

【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19年2月8日(2007.2.8)

【公表番号】特表2002-533336(P2002-533336A)

【公表日】平成14年10月8日(2002.10.8)

【出願番号】特願2000-589531(P2000-589531)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14	
A 61 K 31/496	
A 61 P 35/00	
A 61 P 35/02	
A 61 P 43/00	1 1 1
C 07 D 403/12	

【手続補正書】

【提出日】平成18年12月14日(2006.12.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

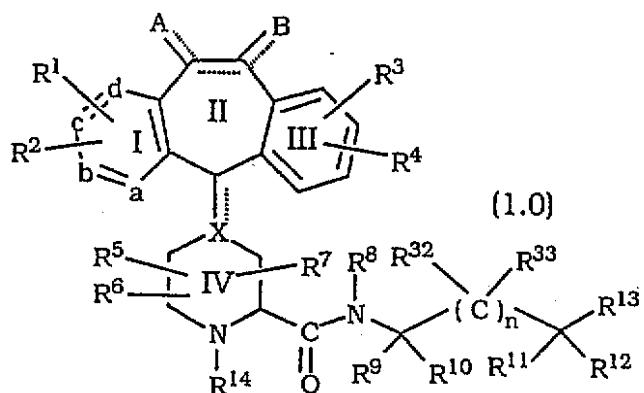
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】以下の式の化合物：

【化1】



あるいはその薬学的に受容可能な塩または溶媒和物であって、ここで：

a、b、cおよびdのうちの1つは、NもしくはN<sup>+</sup>O<sup>-</sup>を表し、そして残りのa、b、cおよびd基は、CR<sup>1</sup>もしくはCR<sup>2</sup>を表すか；または

a、b、cおよびdの各々が独立して、CR<sup>1</sup>もしくはCR<sup>2</sup>から選択され；

Xは、任意の結合（点線で示される）が存在しない場合にはNもしくはCHを表し、そ

して任意の結合が存在する場合にはCを表し；

炭素原子5と炭素原子6との間の点線は、任意の結合を表し、その結果、二重結合が存在する場合には、AおよびBは独立して、-R<sup>15</sup>、ハロ、-OR<sup>16</sup>、-OCO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>、もしくは-OC(O)R<sup>15</sup>を表し、そして二重結合が炭素原子5と炭素原子6との間に存在しない場合には、AおよびBは各々独立して、H<sub>2</sub>、-(OR<sup>16</sup>)<sub>2</sub>、Hおよびハロ、ジハロ、アルキルおよびH、(アルキル)<sub>2</sub>、-Hおよび-OC(O)R<sup>15</sup>、Hおよび-OR<sup>15</sup>、=O、アリールおよびH、=NOR<sup>15</sup>、もしくは-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-を表し、ここでpは2、3、もしくは4であり；

各R<sup>1</sup>および各R<sup>2</sup>は、独立して、H、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OR<sup>15</sup>、-COR<sup>15</sup>、-SR<sup>15</sup>、-S(O)<sub>t</sub>R<sup>16</sup>(ここでtは0、1、もしくは2である)、-N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-OC(O)R<sup>15</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>、-OCO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>、-CN、-NR<sup>15</sup>COOR<sup>16</sup>、-SR<sup>16</sup>C(O)OR<sup>16</sup>、-SR<sup>16</sup>N(R<sup>17</sup>)<sub>2</sub>(ただし、-SR<sup>16</sup>N(R<sup>17</sup>)<sub>2</sub>のR<sup>16</sup>は-CH<sub>2</sub>-ではない)から選択され、ここで各R<sup>17</sup>は独立して、Hまたは-C(O)OR<sup>16</sup>、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ、テトラゾール-5-イルチオ、または置換テトラゾール-5-イルチオ、アルキニル、アルケニルまたはアルキルから選択され、該アルキルまたはアルケニル基は、必要に応じて、ハロ、-OR<sup>15</sup>、もしくは-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>で置換され；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、同一であるかまたは異なり、そして各々独立して、H、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>の任意の置換基を表すか、またはR<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が一緒になって、ベンゼン環(環I I I)への飽和もしくは不飽和のC<sub>5</sub>～C<sub>7</sub>の縮環を表し；

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、およびR<sup>7</sup>は、各々独立して、H、-CF<sub>3</sub>、-COR<sup>15</sup>、アルキルまたはアリールを表し、該アルキルまたはアリールは、必要に応じて、-OR<sup>15</sup>、-SR<sup>15</sup>、-S(O)<sub>t</sub>R<sup>16</sup>、-NR<sup>15</sup>COOR<sup>16</sup>、-N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-COR<sup>15</sup>、-OCOR<sup>15</sup>、-OCO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>、-OP(O<sub>3</sub>)R<sup>15</sup>で置換されるか、またはR<sup>5</sup>はR<sup>6</sup>と一緒にになって、=Oもしくは=Sを表し；

R<sup>8</sup>は、H、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、置換アルキル、置換アリール、置換アリールアルキル、置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリールアルキル、置換シクロアルキル、置換シクロアルキルアルキルから選択され；

R<sup>8</sup>の置換基は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>18</sup>、シクロアルキルアルキル、ハロ、CN、-C(O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、もしくは-CO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>から選択される置換基であり；ただし、-OR<sup>18</sup>および-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>置換基は、-C(O)NR<sup>8</sup>-部分のNに結合する炭素には結合せず；

各R<sup>18</sup>は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、もしくはシクロアルキルから選択され；

R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、もしくは-C(=O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>(ここでR<sup>18</sup>は上に定義したとおりである)から選択され；そして置換可能なR<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

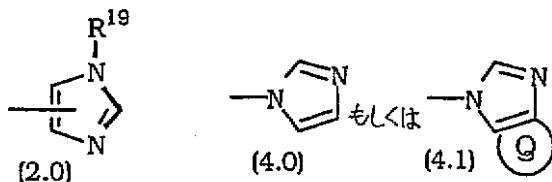
R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル環を形成し；

R<sup>11</sup>およびR<sup>12</sup>は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、-CON(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>18</sup>、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>から選択され；ここで、R<sup>18</sup>は上に定義したとおりであり；ただし、-OR<sup>18</sup>および-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>基は、窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；そしてここで、該置換可能なR<sup>11</sup>およびR<sup>12</sup>基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル環を形成し；

$R^{13}$  は、以下：

【化 2】



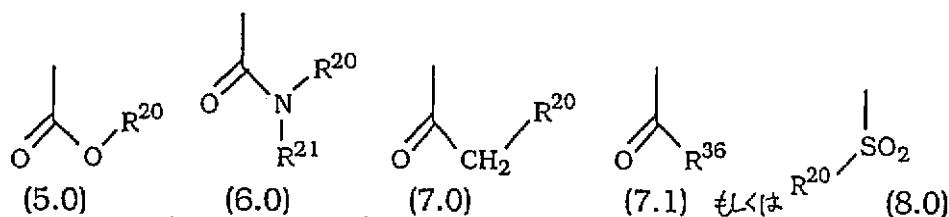
から選択されるイミダゾリル環であり、

ここで、 $R^{19}$  は、(1) H、(2) アルキル、(3) アルキル、(4) アリール、(5) アリールアルキル、(6) 置換アリールアルキル（ここで置換基はハロもしくは CN から選択される）、(7) -C(アリール)<sub>3</sub>、または(8) シクロアルキルから選択され；

該イミダゾリル環 2.0 は、必要に応じて、1 または 2 つの置換基で置換され、そして該イミダゾール環 4.0 は、必要に応じて、1 ~ 3 個の置換基で置換され、そして該イミダゾール環 4.1 は、必要に応じて、1 つの置換基で置換され、ここで環 2.0、4.0、および 4.1 についての該任意の置換基は、独立して、-NHCO(O)R<sup>18</sup>、-C(R<sup>34</sup>)<sub>2</sub>OR<sup>35</sup>、-OR<sup>18</sup>、-SR<sup>18</sup>、F、Cl、Br、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>（ここで各 R<sup>18</sup> は独立して選択される）から選択され；ここで、R<sup>18</sup> は上に定義したとおりであり；ここで、各 R<sup>34</sup> は独立して、H もしくはアルキルから選択され；ここで、R<sup>35</sup> は、H、-C(O)OR<sup>20</sup>、もしくは-C(O)NHR<sup>20</sup> から選択され、そして R<sup>20</sup> は以下で定義され；Q は、アリール環、シクロアルキル環、もしくはヘテロアリール環を表し、該 Q は、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、-OR<sup>18</sup>、-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>（ここで各 R<sup>18</sup> は独立して選択される）、-OC(O)R<sup>18</sup>、もしくは-C(O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>（ここで各 R<sup>18</sup> は独立して選択される）から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換され、そしてここで、R<sup>18</sup> は上で定義した通りであり；

$R^{14}$  は、以下：

【化 3】



から選択され；

$R^{15}$  は、H、アルキル、アリール、もしくはアリールアルキルから選択され；

$R^{16}$  は、アルキルもしくはアリールから選択され；

$R^{20}$  は、H、アルキル、アルコキシ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、もしくはヘテロシクロアルキルから選択され、ただし、R<sup>14</sup> が基 5.0 もしくは 8.0 である場合には、R<sup>20</sup> は H ではなく；

$R^{20}$  が H 以外である場合には、該 R<sup>20</sup> 基は、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、-OC(O)R<sup>18</sup>、-OR<sup>18</sup>、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub> から選択される 1 つ以上の置換基で置換され、ここで各 R<sup>18</sup> 基は同一であるかまたは異なり、そしてここで、R<sup>18</sup> は上で定義した通りであり、ただし、該任意の置換基は、酸素または窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；

