

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-514330(P2005-514330A)

【公表日】平成17年5月19日(2005.5.19)

【年通号数】公開・登録公報2005-019

【出願番号】特願2003-530659(P2003-530659)

【国際特許分類】

| | |
|-----------------|-----------|
| C 0 7 C 233/66 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/166 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/40 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4015 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4045 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/415 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4184 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4196 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4439 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/45 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4709 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/498 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/538 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/5415 | (2006.01) |
| A 6 1 P 9/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/28 | (2006.01) |
| A 6 1 P 43/00 | (2006.01) |
| C 0 7 C 233/73 | (2006.01) |
| C 0 7 D 207/27 | (2006.01) |
| C 0 7 D 207/335 | (2006.01) |
| C 0 7 D 209/14 | (2006.01) |
| C 0 7 D 209/42 | (2006.01) |
| C 0 7 D 211/76 | (2006.01) |
| C 0 7 D 231/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D 233/64 | (2006.01) |
| C 0 7 D 235/14 | (2006.01) |
| C 0 7 D 249/08 | (2006.01) |
| C 0 7 D 401/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D 403/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D 413/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D 413/14 | (2006.01) |
| C 0 7 D 417/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D 417/14 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|-----------------|-------|
| C 0 7 C 233/66 | C S P |
| A 6 1 K 31/166 | |
| A 6 1 K 31/40 | |
| A 6 1 K 31/4015 | |
| A 6 1 K 31/4045 | |
| A 6 1 K 31/415 | |

A 6 1 K 31/4184
 A 6 1 K 31/4196
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/45
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 K 31/498
 A 6 1 K 31/538
 A 6 1 K 31/5415
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 C 233/73
 C 0 7 D 207/27
 C 0 7 D 207/335
 C 0 7 D 209/14
 C 0 7 D 209/42
 C 0 7 D 211/76
 C 0 7 D 231/12 E
 C 0 7 D 233/64 1 0 5
 C 0 7 D 235/14
 C 0 7 D 249/08 5 2 8
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 413/04
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 417/04
 C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月14日(2005.9.14)

【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

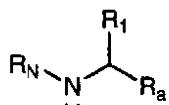
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式Iの化合物又は薬剤として許容可能なその塩：

【化1】



(I)

[式中、R₁は、-(CH₂)_{1~2}-S(=O)_{0~2}-(C_{1~6}アルキル)、あるいは

ハロゲン、-OH、=O、-SH、-C≡N、-CF₃、-C_{1~3}アルコキシ、ア

モノもしくはジアルキルアミノ、-N(R)C(O)R'、-OC(=O)-アミノ、及び-OC(=O)-モノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によって任意選択で置換されているC₁~C₁₀アルキル、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C₆N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₂～C₆アルケニル又はC₂～C₆アルキニル、あるいは

アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール- (C₁ ~ C₆) アルキル-、ヘテロアリール- (C₁ ~ C₆) アルキル-、又はヘテロシクリル- (C₁ ~ C₆) アルキル- であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-NO₂、-NR₁₀₅R₁₀₅、-CO₂R、-N(R)COR'、-N(R)SO₂R'、-C(=O)- (C₁ ~ C₄) アルキル、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノアルキルアミノ、-SO₂-ジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)-モノアルキルアミノ、-C(=O)-ジアルキルアミノ、-SO₂- (C₁ ~ C₄) アルキル、

ハロゲンから独立に選択される 1、2、もしくは 3 個の基によって任意選択で置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、C₁~C₃アルコキシ、アミノ、-C₁~C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₃~C₇シクロアルキル、

ハロゲン、-OH、-SH、-C₆H₅、-CF₃、-C₁~C₃アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C₁~C₃アルキルから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁~C₁₀アルキル、及び

ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₂～C₁₀アルケニルもしくはC₂～C₁₀アルキニル

から独立に選択される 1、2、3、又は 4 個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、ヘテロアリール - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、又はヘテロシクリル - (C₁ ~ C₆) アルキル - であり (該ヘテロシクリル基は、さらに、任意選択でオキソによって置換されている) :

R 及び R' は、独立に、水素、C₁ ~ C₁₀ アルキル、C₁ ~ C₁₀ アルキルアリール、又はC₁ ~ C₁₀ アルキルヘテロアリールであり；

R_N は、

R'_{100} , $-SO_2R'_{100}$, $-(CRR')_{1-6}R'_{100}$, $-C(=O)-(CRR')_{0-6}R_{100}$, $-C(=O)-(CRR')_{1-6}O-R'_{100}$, $-C(=O)-(CRR')_{1-6}S-R'_{100}$, $-C(=O)-(CRR')_{1-6}C(=O)-R_{100}$, $-C(=O)-(CRR')_{1-6}SO_2-R_{100}$ 又は $-C(=O)-(CRR')_{1-6}NR_{100}-R'_{100}$;

