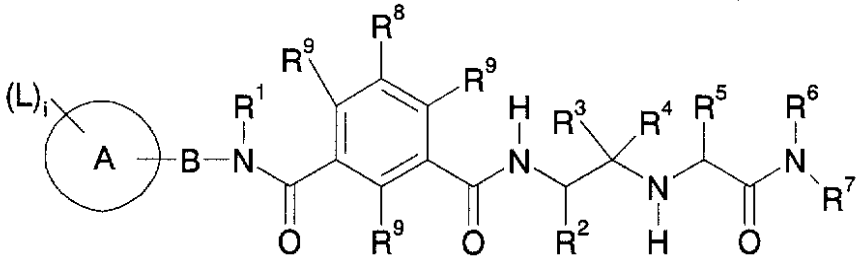
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【公表番号】特表2009-504612(P2009-504612A)
【公表日】平成21年2月5日(2009.2.5)
【年通号数】公開・登録公報2009-005
【出願番号】特願2008-525576(P2008-525576)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 231/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/415　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 277/28　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/426　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 333/20　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 213/40　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4406　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/541　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/14　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/18　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 231/12　ＣＳＰＡ
Ａ６１Ｋ 31/415
Ｃ０７Ｄ 231/12　Ｃ
Ｃ０７Ｄ 277/28
Ａ６１Ｋ 31/426
Ｃ０７Ｄ 333/20
Ａ６１Ｋ 31/381
Ｃ０７Ｄ 213/40
Ａ６１Ｋ 31/4406
Ｃ０７Ｄ 417/12
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｋ 31/541
Ｃ０７Ｄ 417/14
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 43/00　１１１
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 1/18
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/10　１０１

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月10日(2009.8.10)
【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】
下記一般式(I)の化合物、その薬理学的に許容しうる塩、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ化合物、水和物又は溶媒和物。
【化１】



(I)

（式中、
Aは、ヘテロアリールを表し
（基Aは、基Lに加え、任意に1又は2以上のフッ素原子で置換されていてもよい）、
Lは、各場合相互独立に水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{1-6}-アルキル-S、C_{1-6}-アルキル-S-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-6}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-6}-アルキル、アリール-C_{2-6}-アルケニル、アリール-C_{2-6}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-6}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-CO、R^{12}-CO-$(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-CO-$(R^{12})N$、R^{12}-SO_2-$(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-SO_2又はC_{1-6}-アルキル-SO_2を表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、ヒドロキシ-C_{1-6}-アルキル、C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-CO-及び$HOSO_2$-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、
iは0、1、2又は3を表し、
BはC_{1-4}-アルキレンブリッジを表し
（該C_{1-4}-アルキレンブリッジは任意に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、C_{1-4}-アルキル、C_{1-6}-アルキル-S-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキル、R^{13}-O、$(R^{12})_2N$-SO_2、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-CO、R^{12}-SO_2、R^{12}-CO-$(R^{12})N$、R^{12}-$SO_2(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{12}-CO-及びR^{12}-SOの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよく、かつ
該C_{1-4}-アルキレンブリッジの同一炭素原子に結合している2個のC_{1-4}-アルキル基が結

