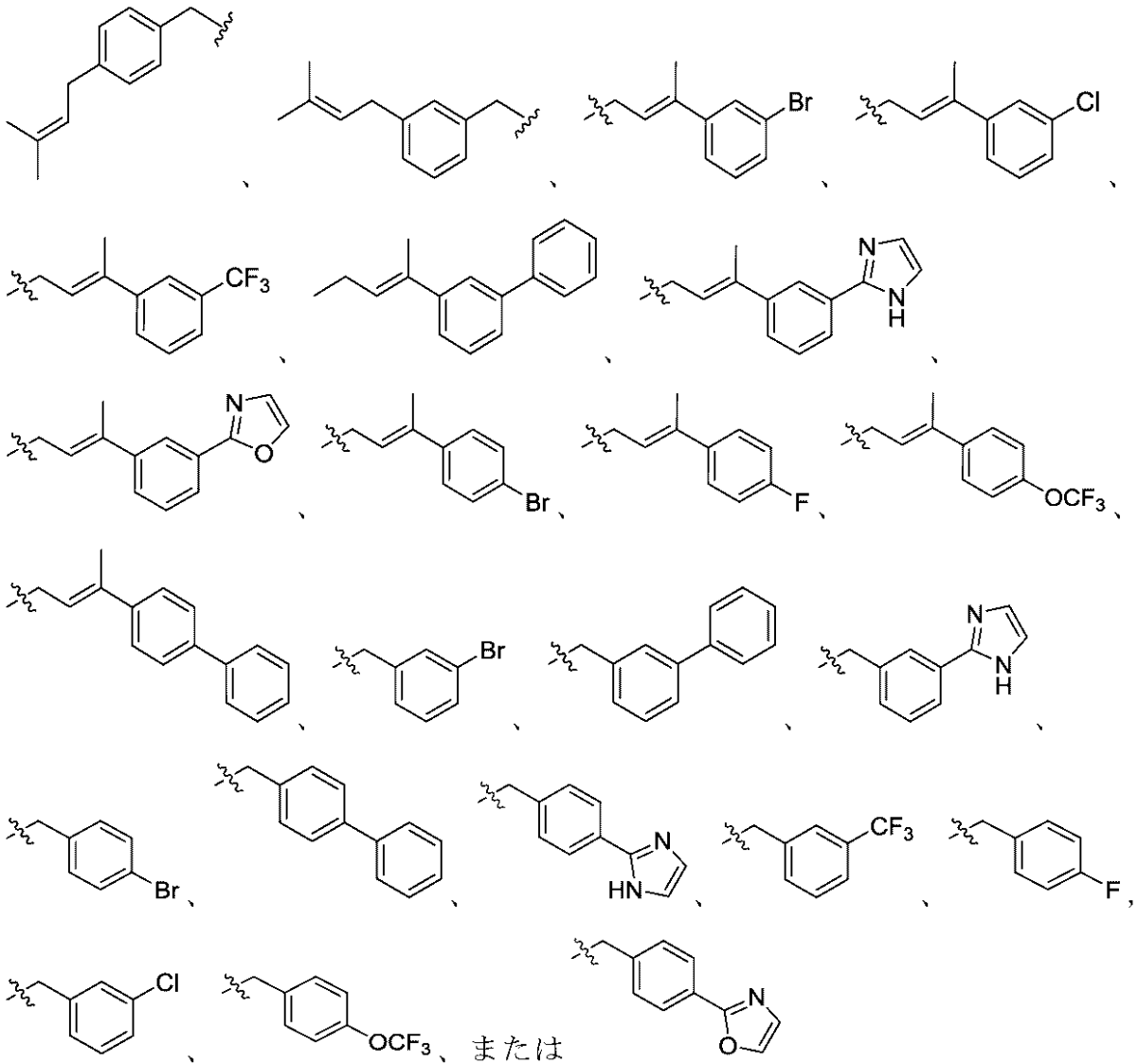
(項目 8)

R<sub>1</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 2 記載の化合物。

(項目 9)

R<sub>1</sub> が、

## 【化 2 7】



である項目 2 記載の化合物。

(項目 1 0)

$R_1$  がアルキル鎖にヘテロアリアル環を含む不飽和 ( $C_5 - C_{20}$ ) アルキル鎖である項目 2 記載の化合物。

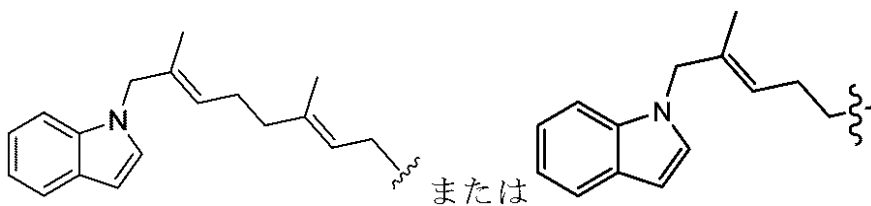
(項目 1 1)

前記ヘテロアリアル環がインドリルである項目 1 0 記載の化合物。

(項目 1 2)

$R_1$  が、

## 【化 2 8】



である項目 2 記載の化合物。

(項目 1 3)

$R_2$  が H または メチル である項目 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 4)

R<sub>2</sub> がメチルである項目 1 3 記載の化合物。

(項目 1 5)

X が (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり、m が 1 である項目 1 4 記載の化合物。

(項目 1 6)

X が (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり、m が 2 である項目 1 4 記載の化合物。

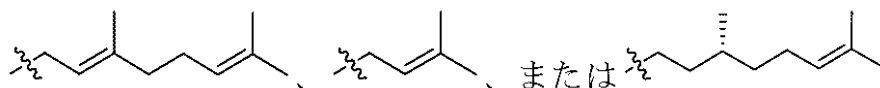
(項目 1 7)