であり、

R_{100} 及び R_{-100} は、独立に、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-アリール-W-アリール、-アリール-W-ヘテロアリール、-アリール-W-ヘテロシクリル、-ヘテロアリール-W-アリール、ヘテロアリール-W-ヘテロアリール、-ヘテロアリール-W-ヘテロシクリル、-ヘテロシクリル-W-アリール、-ヘテロシクリル-W-ヘテロアリール、-ヘテロシクリル-W-ヘテロシクリル、-O-R₁₅₀] - (CH₂)_{0~2}-アリール、-CH[(CH₂)_{0~2}-O-R₁₅₀] - (CH₂)_{0~2}-ヘテロシクリル、又は-CH[(CH₂)_{0~2}-O-R₁₅₀] - (CH₂)_{0~2}-ヘテロアリールであって、それぞれの環部分が、

$-OR$, $-NO_2$, C_1-C_6 アルキル, ハロゲン, $-C\equiv N$, $-OCF_3$, $-CF_3$, $-(CH_2)_0-$
 $4-O-P(=O)(OR)(OR')$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{105}R'_{105}$, $-(CH_2)_{0-4}-O-$
 $(CH_2)_{0-4}-CONR_{102}R_{102}'$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}$ アルキル), $-(CH_2)_{0-4}-$
 $CO-(C_2-C_{12}$ アルケニル), $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ アルキニル),
 $-(CH_2)_{0-4}-CO-(CH_2)_{0-4}(C_3-C_7$ シクロアルキル), $-(CH_2)_{0-4}-R_{110}$,
 $-(CH_2)_{0-4}-R_{120}$, $-(CH_2)_{0-4}-R_{130}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{110}$, $-(CH_2)_{0-4}-$
 $CO-R_{120}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{130}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{140}$, $-(CH_2)_{0-4}-CO-$
 $O-R_{150}$, $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{105}R'_{105}$, $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8$
 アルキル), $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}$ アルキル), $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-$
 $(CH_2)_{0-4}-(C_3-C_7$ シクロアルキル), $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{150})-CO-O-R_{150}$,
 $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{150})-CO-N(R_{150})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{150})-CS-$
 $N(R_{150})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{150})-CO-R_{105}$, $-(CH_2)_{0-4}-NR_{105}R'_{105}$,
 $-(CH_2)_{0-4}-R_{140}$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{0-4}-O-$
 $P(O)-(O-R_{110})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{150})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-$
 $N(R_{150})_2$, $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{150})$, $-(CH_2)_{0-4}-O-R_{150}'-COOH$, $-(CH_2)_{0-4}-$
 $S-(R_{150})$, $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{150})-SO_2-R_{105}$, $-(CH_2)_{0-4}-$
 C_3-C_7 シクロアルキル, (C_2-C_{10}) アルケニル, 及び (C_2-C_{10}) アルキニル

から独立に選択される 1、2、又は 3 個の基によって任意選択で置換されているものを表し、あるいは

R_{1-0-0} は、1、2、又は 3 個の R_{1-1-5} 基によって任意選択で置換されている $C_1 \sim C_{1-0}$ アルキルであり、あるいは

R_{1-0-0} は、1、2、又は 3 個の R_{1-1-5} 基によってそれが任意選択で置換されている $- (C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) 又は $- (C_1 \sim C_6$ アルキル) - S - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) であり、あるいは

R_{1-0-0} は、1、2、又は 3 個の R_{1-1-5} 基によって任意選択で置換されている $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

W は、 $- (CH_2)_{0-4}-$ 、 $-O-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-N(R_{1-3-5})-$ 、 $-CR(OH)-$ 、又は $-C(O)-$ であり；

R_{1-0-2} 及び R_{1-0-2}' は、独立に、水素、又は

独立にハロゲン、アリール、もしくは $-R_{1-1-0}$ である 1、2、もしくは 3 個の基によって任意選択で置換されている $C_1 \sim C_{1-0}$ アルキルであり；

R_{1-0-5} 及び $R_{1-1-0-5}$ は、独立に、 $-H$ 、 $-R_{1-1-0}$ 、 $-R_{1-2-0}$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $- (C_1 \sim C_2$ アルキル) - ($C_3 \sim C_7$ シクロアルキル)、 $- (C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - ($C_1 \sim C_3$ アルキル)、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、又は 1 個の二重結合及び 1 個の三重結合を有する $C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、又は $-O$ H もしくは $-NH_2$ によって任意選択で置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、又はハロゲンから独立に選択される 1、2、もしくは 3 個の基によって任意選択で置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、あるいは

R_{1-0-5} 及び $R_{1-1-0-5}$ は、それが結合している元素と一緒にになって、3 ~ 7 員炭素環

であって、1員が、任意選択で、-O-、-S(O)_{0~2}-、-N(R_{1~5})-から選択されたヘテロ原子であり、前記環が、独立に選択される1、2、又は3個のR_{1~4}基によって任意選択で置換された環であり；

