

【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20年11月20日(2008.11.20)

【公表番号】特表2008-516946(P2008-516946A)

【公表日】平成20年5月22日(2008.5.22)

【年通号数】公開・登録公報2008-020

【出願番号】特願2007-536656(P2007-536656)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/22 (2006.01)

C 0 7 D 409/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/695 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 F 7/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/22 C S P

C 0 7 D 409/10

C 0 7 D 405/10

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 239/47 Z

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 403/10

A 6 1 K 31/695

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 F 7/10 T

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月3日(2008.10.3)

【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

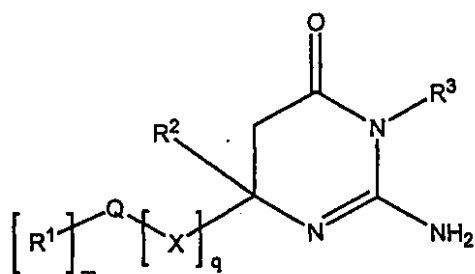
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

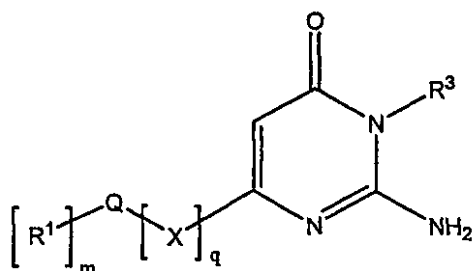
【請求項 1】

式 I a または式 I b で示される化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体：

【化 1】



Ia



Ib

式中：

Q は、C<sub>6-10</sub>アリール、または C<sub>5-10</sub>ヘテロシクリルであり；

X は、C<sub>1-3</sub>アルキルであり；

q は、0 または 1 であり；

m は、0、1 または 2 であり；

R<sup>1</sup> は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、OC<sub>1-4</sub>アルキル、OC<sub>1-3</sub>アルキルOC<sub>1-3</sub>アルキル、OC<sub>1-3</sub>アルキルOC<sub>1-3</sub>アルキルOC<sub>1-3</sub>アルキル、-L-R<sup>4</sup>、C<sub>6-10</sub>アリール、OC<sub>6-10</sub>アリール、または C<sub>5-15</sub>ヘテロシクリルから選択され、ここにおいて、該 C<sub>6-10</sub>アリール、OC<sub>6-10</sub>アリール、または C<sub>5-15</sub>ヘテロシクリルは、場合により、独立して以下：ハロゲン、OH、NH<sub>2</sub>、CN、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、OC<sub>1-6</sub>アルキル、OC<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルキルOH、C<sub>1-4</sub>アルキルCN、C<sub>1-4</sub>アルキルN(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、Si(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>3</sub>、C<sub>1-4</sub>アルキルOC<sub>1-3</sub>アルキル、CH<sub>2</sub>OH、SO<sub>2</sub>H、SO<sub>2</sub>NHC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル、SO<sub>2</sub>NHC<sub>1-6</sub>アルキル、OC<sub>1-3</sub>アルキルOC<sub>1-3</sub>アルキル、OC<sub>1-3</sub>アルキルOH、OC<sub>1-3</sub>アルキルOC(=O)C<sub>1-3</sub>アルキル、C(=O)C<sub>1-6</sub>アルキル、C(=O)OC<sub>1-6</sub>アルキル、C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>6-10</sub>アリール、SO<sub>2</sub>C<sub>6-10</sub>アリール、OC<sub>1-6</sub>アルキルで場合により置換された C<sub>5-6</sub>ヘテロシクリル、OC<sub>5-6</sub>アリール、OC<sub>1-6</sub>アルキル-C<sub>6-10</sub>アリール、C(=O)H、COOH、C(=O)NHC<sub>1-6</sub>アルキル、C(=O)N(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル、SO<sub>2</sub>NHC<sub>1-6</sub>アルキル、SO<sub>2</sub>N(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、NH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、N(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、NHC(=O)H、NHC(=O)C<sub>1-6</sub>アルキル、N(C<sub>1-6</sub>アルキル)C(=O)C<sub>1-6</sub>アルキル、NHC(=O)OC<sub>1-6</sub>アルキル-C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>3-9</sub>