合してC_{3-7}-シクロアルキル基を形成してもよく、かつ
前記C_{1-4}-アルキル基及び前記C_{1-4}-アルキル基から形成された前記C_{3-7}-シクロアルキル基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、F_3C、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{12}-CO(R^{12})N、R^{12}-SO_2(R^{12})N、(R^{12})$_2$N、(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキル、(R^{12})$_2$N-CO、(R^{12})$_2$N-SO_2-及び$HOSO_2$-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、
R^1は、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-6}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-6}-アルキル、アリール-C_{2-6}-アルケニル、アリール-C_{2-6}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-6}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルキニル又はヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキルを表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、F_3C、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、ヒドロキシ-C_{1-6}-アルキル、(R^{12})$_2$N、(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキル、(R^{12})$_2$N-CO、(R^{12})$_2$N-SO_2、R^{12}-CO-(R^{12})N、R^{12}-SO_2(R^{12})N-及び$HOSO_2$-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、
R^2は、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{1-6}-アルコキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルキル-S-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-3}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-3}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-3}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-3}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-3}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-3}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、アリール-C_{2-3}-アルケニル、アリール-C_{2-3}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-3}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-3}-アルキニル又はヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキルを表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、F_3C、HF_2C、FH_2C、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、(R^{12})$_2$N、(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキル、$HOSO_2$、C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルキル-S-C_{1-3}-アルキル、(R^{12})$_2$N-SO_2、R^{12}-CO-(R^{12})N、R^{12}-SO_2(R^{12})N、(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキル、(R^{12})$_2$N-CO、R^{13}-O及びR^{13}-O-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、
R^3、R^4は、各場合相互独立に水素、C_{1-6}-アルキル、フッ素、F_3C、HF_2C又はFH_2Cを表し、
R^5は、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-4}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-4}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-4}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-4}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-4}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-4}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-4}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-4}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-4}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-4}-アルキル、アリール-C_{2-4}-アルケニル、アリール-C_{2-4}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-4}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-4}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-4}-アルキニル又はヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキルを表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ、C_{1-3}-アルキル-S、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、アリール-C_{1-6}-ア

ルキル、R^{12}-CO-(R^{12})N、R^{12}-$SO_2(R^{12})$N-$(R^{12})_2$N-SO_2、$(R^{12})_2$N、$(R^{12})_2$N-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2$N-CO-及びHOSO_2-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^6は、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-6}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-6}-アルキル、アリール-C_{2-6}-アルケニル、アリール-C_{2-6}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-6}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルキニル又はヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキルを表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-S、R^{13}-S-C_{1-3}-アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、アリール-C_{1-6}-アルキル、$(R^{12})_2$N、$(R^{12})_2$N-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2$N-CO、$(R^{12})_2$N-CO-N(R^{12})、$(R^{12})_2$N-SO_2-及びHOSO_2-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^7は、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{1-6}-アルコキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し
（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ヒドロキシ、C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ及び$(R^{12})_2$N-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^8は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-6}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-6}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-6}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-6}-アルキル、アリール-C_{2-6}-アルケニル、アリール-C_{2-6}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-6}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-6}-アルキニル、ヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{10}-SO_2-(R^{11})N又はR^{10}-CO-(R^{11})N-を表し
（前記基は、任意に、相互独立に、C_{1-6}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、$(R^{12})_2$N、$(R^{12})_2$N-CO、R^{12}-CO-(R^{12})N、$(R^{12})_2$N-CO-(R^{12})N、$(R^{12})_2$N-SO_2、$(R^{12})_2$N-SO_2-(R^{12})N、F_3C、HF_2C、FH_2C、F_3C-O、HF_2C-O、FH_2C-O又はR^{12}-SO_2-(R^{12})N-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^9は、各場合相互独立に、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O又は$(R^{12})_2$Nを表し
（前記C_{1-3}-アルキル基は、任意に1又は2以上のフッ素原子で置換されていてもよい）、

R^{10}は、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-4}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-4}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{2-4}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-4}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-4}-アルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{2-4}-アルキニル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-4}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-4}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-4}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-4}-アルキル、ア

リール-C_{2-4}-アルケニル、アリール-C_{2-4}-アルキニル、アリール-C_{3-7}-シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-4}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-4}-アルケニル、ヘテロアリール-C_{2-4}-アルキニル、ヘテロアリール-C_{3-7}-シクロアルキル-又は$(R^{12})_2N$を表し

（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{12}-CO(R^{12})N、R^{12}-SO_2(R^{12})N、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{12}-SO_2、R^{12}-SO、R^{12}-S、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル-及び$(R^{12})_2N$-COの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^{11}は、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル-C_{2-3}-アルケニル、ヘテロサイクリル-C_{2-3}-アルキニル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール-C_{2-3}-アルケニル又はヘテロアリール-C_{2-3}-アルキニルを表し

（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{12}-SO_2、R^{12}-SO、R^{12}-S、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル-及びR^{12}COの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、或いは

R^{10}とR^{11}が一緒に、R^{11}に結合している窒素原子とR^{10}に結合しているSO_2-又はCO-基を含めてヘテロ環式環が形成されるようにC_{2-6}-アルキレンブリッジを形成し