R_{1~5}は、出現するごとに、独立にハロゲン、-OH、-CO₂R_{1~0~2}、-C_{1~C₆}チオアルコキシ、-CO₂-フェニル、-NR_{1~0~5}R_{1~3~5}、-SO₂-(C_{1~C₈}アルキル)、-C(=O)R_{1~8~0}、R_{1~8~0}、-CONR_{1~0~5}R_{1~1~0~5}、-SO₂NR_{1~0~5}R_{1~1~0~5}、-NH-CO-(C_{1~C₆}アルキル)、-NH-C(=O)-OH、-NH-C(=O)-OR、-NH-C(=O)-O-フェニル、-O-C(=O)-C_{1~C₆}アルキル)、-O-C(=O)-アミノ、-O-C(=O)-モノもしくはジアルキルアミノ、-O-C(=O)-フェニル、-O-(C_{1~C₆}アルキル)-CO₂H、-NH-SO₂-(C_{1~C₆}アルキル)、C_{1~C₆}アルコキシ、又はC_{1~C₆}ハロアルコキシであり；

R_{1~3~5}は、C_{1~C₆}アルキル、C_{2~C₆}アルケニル、C_{2~C₆}アルキニル、C_{3~C₇}シクロアルキル、-(CH₂)_{0~2}-(アリール)、-(CH₂)_{0~2}-(ヘテロアリール)、又は-(CH₂)_{0~2}-(ヘテロシクリル)であり；

R_{1~4~0}は、C_{1~C₆}アルキル、C_{1~C₆}アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、モノ(C_{1~C₆})アルキルアミノ、ジ(C_{1~C₆})アルキルアミノ、C_{2~C₆}アルケニル、C_{2~C₆}アルキニル、C_{1~C₆}ハロアルキル、C_{1~C₆}ハロアルコキシ、アミノ(C_{1~C₆})アルキル、モノ(C_{1~C₆})アルキルアミノ(C_{1~C₆})アルキル、ジ(C_{1~C₆})アルキルアミノ(C_{1~C₆})アルキル、及び=Oから独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されているヘテロシクリルであり；

R_{1~5~0}は、水素、C_{3~C₇}シクロアルキル、-(C_{1~C₂}アルキル)-(C_{3~C₇}シクロアルキル)、C_{2~C₆}アルケニル、C_{2~C₆}アルキニル、1個の二重結合及び1個の三重結合を有するC_{1~C₆}アルキル、-R_{1~1~0}、-R_{1~2~0}；又は-OH、-NH₂、C_{1~C₃}アルコキシ、R_{1~1~0}、及びハロゲンから独立に選択される1、2、3、もしくは4個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₆}アルキルであり；

R_{1~5~0'}は、C_{3~C₇}シクロアルキル、-(C_{1~C₃}アルキル)-(C_{3~C₇}シクロアルキル)、C_{2~C₆}アルケニル、C_{2~C₆}アルキニル、1個の二重結合及び1個の三重結合を有するC_{1~C₆}アルキル、-R_{1~1~0}、-R_{1~2~0}；又は-OH、-NH₂、C_{1~C₃}アルコキシ、R_{1~1~0}、及びハロゲンから独立に選択される1、2、3、もしくは4個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₆}アルキルであり；

R_{1~8~0}は、それぞれ、C_{1~C₆}アルキル、C_{1~C₆}アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、モノ(C_{1~C₆})アルキルアミノ、ジ(C_{1~C₆})アルキルアミノ、C_{2~C₆}アルケニル、C_{2~C₆}アルキニル、C_{1~C₆}ハロアルキル、C_{1~C₆}ハロアルコキシ、アミノ(C_{1~C₆})アルキル、モノ(C_{1~C₆})アルキルアミノ(C_{1~C₆})アルキル、及び=Oから独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピベリジニル、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-O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、及びピロリジニルから選択され；

R_{1~1~0}は、1又は2個のR_{1~2~5}基によって任意選択で置換されているアリールであり；

R_{1~2~5}は、出現するごとに、独立にハロゲン、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-OH、-C-N、-SO₂-NH₂、-SO₂-NH-C_{1~C₆}アルキル、-SO₂-N(C_{1~C₆}アルキル)₂、-SO₂-(C_{1~C₄}アルキル)、-CO-NH₂、-CO-NH-C_{1~C₆}アルキル、又は-CO-N(C_{1~C₆}アルキル)₂、あるいは

C_{1~C₃}アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、C_{1~C₃}ア

ルコキシ、アミノ、及びモノ及びジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、又はC₂～C₆アルキニル、あるいは

1個、2個、もしくは3個のハロゲンによって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシであり；

R₁₂₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロアリールであり；

R₁₃₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロシクリルであり；

R_aは、水素、ヒドロキシメチル、又は-CH(OH)CH₂CH₂R₂(R₂は、R₁₂₀又はR₁₃₀である)を表す]。

【請求項2】

R₁が、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-NO₂、-NR₁₀₅R₁₀₅、-CO₂R、-N(R)COR'もしくは-N(R)SO₂R'、-C(=O)-(C₁～C₄)アルキル、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノもしくはジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)-モノもしくはジアルキルアミノ、-SO₂-(C₁～C₄)アルキル、あるいは