R<sub>7</sub> が飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 2 ~ 1 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 1 8)

R<sub>7</sub> が、

【化 2 9】



である項目 1 7 記載の化合物。

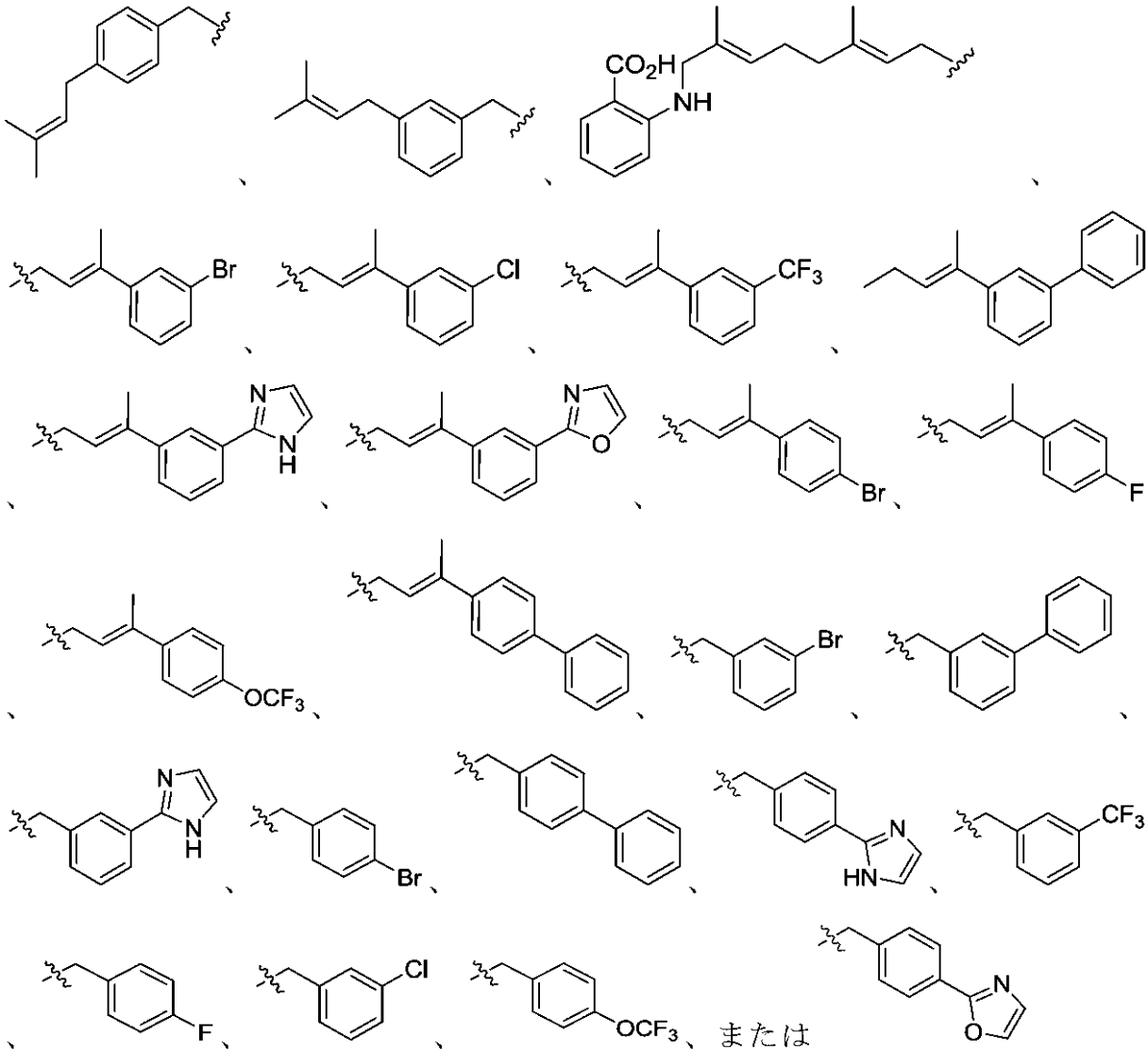
(項目 1 9)

R<sub>7</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 2 ~ 1 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 2 0)

R<sub>7</sub> が、

## 【化30】



である項目19記載の化合物。

(項目21)

Yが  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり、nが1~2の整数である項目3記載の化合物。

(項目22)

R<sub>8</sub>が飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、該飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖が任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub>で置換される、項目3記載の化合物。

(項目23)

R<sub>8</sub>が不飽和(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、該不飽和(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖が任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>m</sub>R<sub>n</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>p</sub>R<sub>q</sub>で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub>で置換される、項目3記載の化合物。

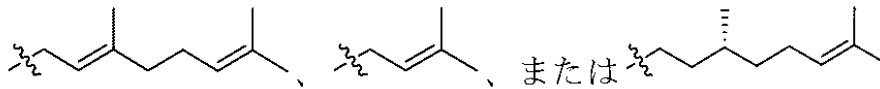
(項目24)

R<sub>8</sub>が不飽和(C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖である項目3記載の化合物。

(項目25)

