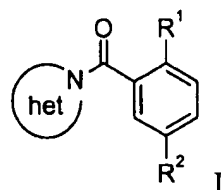
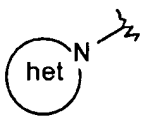


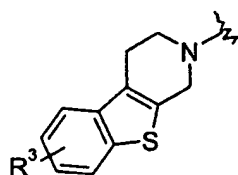
十、申請專利範圍：

1. 一種通式I之化合物：

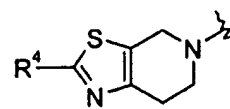


其中  為

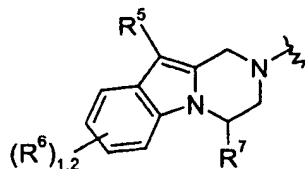
5



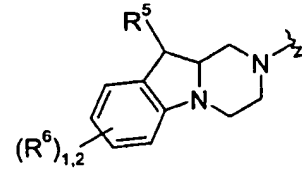
或



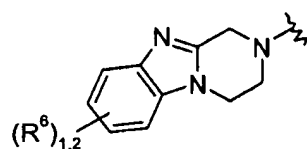
或



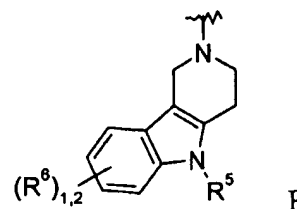
或



或



或



R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1-C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1-C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -環烷基；

R'' 為 C_1-C_7 烷基；

R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

R^3 為氫、鹵素、 C_1-C_7 烷基、 C_1-C_7 烷氧基、或經鹵素取代之 C_1-C_7 烷基；

R^4 為氫、 C_1 - C_7 烷基、經鹵素或 CF_3 取代之苯基、或為五員或六員芳族雜環；

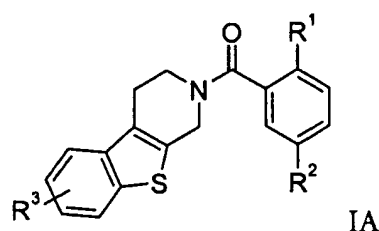
R^5/R^6 為氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或為經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或 C_1 - C_7 烷氧基；

R^7 為氫或 C_1 - C_7 烷基；

n 為0、1或2；

及醫藥活性酸加成鹽。

2. 如請求項1之化合物，其具有式IA，



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由O、N或S組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

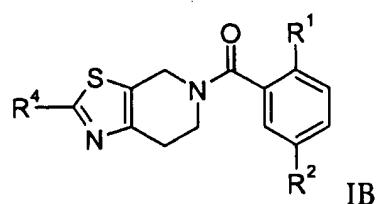
R^2 為 NO_2 、 CN 或 SO_2R'' ；

R^3 為氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基；

n 為0、1或2；

及醫藥活性酸加成鹽。

3. 如請求項1之化合物，其具有式IB，



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

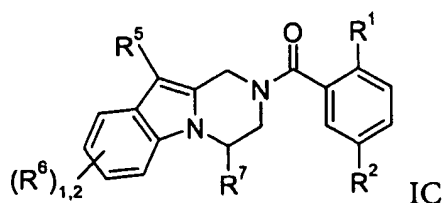
R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

R^4 為氫、 C_1 - C_7 烷基、經鹵素或 CF_3 取代之苯基、或為五員或六員芳族雜環；

n 為 0、1 或 2；

及醫藥活性酸加成鹽。

4. 如請求項 1 之化合物，其具有式 IC，



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -
環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

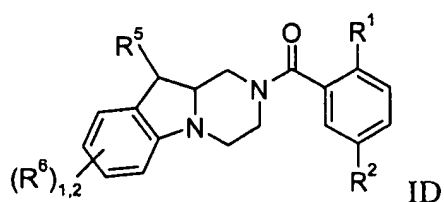
R^5/R^6 為 氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或為經鹵
素取代之 C_1 - C_7 烷基或 C_1 - C_7 烷氧基；