$R^{21}$  は、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリー

ル、ヘテロアリールアルキル、もしくはヘテロシクロアルキルから選択され；

$R^{21}$ がH以外である場合には、該 $R^{21}$ 基は、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、-OR<sup>18</sup>、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>から選択される1つ以上の置換基で置換され、ここで各R<sup>18</sup>基は同一であるかまたは異なり、そしてここで、R<sup>18</sup>は上で定義した通りであり、ただし、該任意の置換基は、酸素または窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；

nは0～5であり；

各R<sup>32</sup>およびR<sup>33</sup>は、各nに対して独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、-CON(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>18</sup>、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>から選択され；ここで、R<sup>18</sup>は上で定義した通りであり、そしてここで、該置換可能なR<sup>32</sup>およびR<sup>33</sup>基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

R<sup>32</sup>およびR<sup>33</sup>は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル環を形成し；そして

R<sup>36</sup>は、分枝アルキル、非分枝アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、もしくはアリールから選択され；

ただし：

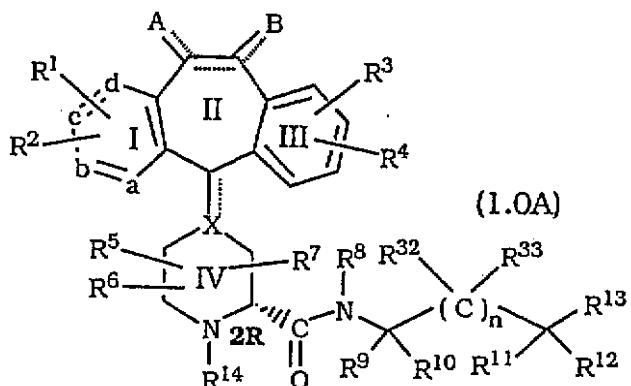
(1) R<sup>14</sup>が、基6.0、7.0、7.1、または8.0から選択され、そしてXがNである場合には、R<sup>8</sup>は、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、置換C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>アルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、もしくは置換シクロアルキルアルキルから選択され；そして

(2) R<sup>14</sup>が、基6.0、7.0、7.1、または8.0から選択され、そしてXがNであり、そしてR<sup>8</sup>がHである場合には、R<sup>13</sup>とアミド部分との間のアルキル鎖が置換される、

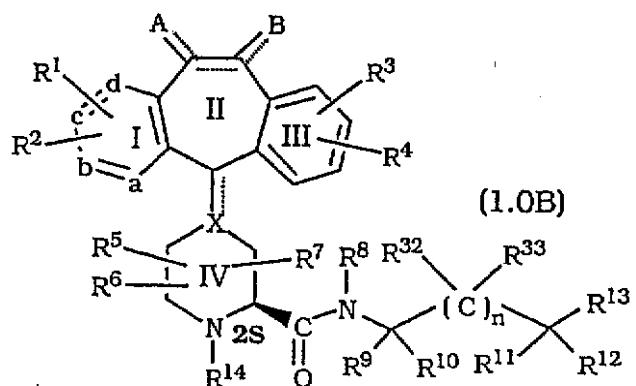
化合物。

【請求項2】 以下の構造：

【化4】



または



を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】  $R^1 \sim R^4$  が独立して、H、Br、もしくはCl から選択され；  $R^5 \sim R^7$  がH であり； a がN であり、そして残りの b、c、およびd 置換基が炭素であるか、または a、b、c、およびd が炭素であり； A および B が  $H_2$  であり； n が0 もしくは1 であり；  $R^{13}$  が基2.0 もしくは4.0 であり；  $R^8$  は、アリールアルキル、置換アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、もしくは置換ヘテロアリールアルキルから選択され；  $R^9$  および  $R^{10}$  は独立して、H、アルキル、-C(O)N( $R^{18}$ )<sub>2</sub>、もしくはアリールアルキルから選択され；  $R^1$  および  $R^{12}$  は独立して、H、アルキル、置換アリール、-OR<sup>18</sup> から選択されるか、あるいは  $R^{11}$  および  $R^{12}$  は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキル環を形成し；  $R^{32}$  および  $R^{33}$  は独立して、H、-OR<sup>18</sup>、アリールアルキル、もしくはアリールから選択され；  $R^{19}$  は、-C(O)N( $R^{18}$ )<sub>2</sub>、アルキル、アリールアルキル、もしくは-C(アリール)<sub>3</sub> から選択され； そして該任意の  $R^{13}$  の置換基は、-OH で置換された-N( $R^{18}$ )<sub>2</sub>、-NHCO $R^{18}$ 、-C( $R^{34}$ )<sub>2</sub>OR<sup>35</sup>、アルキル、もしくはシクロアルキルから選択され、ただし、該-OH 置換基は、酸素原子に隣接する炭素には結合せず；  $R^{14}$  が：

(a) 5.0 であり、そして  $R^{20}$  が、アルキル、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ハロで置換されたアリール、シクロアルキル、もしくはアルキルで置換されたシクロアルキルから選択されるか；

(b) 6.0 であり、ここで  $R^{20}$  および  $R^{21}$  が独立して、H、シクロアルキル、アルキル、アリール、もしくはアリールアルキルから選択されるか；

(c) 7.0 であり、ここで  $R^{20}$  が、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、-C(O)N( $R^{18}$ )<sub>2</sub> で置換されたヘテロシクロアルキルから選択されるか；

(d) 7.1 であり、ここで  $R^{36}$  が、シクロアルキルもしくはヘテロシクロアルキルから選択されるか； あるいは

( e ) 8 . 0 であり、ここで  $R^{20}$  が、アルキルもしくはシクロアルキルから選択される  
化合物。

【請求項 4】 請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

- ( a )  $R^1 \sim R^4$  が独立して、H、Br、もしくはC 1 から選択され；
- ( b )  $R^5 \sim R^7$  がHであり；
- ( c ) a がNであり、そして残りの b、c、およびd 置換基が炭素であり；
- ( d ) A およびB が  $H_2$  であり；
- ( e ) n が0 もしくは1 であり；
- ( f )  $R^{13}$  が、基2 . 0 もしくは4 . 0 であり、そして前記任意の  $R^{13}$  の置換基が、  
 $-N(R^{18})_2$ 、 $-NHCO(O)R^{18}$ 、 $-C(R^{34})_2OR^{35}$ 、もしくはアルキルから選択され；

( g )  $R^8$  が、アリールアルキル、置換アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、  
置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、もしくは置換ヘテロアリールアルキルから選択され；

( a )  $R^9$  および  $R^{10}$  が独立して、H、アルキル、 $-C(O)N(R^{18})_2$ 、もしくはアリールアルキルから選択され；

( h )  $R^{11}$  および  $R^{12}$  が独立して、H、アルキル、置換アリール、 $-OR^{18}$  から選択され  
るか、または  $R^{11}$  および  $R^{12}$  が、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキル環を形成し；

( i )  $R^{11}$  および  $R^{12}$  が独立して、H、アルキル、置換アリール、 $-OR^{18}$  から選択され  
るか、または  $R^{11}$  および  $R^{12}$  が、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキル環を形成し；

( j ) X がCH もしくはN であり；

( k )  $R^{19}$  が、 $-C(O)N(R^{18})_2$ 、アルキル、アリールアルキル、もしくは  
 $-C(\text{アリール})_3$  から選択され；

( l ) 5 . 0 についての  $R^{20}$  が、( 1 ) アルキル、( 2 ) アリールアルキル、( 3 ) ヘテロシクロアルキル、( 4 ) アリール、( 5 ) ハロで置換されたアリール、( 6 ) シクロアルキル、( 7 ) アルキルで置換されたシクロアルキル、または( 8 )  $-OC(O)R^{18}$   
もしくは  $-OH$  で置換されたシクロアルキルから選択され、ただし、該  $-OH$  置換基は、  
酸素原子に隣接する炭素原子には結合せず；

( m ) 6 . 0 についての  $R^{20}$  および  $R^{21}$  が独立して、H、シクロアルキル、アルキル、  
アリール、もしくはアリールアルキルから選択され；

( n ) 7 . 0 についての  $R^{20}$  が、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルコキシ、 $-C(O)N(R^{18})_2$  で置換されたヘテロシクロアルキルから選択され；

( o ) 7 . 1 についての  $R^{36}$  が、ヘテロシクロアルキルもしくはシクロアルキルから選  
択され；

( p ) 8 . 0 についての  $R^{20}$  が、アルキルもしくはシクロアルキルから選択され；そし  
て

( q )  $R^{32}$  および  $R^{33}$  が独立して、H、 $-OR^{18}$ 、アリールアルキルもしくはアリール  
から選択される、

化合物。

【請求項 5】 請求項 4 に記載の化合物であって、ここで：

- ( a )  $R^8$  が、ベンジルもしくは  $-CH_2-$  シクロプロピルから選択され；
- ( b ) 5 . 0 についての  $R^{20}$  が、シクロヘキシルであり；
- ( c ) 6 . 0 についての  $R^{20}$  が、t - ブチル、i - プロピル、もしくはシクロヘキシル  
から選択され；そして  $R^{21}$  が、H、 $-CH_3$ 、もしくはi - プロピルから選択され；
- ( d ) 7 . 0 についての  $R^{20}$  が、シクロヘキシル、シクロペンチル、もしくはi - プロ  
ピルから選択され；
- ( e ) 7 . 1 についての  $R^{36}$  が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、も