（このとき該C_{2-6}-アルキレンブリッジの1又は2個の-CH_2基が、各場合2個のO原子若しくはS原子又は1個のO原子と1個のS原子が直接相互に結合しないように、相互独立にO、S、SO、SO_2又は-N(R^{12})-と置き換わっていてよく、かつ

前記C_{2-6}-アルキレンブリッジのC原子は、任意に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、F_3C、C_{1-6}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ、オキソ及びニトロの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、

R^{12}は、各場合相互独立に、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{3-6}-シクロアルキル、C_{3-6}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し

（このとき同一窒素原子に結合している2個のC_{1-6}-アルキル基が一緒に、基R^{12}に結合している窒素原子を含めてヘテロ環式環が形成されるようにC_{2-6}-アルキレンブリッジを形成してよく、

該C_{2-6}-アルキレンブリッジの-CH_2基がO、S又は-N(R^{13})-と置き換わっていてもよく、かつ

前記基及びヘテロ環式環は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、ヒドロキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、$(R^{13})_2N$-CO-及び$(R^{13})_2N$-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）、及び

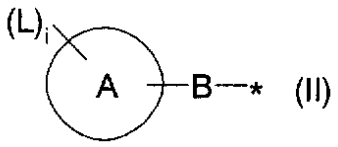
R^{13}は、各場合相互独立に、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表す

（前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、ホルミル、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル-及びC_{1-3}-アルコキシの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい）。）

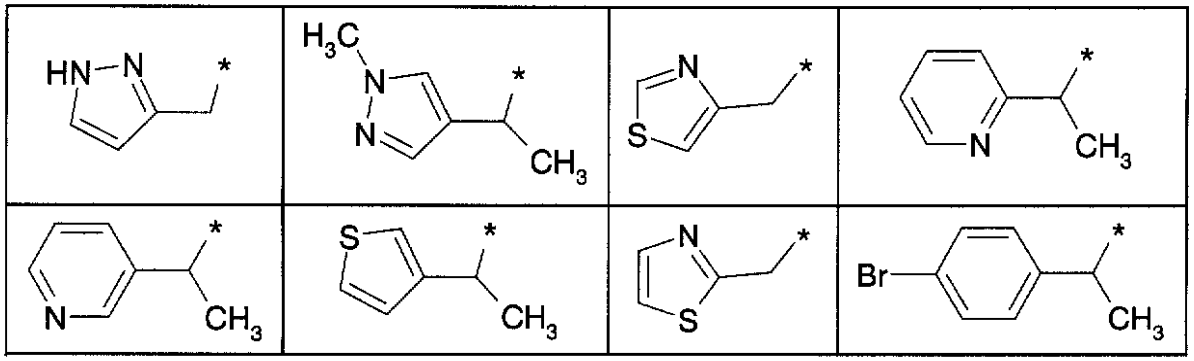
【請求項２】

Aが、N、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有する5員又は6員芳香族ヘテロアリール基を表すことを特徴とする請求項１に記載の化合物。

【請求項３】
Lが、各場合独立に水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-CO、R^{12}-CO-$(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-CO-$(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{12}-SO_2-$(R^{12})N$又はC_{1-3}-アルキル-SO_2を表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、ヒドロキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル-及び$(R^{12})_2N$-CO-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよく、かつ
iが、0、1又は2を表す
ことを特徴とする請求項１又は２の１項に記載の化合物。
【請求項４】
Bが、C_{1-4}-アルキレンブリッジを表し、
該C_{1-4}-アルキレンブリッジは、任意に、相互独立に、フッ素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、F_3C、HF_2C、FH_2C、C_{1-4}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、$(R^{12})_2N$-SO_2-及び$(R^{12})_2N$-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよく、かつ
該C_{1-4}-アルキレンブリッジの同一炭素原子に結合している2個のC_{1-4}-アルキル基が結合してC_{3-7}-シクロアルキル基を形成してもよく、かつ
前記基及び前記C_{1-4}-アルキル基から形成された前記C_{3-7}-シクロアルキル基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、F_3C、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ-及びR^{13}-O-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～３のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項５】
下記部分式(II)
【化２】



