

【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9月20日(2007.9.20)

【公表番号】特表2004-502664(P2004-502664A)

【公表日】平成16年1月29日(2004.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2004-004

【出願番号】特願2002-507762(P2002-507762)

【国際特許分類】

C 0 7 C 233/78 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 31/336 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 303/36 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 233/78

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 31/336

A 6 1 P 7/04

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 303/36

【手続補正書】

【提出日】平成19年7月27日(2007.7.27)

【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

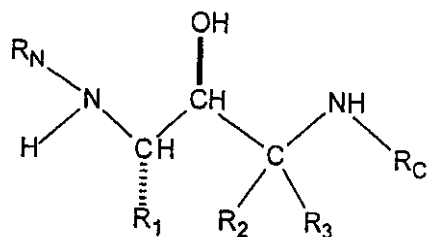
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式(X)で表わされる置換アミン化合物またはその医薬として許

容される塩：



式中、

R_1 は、下記基である：

(I) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 C_1-C_7 アルキル（この基は C_1-C_3 アルキルおよび C_1-C_3 アルコキシにより置換されていてもよい）、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）および $-OC(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(II) $-CH_2-S(O)_{0-2}-(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、

(III) $-CH_2-CH_2-S(O)_{0-2}-(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、

(IV) 1個または2個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(V) 1個または2個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(VI)

$-(CH_2)_{n1}-(R_{1-アリール})$ 基、

この基において、 $n1$ は0または1であり、

$R_{1-アリール}$

はフェニル、1-ナフチル、2-ナフチルおよびインダニル、インデニル、ジヒドロナフタイル、またはテトラニルであり、この基は、そのアリール環に1個、2個、3個または4個の下記置換基を有していてもよい：

(A) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(B) 1個または2個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(C) 1個または2個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコ

キシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(D) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ 、

(E) $-C_1-C_6$ アルコキシ基、この基は1個、2個または3個の $-F$ により置換されていてもよい、

(F) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ （ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は下記に定義されているとおりである）、

(G) $-OH$ 、

(H) $-C \equiv N$ 、

(I) C_3-C_7 シクロアルキル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(J) $-CO-(C_1-C_4\text{アルキル})$ 、

(K) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(L) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(M) $-SO_2-(C_1-C_4\text{アルキル})$ 、

(VII)

$-(CH_2)_{n1}-(R_{1-\text{ヘテロアリール}})$

（ここで、 $n1$ は上記定義のとおりであり、および

$R_{1-\text{ヘテロアリール}}$

は、下記群から選択される：

ピリジニル

ピリミジニル、

キノリニル、

ベンゾチエニル、

インドリル、

インドリニル、

ピリダジニル、

ピラジニル、

イソインドリル、

イソキノリル、

キナゾリニル、

キノキサリニル、

フタラジニル、

イミダゾリル、

イソオキサゾリル、

ピラゾリル、

オキサゾリル、

チアゾリル、

インドリジニル、

インダゾリル、

ベンゾチアゾリル、
ベンズイミダゾリル、
ベンゾフラニル、
フラニル、
チエニル、
ピロリル、
オキサジアゾリル、
チアジアゾリル、
トリアゾリル、
テトラゾリル、
オキサゾロピリジニル、
イミダゾピリジニル、
イソチアゾリル、
ナフチリジニル、
シンノリニル、
カルバゾリル、
ベーターカルボリニル、
イソクロマニル、
クロマニル、
テトラヒドロイソキノリニル、
イソインドリニル、
イソベンゾテトラヒドロフラニル、
イソベンゾテトラヒドロチエニル、
イソベンゾチエニル、
ベンゾキサゾリル、
ピリドピリジニル、
ベンゾテトラヒドロフラニル、
ベンゾテトラヒドロチエニル、
プリニル、
ベンゾジオキサソリル、
トリアジニル、
フェノキサジニル、
フェノチアジニル、
プテリジニル、
ベンゾチアゾリル、
イミダゾピリジニル、
イミダゾチアゾリル、
ジヒドロベンズイソキサジニル、
ベンズイソキサジニル、
ベンゾキサジニル、
ジヒドロベンズイソチアジニル、
ベンゾピラニル、
ベンゾチオピラニル、
クマリニル、
イソクマリニル、
クロモニル、
クロマノニル、
ピリジニル-N-オキシド、
テトラヒドロキノリニル、
ジヒドロキノリニル、

ジヒドロキノリノニル、
 ジヒドロイソキノリノニル、
 ジヒドロクマリニル、
 ジヒドロイソクマリニル、
 イソインドリノニル、
 ベンゾジオキサニル、
 ベンゾキサゾリノニル、
 ピロリルN-オキシド、
 ピリミジニルN-オキシド、
 ピリダジニルN-オキシド、
 ピラジニルN-オキシド、
 キノリニルN-オキシド、
 インドリルN-オキシド、
 インドリニルN-オキシド、
 イソキノリルN-オキシド、
 キナゾリニルN-オキシド、
 キノキサリニルN-オキシド、
 フタラジニルN-オキシド、
 イミダゾリルN-オキシド、
 イソキサゾリルN-オキシド、
 オキサゾリルN-オキシド、
 チアゾリルN-オキシド、
 インドリジニルN-オキシド、
 インダゾリルN-オキシド、
 ベンゾチアゾリルN-オキシド、
 ベンズイミダゾリルN-オキシド、
 ピロリルN-オキシド、
 オキサジアゾリルN-オキシド、
 チアジアゾリルN-オキシド、
 チアゾリルN-オキシド、
 テトラゾリルN-オキシド、
 ベンゾチオピラニルS-オキシド、および
 ベンゾチオピラニルS、S-ジオキシド、

および

R_1 -ヘテロアリアル

は、水素原子およびその結合の代わりに

R_1 -ヘテロアリアル

への新しい結合が存在するように、水素により置換されている元の

R_N -ヘテロアリアル基

基の環原子いずれかによって $-(CH_2)_{n1}$ に結合しており、ここで上記ヘテロアリアルは、1個、2個、3個または4個の下記基により置換されていてもよい：

(1) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(2) 1個または2個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(3) 1個または2個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ 、

(5) $-C_1-C_6$ アルコキシ基、この基は1個、2個または3個の $-F$ により置換されていてもよい、

(6) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ （ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は下記に定義されているとおりである）、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C\equiv N$ 、

(9) C_3-C_7 シクロアルキル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(10) $-CO-(C_1-C_4$ アルキル)、