ハロゲンから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシ、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、-C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₃～C₇シクロアルキル、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、-C₁～C₃アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C₁～C₃アルキルから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₁₀アルキル、あるいは
ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれが任意選択で置換されているC₂～C₁₀アルケニルもしくはC₂～C₁₀アルキニル

から独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-である(該ヘテロシクリル基は、任意選択でさらにオキソによって置換されている)、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R_Nは、-C(=O)-(CRR')_{0～6}R₁₀₀であり；

R₁₀₀は、それぞれの環部分が、

$-\text{OR}$, $-\text{NO}_2$, $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル, ハロゲン, $-\text{C}\equiv\text{N}$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_0\text{-}$
 $4\text{-O-P(=O)(OR)(OR')}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-NR}_{105}\text{R'}_{105}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-}$
 $(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CONR}_{102}\text{R}_{102'}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-(C}_1\text{-C}_{12}\text{ アルキル)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-(C}_2\text{-C}_{12}\text{ アルケニル)}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-(CH}_2)_{0\sim 4}(\text{C}_3\text{-C}_7\text{ シクロアルキル)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-R}_{110}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-R}_{120}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-R}_{130}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-R}_{110}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-R}_{120}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-R}_{130}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-R}_{140}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-CO-O-R}_{150}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-SO}_2\text{-NR}_{105}\text{R'}_{105}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-SO-(C}_1\text{-C}_8\text{ アルキル)}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-SO-(C}_1\text{-C}_{12}\text{ アルキル)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-SO}_2\text{-}$
 $(\text{CH}_2)_{0\sim 4}(\text{C}_3\text{-C}_7\text{ シクロアルキル)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-N(R}_{150}\text{)-CO-O-R}_{150}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-N(R}_{150}\text{)-CO-N(R}_{150}\text{)}_2$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-N(R}_{150}\text{)-CS-}$
 $\text{N(R}_{150}\text{)}_2$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-N(R}_{150}\text{)-CO-R}_{105}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-NR}_{105}\text{R'}_{105}$,
 $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-R}_{140}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-CO-(C}_1\text{-C}_6\text{ アルキル)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-}$
 $\text{P(O)-(O-R}_{110}\text{)}_2$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-CO-N(R}_{150}\text{)}_2$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-CS-}$
 $\text{N(R}_{150}\text{)}_2$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-(R}_{150}\text{)}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-O-R}_{150'}\text{-COOH}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-S-}$
 (R_{150}) , $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-N(R}_{150}\text{)-SO}_2\text{-R}_{105}$, $-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}\text{-}$
 $\text{C}_3\text{-C}_7\text{ シクロアルキル}$, $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ アルケニル, 又は $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ アルキニル,

から独立に選択される 1、2、又は 3 個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-アリール-W-アリール、-アリール-W-ヘテロアリール、-アリール-W-ヘテロシクリル、-ヘテロアリール-W-アリール、-ヘテロアリール-W-ヘテロアリール、-ヘテロアリール-W-ヘテロシクリル、-ヘテロシクリル-W-アリール、-ヘテロシクリル-W-ヘテロアリール、-ヘテロシクリル-W-ヘテロシクリル、-CH[$(\text{CH}_2)_{0\sim 2}\text{-O-R}_{150}$]- $(\text{CH}_2)_{0\sim 2}$ -アリール、-CH[$(\text{CH}_2)_{0\sim 2}\text{-O-R}_{150}$]- $(\text{CH}_2)_{0\sim 2}$ -ヘテロシクリル、又は-CH[$(\text{CH}_2)_{0\sim 2}\text{-O-R}_{150}$]- $(\text{CH}_2)_{0\sim 2}$ -ヘテロアリールを表し；あるいは

R_{100} は、1、2、又は 3 個の R_{115} 基によって任意選択で置換されている $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキルであり、あるいは

R_{100} は、1、2、又は 3 個の R_{115} 基によってそれが任意選択で置換されている $-(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{ アルキル})\text{-O-}(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{ アルキル})$ 又は $-(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{ アルキル})\text{-S-}(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{ アルキル})$ であり、あるいは

R_{100} は、1、2、又は 3 個の R_{115} 基によって任意選択で置換されている $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ シクロアルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_N が、-C(=O)- R_{100} であり；