R^7 為 氫或 C_1 - C_7 烷基；

n 為 0、1 或 2；

及醫藥活性酸加成鹽。

5. 如請求項 1 之化合物，其具有式 ID，



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的
五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -
環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

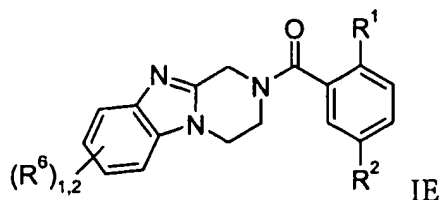
R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

R^5/R^6 為 氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或為經鹵
素取代之 C_1 - C_7 烷基或 C_1 - C_7 烷氧基；

n 為 0、1 或 2；

及醫藥活性酸加成鹽。

6. 如請求項 1 之化合物，其具有式 IE



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

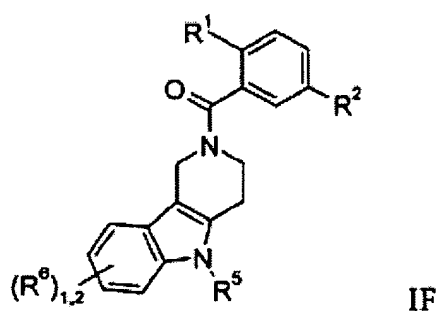
R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

R^6 為氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或為經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或 C_1 - C_7 烷氧基；

n 為 0、1 或 2；

及醫藥活性酸加成鹽。

7. 如請求項 1 之化合物，其具有式 IF，



其中：

R^1 為包含一或兩個選自由 O、N 或 S 組成之群之雜原子的五員或六員雜環，或為 OR' 或 $N(R'')_2$ ；

R' 為 C_1 - C_7 烷基、經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或為 $-(CH_2)_n$ -環烷基；

R'' 為 C_1 - C_7 烷基；

R^2 為 NO_2 、CN 或 SO_2R'' ；

R^5/R^6 為氫、鹵素、 C_1 - C_7 烷基、 C_1 - C_7 烷氧基、或為經鹵素取代之 C_1 - C_7 烷基或 C_1 - C_7 烷氧基；

n 為 0、1 或 2；

及醫藥活性酸加成鹽。

8. 如請求項 2 之化合物，其中式 IA 之化合物為

(6-氯-3,4-二氫-1H-苯并[4,5]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-基)-(2-異丙氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-甲酮、

(6-氯-3,4-二氫-1H-苯并[4,5]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-基)-(5-甲烷磺醯基-2-嗎啉基-4-基-苯基)-甲酮、

3-(6-氯-3,4-二氫-1H-苯并[4,5]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-羰基)-4-異丙氧基-苯并腈、

(6-氯-3,4-二氫-1H-苯并[4,5]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-

基)-(2-環丙基甲氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-甲酮或

(6-氯-3,4-二氫-1H-苯并[4,5]噻吩并[2,3-c]吡啶-2-基)-[5-甲烷磺醯基-2-((S)-2,2,2-三氟-1-甲基-乙氧基)-苯基]-甲酮。

9. 如請求項3之化合物，其中式IB之化合物為

(2-異丁氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-(2-噻吩-2-基-6,7-二氫-4H-噻唑并[5,4-c]吡啶-5-基)-甲酮、

(2-異丙氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-(2-噻吩-2-基-6,7-二氫-4H-噻唑并[5,4-c]吡啶-5-基)-甲酮或

(2-異丁氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-[2-(4-三氟甲基-苯基)-6,7-二氫-4H-噻唑并[5,4-c]吡啶-5-基]-甲酮。

10. 如請求項4之化合物，其中式IC之化合物為

(7-氯-3,4-二氫-1H-吡嗪并[1,2-a]吡啶-2-基)-(2-異丙氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-甲酮或

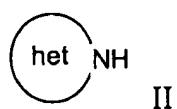
(2-異丙氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-(8-三氟甲氧基-3,4-二氫-1H-吡嗪并[1,2-a]吡啶-2-基)-甲酮。