(11) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(12) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(13) $-SO_2-(C_1-C_4$ アルキル)、

ただし、 n_1 が0である場合、

R_{1-} ヘテロアリール

は窒素原子により炭素鎖に結合することはない、

(VII)

$-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-}$ ヘテロ環)、

ここで n_1 は上記定義のとおりであり、および

R_{1-} ヘテロ環

は下記群から選択される：

モルホリニル、

チオモルホリニル、

チオモルホリニル S -オキシド、

チオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、

ピペラジニル、
 ホモピペラジニル、
 ピロリジニル、
 ピロリニル、
 テトラヒドロピラニル、
 ピペリジニル、
 テトラヒドロフラニル、
 テトラヒドロチエニル、
 ホモピペリジニル、
 ホモモルホリニル、
 ホモチオモルホリニル、
 ホモチオモルホリニル S, S-ジオキシド、
 オキサゾジノニル、
 ジヒドロピラゾリル、
 ジヒドロピロリル、
 ジヒドロピラジニル、
 ジヒドロピリジニル、
 ジヒドロピリミジニル、
 ジヒドロフリル、
 ジヒドロピラニル、
 テトラヒドロチエニル S-オキシド、
 テトラヒドロチエニル S, S-ジオキシド、および
 ホモチオモルホリニル S-オキシド、

ここで、

$R_{1-\text{ヘテロ環基}}$

は、水素原子およびその結合の代わりに

$R_{1-\text{ヘテロ環}}$

への新しい結合が存在するように、水素により置換されている元の

$R_{1-\text{ヘテロ環基}}$

の環原子いずれかによって結合されており、ここで上記ヘテロ環は、1個、2個、3個または4個の下記基により置換されていてもよい：

(1) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(2) 1個または2個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(3) 1個または2個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 ア

ルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ 、

(5) $-C_1-C_6$ アルコキシ基、この基は1個、2個または3個の $-F$ により置換されていてもよい、

(6) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ （ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は下記に定義されているとおりである）、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C \equiv N$ 、

(9) C_3-C_7 シクロアルキル基、この基は1個、2個または3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(10) $-CO-(C_1-C_4\text{アルキル})$ 、

(11) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(12) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）、

(13) $-SO_2-(C_1-C_4\text{アルキル})$ 、

(14) $=O$ 、

ただし、 n_1 が0である場合、

R_{1-} ヘテロ環

は窒素原子により炭素鎖に結合することはない；

R_2 は、下記基である：

(I) $-H$ 、または

(II) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよく、

R_3 は、下記基である：

(I) $-H$ 、または

(II) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい；および

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒に3個、4個、5個、6個または7個の炭素原子を有する炭素環を形成しており、この環中に存在する1個の炭素原子は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ および $-NR_{N-2}-$ （ここで、 R_{N-2} は以下に定義されているとおりである）からなる群から選択されるヘテロ原子によって置き換えられていてもよい；

R_N は、下記基である：

(I) $R_{N-1}-X_N-$ 、ここで X_N は下記群から選択される：

(A) $-CO-$ 、および

(B) $-SO_2-$ 、

および R_{N-1} は下記群から選択される：

(A)

$R_{N-アリール}$

ここで

$R_{N-アリール}$

はフェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、テトラリニル、インダニル、ジヒドロナフチルまたは6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ [a] シクロヘプテニルであり、この基は1個、2個または3個の同一または相違していてもよい下記群から選択される基により置換されていてもよい：

(1) C_1-C_6 アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は $-H$ または C_1-C_6 アルキルである）、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ （ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は同一または相違していてもよく、下記群から選択される：

(a) $-H$ 、

(b) $-C_1-C_6$ アルキル基、この基は1個の下記群から選択される置換基により置換されていてもよい：

(i) $-OH$ 、および

(ii) $-NH_2$ 、

(c) $-C_1-C_6$ アルキル基、この基は1～3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ により置換されていてもよい、

(d) $-C_3-C_7$ シクロアルキル、

(e) $-(C_1-C_2アルキル)-(C_3-C_7シクロアルキル)$ 、

(f) $-(C_1-C_6アルキル)-O-(C_1-C_3アルキル)$ 、

(g) 1個または2個の二重結合を有する $-C_2-C_6$ アルケニル、

(h) 1個または2個の三重結合を有する $-C_2-C_6$ アルキニル、

(i) 1個の二重結合および1個の三重結合を有する $-C_1-C_6$ アルキル鎖、

(j)

$-R_{1-アリール}$

ここで

$R_{1-アリール}$

は上記定義のとおりである、

(k)

— R_{1-} ヘテロアリール、

ここで

R_{1-} ヘテロアリール

は上記定義のとおりである、

(8) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_1 - C_{12}$ アルキル)、

(9) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_2 - C_{12}$ の1個、2個または3個の二重結合を有するアルケニル)、

(10) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_2 - C_{12}$ の1個、2個または3個の三重結合を有するアルキニル)、

(11) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_3 - C_7$ シクロアルキル)、

(12)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ アリール

(ここで、

R_{1-} アリール

は上記定義のとおりである)、

(13)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ ヘテロアリール

(ここで、

R_{1-} ヘテロアリール

は上記定義のとおりである)、

(14)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ ヘテロ環

(ここで、

R_{1-} ヘテロ環

は上記定義のとおりである)、

(15) — $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{N-4}$ (ここで、 R_{N-4} はメルホリニル、チオモ

ルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S, S-ジオキシド、ピロリニルおよびピロリジニルからなる群から選択され、これら各基は 1 個、2 個、3 個または 4 個の C_1-C_6 アルキルにより置換されていてもよい、

(16) $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{N-5}$ (ここで、 R_{N-5} は、下記群から選択される：

- (a) C_1-C_6 アルキル、
- (b)

$-(CH_2)_{0-2}-R_{1-アリール}$

(ここで、

$R_{1-アリール}$

は上記定義のとおりである)、

- (c) 1 個または 2 個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル、
- (d) 1 個または 2 個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル、
- (e) C_3-C_7 シクロアルキル、
- (f)

$-(CH_2)_{0-2}-R_{1-ヘテロアリール}$

(ここで、

$R_{1-ヘテロアリール}$

は上記定義のとおりである)、

(17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ (ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は上記定義のとおりである)、

(18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-N-(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

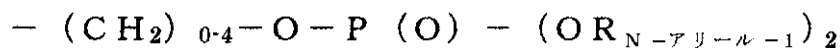
(24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-O-R_{N-2}$ (ここで、 R_{N-5} および R_{N-2} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ (ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