 $R_8$  が、

【化31】



である項目3記載の化合物。

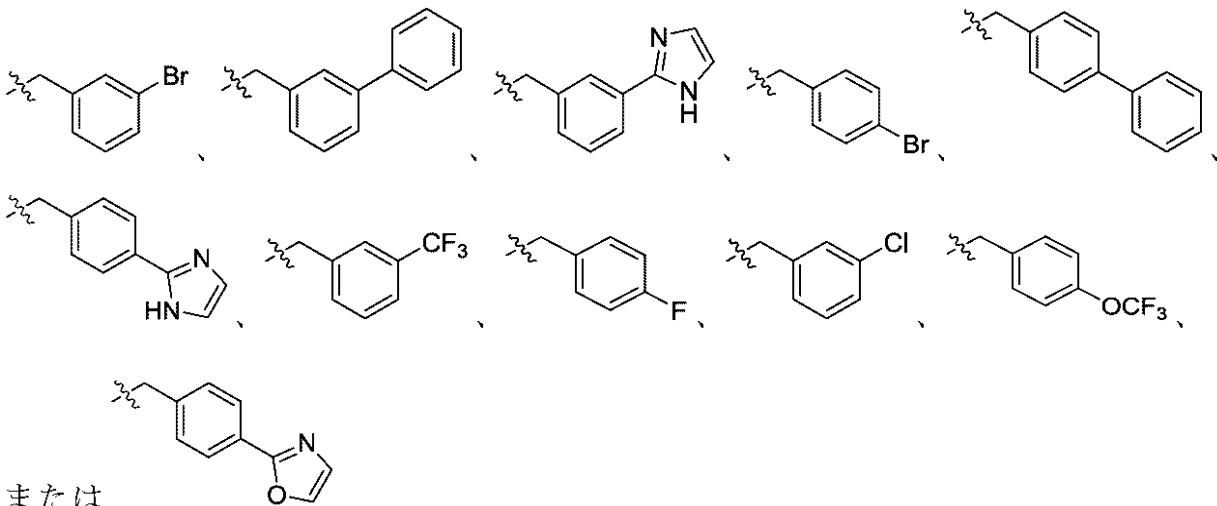
(項目26)

$R_8$  がアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であって、( $C_1 - C_{20}$ ) アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_m R_n$  または  $S(O)_2 NR_p R_q$  で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイル、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_a R_b$  または  $S(O)_2 NR_c R_d$  で置換される、項目3記載の化合物。

(項目27)

 $R_8$  が、

【化32】



である項目19記載の化合物。

(項目28)

 $R_8$  が飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖である項目3記載の化合物。

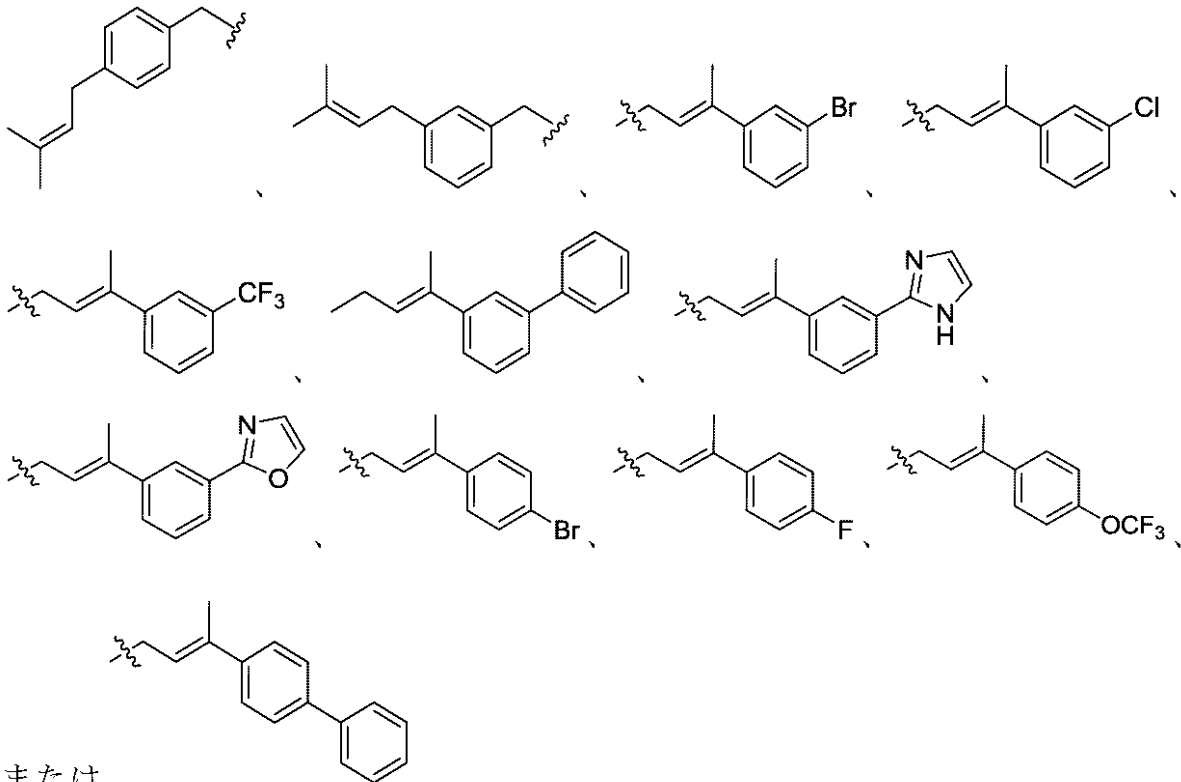
(項目29)

$R_8$  がアルキル鎖に1個以上のアリール環またはヘテロアリール環を含む不飽和 ( $C_1 - C_{20}$ ) アルキル鎖であって、( $C_1 - C_{20}$ ) アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アリール、ヘテロアリール、 $NR_m R_n$  または  $S(O)_2 NR_p R_q$  で置換され、任意のアリールまたはヘテロアリールは任意に1個以上の ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイル、( $C_1 - C_6$ ) アルカノイルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NR_a R_b$  または  $S(O)_2 NR_c R_d$  で置換される、項目3記載の化合物。