11. 如請求項5之化合物，其中式ID之化合物為外消旋-(2-異丙氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-(8-三氟甲氧基-3,4,10,10a-四氫-1H-吡嗪并[1,2-a]吡啶-2-基)-甲酮。

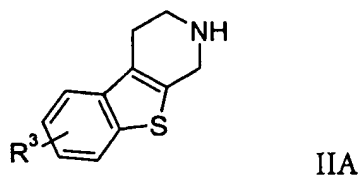
12. 如請求項6之化合物，其中式IE之化合物為(2-環戊氧基-5-甲烷磺醯基-苯基)-(3,4-二氫-1H-苯并[4,5]咪唑并[1,2-a]吡嗪-2-基)-甲酮。

13. 一種製備如請求項1之通式I之化合物的方法，該方法包含：

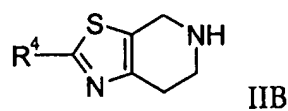
a)將選自由



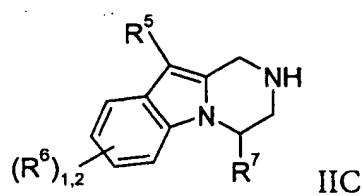
組成之群之式



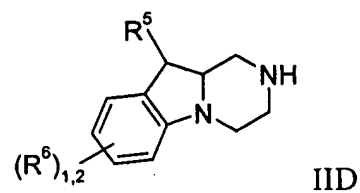
或



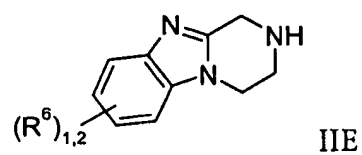
或



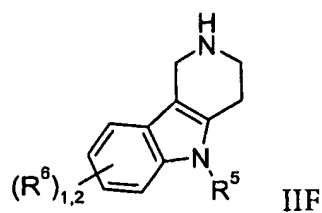
或



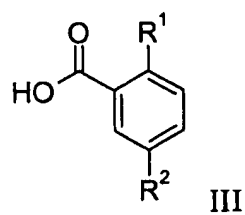
或



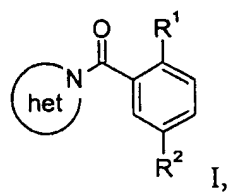
或



之化合物與式

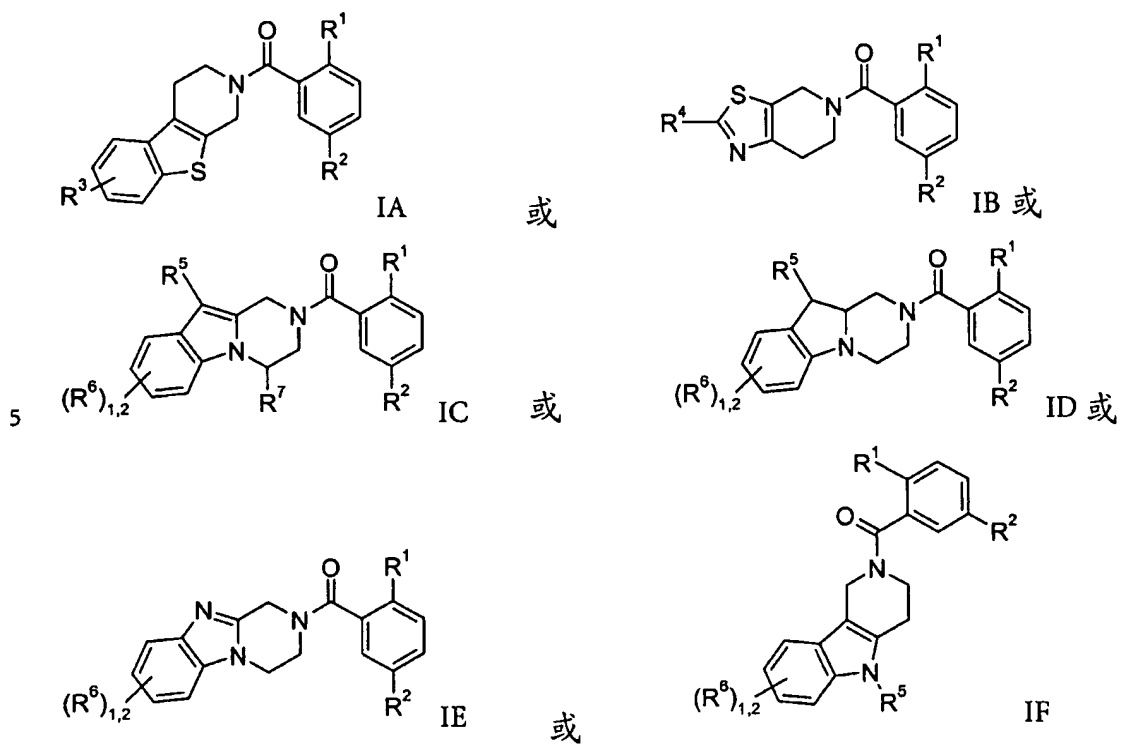


之化合物於一諸如 TBTU 之活化劑存在下反應成式



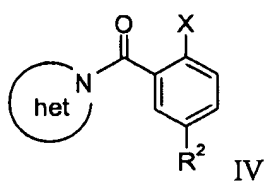
之化合物，

其中視  而定，式I包含以下結構：

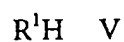


其中該等取代基如請求項1中之定義，或

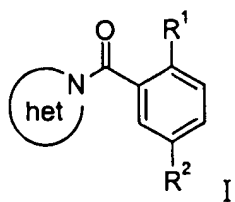
b)將式