しくはシクロヘキシリから選択され；そして  
(d) R<sup>20</sup>についてのR<sup>20</sup>が、メチルである、  
化合物。

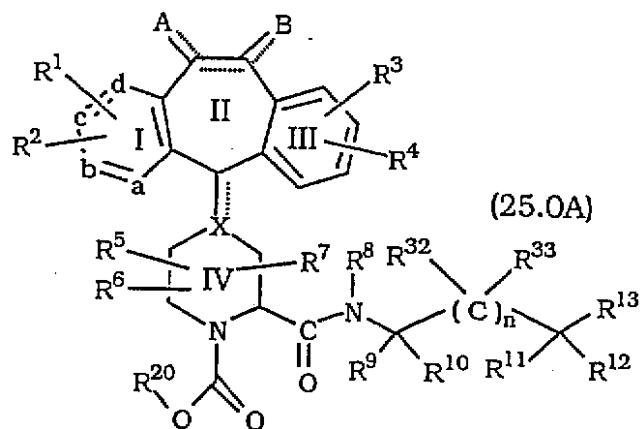
【請求項6】 前記化合物が2R異性体である、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】 前記R<sup>8</sup>がHであり、そして前記アミド置換基-C(=O)NR<sup>8</sup>とR<sup>13</sup>  
との間のアルキル鎖が置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】 請求項1に記載の化合物であって、ここで、R<sup>14</sup>が基5.0であり、  
XがNであり、そしてR<sup>8</sup>がHである場合、(a) R<sup>13</sup>と前記アミド部分との間のアルキ  
ル鎖が置換され、そして/または(b) R<sup>9</sup>とR<sup>10</sup>、および/またはR<sup>11</sup>とR<sup>12</sup>が、一緒  
になってシクロアルキル環を形成する、化合物。

【請求項9】 以下の式の化合物：

【化9】



あるいはその薬学的に受容可能な塩または溶媒和物であって、ここで：

a、b、cおよびdのうちの1つは、NもしくはN<sup>+</sup>O<sup>-</sup>を表し、そして残りのa、b、  
cおよびd基は、CR<sup>1</sup>もしくはCR<sup>2</sup>を表すか；または

a、b、cおよびdの各々が独立して、CR<sup>1</sup>もしくはCR<sup>2</sup>から選択され；

Xは、任意の結合（点線で示される）が存在しない場合にはNもしくはCHを表し、そ  
して任意の結合が存在する場合にはCを表し；

炭素原子5と炭素原子6との間の点線は、任意の結合を表し、その結果、二重結合が存  
在する場合には、AおよびBは独立して、-R<sup>15</sup>、ハロ、-OR<sup>16</sup>、-OC(=O)R<sup>16</sup>、も  
しくは-OC(=O)R<sup>15</sup>を表し、そして二重結合が炭素原子5と炭素原子6との間に存  
在しない場合には、AおよびBは各々独立して、H<sub>2</sub>、-(OR<sup>16</sup>)<sub>2</sub>、Hおよびハロ、ジハ  
ロ、アルキルおよびH、(アルキル)<sub>2</sub>、-Hおよび-OC(=O)R<sup>15</sup>、Hおよび-OR<sup>1</sup>  
<sup>5</sup>、=O、アリールおよびH、=NOR<sup>15</sup>、もしくは-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-を表し、こ  
こでpは2、3、もしくは4であり；

各R<sup>1</sup>および各R<sup>2</sup>は、独立して、H、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OR<sup>15</sup>、-COR<sup>15</sup>、-SR<sup>1</sup>  
<sup>5</sup>、-S(=O)<sub>t</sub>R<sup>16</sup>（ここでtは0、1、もしくは2である）、-N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、  
-OC(=O)R<sup>15</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>、-OC(=O)R<sup>16</sup>、-CN、-NR<sup>15</sup>COOR<sup>16</sup>、-S  
R<sup>16</sup>C(=O)OR<sup>16</sup>、-SR<sup>16</sup>N(R<sup>17</sup>)<sub>2</sub>（ただし、-SR<sup>16</sup>N(R<sup>17</sup>)<sub>2</sub>のR<sup>16</sup>は-C  
H<sub>2</sub>-ではない）から選択され、ここで各R<sup>17</sup>は独立して、Hまたは-C(=O)OR<sup>16</sup>、  
ベンゾトリニアゾール-1-イルオキシ、テトラゾール-5-イルチオ、または置換テトラ  
ゾール-5-イルチオ、アルキニル、アルケニルまたはアルキルから選択され、該アルキ  
ルまたはアルケニル基は、必要に応じて、ハロ、-OR<sup>15</sup>、もしくは-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>で置換  
され；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、同一であるかまたは異なり、そして各々独立して、H、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>  
の任意の置換基を表すか、またはR<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が一緒になって、ベンゼン環（環I II）  
への飽和もしくは不飽和のC<sub>5</sub>～C<sub>7</sub>の縮環を表し；

$R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ は、各々独立して、H、-CF<sub>3</sub>、-COR<sup>15</sup>、アルキルもしくはアリールを表し、該アルキルもしくはアリールは、必要に応じて、-OR<sup>15</sup>、-SR<sup>15</sup>、-S(O)<sub>t</sub>R<sup>16</sup>、-NR<sup>15</sup>COOR<sup>16</sup>、-N(R<sup>15</sup>)<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-COR<sup>15</sup>、-OCOR<sup>15</sup>、-OCO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>、-OPPO<sub>3</sub>R<sup>15</sup>で置換されるか、または $R^5$ は $R^6$ と一緒にになって、=Oもしくは=Sを表し；

$R^8$ は、H、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、置換アルキル、置換アリール、置換アリールアルキル、置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリールアルキル、置換シクロアルキル、置換シクロアルキルアルキルから選択され；

$R^8$ の置換基は、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>18</sup>、シクロアルキルアルキル、ハロ、CN、-C(O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、もしくは-CO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>から選択される置換基であり；ただし、-OR<sup>18</sup>および-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>置換基は、-C(O)NR<sup>8</sup>-部分のNに結合する炭素には結合せず；

各 $R^{18}$ は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、もしくはシクロアルキルから選択され；

$R^9$ および $R^{10}$ は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、もしくは-CO<sub>2</sub>(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>（ここで $R^{18}$ は上に定義したとおりである）から選択され；そして該置換可能な $R^9$ および $R^{10}$ 基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

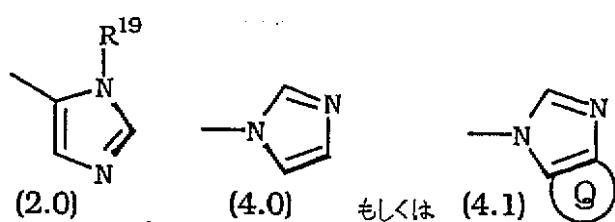
$R^9$ および $R^{10}$ は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル環を形成し；

$R^{11}$ および $R^{12}$ は独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、-CO<sub>2</sub>(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-OR<sup>18</sup>、もしくは-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>から選択され；ここで、 $R^{18}$ は上に定義したとおりであり；ただし、-OR<sup>18</sup>および-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>基は、窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；そしてここで、該置換可能な $R^{11}$ および $R^{12}$ 基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

$R^{11}$ および $R^{12}$ は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル環を形成し；

$R^{13}$ は、以下：

#### 【化10】



から選択されるイミダゾリル環であり、

ここで、 $R^{19}$ は、(1)H、(2)アルキル、(3)アルキル、(4)アリール、(5)アリールアルキル、(6)置換アリールアルキル（ここで置換基はハロもしくはCNから選択される）、(7)-C(アリール)<sub>3</sub>、または(8)シクロアルキルから選択され；

該イミダゾリル環2.0は、必要に応じて、1つまたは2つの置換基で置換され、そして該イミダゾール環4.0は、必要に応じて、1～3個の置換基で置換され、そして該イミダゾール環4.1は、必要に応じて、1つの置換基で置換され、ここで環2.0、4.0、および4.1についての該任意の置換基は、独立して、-NHCO(O)R<sup>18</sup>、-C

$(R^{34})_2OR^{35}$ 、 $-OR^{18}$ 、 $-SR^{18}$ 、F、Cl、Br、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、もしくは $-N(R^{18})_2$ から選択され；ここで、 $R^{18}$ は上に定義したとおりであり；ここで、各 $R^{34}$ は独立して、Hもしくはアルキルから選択され；ここで、 $R^{35}$ は、H、 $-C(O)OR^{20}$ 、もしくは $-C(O)NHR^{20}$ から選択され、 $R^{20}$ は以下で定義され；Qは、アリール環、シクロアルキル環、もしくはヘテロアリール環を表し、該Qは、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、 $-OR^{18}$ 、 $-N(R^{18})_2$ （ここで各 $R^{18}$ は独立して選択される）、 $-OC(O)R^{18}$ 、もしくは $-C(O)N(R^{18})_2$ （ここで各 $R^{18}$ は独立して選択される）から独立して選択される1～4個の置換基で置換され、そしてここで、 $R^{18}$ は上で定義した通りであり；

$R^{15}$ は、H、アルキル、アリール、もしくはアリールアルキルから選択され；

$R^{16}$ は、アルキルもしくはアリールから選択され；

$R^{20}$ は、アルキル、アルコキシ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、もしくはヘテロシクロアルキルから選択され；