(項目30)

 $R_8$  が、

## 【化 3 3】



または

である項目 2 9 記載の化合物。

(項目 3 1)

R<sub>9</sub> が不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

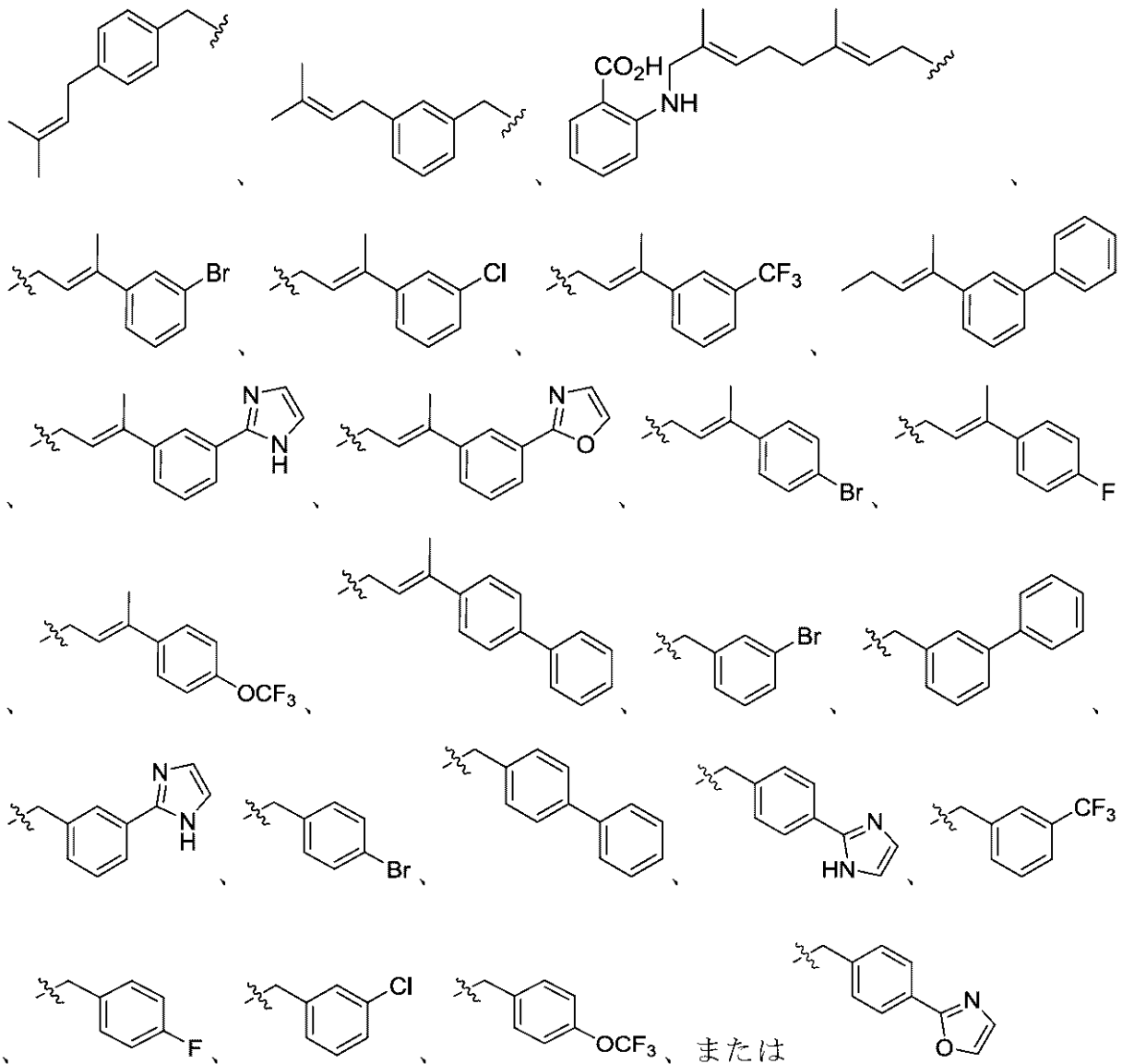
(項目 3 2)

R<sub>9</sub> がアルキル鎖に 1 個以上のアリール環を含む飽和または不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 3)

R<sub>9</sub> が、

## 【化 3 4】



である項目 3 2 記載の化合物。

(項目 3 4)

R<sub>9</sub> がアルキル鎖にヘテロアリアル環を含む不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

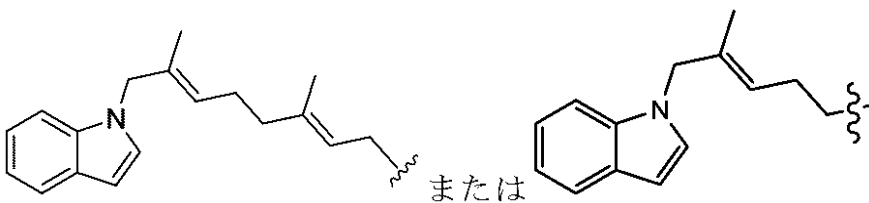
(項目 3 5)

前記ヘテロアリアル環がインドリルである項目 3 4 記載の化合物。

(項目 3 6)

R<sub>9</sub> が、

## 【化 3 5】



である項目 3 5 記載の化合物。

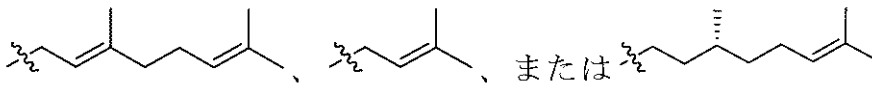
(項目 3 7)