R_{100} が、それぞれの環部分が、

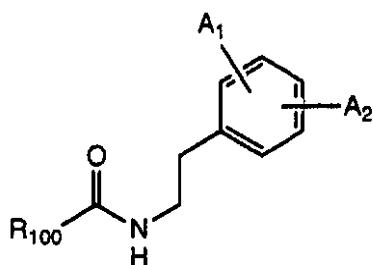
-OR, -NO₂, C₁-C₆ アルキル, ハロゲン, -C≡N, -OCF₃, -CF₃, -(CH₂)₀₋₄-O-P(=O)(OR)(OR'), -(CH₂)₀₋₄-CO-NR₁₀₅R'₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-O-(CH₂)₀₋₄-CONR₁₀₂R'₁₀₂, -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₁₂ アルキル), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂ アルケニル), -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂ アルキニル), -(CH₂)₀₋₄-CO-(CH₂)₀₋₄(C₃-C₇ シクロアルキル), -(CH₂)₀₋₄-R₁₁₀, -(CH₂)₀₋₄-R₁₂₀, -(CH₂)₀₋₄-R₁₃₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₁₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₂₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₃₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁₄₀, -(CH₂)₀₋₄-CO-O-R₁₅₀, -(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR₁₀₅R'₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-SO-(C₁-C₈ アルキル), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₁₂ アルキル), -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(CH₂)₀₋₄(C₃-C₇ シクロアルキル), -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CO-O-R₁₅₀, -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CO-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CS-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-CO-R₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-NR₁₀₅R'₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-R₁₄₀, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-(C₁-C₆ アルキル), -(CH₂)₀₋₄-O-P(O)-(O-R₁₁₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CO-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-CS-N(R₁₅₀)₂, -(CH₂)₀₋₄-O-(R₁₅₀), -(CH₂)₀₋₄-O-R₁₅₀'-COOH, -(CH₂)₀₋₄-S-(R₁₅₀), -(CH₂)₀₋₄-N(R₁₅₀)-SO₂-R₁₀₅, -(CH₂)₀₋₄-C₃-C₇ シクロアルキル, (C₂-C₁₀) アルケニル, 又は (C₂-C₁₀) アルキニル.

から独立に選択される 1、2、又は 3 個の基によって任意選択で置換されているアリール又はヘテロアリールを表す、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

次式 I - 3 - b の請求項 4 に記載の化合物：

【化 2】



I-3-b

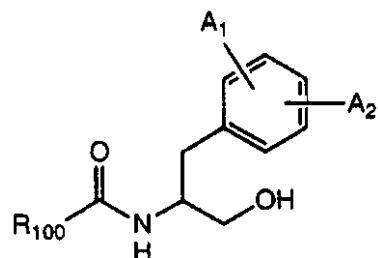
[式中、

A₁ 及び A₂ は、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルコキシ、ヒドロキシ、-NO₂、及びハロゲン、OH、SH、NH₂、NH(C₁ ~ C₆ アルキル)、N-(C₁ ~ C₆ アルキル)(C₁ ~ C₆ アルキル)、C≡N、CF₃ から独立に選択される 1、2、又は 3 個の置換基によって任意選択で置換されている C₁ ~ C₄ アルキルから独立に選択される]。

【請求項 6】

次式 I - 4 - b の請求項 4 に記載の化合物：

【化 3】



I-4-b

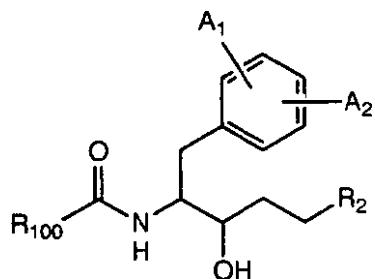
[式中、

A_1 及び A_2 は、ハロゲン、 C_1 ~ C_4 アルコキシ、ヒドロキシ、 $-NO_2$ 、及びハロゲン、 OH 、 SH 、 NH_2 、 NH (C_1 ~ C_6 アルキル)、 $N-(C_1$ ~ C_6 アルキル) (C_1 ~ C_6 アルキル)、 CN 、 CF_3 から独立に選択される 1、2、又は 3 個の置換基によって任意選択で置換されている C_1 ~ C_4 アルキルから独立に選択される]。

【請求項 7】

次式 I - 5 - b の請求項 4 に記載の化合物：

【化 4】



I-5-b

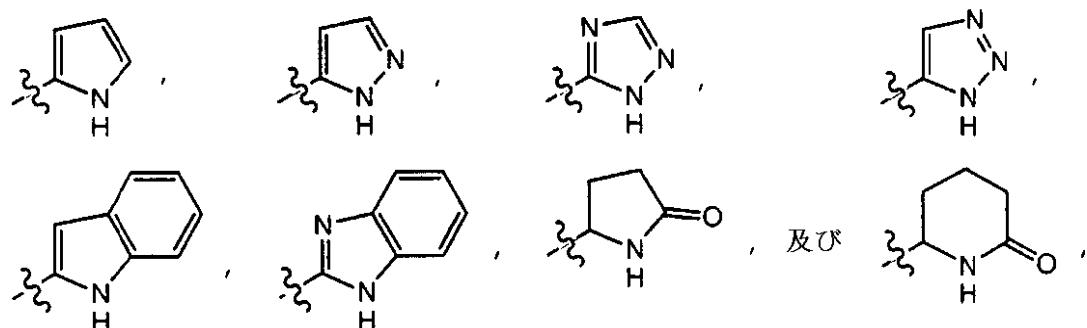
[式中、

A_1 及び A_2 は、ハロゲン、 C_1 ~ C_4 アルコキシ、ヒドロキシ、 $-NO_2$ 、及びハロゲン、 OH 、 SH 、 NH_2 、 NH (C_1 ~ C_6 アルキル)、 $N-(C_1$ ~ C_6 アルキル) (C_1 ~ C_6 アルキル)、 CN 、 CF_3 から独立に選択される 1、2、又は 3 個の置換基によって任意選択で置換されている C_1 ~ C_4 アルキルから独立に選択される]。