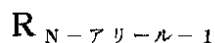
(26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$ (ここで、 R_{N-4} は上記定義のとおりである)、

(27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$

(28)



(ここで、



は-Hまたは C_1-C_4 アルキルである)、

(29) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{CO}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-5})_2$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ は上記定義のとおりである)、

(30) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{CS}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-5})_2$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ は上記定義のとおりである)、

(31) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{R}_{\text{N}-5})_2$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ は上記定義のとおりである)、

(32) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{R}_{\text{N}-5})_2-\text{COOH}$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ は上記定義のとおりである)、

(33) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{S}-(\text{R}_{\text{N}-5})_2$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ は上記定義のとおりである)、

(34) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6$ の1個、2個、3個、4個または5個の-Fにより置換されていてもよいアルキル)、

(35) C_3-C_7 シクロアルキル

(36) 1個または2個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は C_1-C_3 アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(37) 1個または2個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル基、この基は C_1-C_3 アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

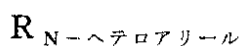
(38) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(-\text{H}$ または $\text{R}_{\text{N}-5})-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ (ここで、 $\text{R}_{\text{N}-5}$ および $\text{R}_{\text{N}-2}$ は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、または

(39) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{C}_3-\text{C}_7$ シクロアルキル;

(B)

$-\text{R}_{\text{N}-\text{ヘテロアリール}}$ 、

ここで、



は下記基からなる群から選択される:

ピリジニル

ピリミジニル、

キノリニル、

ベンゾチエニル、

インドリル、

インドリニル、
ピリダジニル、
ピラジニル、
イソインドリル、
イソキノリル、
キナゾリニル、
キノキサリニル、
フタラジニル、
イミダゾリル、
イソオキサゾリル、
ピラゾリル、
オキサゾリル、
チアゾリル、
インドリジニル、
インダゾリル、
ベンゾチアゾリル、
ベンズイミダゾリル、
ベンゾフラニル、
フラニル、
チエニル、
ピロリル、
オキサジアゾリル、
チアジアゾリル、
トリアゾリル、
テトラゾリル、
オキサゾロピリジニル、
イミダゾピリジニル、
イソチアゾリル、
ナフチリジニル、
シンノリニル、
カルバゾリル、
ペーターカルボリニル、
イソクロマニル、
クロマニル、
テトラヒドロイソキノリニル、
イソインドリニル、
イソベンゾテトラヒドロフラニル、
イソベンゾテトラヒドロチエニル、
イソベンゾチエニル、
ベンゾキサゾリル、
ピリドピリジニル、
ベンゾテトラヒドロフラニル、
ベンゾテトラヒドロチエニル、
プリニル、
ベンゾジオキサソリル、
トリアジニル、
フェノキサジニル、
フェノチアジニル、
プテリジニル、
ベンゾチアゾリル、

イミダゾピリジニル、
イミダゾチアゾリル、
ジヒドロベンズイソキサジニル、
ベンズイソキサジニル、
ベンゾキサジニル、
ジヒドロベンズイソチアジニル、
ベンゾピラニル、
ベンゾチオピラニル、
クマリニル、
イソクマリニル、
クロモニル、
クロマノニル、
ピリジニル-N-オキシド、
テトラヒドロキノリニル、
ジヒドロキノリニル、
ジヒドロキノリノニル、
ジヒドロイソキノリノニル、
ジヒドロクマリニル、
ジヒドロイソクマリニル、
イソインドリノニル、
ベンゾジオキサニル、
ベンゾキサゾリノニル、
ピロリル-N-オキシド、
ピリミジニルN-オキシド、
ピリダジニルN-オキシド、
ピラジニルN-オキシド、
キノリニルN-オキシド、
インドリルN-オキシド、
インドリニルN-オキシド、
イソキノリルN-オキシド、
キナゾリニルN-オキシド、
キノキサリニルN-オキシド、
フタラジニルN-オキシド、
イミダゾリルN-オキシド、
イソキサゾリルN-オキシド、
オキサゾリルN-オキシド、
チアゾリルN-オキシド、
インドリジニルN-オキシド、
インダゾリルN-オキシド、
ベンゾチアゾリルN-オキシド、
ベンズイミダゾリルN-オキシド、
ピロリルN-オキシド、
オキサジアゾリルN-オキシド、
チアジアゾリルN-オキシド、
チアゾリルN-オキシド、
テトラゾリルN-オキシド、
ベンゾチオピラニルS-オキシド、および
ベンゾチオピラニルS，S-ジオキシド、

ここで、

R_{N-} ヘテロアリール基

は、水素原子およびその結合の代わりに

R_{N-} ヘテロアリール基

への新しい結合が存在するように、水素により置換されている元の

R_{N-} ヘテロアリール基

の環原子のいずれかによって結合されており、ここで上記ヘテロアリールは、1個、2個、3個または4個の下記基により置換されていてもよい：

(1) C_1-C_6 アルキル、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C\equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は下記基からなる群から選択される：

(a) $-H$ 、

(b) $-C_1-C_6$ アルキル基、この基は下記群から選択される置換基により置換されていてもよい：

(i) $-OH$ 、および

(ii) $-NH_2$ 、

(c) $-C_1-C_6$ アルキル基、この基は1～3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ または $-I$ により置換されていてもよい、

(d) $-C_3-C_7$ シクロアルキル、

(e) $-(C_1-C_2\text{アルキル})-(C_3-C_7\text{シクロアルキル})$ 、

(f) $-(C_1-C_6\text{アルキル})-O-(C_1-C_3\text{アルキル})$ 、

(g) 1個または2個の二重結合を有する $-C_2-C_6$ アルケニル、

(h) 1個または2個の三重結合を有する $-C_2-C_6$ アルキニル、

(i) 1個の二重結合および1個の三重結合を有する $-C_1-C_6$ アルキル鎖、

(j)

$-R_{1-}$ アリール

(ここで、

R_{1-} アリール

は上記定義のとおりである)、
(k)

— R_{1-} ヘテロアリール

(ここで、

R_{1-} ヘテロアリール

は上記定義のとおりである)、

(8) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_1 - C_{12}$ アルキル)、

(9) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_2 - C_{12}$ の1個、2個または3個の二重結合を有するアルケニル)、

(10) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_2 - C_{12}$ の1個、2個または3個の三重結合を有するアルキニル)、