シクロアルキル、 $C_{5-6}$ アリール、 $C(=O)C_{5-6}$ アリール、 $C(=O)OC_{5-6}$ アリール、 $C(=O)OC_{1-6}$ アルキル- $C_{6-10}$ アリール、 $C(=O)NHC_{5-6}$ アリール、 $C(=O)N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $SO_2C_{5-6}$ アリール、 $SO_2NHC_{5-6}$ アリール、 $SO_2N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $NH(C_{5-6}アリール)$ 、 $N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $NHC(=O)C_{5-6}$ アリール、 $C_{1-6}$ アルキル- $C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $OC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)OC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)NHC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、 $SO_2C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $SO_2NHC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $SO_2N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、 $NHSO_2C_{1-6}$ アルキル、 $NH(C_{5-6}ヘテロシクリル)$ 、 $N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、または、 $NHC(=O)C_{5-6}$ ヘテロシクリル；から選択される1、2または3個の置換基で置換され；

$R^2$ は、H、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、または $C_{1-6}$ アルキル- $C_{6-10}$ アリールであり；

$R^3$ は、H、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル $R^c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NR^cR^c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OR^c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC_{1-6}$ アルキル $C_{6-10}$ アリール $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC_{6-10}$ アリール $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC(O)C_{6-10}$ アリール $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC_{1-6}$ アルキル $C_{5-6}$ アリール $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C_{6-10}$ アリール $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C_{5-9}$ ヘテロシクリル $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C_{3-9}$ シクロアルキル $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC_{1-6}$ アルキル $C_{5-9}$ ヘテロシクリル $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC_{5-9}$ ヘテロシクリル $(R^d)_n$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC(O)C_{5-9}$ ヘテロシクリル $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC_{1-6}$ アルキル $C_{5-9}$ ヘテロシクリル $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $NHC_{1-6}$ アルキル $C_{3-9}$ シクロアルキル $R^d$ 、または $C_{1-6}$ アルキル $OC_{1-6}$ アルキル $C_{3-9}$ シクロアルキル $R^d$ から選択され；

$n$ は、0、1、2、3、4または5であり；

$L$ は、それぞれ独立して、存在なし、O、O- $C_{1-4}$ アルキレニル、 $C_{1-4}$ アルキレニル、または $C_{2-4}$ アルケニレニルであり；

$R^4$ は、それぞれ独立して、 $C_{6-10}$ アリール、または $C_{5-15}$ ヘテロシクリルであり、ここにおいて、該アリールおよびヘテロシクリルは、それぞれ場合により、独立して以下：ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、CN、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $OC_{1-6}$ アルキル、 $OC_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルキルOH、 $C_{1-4}$ アルキルCN、 $C_{1-4}$ アルキル $N(C_{1-6}アルキル)_2$ 、 $Si(C_{1-4}アルキル)_3$ 、 $C_{1-4}$ アルキル $OC_{1-3}$ アルキル、 $CH_2OH$ 、 $SO_2H$ 、 $SO_2NHC(CH_3)_3$ 、 $SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $OC_{1-3}$ アルキル $OC_{1-3}$ アルキル、 $OC_{1-3}$ アルキルOH、 $OC_{1-3}$ アルキル $OC(=O)C_{1-3}$ アルキル、 $C(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $C(=O)OC_{1-6}$ アルキル、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{6-10}$ アリール、 $SO_2C_{6-10}$ アリール、 $OC_{1-6}$ アルキルで場合により置換された $C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $OC_{5-6}$ アリール、 $OC_{1-6}$ アルキル- $C_{6-10}$ アリール、 $C(=O)H$ 、 $COOH$ 、 $C(=O)NHC_{1-6}$ アルキル、 $C(=O)N(C_{1-6}アルキル)_2$ 、 $SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $SO_2NHC_{1-6}$ アルキル、 $SO_2N(C_{1-6}アルキル)_2$ 、 $NH(C_{1-6}アルキル)$ 、 $N(C_{1-6}アルキル)_2$ 、 $NHC(=O)H$ 、 $NHC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $N(C_{1-6}アルキル)C(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $NHC(=O)OC_{1-6}$ アルキル- $C_{6-10}$ アリール、 $C_{3-9}$ シクロアルキル、 $C_{5-6}$ アリール、 $C(=O)C_{5-6}$ アリール、 $C(=O)OC_{5-6}$ アリール、 $C(=O)OC_{1-6}$ アルキル- $C_{6-10}$ アリール、 $C(=O)NHC_{5-6}$ アリール、 $C(=O)N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $SO_2C_{5-6}$ アリール、 $SO_2NHC_{5-6}$ アリール、 $SO_2N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $NH(C_{5-6}アリール)$ 、 $N(C_{5-6}アリール)_2$ 、 $NHC(=O)C_{5-6}$ アリール、 $C_{1-6}$ アルキル- $C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $OC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)OC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)NHC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $C(=O)N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、 $SO_2C_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $SO_2NHC_{5-6}$ ヘテロシクリル、 $SO_2N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、 $NHSO_2C_{1-6}$ アルキル、 $NH(C_{5-6}ヘテロシクリル)$ 、 $N(C_{5-6}ヘテロシクリル)_2$ 、または $NHC(=O)C_{5-6}$ ヘテロシクリル；から選択される1、2または3個の置換基で置換され；