R<sub>9</sub> が不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 3 および 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目38)

 $R_9$ が、

【化36】



である項目37記載の化合物。

(項目39)

 $R_{10}$ がHまたはメチルである項目3および21~38のいずれか1項に記載の化合物

(項目40)

 $R_{10}$ がメチルである項目39記載の化合物。

(項目41)

Yが  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり、nが1である項目1記載の化合物。

(項目42)

Yが  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり、nが2である項目14記載の化合物。

(項目43)

 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  がそれぞれOHである項目1~42のいずれか1項に記載の化合物。

(項目44)

 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  がそれぞれ  $(NaO)_2O$  である項目1~42のいずれか1項に記載の化合物。

(項目45)

 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  がそれぞれアルコキシである項目1~42のいずれか1項に記載の化合物。

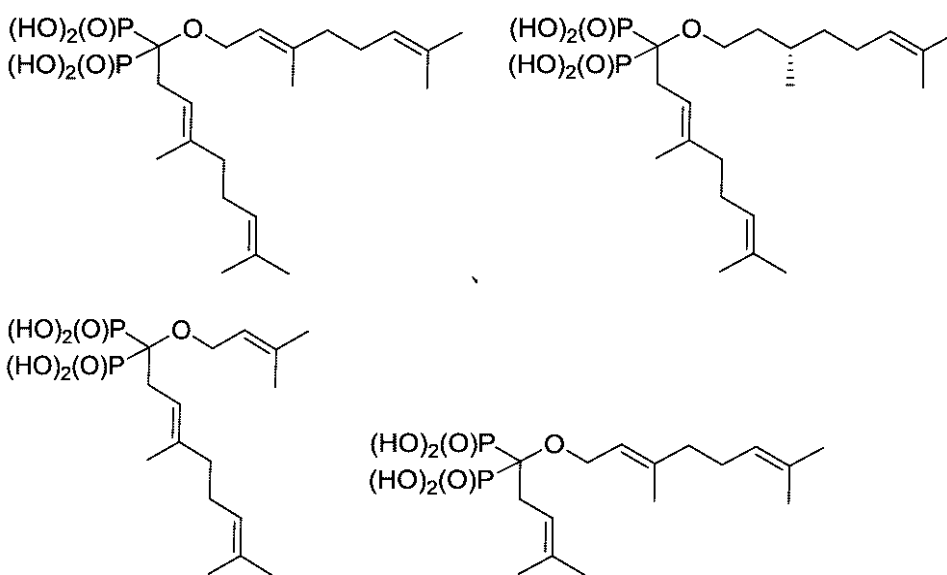
(項目46)

 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  がそれぞれエトキシである項目1~42のいずれか1項に記載の化合物。

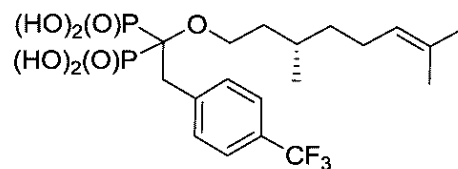
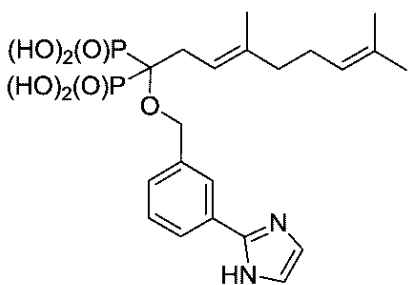
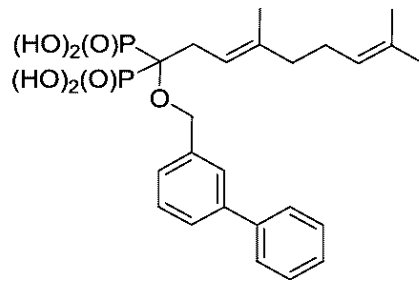
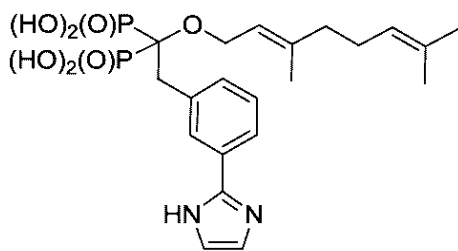
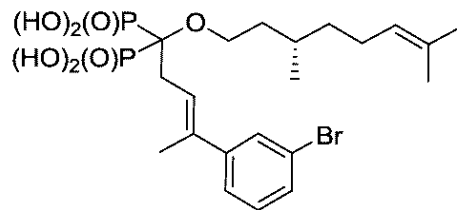
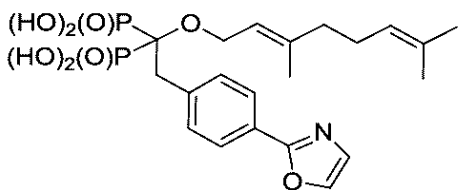
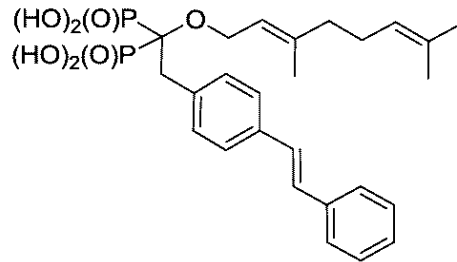
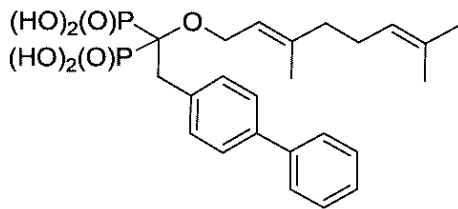
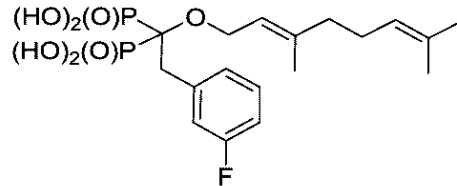
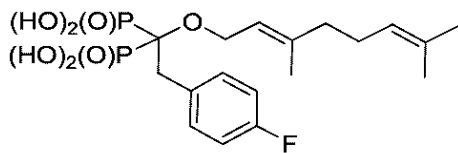
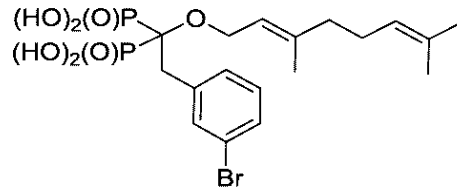
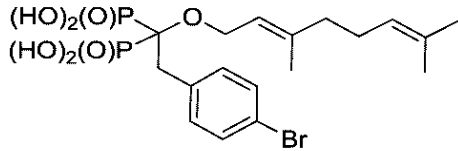
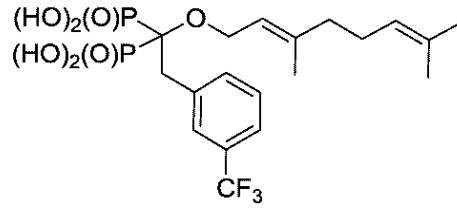
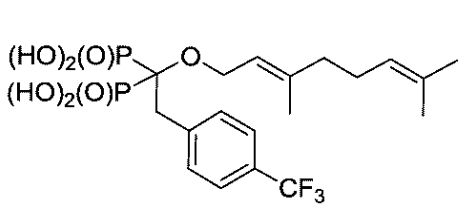
(項目47)