該 $R^{20}$ 基は、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、 $-OC(O)R^{18}$ 、 $-OR^{18}$ 、もしくは $-N(R^{18})_2$ から選択される1つ以上の置換基で置換され、ここで各 $R^{18}$ は同一であるかまたは異なり、そしてここで、 $R^{18}$ は上で定義した通りであり、ただし、該任意の置換基は、酸素または窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；

nは0～5であり；

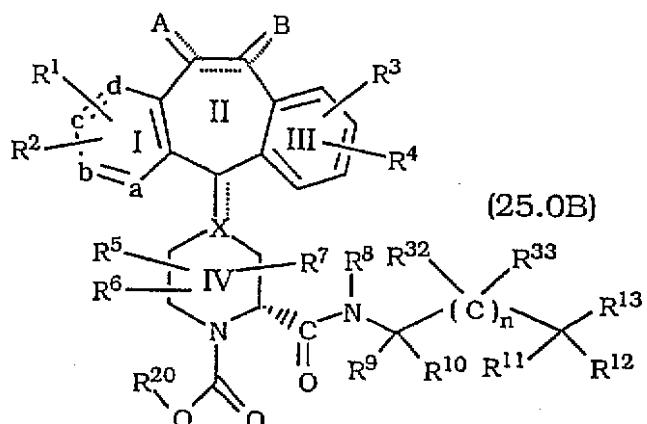
各 $R^{32}$ および $R^{33}$ は、各nに対して独立して、H、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、 $-CON(R^{18})_2$ 、 $-OR^{18}$ 、もしくは $-N(R^{18})_2$ から選択され；ここで、 $R^{18}$ は上で定義した通りであり、そしてここで、該置換可能な $R^{32}$ および $R^{33}$ 基は、必要に応じて、アルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されるか；または

$R^{32}$ および $R^{33}$ は、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル環を形成し；そして

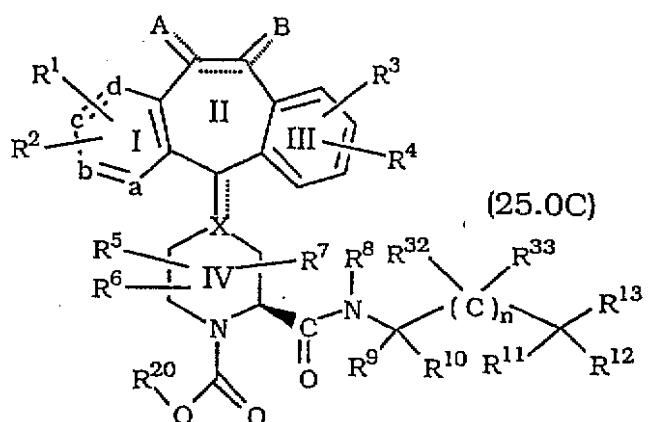
ただし：XがNであり、そして $R^8$ がHである場合には、 $R^{13}$ とアミド部分との間のアルキル鎖が置換される、化合物。

【請求項10】 以下の構造：

【化11】



または



を有する、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 1\_1】 請求項 1\_0 に記載の化合物 25.0B であって、ここで、R<sup>8</sup> が H であり、そしてアミド置換基 - C(O)NR<sup>8</sup> と R<sup>13</sup> との間のアルキル鎖が置換される、化合物。

【請求項 1\_2】 請求項 1\_0 に記載の化合物 25.0B であって、ここで：

(a) R<sup>1</sup> ~ R<sup>4</sup> は独立して、H、Br、もしくは Cl から選択され；

(b) R<sup>5</sup> ~ R<sup>7</sup> は、H であり；

(c) (1) a、b、c、および d は、炭素であり、そして R<sup>20</sup> は、アルキル、アルコキシ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、もしくはヘテロシクロアルキルから選択され；該 R<sup>20</sup> 基は、必要に応じて、ハロ、アルキル、アリール、-OC(O)R<sup>18</sup>、-OR<sup>18</sup>、もしくは -N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub> から選択される 1 つ以上の置換基で置換され、ここで各 R<sup>18</sup> 基は同一であるかまたは異なり、そしてここで、R<sup>18</sup> は上で定義した通りであり、ただし、該任意の置換基は、酸素または窒素原子に隣接する炭素原子には結合せず；または

(2) a が N であり、そして残りの b、c、および d 置換基が炭素であり、そして R<sup>20</sup> が、アルキル、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ハロで置換されたアリール、シクロアルキル、アルキルで置換されたシクロアルキル、もしくは -OH で置換されたシクロアルキルから選択され、ただし、該 -OH 置換基は、酸素原子に隣接する炭素には結合せず；

(d) A および B が H<sub>2</sub> であり；

(e) n が 0 もしくは 1 であり；

(f) R<sup>13</sup> が、基 2.0 もしくは 4.0 であり；

(g) R<sup>8</sup> が、アリールアルキル、置換アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、もしくは置換ヘテロアリールアルキルから選択され；

( h ) X が C H もしくは N であり；

( i ) R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> が独立して、H、アルキル、-C(O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、もしくはアリールアルキルから選択され；

( j ) R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> が独立して、H、アルキル、置換アリール、-OR<sup>18</sup> から選択されるか、または R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> が、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロアルキル環を形成し；

( k ) R<sup>32</sup> および R<sup>33</sup> が独立して、H、-OR<sup>18</sup>、アリールアルキルもしくはアリールから選択され；

( l ) R<sup>19</sup> が、-C(O)N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、アルキル、アリールアルキル、もしくは -C(アリール)<sub>3</sub> から選択され；そして

( m ) 該任意の R<sup>13</sup> の置換基が、-N(R<sup>18</sup>)<sub>2</sub>、-NHCO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>、-C(R<sup>34</sup>)<sub>2</sub>OR<sup>35</sup>、もしくはアルキルから選択される、化合物。

【請求項 1\_3】 請求項 1\_2 に記載の化合物であって、ここで、a が N であり、そして残りの b、c、および d 置換基が炭素であり：

( a ) R<sup>8</sup> は、アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、もしくはヘテロアリールアルキルから選択され；

( b ) R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は独立して、H もしくはベンジルから選択され；

( c ) R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> は独立して、H、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、ベンジル、エチル、p-クロロフェニル、-OH から選択されるか、または R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> が、これらが結合する炭素原子と一緒にになって、シクロプロピル環を形成し；

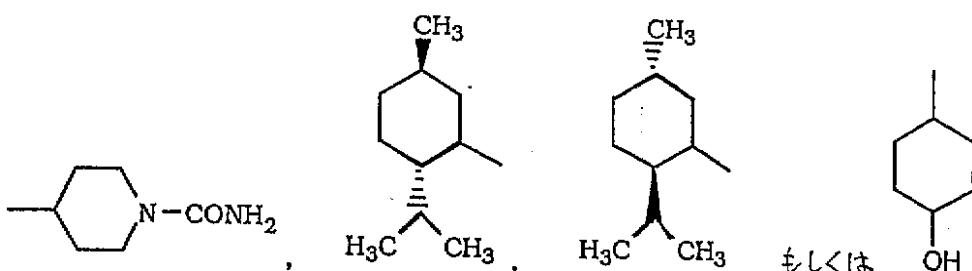
( d ) R<sup>32</sup> および R<sup>33</sup> が独立して、H、フェニル、-OH、もしくはベンジルから選択され；

( e ) R<sup>19</sup> は、-C(O)NH-シクロヘキシリル、-C(フェニル)<sub>3</sub>、H、メチルもしくはエチルから選択され；

( f ) 該任意の R<sup>13</sup> の置換基は、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>OOC(O)O-シクロヘキシリル、-CH<sub>2</sub>OOC(O)O-シクロペンチル、エチル、イソプロピル、NH<sub>2</sub>、もしくは-NHC(O)CF<sub>3</sub> から選択され；そして

( g ) R<sup>20</sup> は、t-ブチル、エチル、ベンジル、-CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、n-ブチル、n-ヘキシリル、n-オクチル、p-クロロフェニル、シクロヘキシリル、シクロペンチル、