(11) — $(CH_2)_{0-4} - CO - (C_3 - C_7$ シクロアルキル)、

(12)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ アリール

(ここで、

R_{1-} アリール

は上記定義のとおりである)、
(13)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ ヘテロアリール

(ここで、

R_{1-} ヘテロアリール

は上記定義のとおりである)、
(14)

— $(CH_2)_{0-4} - CO - R_{1-}$ ヘテロ環

(ここで、

R_{1-} ヘテロ環

は上記定義のとおりである)、

(15) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{N-4}$ (ここで、 R_{N-4} はモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニルおよびピロリジニルからなる群から選択され、これら各基は 1 個、2 個、3 個または 4 個の C_1-C_6 アルキルにより置換されていてもよい)、

(16) $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{N-5}$ 、ここで、 R_{N-5} は、下記群から選択される：

- (a) C_1-C_6 アルキル、
- (b)

$-(CH_2)_{0-2}-R_{1-アリール}$

(ここで、

$R_{1-アリール}$

は上記定義のとおりである)、

- (c) 1 個または 2 個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル、
- (d) 1 個または 2 個の三重結合を有する C_2-C_6 アルキニル、
- (e) C_3-C_7 シクロアルキル、および
- (f)

$-(CH_2)_{0-2}-(R_{1-ヘテロアリール})$

(ここで、

$R_{1-ヘテロアリール}$

は上記定義のとおりである)、

(17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ (ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は上記定義のとおりである)、

(18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

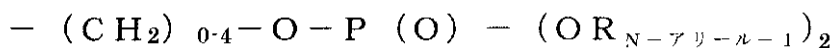
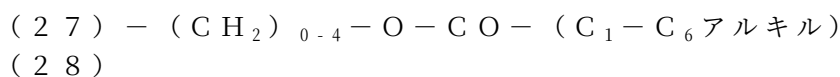
(22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

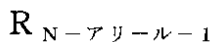
(24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ (ここで、 R_{N-5} および R_{N-2} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ (ここで、 R_{N-2} および R_{N-3} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、

(26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$ (ここで、 R_{N-4} は上記定義のとおりである)、



(ここで、



は-Hまたは $C_1 - C_4$ アルキルである)、

(29) $- (CH_2)_{0-4} - O - CO - N(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、

(30) $- (CH_2)_{0-4} - O - CS - N(R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、

(31) $- (CH_2)_{0-4} - O - (R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、

(32) $- (CH_2)_{0-4} - O - (R_{N-5})_2 - COOH$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、

(33) $- (CH_2)_{0-4} - S - (R_{N-5})_2$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、

(34) $- (CH_2)_{0-4} - O - (C_1 - C_6 \text{ の } 1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個または } 5 \text{ 個の } -F \text{ により置換されていてもよいアルキル})$ 、

(35) $C_3 - C_7$ シクロアルキル

(36) 1個または2個の二重結合を有する $C_2 - C_6$ アルケニル基、この基は $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(37) 1個または2個の三重結合を有する $C_2 - C_6$ アルキニル基、この基は $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(38) $- (CH_2)_{0-4} - N(-H \text{ または } R_{N-5}) - SO_2 - R_{N-2}$ (ここで、 R_{N-5} および R_{N-2} は同一または相違していてもよく、上記定義のとおりである)、または

(39) $- (CH_2)_{0-4} - C_3 - C_7$ シクロアルキル、

(C) $R_{N-\text{アリール}} - W - R_{N-\text{アリール}}$ 、

(D) $R_{N-\text{アリール}} - W - R_{N-\text{ヘテロアリール}}$ 、

(E) $R_{N-\text{アリール}} - W - R_{N-1-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{N-\text{ヘテロ環}}$ は $R_{1-\text{ヘテロ環}}$

と同一である)、

- (F) $R_{N-\text{ヘテロアリール}}-W-R_{N-\text{アリール}}$ 、
 (G) $R_{N-\text{ヘテロアリール}}-W-R_{N-1-\text{ヘテロアリール}}$ 、
 (H) $R_{N-\text{ヘテロアリール}}-W-R_{N-1-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{N-1-\text{ヘテロ環}}$ は $R_{1-\text{ヘテロ環}}$

と同一である)、

- (I) $R_{N-\text{ヘテロ環}}-W-R_{N-\text{ヘテロアリール}}$ 、
 (J) $R_{N-\text{ヘテロ環}}-W-R_{N-\text{ヘテロアリール}}$ 、
 (K) $R_{N-\text{ヘテロ環}}-W-R_{N-1-\text{ヘテロ環}}$ 、

(ここで、Wは、下記基である：

- (1) $-(CH_2)_{0-4}-$ 、
 (2) $-O-$ 、
 (3) $-S(O)_{0-2}-$ 、
 (4) $-N(R_{N-5})-$ (ここで、 R_{N-5} は上記定義のとおりである)、または
 (5) $-CO-$ ；

R_c は、下記基である：

(I) $-C_3-C_{10}$ アルキル基、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)、 $-OC=O-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)、 $-S(=O)_{0-2}R_{1-a}$ (ここで、 R_{1-a} は上記定義のとおりである)、 $-NR_{1-a}C=ONR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)、 $-C=O-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)、および $-S(=O)_2-R_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(II) $-(CH_2)_{0-3}-(C_3-C_8)$ シクロアルキル、このシクロアルキル基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-CO-OH$ 、 $-CO-O-(C_1-C_4)$ アルキル)および $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである)からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(III)

$-(CR_{c-x}R_{c-y})_{0-4}-R_{C-\text{アリール}}$ 、

ここで、 R_{c-x} および R_{c-y} は下記基である：

$-H$ 、

C_1-C_4 アルキル、この基は1個または2個の $-OH$ により置換されていてもよい、

C₁－C₄アルコキシ、この基は1個、2個または3個の－Fにより置換されているもよい、

－(CH₂)₀₋₄－C₃－C₇シクロアルキル、

1個または2個の二重結合を含有するC₂－C₆アルケニル、

1個または2個の三重結合を含有するC₂－C₆アルキニル、

フェニル、

およびR_{c-x}およびR_{c-y}は、これらが結合している炭素と一緒に3個、4個、5個、6個または7個の炭素原子を有する炭素環を形成しており、この環中に存在する1個の炭素原子は－O－、－S－、－SO₂－、－NR_{N-2}－および

R_{C-アリール}

(この基は

R_{N-アリール}

と同一である) からなる群から選択されるヘテロ原子によって置き換えられていてもよい；

(IV)