以下の化合物、またはその塩。

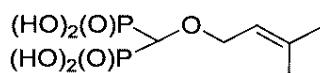
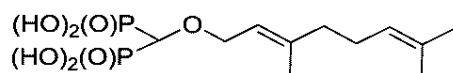
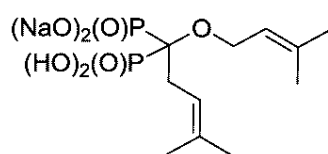
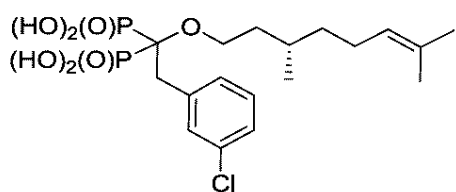
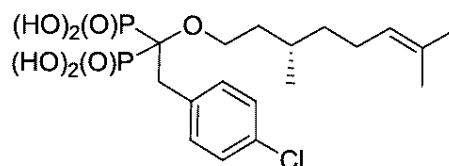
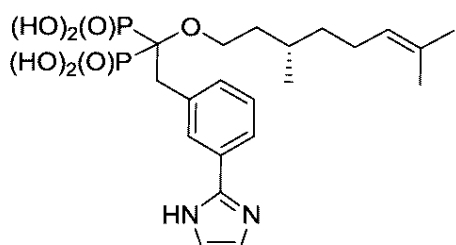
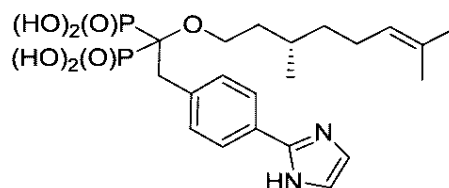
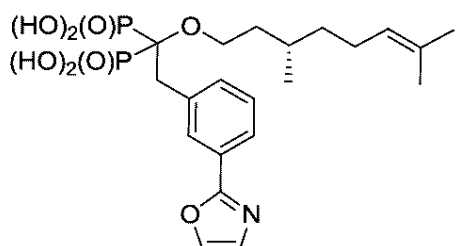
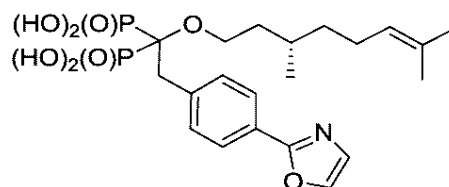
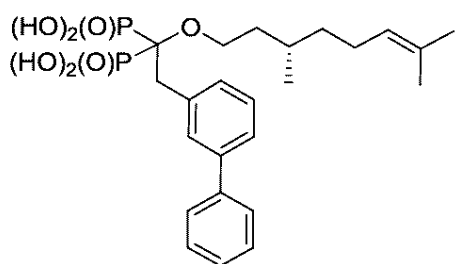
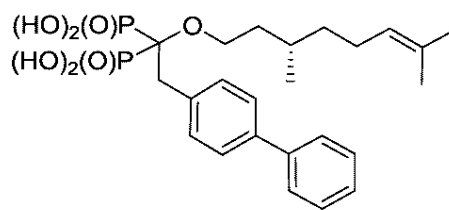
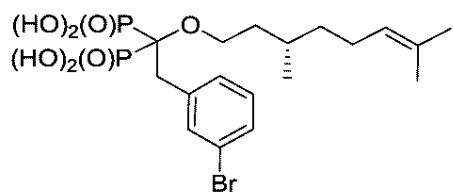
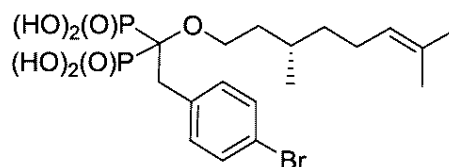
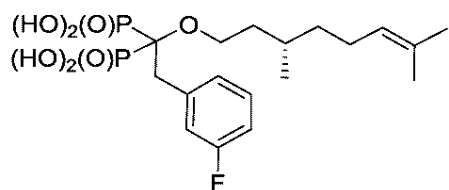
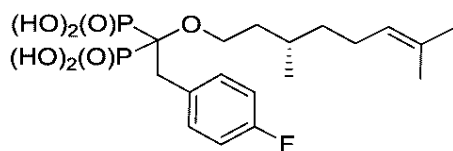
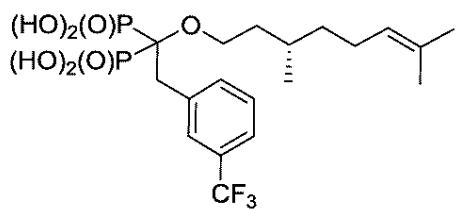
【化37-1】