### 【化 1\_2】



から選択される、化合物。

【請求項 1\_4】 請求項 1\_3 に記載の化合物であって、ここで：

( a ) R<sup>8</sup> が、ベンジルもしくは -CH<sub>2</sub>-シクロプロピルから選択され；そして

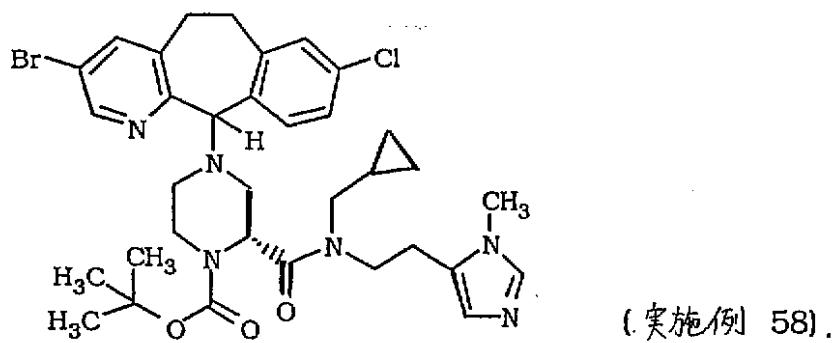
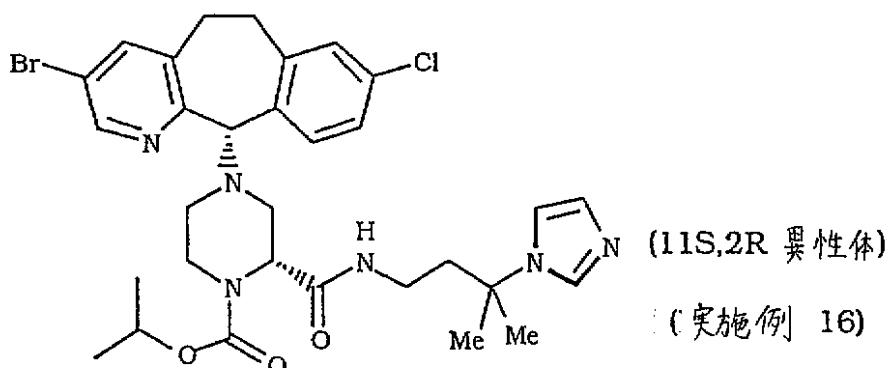
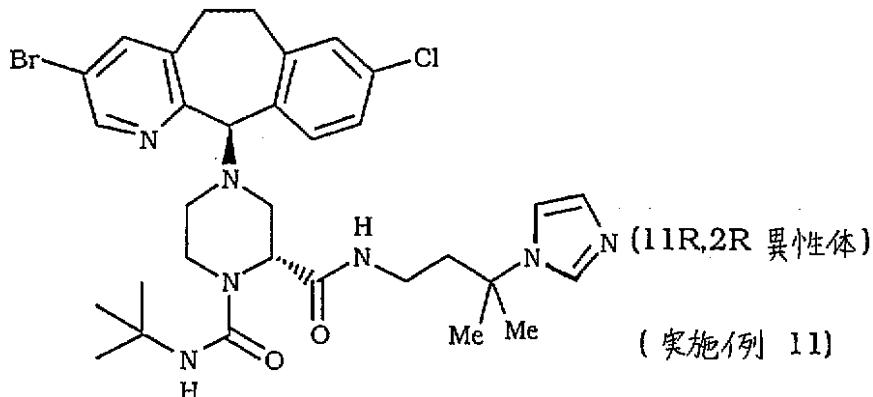
( b ) R<sup>20</sup> がシクロヘキシリルである、化合物。

【請求項 1\_5】 (1) 3-Br-8-C<sub>1</sub>-化合物、8-C<sub>1</sub>-化合物、もしくは 10-C<sub>1</sub>-化合物；または (2) 3-Br-8-C<sub>1</sub>-化合物、8-C<sub>1</sub>-化合物、も

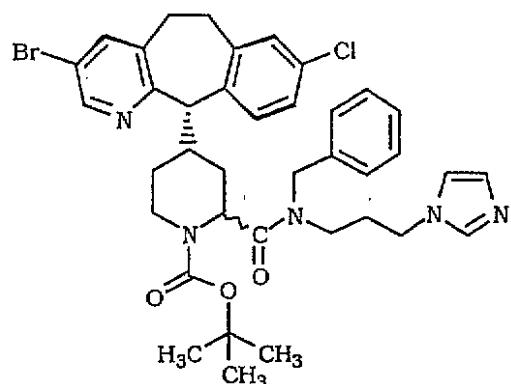
しくは 10-C1-化合物である、請求項14に記載の化合物であって、ここで R<sup>9</sup>、R<sup>1</sup>  
0、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>32</sup>、およびR<sup>33</sup>がHである、化合物。

【請求項16】 以下：

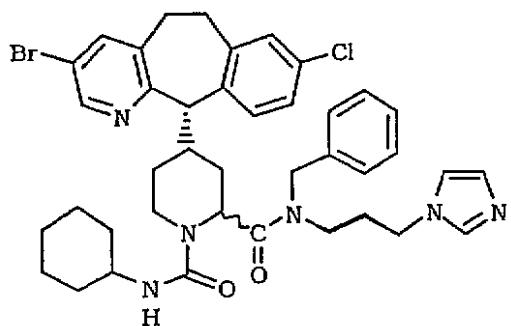
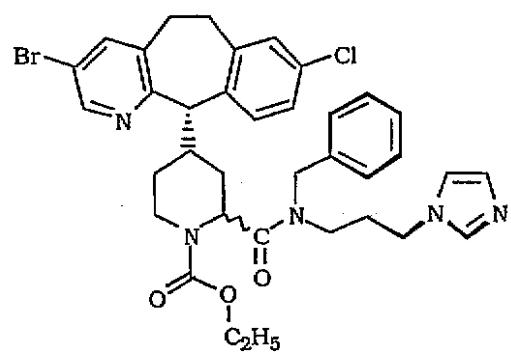
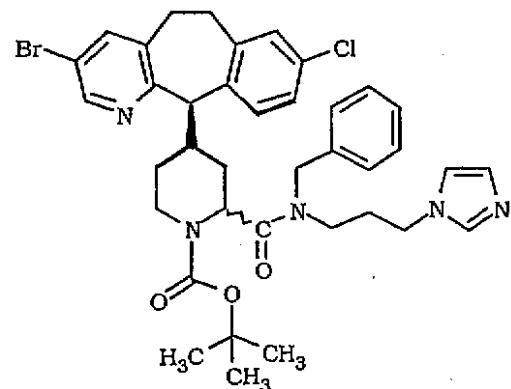
【化14】



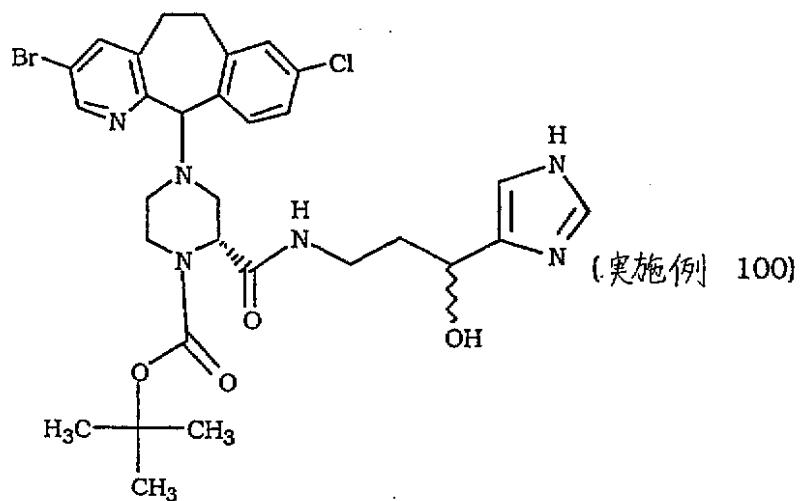
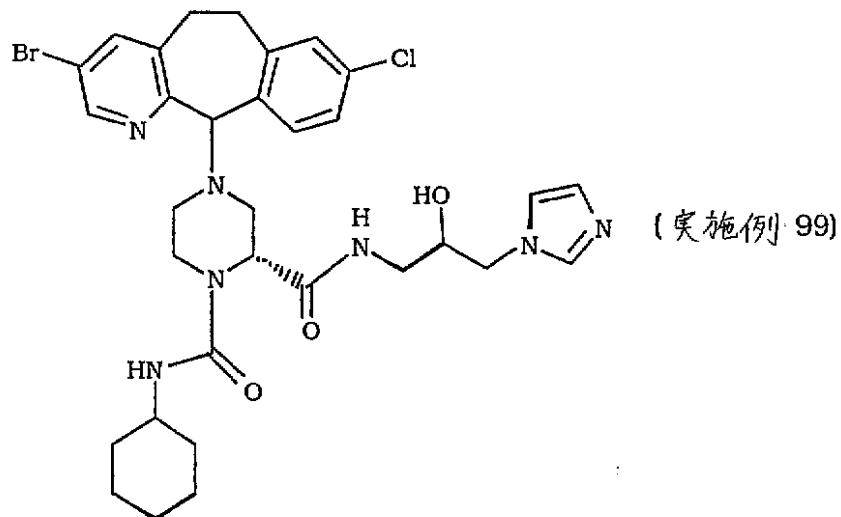
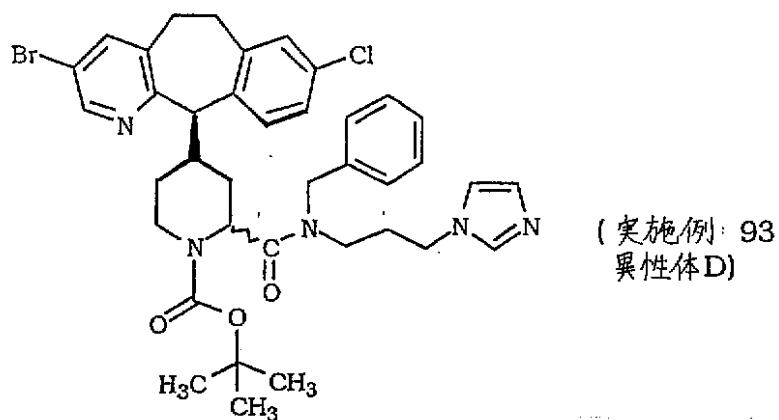
[化14]の続き



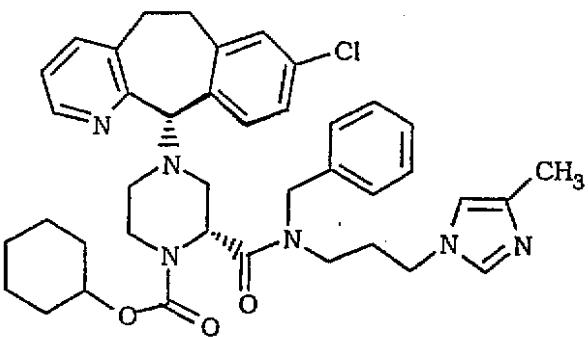
(実施例 78 工程 B)