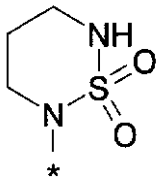
が下記部分式の中から選択されることを特徴とする請求項１に記載の化合物。
【化３】

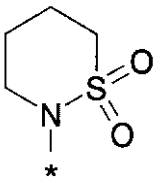


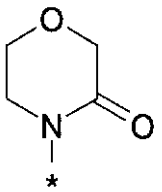
【請求項６】
R^1が、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、F_3C、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ-及びヒドロキシ-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～５のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項７】
R^2が、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{1-6}-アルコキシ-C_{1-3}-アルキル、C_{1-6}-アルキル-S-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、F_3C、HF_2C、FH_2C、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{12}-CO-$(R^{12})N$、R^{12}-$SO_2(R^{12})N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-CO、R^{13}-O及びR^{13}-O-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～６のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項８】
R^3が水素、フッ素、メチル、F_3C、HF_2C又はFH_2Cを表し、かつ
R^4が水素又はフッ素を表す
ことを特徴とする請求項１～７のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項９】
R^5が、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、C_{1-3}-アルキル-S、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、アリール-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-SO_2、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル及び$(R^{12})_2N$-CO-の中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～８のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１０】
R^6が、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、C_{3-6}-シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$、$(R^{12})_2N$-C_{1-3}-アルキル、$(R^{12})_2N$-CO、$(R^{12})_2N$-CO-$N(R^{12})$、$(R^{12})_2N$-SO_2、R^{13}-O及びR^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-S-及びR^{13}-S-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～９のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１１】
R^7が、水素又はC_{1-4}-アルキルを表し、
前記C_{1-4}-アルキル基の1又は2以上の水素原子はフッ素と置き換わっていてもよい
ことを特徴とする請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物。

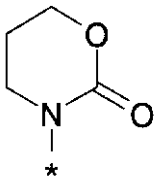
【請求項１２】
R^8が、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル、R^{13}-O、R^{13}-O-C_{1-3}-アルキル、R^{10}-SO_2-(R^{11})N又はR^{10}-CO-(R^{11})Nを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、C_{1-6}-アルキル、C_{1-6}-アルコキシ、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、(R^{12})$_2$N、(R^{12})$_2$N-CO、R^{12}-CO-(R^{12})N、(R^{12})$_2$N-CO-(R^{12})N、(R^{12})$_2$N-SO_2、(R^{12})$_2$N-SO_2-(R^{12})N、F_3C、HF_2C、FH_2C、F_3C-O、HF_2C-O、FH_2C-O又はR^{12}-SO_2-(R^{12})Nから選択される1又は2以上の基で置換されていてもよく、かつ
R^9が、各場合相互独立に水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、F_2HC、FH_2C又はF_3Cを表す
ことを特徴とする請求項１～１１のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１３】
R^{10}が、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、C_{3-7}-シクロアルケニル、C_{3-7}-シクロアルケニル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-C_{1-3}-アルキル又は(R^{12})$_2$Nを表し、
前記基は、任意に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、ヒドロキシ-C_{1-3}-アルキル、R^{12}-CO(R^{12})N、R^{12}-SO_2(R^{12})N、(R^{12})$_2$N、(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキル及び(R^{12})$_2$N-COの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよく、かつ
R^{11}が、水素、C_{1-6}-アルキル、C_{2-6}-アルケニル、C_{2-6}-アルキニル、C_{3-7}-シクロアルキル、C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、アリール、アリール-C_{1-3}-アルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリール-C_{1-3}-アルキルを表し、
前記基は、任意に、相互独立に、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ、シアノ、C_{1-3}-アルキル、C_{1-3}-アルコキシ、ヒドロキシ-C_{1-3}-アルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリル-C_{1-3}-アルキル、(R^{12})$_2$N及び(R^{12})$_2$N-C_{1-3}-アルキルの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～１２のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１４】
R^{10}とR^{11}が一緒に、R^{11}に結合している窒素原子とR^{10}に結合しているSO_2-又はCO-基とを含めてヘテロ環式環が形成されるようにC_{2-6}-アルキレンブリッジを形成し、
前記C_{2-6}-アルキレンブリッジの1又は2個の-CH_2基は、各場合2個のO若しくはS原子又は1個のO原子と1個のS原子が直接相互に結合しないように、相互独立にO、S、SO、SO_2又は-N(R^{12})-と置き換わっていてもよく、かつ
前記C_{2-6}-アルキレンブリッジのC原子は、任意に、相互独立に、フッ素、ヒドロキシ、カルボキシ、F_3C、C_{1-3}-アルキル-及びC_{1-3}-アルコキシの中から選択される1又は2以上の基で置換されていてもよい
ことを特徴とする請求項１～１２のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１５】
R^{10}とR^{11}が、R^{11}に結合している窒素原子とR^{10}に結合しているSO_2-又はCO-基とを含めて下記式(IIa)、(IIb)、(IIc)又は(IId)のヘテロ環式環を形成することを特徴とする請求項１～１２のいずれか１項に記載の化合物。