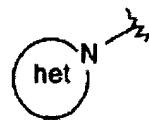
之化合物與式



之化合物於一諸如三乙胺之鹼或一如Cu(I)Br之催化劑存在下反應成式



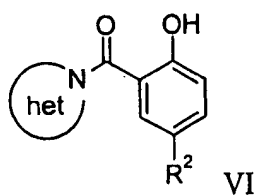
之化合物，其中該等取代基 R^1 、 R^2 及



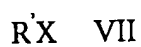
如請求項 1 中

之定義，且 X 為鹵素，或

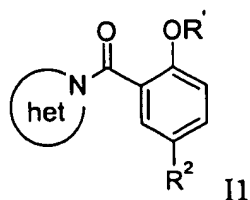
c) 式



之化合物與式

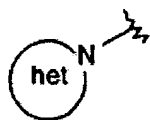


之化合物反應成式



之化合物，

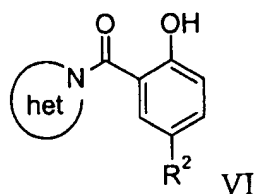
其中該等取代基 R^2 、 R^1 及



如請求項 1 中之定義，且

X 為鹵素，或

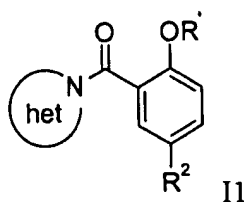
d) 式



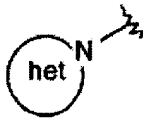
之化合物與式



之化合物於 Mitsunobu 條件下反應成式



之化合物，

其中該等取代基 R^2 、 R' 及  如上述之定義，且若需要，則將該等獲得之化合物轉化為醫藥學上可接受之酸加成鹽。

14. 如請求項 1 至 12 中任一項之化合物，其藉由如請求項 13 之方法隨時製備。
15. 一種用於治療關於經由 GlyT-1 抑制作用活化 NMDA 受體之疾病的醫藥組合物，其含有一或多種如請求項 1 至 12 中任一項之化合物及醫藥學上可接受之賦形劑，其中該疾病係選自由精神病、記憶及學習中之機能失調、精神分裂症、癡呆及認知過程受損之其他疾病、注意力不足症及阿茲海默氏病所組成之群。
16. 如請求項 15 之醫藥組合物，其係用於治療阿茲海默氏

(Alzheimer)病。

17. 一種如請求項1至12中任一項之化合物之用途，其係用於製造用於治療阿茲海默氏病之藥品。