(実施例 79  
異性体A)(実施例 80  
異性体A)(実施例 88  
異性体A)

[化 14] の続き

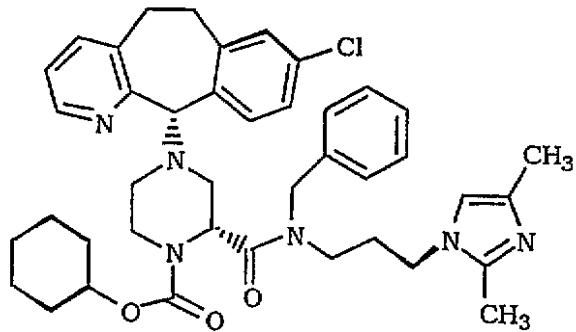


[化14] の続き



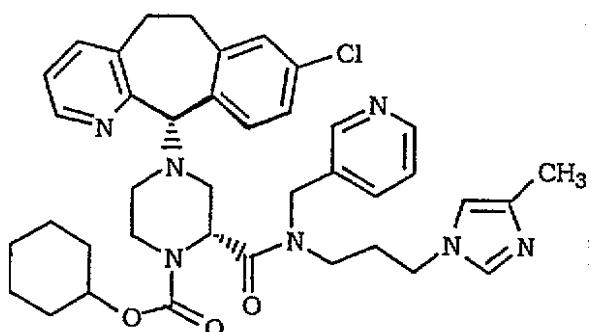
(実施例) 225

;



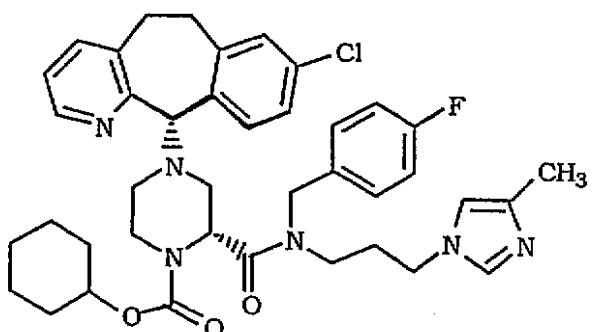
(実施例) 226

;



(実施例) 227

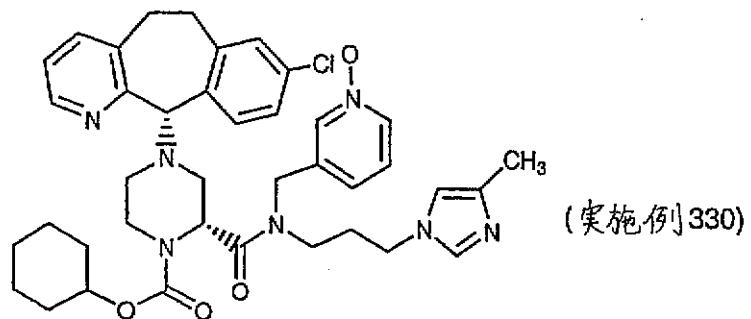
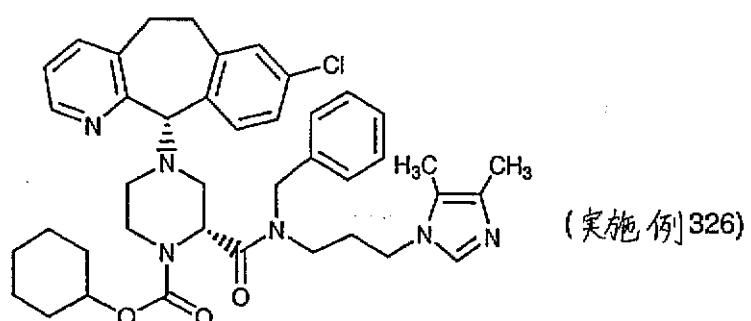
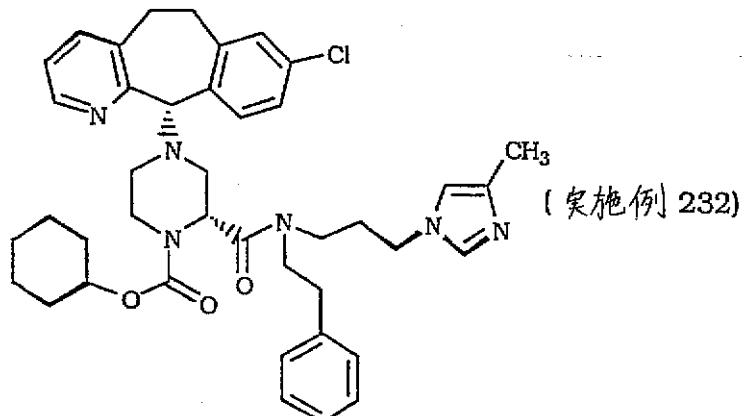
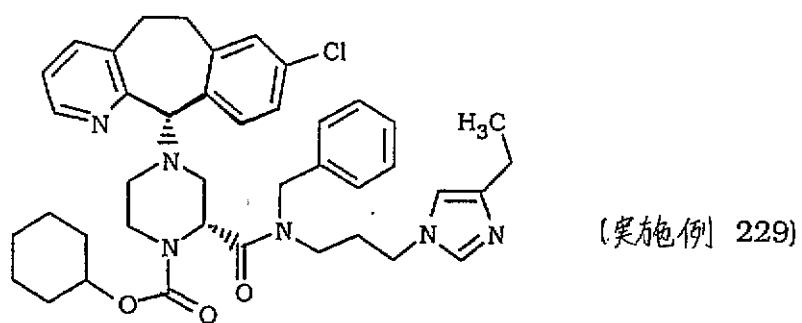
;



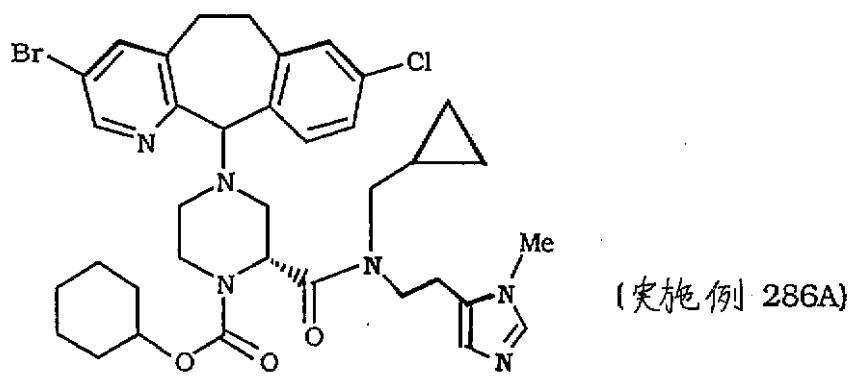
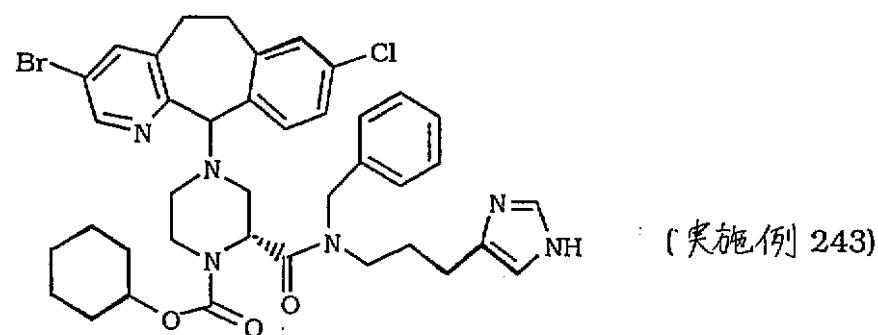
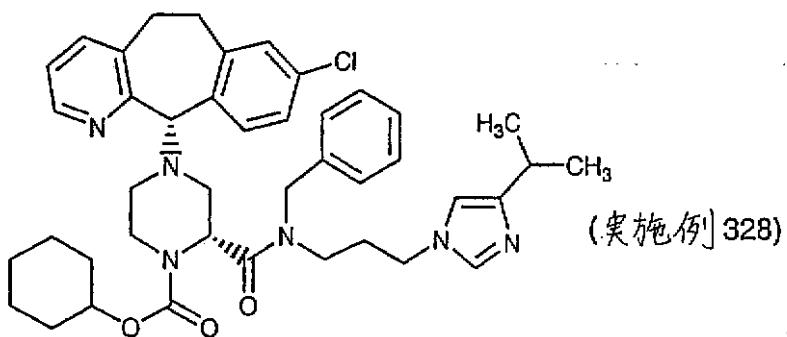
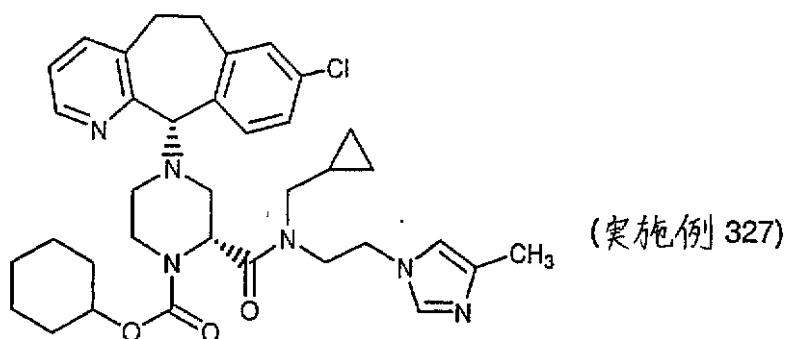
(実施例) 228