－(CR_{c·x}CR_{c·y})₀₋₄－R_{C-ヘテロアリール}

(ここで、

R_{C-ヘテロアリール}はR_{N-ヘテロアリール}

と同一であり、およびR_{c-x}およびR_{c-y}は上記定義のとおりである)、

(V)

－(CR_{c·x}CR_{c·y})₀₋₄－R_{C-アリール}R_{C-アリール}

(ここで、

R_{C-アリール}、

R_{c-x}およびR_{c-y}は上記定義のとおりである)、

(VI)

－(CR_{c·x}CR_{c·y})₀₋₄－R_{C-アリール}－R_{C-ヘテロアリール}

(ここで、

$R_{C-アリール}$ 、 $R_{C-ヘテロアリール}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(V I I)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0.4} - R_{C-ヘテロアリール} - R_{C-アリール}$

(ここで、

$R_{C-ヘテロアリール}$ 、 $R_{C-アリール}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(V I I I)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0.4} - R_{C-ヘテロアリール} - R_{C-ヘテロアリール}$

(ここで、

$R_{C-ヘテロアリール}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(I X)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0.4} - R_{C-アリール} - R_{C-ヘテロ環}$

(ここで、

$R_{C-アリール}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりであり、

$R_{C-ヘテロ環}$ は $R_{N-ヘテロ環}$

と同一である）、
(X)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0.4} - R_{C-ヘテロアリール} - R_{C-ヘテロ環}$

(ここで、

— $R_{C-\text{ヘテロアリール}}$ 、 $R_{C-\text{ヘテロ環}}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(X I)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0-4} - R_{C-\text{ヘテロ環}} - R_{C-\text{アリール}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$ 、 $-R_{C-\text{アリール}}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(X I I)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0-4} - R_{C-\text{ヘテロ環}} - R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$ 、 $-R_{C-\text{ヘテロアリール}}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(X I I I)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0-4} - R_{C-\text{ヘテロ環}} - R_{C-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(X I V)

— $(C R_{c-x} R_{c-y})_{0-4} - R_{C-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$ 、

R_{c-x} および R_{c-y} は上記定義のとおりである）、
(X V)

$R_{C-アリール}$ または $R_{C-ヘテロアリール}$ または $R_{C-ヘテロ環}$

(ここで、

$-R_{C-アリール}$ または $-R_{C-ヘテロアリール}$ または $R_{C-ヘテロ環}$

は上記定義のとおりである) に縮合している $-シクロペンチル$ 、 $-シクロヘキシル$ または $-シクロヘプチル$ 環、このシクロペンチル、シクロヘキシルまたはシクロヘプチルの 1 個の炭素は NH 、 NR_{N-5} 、 O 、 $S(=O)_{0-2}$ により置き換えられていてもよく、およびこのシクロペンチル、シクロヘキシルまたはシクロヘプチルは 1 個または 2 個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $=O$ 、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) により置換されていてもよい、

$(XVI) - [C(R_{c-1})(R_{c-2})]_{1-3} - CO - N - (R_{c-3})_2$ (ここで、 R_{c-1} および R_{c-2} は同一または相違していてもよく、下記群から選択される：

(A) $-H$ 、

(B) $-C_1-C_6$ アルキル、この基は 1 個、2 個または 3 個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニルおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(C) 1 個または 2 個の二重結合を有する C_2-C_6 アルケニル基、この基は 1 個、2 個または 3 個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニルおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(C) $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7$ シクロアルキル、この基は 1 個、2 個または 3 個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニルおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ (ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである) からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(D)

$-(C_1-C_4 \text{ アルキル}) - R_{C'-アリール}$

(ここで、

$R_{C'-アリール}$ は $R_{1-アリール}$

について定義されているとおりである)、

(E)

$-(C_1-C_4 \text{ アルキル}) - R_{C-ヘテロアリール}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

は上記定義のとおりである)、
(F)

— (C₁—C₄アルキル) — $R_{C-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$

は上記定義のとおりである)、
(G)

— $R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

は上記定義のとおりである)、
(H)

— $R_{C-\text{ヘテロ環}}$

(ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$

は上記定義のとおりである)、および
(I)

— $R_{C'-\text{アリール}}$

(ここで、

$R_{C'-\text{アリール}}$

は上記定義のとおりである)、
および R_{C-3} は同一または相違していてもよく、下記基である：

(A) $-H$ 、

(B) $-C_1-C_6$ アルキル、この基は1個、2個または3個の C_1-C_3 アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニルおよび $-NR_{1-a}R_{1-b}$ （ここで、 R_{1-a} および R_{1-b} は上記定義のとおりである）からなる群から選択される置換基により置換されていてもよい、

(C) $-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7$ シクロアルキル、

(D)

$-(C_1-C_4\text{アルキル})-R_{C'-\text{アリール}}$

（ここで、

$R_{C'-\text{アリール}}$

は上記定義のとおりである）、

(E)

$-(C_1-C_4\text{アルキル})-R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

（ここで、

$R_{C-\text{ヘテロアリール}}$

は上記定義のとおりである）、

(F)

$-(C_1-C_4\text{アルキル})-R_{C-\text{ヘテロ環}}$

（ここで、

$R_{C-\text{ヘテロ環}}$

は上記定義のとおりである）。

【請求項2】 R_1 は、

$-(CH_2)_{0-1}-(R_{1-\text{アリール}})$ 、または $-(CH_2)_{0-1}-(R_{1-\text{ヘテロアリール}})$

であり、

R_N は、 $R_{N-1}-X_N$ （ここで、 X_N は $-CO-$ および $-SO_2-$ からなる群から選択され、 R_{N-1} は

— R_N -アリールおよび R_N -ヘテロアリール

からなる群から選択される) であり、

R_c は、— $C_3 - C_8$ アルキル、

— $(CH_2)_{0-3} (C_3 - C_7)_{1-4} - R_C$ -アリール、

— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -ヘテロアリール、

— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -ヘテロ環または R_C -アリールまたは R_C -ヘテロアリール

または R_C -ヘテロ環

に縮合している—シクロペンチルまたは—シクロヘキシルである、

請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 3】 R_1 は、

— $(CH_2) - (R_1$ -アリール)、または— $(CH_2) - (R_1$ -ヘテロアリール)

であり、

R_2 は、— H であり、

R_3 は、— H であり、

R_N は、 $R_{N-1} - X_N$ — (ここで、 X_N は— CO— であり、 R_{N-1} は

— R_N -アリールおよび R_N -ヘテロアリール

からなる群から選択される) であり、

R_c は、— $(CH_2)_{0-3} (C_3 - C_7)$ シクロアルキル、

— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -アリール、— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -ヘテロアリール、

— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -ヘテロ環、または R_C -アリールまたは R_C -ヘテロアリール

または R_C -ヘテロ環

に縮合している—シクロペンチルまたは—シクロヘキシルである、

請求項 2 に記載の置換アミン化合物。

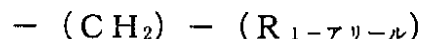
【請求項 4】 R_c は、

— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -アリール、— $(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4} - R_C$ -ヘテロアリール、

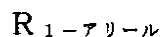
または R_C -アリールまたは R_C -ヘテロアリールまたは R_C -ヘテロ環

に縮合している—シクロペンチルまたは—シクロヘキシルである、請求項 3 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 5】 R_1 が

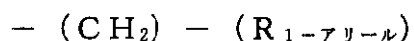


(ここで、

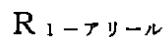


はフェニルである) である、
請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 6】 R_1 が



(ここで、



は 2 個の—F により置換されているフェニルである) である、
請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 7】 —F 置換が 3, 5—ジフルオロベンジルである、請求項 6 に記載の置換アミン化合物。

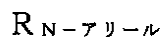
【請求項 8】 R_2 が—H である、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 9】 R_3 が—H である、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 10】 R_N が $R_{N-1}-X_N$ —であり、ここで、 X_N は—C O—であり、 R_{N-1} は



であり、



が 1 個の—C O— $N R_{N-2} R_{N-3}$ により置換されているフェニルであり、このフェニル上の置換は 1, 3—である、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 11】 R_{N-2} および R_{N-3} が同一であり、 C_3 アルキルである、請求項 10 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 12】 R_N が、 $R_{N-1}-X_N$ —であり、ここで、 X_N は—C O—であり、 R_{N-1} は

$R_{N-アリール}$

であり、

$R_{N-アリール}$

は 1 個の C_1 アルキルおよび 1 個の $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ により置換されているフェニルであり、このフェニル上の置換は 1, 3, 5-である、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 13】 R_{N-2} および R_{N-3} が同一であり、 C_3 アルキルである、請求項 12 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 14】 R_N が、 $R_{N-1}-X_N-$ であり、ここで、 X_N は $-CO-$ であり、 R_{N-1} は

$R_{N-ヘテロアリール}$

であり、

$R_{N-ヘテロアリール}$

は 1 個の $-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ により置換されている、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 15】 R_{N-2} および R_{N-3} が同一であり、 $-C_3$ アルキルである、請求項 14 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 16】 R_c が、

$-(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4}-R_{C-アリール}$

(ここで、

$R_{C-アリール}$

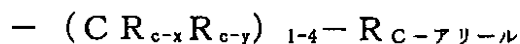
はフェニルである)、

$-(CR_{c-x}R_{c-y})_{1-4}-R_{C-ヘテロアリール}$ または $R_{C-アリール}$ 、

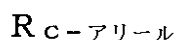
または $R_{C-ヘテロアリール}$ または $R_{C-ヘテロ環}$

に縮合している $-シクロペンチル$ または $-シクロヘキシル$ である、請求項 1 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 17】 R_c が、



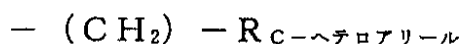
であり、ここで、



はフェニルである、請求項 16 に記載の置換アミン化合物。

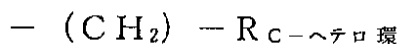
【請求項 18】 フェニルが 1, 3-位置または 3, 5-位置で置換されている、請求項 17 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 19】 R_c が、



である、請求項 16 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 20】 R_c が、



である、請求項 16 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 21】 R_c が、フェニル環に縮合されている-シクロヘキシルである、請求項 16 に記載の置換アミン化合物。

【請求項 22】 医薬として許容される塩が下記酸の塩からなる群から選択される請求項 1 に記載の置換アミン化合物：酢酸、アスパラギン酸、ベンゼスルホン酸、安息香酸、重炭酸、重硫酸、重酒石酸、酪酸、カルシウムエデエート、カムシル酸 (cansylic acid)、炭酸、クロロ安息香酸、クエン酸、エデト酸 (editic acid)、エディシル酸、エストール酸、エシル酸 (esyl acid)、エシリル酸 (esylic acid)、ギ酸、フマル酸、グルセプト酸、グルコン酸、グルタミン酸、グリコリルアルサニル酸、ヘキサン酸、ヘキシルレゾルシノール酸、ヒドラバミン酸、臭化水素酸、塩酸、ヨウ化水素酸、ヒドロキシナフト酸、イセチオン酸、乳酸、ラクトビオン酸、マレイン酸、マロン酸、マンデル酸、メタンスルホン酸、メチル硝酸、メチル硫酸、ムチン酸、ムコン酸、ナプシル酸、硝酸、シュウ酸、p-ニトロメタンスルホン酸、パモ酸、パントテン酸、リン酸、一水素リン酸、二水素リン酸、フタル酸、ポリガラクトウロン酸、プロピオン酸、フリチル酸、ステアリン酸、コハク酸、スルファミン酸、スルホン酸、硫酸、タンニン酸、酒石酸、テオクリン酸 (teoclic acid) およびトルエンスルホン酸。

【請求項 23】 下記群から選択される請求項 1 に記載の置換アミン化合物：

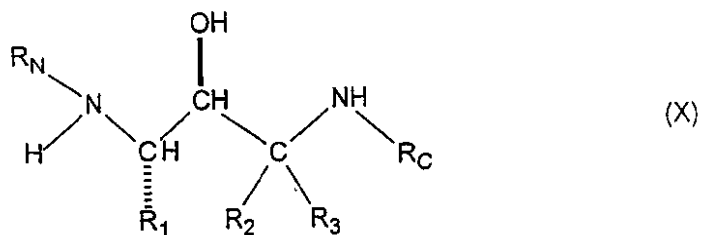
$N^1-[(1S, 2S)-1-(3, 5-ジフルオロベンジル)-3-(ヘキシルアミノ)-2-ヒドロキシプロピル]-N^3$, N^3 -ジプロピルイソフタルアミド、

$N^1-[(1S, 2S)-1-(3-ベンジルアミノ)-1-(3, 5-ジフルオロベンジル)-2-ヒドロキシプロピル]-5-メチル-N^3$, N^3 -ジプロピルイソフタルアミド、