【化４】


(IIa)

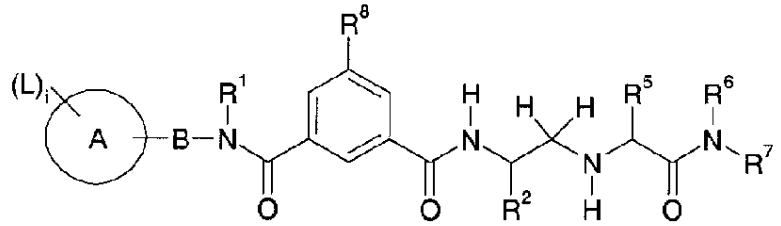

(IIb)


(IIc)

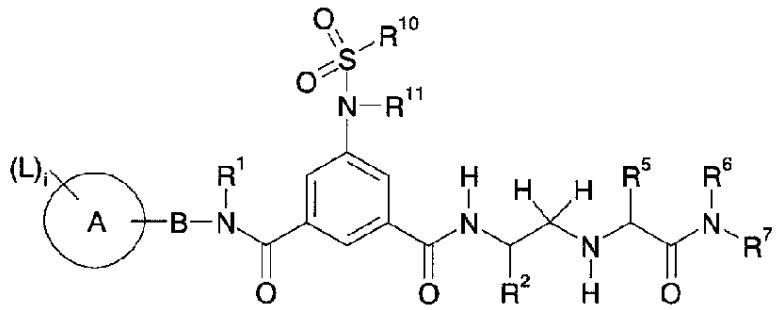

(IId)

【請求項１６】
　R^{12}が、水素又はC_{1-6}-アルキル基を表し、
　前記C_{1-6}-アルキル基の1又は2以上の水素原子はフッ素と置き換わっていてもよい
ことを特徴とする請求項１～１５のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１７】
　R^{13}が、水素又はC_{1-3}-アルキル基を表し、
　前記C_{1-3}-アルキル基の1又は2以上の水素原子はフッ素と置き換わっていてもよい
ことを特徴とする請求項１～１６のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１８】
　下記式(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)及び(Ie)の中から選択される、請求項１～１７のいずれか１項に記載の化合物。