$R^c$ は、それぞれ独立して、H、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 $C(=O)$

)  $C_{1-4}$ アルキル  $O C_{1-4}$ アルキル、 $C(=O) C_{1-4}$ アルキル  $C(=O) O C_{1-4}$ アルキル、 $C(=O) C_{1-4}$ アルキル  $C(=O) OH$ 、 $C(=O) C_{1-4}$ アルキル  $O C(=O) C_{1-4}$ アルキル、 $C_{5-6}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{5-9}$ ヘテロシクリル  $R^d$ 、 $C_{3-9}$ シクロアルキル  $R^d$ 、 $C(=O) C_{5-6}$ アリール  $R^d$ 、 $C(=O) C_{5-9}$ ヘテロシクリル  $R^d$ 、 $C(=O) C_{3-9}$ シクロアルキル  $R^d$ 、 $C_{1-4}$ アルキル -  $C_{5-6}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{1-4}$ アルキル -  $C_{5-9}$ ヘテロシクリル  $R^d$ 、または  $C_{1-4}$ アルキル -  $C_{3-9}$ シクロアルキル  $R^d$  から選択され；そして

$R^d$  は、 $H$ 、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{5-9}$ ヘテロシクリル、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $OH$ 、 $CN$ 、 $COOH$ 、 $C(=O) C_{1-4}$ アルキル、 $OC_{1-3}$ アルキル、または  $OC_{1-3}$ アルキル  $OH$  から選択され；

ただし：

a) 該化合物が式 I a を有し、 $R^2$  が  $C_{1-4}$ アルキルであり、 $R^3$  が  $H$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、または  $C_{1-4}$ アルキル  $OR^c$  であり、 $q$  が 0 である場合、 $[R^1 - ]_m - Q$  は、フェニル以外であり；

b) 該化合物が式 I a を有し、 $R^2$  が  $C_{1-4}$ アルキルであり、 $q$  が 0 であり、 $Q$  がフェニルであり、 $R^3$  が  $H$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、または  $C_{1-4}$ アルキル  $OR^c$  であり、 $m$  が 1 である場合、 $R^1$  は、プロモ、ピリジルまたはメトキシフェニル以外であり；

c) 該化合物が式 I b を有し、 $X$  が  $CH_2$  であり、 $R^3$  が  $H$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、または  $C_{1-4}$ アルキル  $OR^c$  であり、 $q$  が 1 である場合、 $[R^1 - ]_m - Q$  は、フェニル以外であり；そして

d) 該化合物が式 I b を有し、 $X$  が  $CH_2$ 、または  $CH(CH_3)$  であり、 $q$  が 1 であり、 $Q$  がフェニルであり、 $R^3$  が  $H$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、または  $C_{1-4}$ アルキル  $OR^c$  であり、 $m$  が 2 である場合、少なくとも 1 個の  $R^1$  は、フルオロ以外である。

#### 【請求項 2】

化合物は、式 I a で示される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 3】

化合物は、式 I b で示される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 4】

$R^3$  は、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $OR^c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $NH C_{1-6}$ アルキル  $C_{6-10}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $NH C(O) C_{6-10}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $O C_{1-6}$ アルキル  $C_{5-6}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $C_{6-10}$ アリール  $R^d$ 、 $C_{1-6}$ アルキル  $C_{5-9}$ ヘテロシクリル  $R^d$ 、または  $C_{1-6}$ アルキル  $C_{3-9}$ シクロアルキル  $R^d$  から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 5】