$N^1-\{ (1S, 2S)-1-(3, 5-ジフルオロベンジル)-2-ヒドロキシ-3-[(3-メトキシベンジル)アミノ]プロピル\}-5-メチル-N^3$, N^3 -ジプロピルイソフタルアミド、および

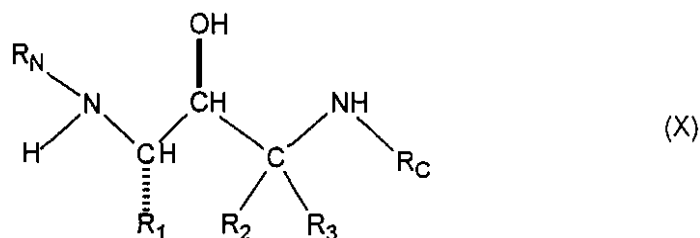
$N^1 - (1S, 2S) - 1 - (3, 5\text{-ジフルオロベンジル}) - 2\text{-ヒドロキシ} - 3 - \{ [(1S) - 2 - (\text{イソブチルアミノ}) - 1\text{-メチル} - 2\text{-オキソエチル}] \text{アミノ} \}$ プロピル) - N^3 , N^3 -ジプロピルイソフタルアミド。

【請求項 24】 下記式 (X) で表わされる置換アミン化合物またはその医薬として許容される塩および医薬上で許容される稀釈剤または担体を含む医薬組成物：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 25】 ベーターセクレターゼ活性の抑制方法であって、有効抑制量の式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩にベーターセクレターゼをさらすことを包含する方法：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

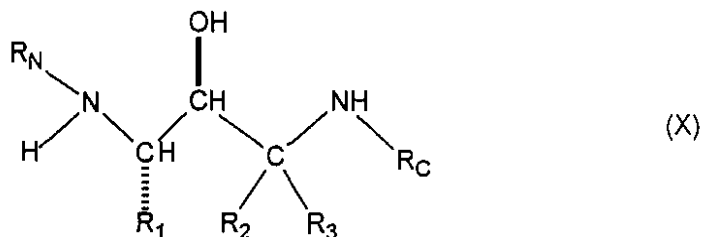
【請求項 26】 上記ベーターセクレターゼを、インビトロで上記化合物にさらす、請求項 25 に記載の方法。

【請求項 27】 上記ベーターセクレターゼを、細胞中で上記化合物にさらす、請求項 25 に記載の方法。

【請求項 28】 上記細胞が動物である、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】 上記動物がヒトである、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 30】 反応混合物中における、APP-695 アミノ酸イソ型について番号付けして Met 596 と Asp 597 との間の部位、またはそのイソ型または変異体の対応する部位におけるアミロイド先駆タンパク質 (APP) の分解を抑制する方法であって、上記反応混合物を有効抑制量の式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩にさらすことを包含する上記方法：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 31】 上記分裂部位が、APP-751 イソ型について番号付けして Me

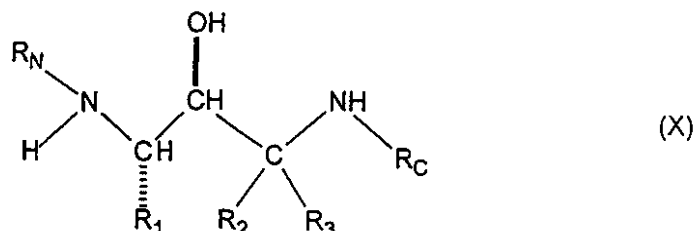
t 6 5 2 と A s p 6 5 3 との間の部位；A P P-7 7 0 イソ型について番号付けして M e t 6 7 1 と A s p 6 7 2 との間の部位；A P P-6 9 5 スウェーデン突然変異体の L e u 5 9 6 と A s p 5 9 7 との間の部位；A P P-7 5 1 スウェーデン突然変異体の L e u 6 5 2 と A s p 6 5 3 との間の部位；または A P P-7 7 0 スウェーデン突然変異体の L e u 6 7 1 と A s p 6 7 2 との間の部位；である、請求項 3 0 に記載の方法。

【請求項 3 2】 上記反応混合物をインビトロでさらす、請求項 3 0 に記載の方法。

【請求項 3 3】 上記反応混合物を細胞中でさらす、請求項 3 2 に記載の方法。

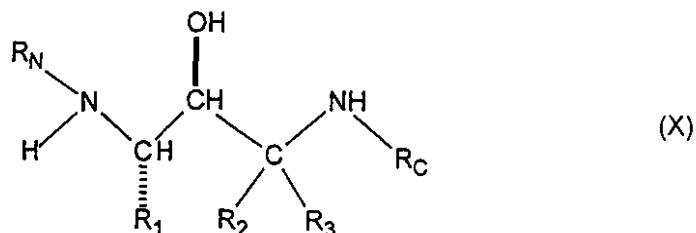
【請求項 3 4】 上記細胞がヒト細胞である、請求項 3 3 に記載の方法。

【請求項 3 5】 式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩と複合体化されているベーターセクレターゼを含有する組成物：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 3 6】 ベーターセクレターゼ複合体の製造方法であって、反応混合物中で上記複合体の生成に適する条件下に、ベーターセクレターゼを式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩にさらすことを包含する上記方法：

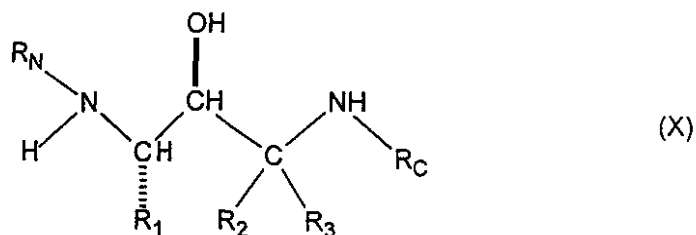


式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 3 7】 上記さらす処理がインビトロである、請求項 3 6 に記載の方法。

【請求項 3 8】 上記反応混合物が細胞である、請求項 3 6 に記載の方法。

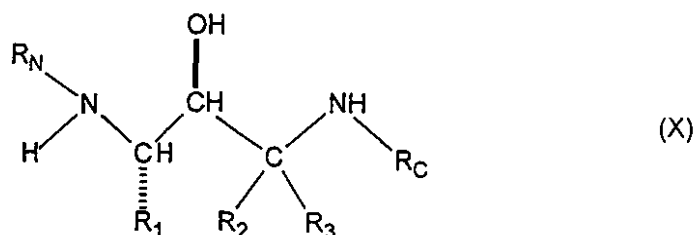
【請求項 3 9】 組立て可能な成分部品を包含するキットであって、少なくとも 1 個の成分部品が容器内に式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有する上記キット：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 4 0】 上記化合物が凍結乾燥されており、および少なくとも 1 種の追加の成分が稀釈剤を包含する、請求項 3 9 に記載のキット。