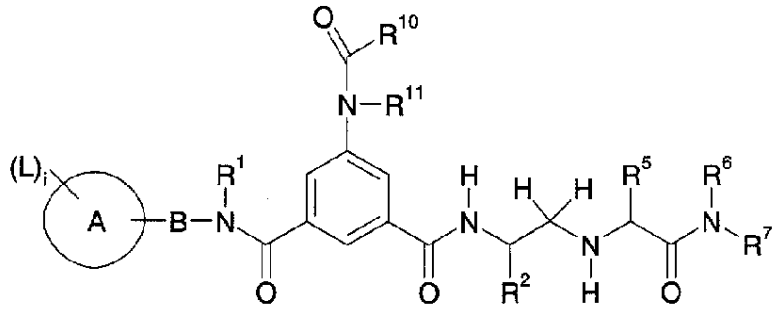
【化５】



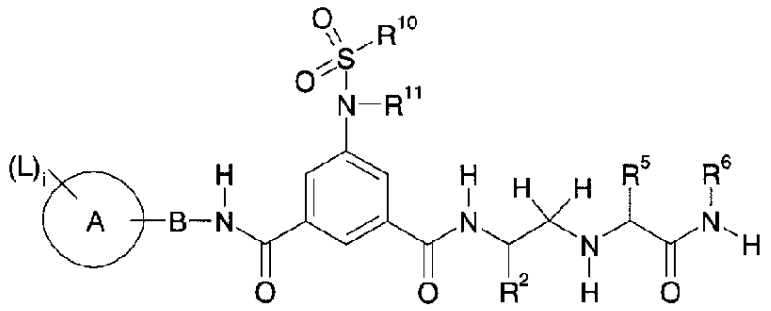
(Ia)



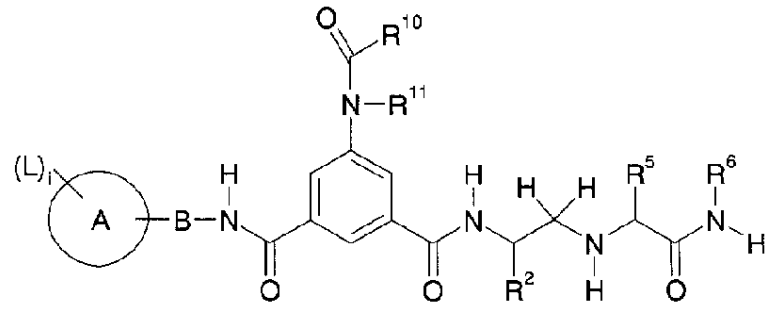
(Ib)



(Ic)



(Id)



(Ie)

（式中、A、B、L、i、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}、R^{12}及びR^{13}は、

請求項１～１７に記載の意味を有する。）
【請求項１９】
請求項１～１８のいずれか１項に記載の化合物の生理学的に許容しうる塩。
【請求項２０】
医薬としての請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物の使用。
【請求項２１】
請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物を含み、任意に、１又は２以上の不活性な担体及び/又は希釈剤を共に含有しうる医薬組成物。
【請求項２２】
β-セクレターゼインヒビター、γ-セクレターゼインヒビター、アミロイド凝集インヒビター、直接又は間接的に作用する神経保護物質、抗酸化剤、Coxインヒビター、付加的又はAβ低減特性のみ有するNSAIDs；HMG-CoAレダクターゼインヒビター、アセチルコリンエステラーゼインヒビター、NMDA受容体アンタゴニスト、AMPAアゴニスト；神経伝達物質の濃度又は放出を調節する物質、成長ホルモンの分泌を誘導する物質、CB-1受容体アンタゴニスト又はインバースアゴニスト、抗生物質、PDE-IVインヒビター、PDE-IXインヒビター、$GABA_A$インバースアゴニスト、ニコチンアゴニスト、ヒスタミンH3アンタゴニスト、5HT-4アゴニスト又は部分アゴニスト、5HT-6アンタゴニスト、a2-アドレノレセプターアンタゴニスト、ムスカリン性M1アゴニスト、ムスカリン性M2アンタゴニスト及び代謝調節型グルタミン酸-受容体5ポジティブモジュレーターの中から選択される１又は２以上の医薬的に有効な活性物質を含む、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２３】
請求項１～１９のいずれか１項に記載の少なくとも１種の化合物の、β-セクレターゼインヒビターとしての使用。
【請求項２４】
アミロイド前駆体タンパク質(APP)の異常なプロセシング又はAβペプチドの凝集と関係がある疾患又は状態の治療又は予防に適切な薬物を製造するための、請求項１～１９のいずれか１項に記載の少なくとも１種の化合物又は請求項２１又は２２の１項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項２５】
アルツハイマー病(AD)の治療又は予防用薬物を製造するための、請求項１～１９のいずれか１項に記載の少なくとも１種の化合物又は請求項２１又は２２の１項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項２６】
β-セクレターゼ活性の阻害方法であって、β-セクレターゼを阻害量の請求項１～１９のいずれか１項に記載の化合物と接触させることを特徴とする方法。