;

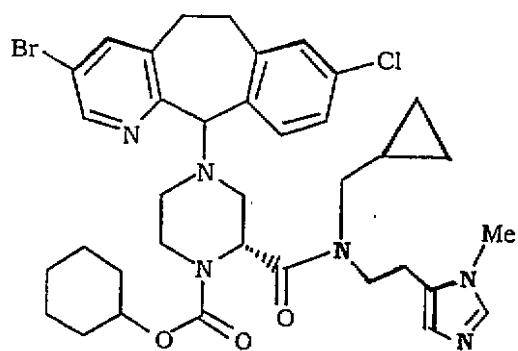
[化14] の続き



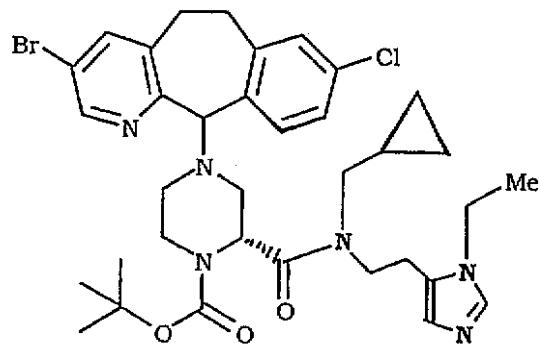
[化14]の続き



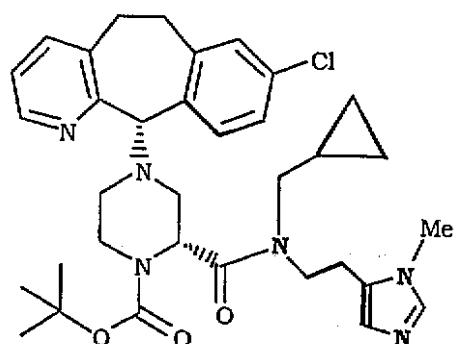
[化14]の続き



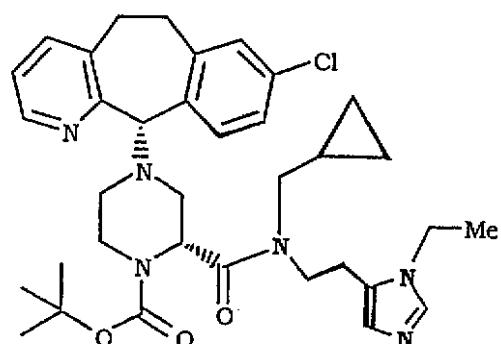
(実施例 286B)



(実施例 304)



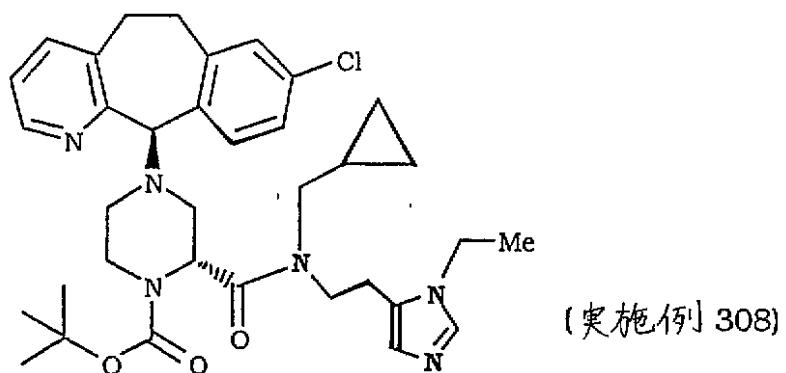
(実施例 306)



(実施例 307)

; または

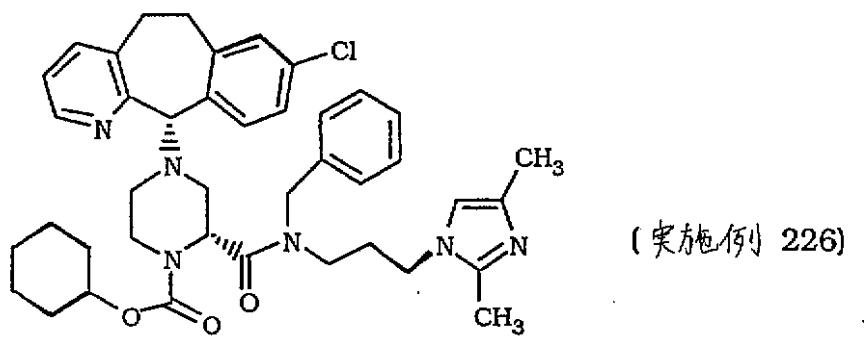
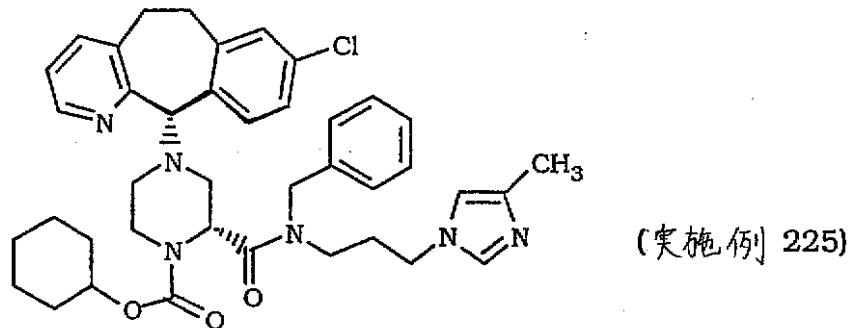
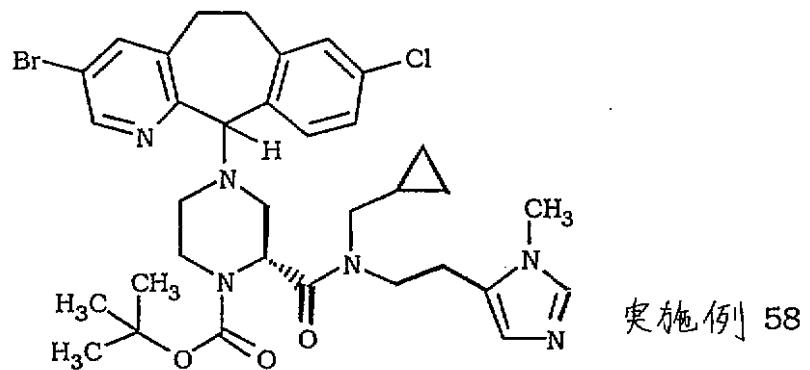
[化 14]の続き



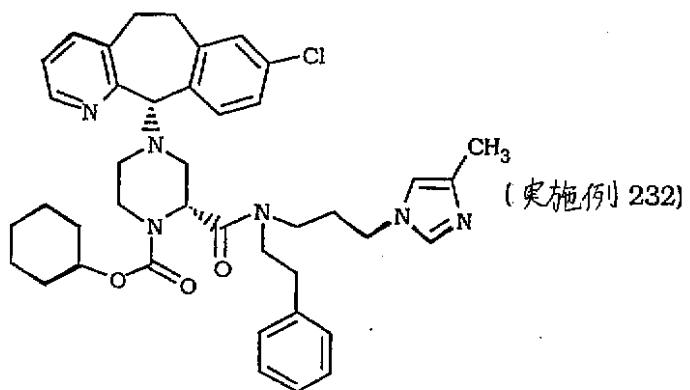
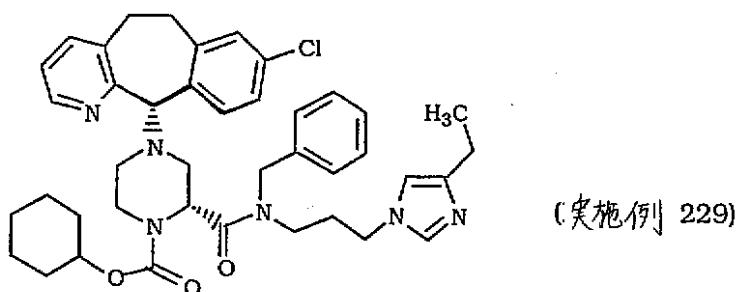
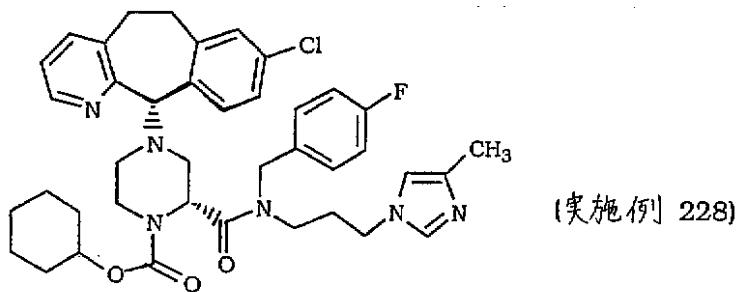
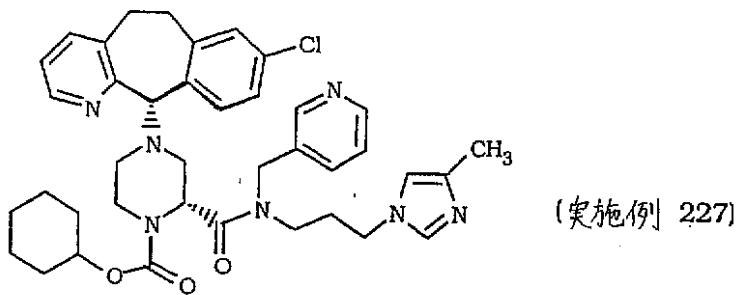
から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1\_7】 以下：