【請求項 8】

R₂ が、次式からなる群から選択される、請求項 7 に記載の化合物：

【化 5 】



[式中、各環は、1又は2個のR_{1,2,5}基によって任意選択で置換される]。

【請求項9】

N' - [(1S) - 1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピル - イソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - ピロール - 2 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - ピラゾール - 5 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - インドール - 2 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [4 - (1H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) - 1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (5 - オキソピロリジン - 2 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N' - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (6 - オキソピペリジン - 2 - イル) プチル] - 5 - メチル - N, N -ジプロピルイソフタルアミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - ピロール - 2 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - ピラゾール - 5 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - インドール - 2 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [4 - (1H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) - 1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシブチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (5 - オキソピロリジン - 2 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N³ - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (6 - オキソピペリジン - 2 - イル) プチル] - N¹, N¹ -ジプロピルベンゼン - 1, 3, 5 - トリカルボキサミド、
 N - [1 - (3, 5 -ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1H - ピロール - 2 - イル) プチル] - 2 - (ジプロピルアミノ) - 6 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) イソニコチンアミド、

H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イル) ブチル] - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) ブチル] - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - インドール - 2 - イル) ブチル] - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 1 ,
 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 N - [4 - (1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロベン
 ジル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 4 - ブチル - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル
) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (5
 - オキソピロリジン - 2 - イル) ブチル] - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) -
 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (6
 - オキソピペリジン - 2 - イル) ブチル] - 8 - (1 , 3 - オキサゾール - 2 - イル) -
 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - ピロール - 2 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - ピラゾール - 5 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキ
 サミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキ
 サミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (1
 H - インドール - 2 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 N - (4 - (1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロベン
 ジル) - 2 - ヒドロキシブチル] - 1 - ブチル - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (5
 - オキソピロリジン - 2 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - (6
 - オキソピペリジン - 2 - イル) ブチル] - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 1 H - インドール
 - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 8 - (1 , 3 - オ
 キサゾール - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサ
 ミド、
 4 - ブチル - N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 8 - (1 , 3 - オ
 キサゾール - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カ
 ルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 8 - (1 , 3 - オ
 キサゾール - 2 - イル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンズオキサジン - 6 - カ
 ルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 5 - (1 , 3 - オ
 キサゾール - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 7 - カルボキサミド
 、
 N - [2 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) エチル] - 2 - (ジプロピルアミノ) - 6

- (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) イソニコチニアミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] -
 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] -
 8 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン
 - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] -
 8 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチ
 アジン - 6 - カルボキサミド、
 4 - ブチル - N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] -
 8 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾオ
 キサジン - 6 - カルボキサミド、
 1 - ブチル - N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] -
 5 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 7
 - カルボキサミド、及び
 N - [1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 2 - ヒドロキシエチル] - 2 - (ジプロ
 ピルアミノ) - 6 - (1, 3 - オキサゾール - 2 - イル) イソニコチニアミドからなる群
 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩を含む、アルツハイマー病、軽度認知障害、ダウン症候群、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血、脳アミロイド血管障害、他の変性痴呆、血管性変性混合型痴呆、パーキンソン病に随伴する痴呆、進行性核上麻痺に随伴する痴呆、皮質基底核変性症に随伴する痴呆、又はびまん性レビー小体型アルツハイマー病を治療又は予防するための、医薬組成物。

【請求項 11】

前記患者がヒトである請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記疾患が痴呆である請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩の、医薬を製造するための使用。

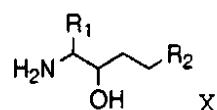
【請求項 14】

アルツハイマー病、軽度認知障害、ダウン症候群、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血、脳アミロイド血管障害、他の変性痴呆、血管性変性混合型痴呆、パーキンソン病に随伴する痴呆、進行性核上麻痺に随伴する痴呆、皮質基底核変性症に随伴する痴呆、又はびまん性レビー小体型アルツハイマー病の治療又は予防に使用する医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物又はその塩の使用。

【請求項 15】

次式 X の化合物：

【化 6】



[式中、

R₁ は、 - (C H₂)_{1 ~ 2} - S (O)_{0 ~ 2} - (C_{1 ~ C₆} アルキル)、あるいはハロゲン、- OH、= O、- SH、- C N、- CF₃、- C_{1 ~ C₃} アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、- N (R) C (O) R' - 、- O C (= O) - アミノ、及び- O C (= O) - モノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される 1、2 又は 3 個の基によって任意選択で置換されている C_{1 ~ C₁₀} アルキル、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によってそれが任意選択で置換されている、C₂～C₆アルケニル又はC₂～C₆アルキニル、あるいは

アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-NO₂、-NR₁₀₅R₁₀₅、-CO₂R、-N(R)COR'、-N(R)SO₂R'、-C(=O)-(C₁～C₄)アルキル、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノアルキルアミノ、-SO₂-ジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)モノアルキルアミノ、-C(=O)-ジアルキルアミノ、-SO₂-(C₁～C₄)アルキル、