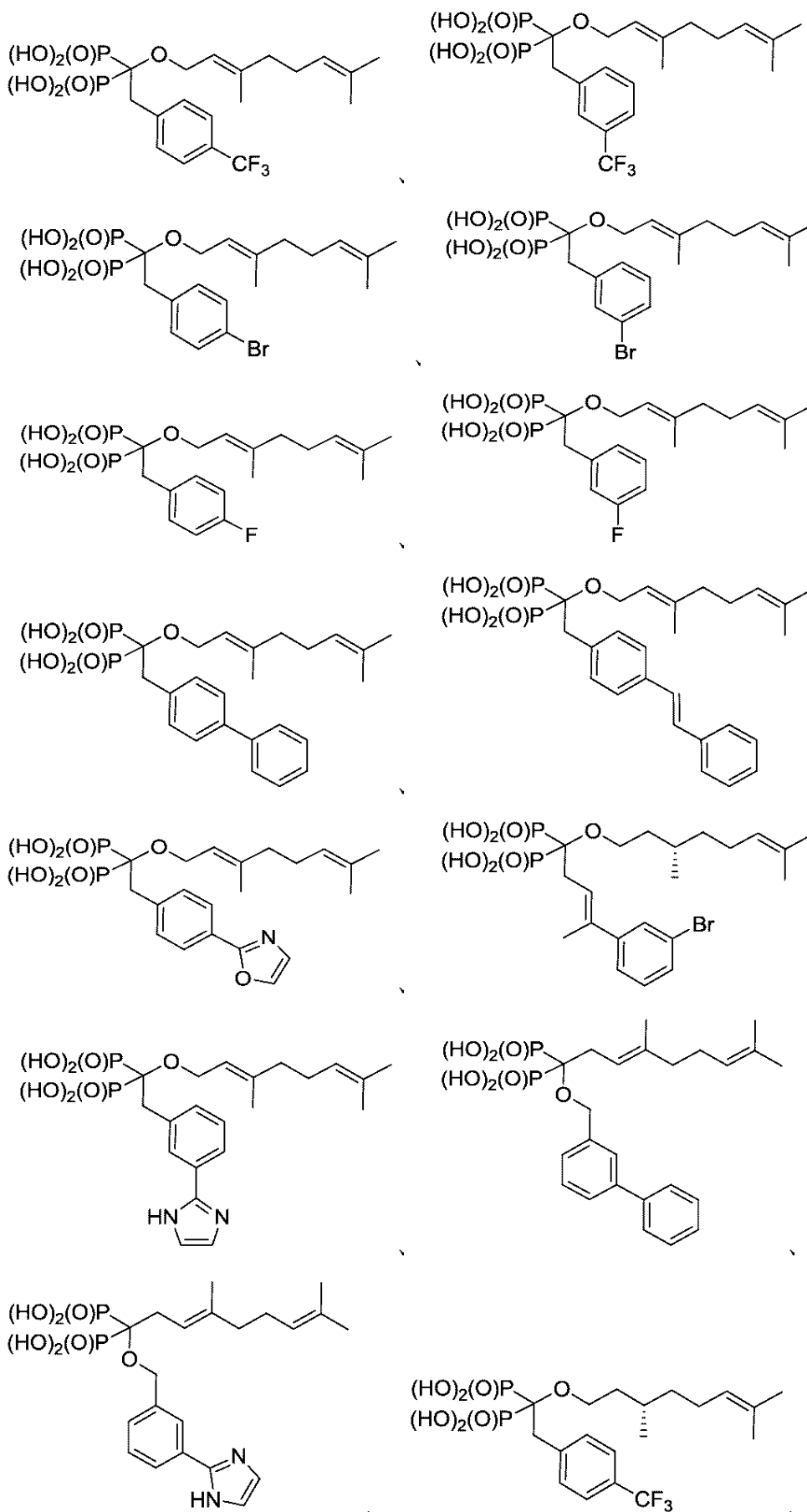
【化 3 7 - 2】



## 【化 3 7 - 3】



## 【化 3 7 - 4】





m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 ~ 3 個のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され；

R<sub>2</sub> は、H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換される；

項目 2 記載の化合物またはその塩。

(項目 49)

X は (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり；

m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、該飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖が任意に 1 ~ 3 個のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され；

R<sub>2</sub> は、H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub> または S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> で置換される；

項目 48 記載の化合物またはその塩。

(項目 50)

X は (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>) であり；

m は 1 ~ 2 の整数であり；

R<sub>1</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖であり；

R<sub>2</sub> は H またはメチルであり；

各 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、互いに独立して OH または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシであり；

R<sub>7</sub> は飽和または不飽和 (C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である；

項目 48 記載の化合物またはその塩。

(項目 51)