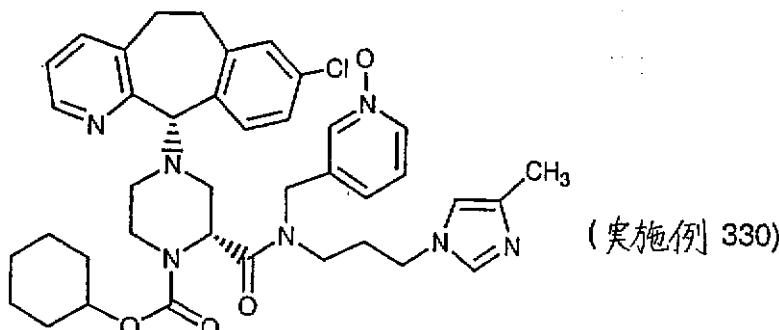
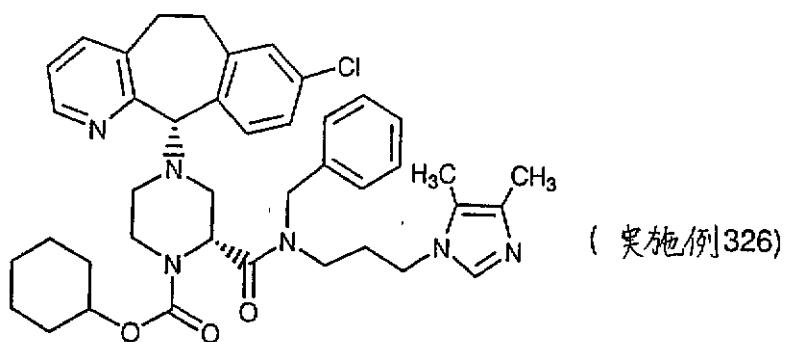
【化 15】



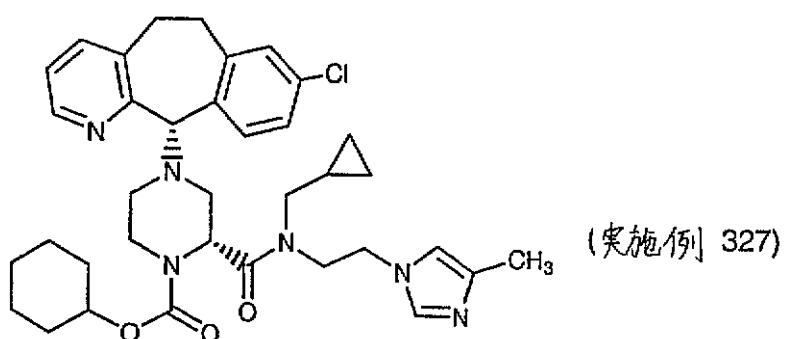
[化15]の続き



【化15】の続き



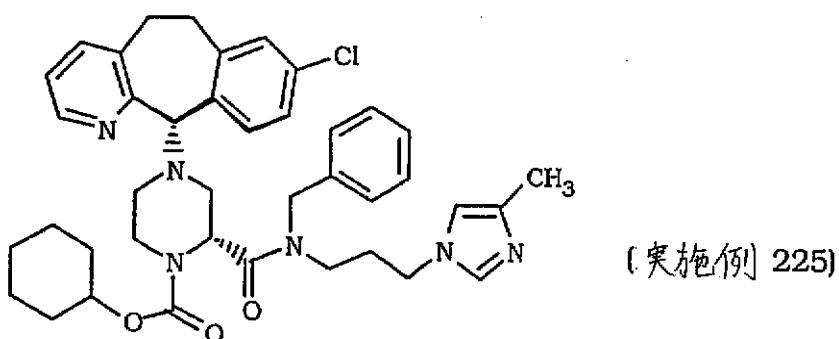
; または



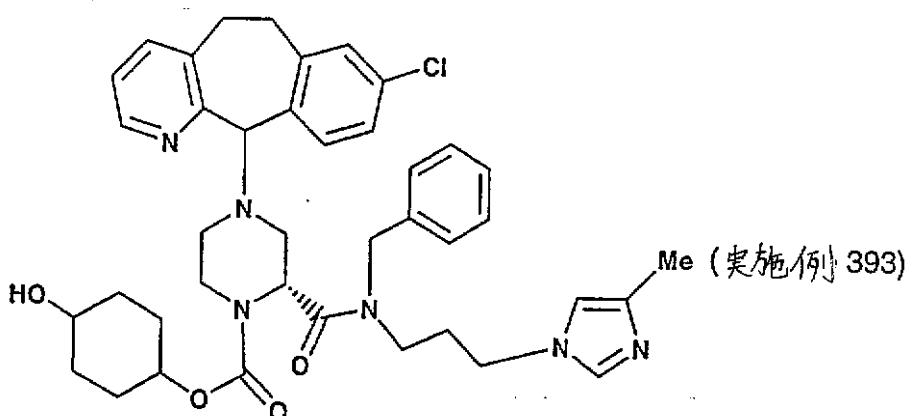
から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1\_8】 以下の式：

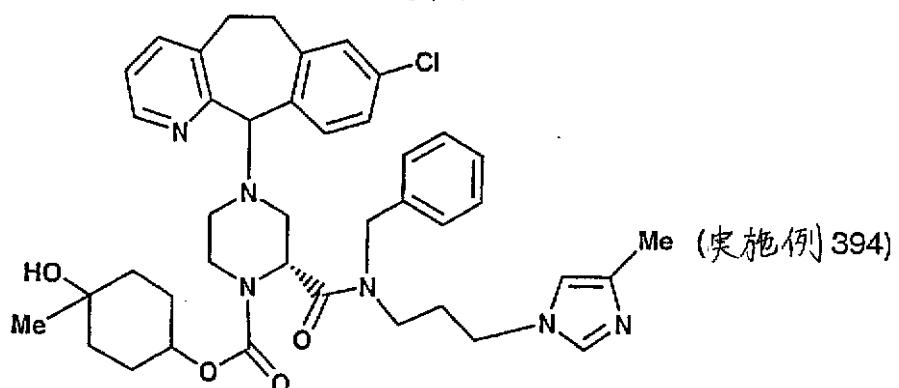
【化 1\_6】



【化 1\_7】



または



の化合物。

**【請求項 1\_9】** 実施例 1 ~ 22、25、45 ~ 66、77、78 工程 B、79、80、82 ~ 85、86、86A、87 ~ 97、99、100、102、112 ~ 208、208A、209、209A、210、210A、210B、211 ~ 220、220A、221 ~ 232、234B、234C、234E、235 ~ 254、286A、286B、304 ~ 308、310 ~ 342、343 ~ 366、367 ~ 373、または 375 ~ 382 の化合物から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 2\_0】** 実施例 26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、81、98、101、103、104、105、106、107、108、110、111、255、256、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、279、280、281、282、283、284、285、286、287、289、290、291、292、293、294、295、296、297、299、300、301、302、303 または 309 の化合物から選択される、化合物。

**【請求項 2\_1】** 請求項 1 ~ 20 のいずれかに記載の化合物を含む、腫瘍細胞を処置するための組成物であって、ここで、Ras タンパク質が、Ras 遺伝子以外の遺伝子における腫瘍形成変異の結果として活性化され、該腫瘍細胞が、膵臓腫瘍細胞、肺癌細胞、骨髄性白血病腫瘍細胞、甲状腺小胞腫瘍細胞、脊髄形成異常腫瘍細胞、表皮癌腫瘍細胞、膀胱癌腫瘍細胞、結腸腫瘍細胞、黒色腫、乳房腫瘍細胞および前立腺腫瘍細胞である、組成物。

**【請求項 2\_2】** ファルネシルタンパク質トランスフェラーゼを阻害するための薬学的組成物であって、請求項 1 ~ 20 のいずれかに記載の化合物を、薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて含有する、薬学的組成物。

**【請求項 2\_3】** ファルネシルタンパク質トランスフェラーゼを阻害するための医薬

の製造のための、請求項 1 ~ 20 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 2\_4】 脾臓腫瘍細胞、肺癌細胞、骨髓性白血病腫瘍細胞、甲状腺小胞腫瘍細胞、脊髄形成異常腫瘍細胞、表皮癌腫瘍細胞、膀胱癌腫瘍細胞、結腸腫瘍細胞、黒色腫、乳房腫瘍細胞および前立腺腫瘍細胞を処置するための医薬を製造するための、請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 2\_5】 ファルネシリタンパク質トランスフェラーゼを阻害するための、請求項 1 ~ 20 のいずれかに記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 2\_6】 脾臓腫瘍細胞、肺癌細胞、骨髓性白血病腫瘍細胞、甲状腺小胞腫瘍細胞、脊髄形成異常腫瘍細胞、表皮癌腫瘍細胞、膀胱癌腫瘍細胞、結腸腫瘍細胞、黒色腫、乳房腫瘍細胞および前立腺腫瘍細胞を処置するための、請求項 1 ~ 20 のいずれかに記載の化合物を含む、組成物。