ハロゲンから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシ、

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、-C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₃～C₇シクロアルキル、

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、-C₁～C₃アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C₁～C₃アルキルから独立に選択される1、2、又は3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₁₀アルキル、及び

ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれが任意選択で置換されているC₂～C₁₀アルケニルもしくはC₂～C₁₀アルキニル

から独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-であり（該ヘテロシクリル基は、任意選択でオキソによってさらに置換されている）；

R及びR'は、独立に、水素、C₁～C₁₀アルキル、C₁～C₁₀アルキルアリール、又はC₁～C₁₀アルキルヘテロアリールであり；

R₂は、R₁₂₀又はR₁₃₀であり；

R₁₂₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロアリールであり；

R₁₃₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロシクリルであり；

R₁₂₅は、出現するごとに、独立にハロゲン、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-OH、-C N、-SO₂-NH₂、-SO₂-NH-C₁～C₆アルキル、-SO₂-N(C₁～C₆アルキル)₂、-SO₂-(C₁～C₄アルキル)、-CO-NH₂、-CO-NH-C₁～C₆アルキル、又は-CO-N(C₁～C₆アルキル)₂、あるいは

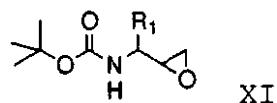
C₁～C₃アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、モノ及びジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれが任意選択で置換されているC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、もしくはC₂～C₆アルキニル、あるいは

1個、2個、もしくは3個のハロゲンによって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシである】。

【請求項16】

次式X Iの化合物：

【化7】



[式中、R₁は、-(CH₂)_{1~2}-S(=O)_{0~2}-(C_{1~C₆}アルキル)、あるいは

ハロゲン、-OH、=O、-SH、-C=N、-CF₃、-C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-N(R)C(=O)R'、-OC(=O)-アミノ、及び-OC(=O)-モノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₁₀}アルキル、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C=N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC_{2~C₆}アルケニル又はC_{2~C₆}アルキニル、あるいは

アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C_{1~C₆}アルキル)、ヘテロアリール-(C_{1~C₆}アルキル)、又はヘテロシクリル-(C_{1~C₆}アルキル)であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C=N、-NO₂、-NR_{1~5}R_{2~5}、-CO₂R、-N(R)COR'、-N(R)SO₂R'、-C(=O)-(C_{1~C₄}アルキル)、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノアルキルアミノ、-SO₂-ジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)-モノアルキルアミノ、-C(=O)-ジアルキルアミノ、-SO₂-(C_{1~C₄}アルキル)、

ハロゲンから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₆}アルコキシ、

ハロゲン、-OH、-SH、-C=N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、-C_{1~C₆}アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{3~C₇}シクロアルキル、

ハロゲン、-OH、-SH、-C=N、-CF₃、-C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C_{1~C₃}アルキルから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₁₀}アルキル、及び

ハロゲン、-OH、-SH、-C=N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、C_{1~C₆}アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC_{2~C₁₀}アルケニルもしくはC_{2~C₁₀}アルキニル

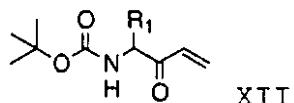
から独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C_{1~C₆}アルキル)、ヘテロアリール-(C_{1~C₆}アルキル)、又はヘテロシクリル-(C_{1~C₆}アルキル)であり(該ヘテロシクリル基は、任意選択で、さらにオキソによって置換されている)；

R及びR'は、独立に、水素、C_{1~C₁₀}アルキル、C_{1~C₁₀}アルキルアリール、又はC_{1~C₁₀}アルキルヘテロアリールである]。

【請求項17】

次式XIIの化合物：

【化8】



[式中、R₁は、-(CH₂)_{1~2}-S(=O)_{0~2}-(C_{1~C₆}アルキル)、あるいは

ハロゲン、-OH、=O、-SH、-C-N、-CF₃、-C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-N(R)C(=O)R'、-OC(=O)-アミノ、及び-OC(=O)-モノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₁₀}アルキル、あるいは

ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC_{2~C₆}アルケニル又はC_{2~C₆}アルキニル、あるいは

アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C_{1~C₆}アルキル)、ヘテロアリール-(C_{1~C₆}アルキル)、又はヘテロシクリル-(C_{1~C₆}アルキル)であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-NO₂、-NR₁₀₅R₁₀₅、-CO₂R、-N(R)COR'、-N(R)SO₂R'、-C(=O)-C_{1~C₄}アルキル、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノアルキルアミノ、-SO₂-ジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)-モノアルキルアミノ、-C(=O)-ジアルキルアミノ、-SO₂-(C_{1~C₄}アルキル)、

ハロゲンから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₆}アルコキシ、

ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、-C_{1~C₆}アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{3~C₇}シクロアルキル、

ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、-C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C_{1~C₃}アルキルから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC_{1~C₁₀}アルキル、及び

ハロゲン、-OH、-SH、-C-N、-CF₃、C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、C_{1~C₆}アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC_{2~C₁₀}アルケニルもしくはC_{2~C₁₀}アルキニル