R<sub>1</sub> が飽和または不飽和 (C<sub>5</sub> - C<sub>20</sub>) アルキル鎖である項目 50 記載の化合物。

(項目52)R<sub>1</sub>が飽和または不飽和(C<sub>5</sub>-C<sub>15</sub>)アルキル鎖である項目51記載の化合物。(項目53)R<sub>1</sub>が飽和または不飽和(C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>)アルキル鎖である項目52記載の化合物。(項目54)Xは(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>または(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>)であり;mは1~2の整数であり;R<sub>1</sub>は飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であり;R<sub>2</sub>はメチルであり;各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり;R<sub>7</sub>はアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1または2個の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換される;項目48記載の化合物またはその塩。(項目55)Xは(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>または(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>)であり;mは1~2の整数であり;R<sub>1</sub>はアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であり;R<sub>2</sub>は、Hまたはメチルであり;各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり;R<sub>7</sub>は任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、(C<sub>5</sub>-C<sub>20</sub>)アルキルは任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換される;項目48記載の化合物またはその塩。(項目56)Xは(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>または(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CH(CH<sub>3</sub>)であり;mは1~2の整数であり;R<sub>1</sub>は任意にアルキル鎖に1個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に1個以上の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルカノイルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され;R<sub>2</sub>は、Hまたはメチルであり;各R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、互いに独立してOHまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシであり;R<sub>7</sub>は飽和または不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖である;項目48記載の化合物またはその塩。(項目57)Yは(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>または(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH(CH<sub>3</sub>)であり;nは1~2の整数であり;

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または  $(C_1 - C_6)$  アルコキシであり；

$R_8$  は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖であって、 $(C_5 - C_{20})$  アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され；

$R_9$  は任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖であって、 $(C_1 - C_{20})$  アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され；

$R_{10}$  は、H またはメチルである；  
項目 3 記載の化合物またはその塩。

(項目 58)

Y は  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり；  
n は 1 ~ 2 の整数であり；

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または  $(C_1 - C_6)$  アルコキシであり；

$R_8$  は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖であって、 $(C_5 - C_{20})$  アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され；

$R_9$  は H、または飽和もしくは不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖であって、該飽和もしくは不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖は任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され；

$R_{10}$  は、H またはメチルである；  
項目 57 記載の化合物またはその塩。

(項目 59)

Y は  $(CH_2)_n$  または  $(CH_2)_nCH(CH_3)$  であり；  
n は 1 ~ 2 の整数であり；

各  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$  および  $R_6$  は、互いに独立して OH または  $(C_1 - C_6)$  アルコキシであり；

$R_8$  は、任意にアルキル鎖に 1 個以上のアリアル環またはヘテロアリアル環を含む飽和または不飽和  $(C_1 - C_{20})$  アルキル鎖であって、 $(C_5 - C_{20})$  アルキルは任意に 1 個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $NH_2$  または  $S(O)_2NH_2$  で置換され、任意のアリアルまたはヘテロアリアルは任意に 1 個以上の  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイル、 $(C_1 - C_6)$  アルカノイルオキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボ

ニル、ハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>9</sub>はH、または飽和もしくは不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖であって、該飽和もしくは不飽和(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>)アルキル鎖は任意に1個以上のハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、NH<sub>2</sub>またはS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換され；

R<sub>10</sub>は、Hまたはメチルである；

項目57記載の化合物またはその塩。

(項目60)

任意のアリールがフェニルであり、任意のヘテロアリールが5~6個の環原子を含み、これらの環原子のうち1~4個はN、OおよびSから選択されるヘテロ原子であり、これらの環原子のいずれかは任意に1または2個の(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されてもよい、項目48~59のいずれか1項に記載の化合物。

(項目61)

項目1~61のいずれか1項に記載の化合物および薬学的に許容な担体を含む医薬組成物。

(項目62)

生体外または生体内においてゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを、阻害有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物と接触させることを含むゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害する方法。

(項目63)

前記化合物がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも2倍選択性がある項目61記載の方法。

(項目64)

前記化合物がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも10倍選択性がある項目61記載の方法。

(項目65)

前記化合物がファルネシルピロリン酸シンターゼまたはスクアレンシンターゼと比較して、ゲラニルゲラニルピロリン酸シンターゼを阻害することに対し少なくとも100倍選択性がある項目61記載の方法。

(項目66)

がんを治療する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目67)

精巣機能を調節する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目68)

受精能を調節する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目69)

インスリン抵抗性を治療する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目70)

肥満症を治療する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61のいずれか1項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目71)

体重増加を調節する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目1~61

のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目 7 2)

破骨細胞機能を調節する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目 7 3)

寄生虫感染症を治療する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目 7 4)

生体内または生体外で、寄生生物を有効量の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させることを含む抗寄生虫効果を産生する方法。

(項目 7 5)

心不整脈を治療する方法であって、その治療を必要とする動物に有効量の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物を投与することを含む、方法。

(項目 7 6)

医学的治療または診断において使用する項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 7)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物におけるがんを治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 7 8)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における精巣機能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 7 9)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における受精能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 0)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物におけるインスリン抵抗性を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 1)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における肥満症を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 2)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における体重増加を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 3)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における破骨細胞機能を調節するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 4)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における寄生虫感染症を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 5)

項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物の、動物における心不整脈を治療するのに有用な医薬品を調製するための使用。

(項目 8 6)

がんの予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 7)

精巣機能調節用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 8)

受精能調節用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 9)

インスリン抵抗性の予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記

載の化合物。

( 項目 9 0 )

肥満症の予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物

。

( 項目 9 1 )

体重増加の予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 2 )

破骨細胞機能調節用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 3 )

寄生虫感染症の予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 9 4 )

心不整脈の予防的処置または治療的処置用の項目 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。