【請求項 4 1】 複数の容器を包含するキットであって、各容器が 1 単位用量または 2 以上の単位用量の式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有する上記キット：



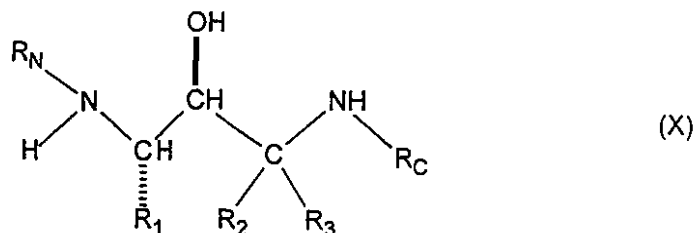
式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

【請求項 4 2】 各容器が経口放出に適しており、および錠剤、ゲルまたはカプセルを包含する、請求項 4 1 に記載のキット。

【請求項 4 3】 各容器が非経口放出に適しており、およびデポー製剤、注射器、アンプルまたはバイアルを包含する、請求項 4 2 に記載のキット。

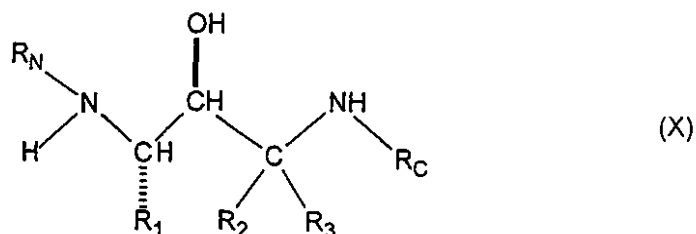
【請求項 4 4】 各容器が局所放出に適しており、および貼布剤、メディパット、軟膏またはクリームを包含する、請求項 4 2 に記載のキット。

【請求項 4 5】 酸化防止剤、抗炎症剤、ガンマセクレターゼ阻害剤、神経向性薬剤、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤、スタチン、A ベータペプチドおよび抗 A ベータ抗体から選択される 1 種または 2 種以上の治療剤；および式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有するキット：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

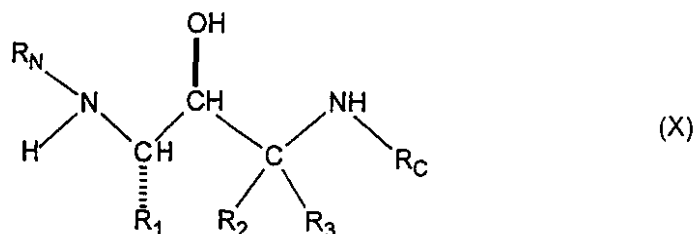
【請求項 4 6】 不活性稀釈剤または食用担体、および式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有する組成物：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項 1 に定義されているとおりである。

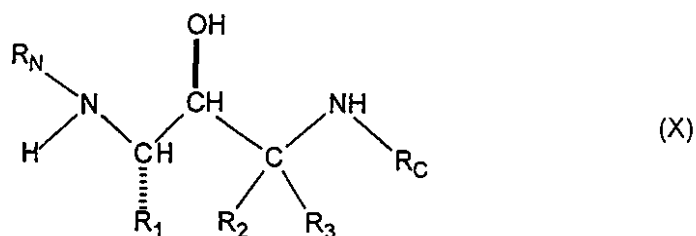
【請求項 4 7】 上記担体が油である、請求項 4 6 に記載の組成物。

【請求項 4 8】 結合剤、賦形剤、崩壊剤、滑剤または被覆剤、および式 (X) で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有する組成物：



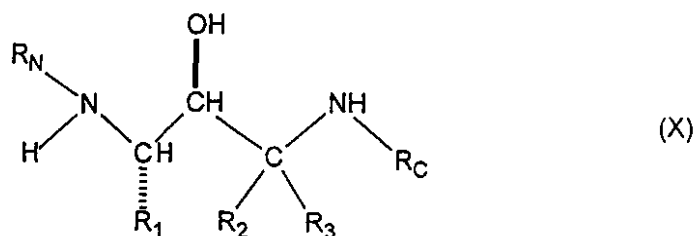
式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項1に定義されているとおりである。

【請求項49】 式(X)で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩を含有し、上記化合物がクリーム、軟膏または貼布剤中に分散されている組成物：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項1に定義されているとおりである。

【請求項50】 アルツハイマー病からなる群から選択される病気または症状を有する者およびこのような処置を必要とする者の処置またはこのような病気または症状の被患から患者を保護するための処置方法であって、アルツハイマー病の発現を防止または遅延させる補助、中程度の認識障害(MCI)を患う患者の処置およびMCIからADに進行するものと見なされる患者におけるアルツハイマー病の発現の防止または遅延、ダウン症候群の処置、オランダ型アミロイドーシスを伴う遺伝性脳出血を有するヒトの処置、脳アミロイド血管障害の処置およびその潜在的後遺症、すなわち一時的および反復性脳葉出血の防止、その他の混合血管系および変質から生じる痴呆、パーキンソン病に付随する痴呆、進行性核上麻痺に付随する痴呆、皮質基底変質に付随する痴呆を包含する変質性痴呆の処置、散在性ルーイ粒型アルツハイマー病に用いる医薬の製造における、下記式(X)で表わされる置換アミン化合物およびその医薬として許容される塩の使用：



式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_N および R_C は請求項1に定義されているとおりである。

【請求項51】 病気がアルツハイマー病である、請求項50に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項52】 方法がアルツハイマー病の発現の防止または遅延の補助である、請求項50に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項53】 病気が中程度の認識障害である、請求項50に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項54】 病気がダウン症候群である、請求項50に記載の置換アミン化合物

の使用。

【請求項 55】 病気がオランダ型アミロイドーシスを伴う遺伝性脳出血である、請求項 50 に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項 56】 病気が脳アミロイド血管障害である、請求項 50 に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項 57】 病気が変質性痴呆である、請求項 50 に記載の置換アミン化合物の使用。

【請求項 58】 病気が散在性ルーイ粒型アルツハイマー病である、請求項 50 に記載の置換アミン化合物の使用。