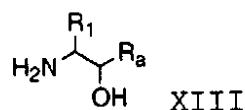
から独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C_{1~C₆}アルキル)、ヘテロアリール-(C_{1~C₆}アルキル)、又はヘテロシクリル-(C_{1~C₆}アルキル)であり(該ヘテロシクリル基は、任意選択で、さらにオキソによって置換されている)；

R及びR'は、独立に、水素、C_{1~C₁₀}アルキル、C_{1~C₁₀}アルキルアリール、又はC_{1~C₁₀}アルキルヘテロアリールである]。

【請求項18】

次式XIIIの化合物：

【化9】



[式中、R₁は、-(CH₂)_{1~2}-S(=O)_{0~2}-(C_{1~C₆}アルキル)、あるいは

ハロゲン、-OH、=O、-SH、-C-N、-CF₃、-C_{1~C₃}アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-N(R)C(=O)R'、-OC(=O)-アミノ、及び-OC(=O)-モノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2

、又は3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₁₀アルキル、あるいはハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、又は3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₂～C₆アルケニル又はC₂～C₆アルキニル、あるいは

アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-であって、それぞれの環部分が、ハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-NO₂、-NR₁₀₅R₁₀₅、-CO₂R、-N(R)COR'、-N(R)SO₂R'、-C(=O)-(C₁～C₄)アルキル、-SO₂-アミノ、-SO₂-モノアルキルアミノ、-SO₂-ジアルキルアミノ、-C(=O)-アミノ、-C(=O)-モノアルキルアミノ、-C(=O)-ジアルキルアミノ、-SO₂-(C₁～C₄)アルキル、

ハロゲンから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシ、

ハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、-C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₃～C₇シクロアルキル、

ハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-CF₃、-C₁～C₃アルコキシ、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、及び-C₁～C₃アルキルから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によって任意選択で置換されているC₁～C₁₀アルキル、及び

ハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、及びモノもしくはジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₂～C₁₀アルケニルもしくはC₂～C₁₀アルキニル

から独立に選択される1、2、3、又は4個の基によって任意選択で置換されている、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール-(C₁～C₆)アルキル-、ヘテロアリール-(C₁～C₆)アルキル-、又はヘテロシクリル-(C₁～C₆)アルキル-であり(該ヘテロシクリル基は、任意選択で、さらにオキソによって置換されている)；

R及びR'は、独立に、水素、C₁～C₁₀アルキル、C₁～C₁₀アルキルアリール、又はC₁～C₁₀アルキルヘテロアリールであり；

R_aは、水素、ヒドロキシメチル、又は-CH(OH)CH₂CH₂R₂を表し、R₂は、R₁₂₀又はR₁₃₀であり；

R₁₂₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロアリールであり；

R₁₃₀は、1又は2個のR₁₂₅基によって任意選択で置換されているヘテロシクリルであり；

R₁₂₅は、出現するごとに、独立にハロゲン、アミノ、モノもしくはジアルキルアミノ、-OH、-C_N、-SO₂-NH₂、-SO₂-NH-C₁～C₆アルキル、-SO₂-N(C₁～C₆アルキル)₂、-SO₂-(C₁～C₄アルキル)、-CO-NH₂、-CO-NH-C₁～C₆アルキル、又は-CO-N(C₁～C₆アルキル)₂、あるいは

C₁～C₃アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C_N、-CF₃、C₁～C₃アルコキシ、アミノ、及びモノ及びジアルキルアミノから独立に選択される1、2、もしくは3個の基によってそれぞれが任意選択で置換されているC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、もしくはC₂～C₆アルキニル、あるいは

1個、2個、もしくは3個のハロゲンによって任意選択で置換されているC₁～C₆アルコキシである]。

【請求項19】

請求項1から18までのいずれか一項に記載の化合物又はその塩を含む、アルツハイマ

ー病、軽度認知障害、ダウン症候群、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血、脳アミロイド血管障害、他の変性痴呆、血管性変性混合型痴呆、パーキンソン病に随伴する痴呆、進行性核上麻痺に随伴する痴呆、皮質基底核変性症に随伴する痴呆、又はびまん性レビー小体型アルツハイマー病を治療又は予防するための、医薬組成物。

【請求項 20】

前記患者がヒトである請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記疾患が痴呆である請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

請求項 1 に記載の化合物又はその塩の、医薬を製造するための使用。

【請求項 23】

アルツハイマー病、軽度認知障害、ダウン症候群、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血、脳アミロイド血管障害、他の変性痴呆、血管性変性混合型痴呆、パーキンソン病に随伴する痴呆、進行性核上麻痺に随伴する痴呆、皮質基底核変性症に随伴する痴呆、又はびまん性レビー小体型アルツハイマー病の治療又は予防に使用する医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物又はその塩の使用。

【請求項 24】

アルツハイマー病を治療するための、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

請求項 1 の化合物の調製方法。

【請求項 26】

請求項 1 から 18 までのいずれかに記載の化合物を含む医薬組成物。