$R^3$  は、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル  $NR^c R^c$ 、または  $C_{1-6}$ アルキル -  $C_{5-9}$ ヘテロシクリル  $R^d$  から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 6】

$R^3$  は、 $C_{1-3}$ アルキルである、請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 7】

$Q$  は、 $C_{6-10}$ アリールである、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

#### 【請求項 8】

$Q$  は、 $C_6$ アリールである、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

## 【請求項 9】

X は、メチレニル、またはエチレニルであり、q は、1 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

## 【請求項 10】

q は、0 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

## 【請求項 11】

m は、1 または 2 であり、 $R^1$  は、それぞれ独立して、ハロゲン、および - L -  $R^4$  から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

## 【請求項 12】

m は、1 であり、 $R^1$  は、 $R^4$  であり、 $R^4$  は、 $C_{6-10}$  アリール、または  $C_{5-15}$  ヘテロシクリルであり、該アリールおよびヘテロシクリルは、それぞれ場合により、独立して、ハロゲン、CN、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $OC_{1-4}$  アルキル、 $OC_{1-4}$  ハロアルキル、- C(O)H、COOH、 $OC_{1-4}$  アルキル -  $C_{6-10}$  アリール、OH、および  $NHC(=O)C_{1-4}$  アルキルから選択される 1 または 2 個の置換基で置換されている、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体。

## 【請求項 13】

$R^2$  は、H、または  $C_{1-3}$  アルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

$R^2$  は、 $C_{1-3}$  アルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

$R^1$  は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_{2-6}$  アルケニル、- L -  $R^4$ 、 $C_{6-10}$  アリール、 $OC_{6-10}$  アリール、または  $C_{5-10}$  ヘテロシクリルから選択され、該  $C_{6-10}$  アリール、 $OC_{6-10}$  アリール、または  $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは、場合により、独立して以下：ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、CN、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $OC_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルキル OH、 $C_{1-4}$  アルキル  $OC_{1-3}$  アルキル、 $CH_2OH$ 、 $SO_2H$ 、 $SO_2NHC(CH_3)_3$ 、 $SO_2C_{1-6}$  アルキル、 $SO_2NHC_{1-6}$  アルキル、 $OC_{1-3}$  アルキル  $OC_{1-3}$  アルキル、 $OC_{1-3}$  アルキル OH、 $OC_{1-3}$  アルキル  $OC(=O)C_{1-3}$  アルキル、 $C(=O)C_{1-6}$  アルキル、 $C(=O)OC_{1-6}$  アルキル、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{5-6}$  ヘテロシクリル、 $OC_{5-6}$  アリール、または  $OC_{1-6}$  アルキル -  $C_{5-6}$  アリール；から選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換され；

$R^2$  は、H、または  $C_{1-6}$  アルキルであり；そして

$R^3$  は、H、または  $C_{1-3}$  アルキルである、

請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

Q は、 $C_6$  アリール、または  $C_9$  ヘテロシクリルであり；

$R^1$  は、独立して、H、ハロゲン、- L -  $R^4$ 、 $C_6$  アリール、または  $C_{5-6}$  ヘテロシクリルから選択され、該  $C_6$  アリール、または  $C_{5-6}$  ヘテロシクリルは、場合により、独立して以下：ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、CN、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $OC_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルキル OH、 $C_{1-4}$  アルキル  $OC_{1-3}$  アルキル、 $CH_2OH$ 、 $SO_2H$ 、 $SO_2NHC(CH_3)_3$ 、 $SO_2C_{1-6}$  アルキル、 $SO_2NHC_{1-6}$  アルキル、 $OC_{1-3}$  アルキル  $OC_{1-3}$  アルキル、 $OC_{1-3}$  アルキル OH、 $OC_{1-3}$  アルキル  $OC(=O)C_{1-3}$  アルキル、 $C(=O)C_{1-6}$  アルキル、 $C(=O)OC_{1-6}$  アルキル、 $C(=O)NH_2$ 、 $C_{5-6}$  ヘテロシクリル、 $OC_{5-6}$  アリール、または  $OC_{1-6}$  アルキル -  $C_{5-6}$  アリール；から選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換され；そして

$R^2$  は、 $C_{1-3}$  アルキルである、

請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 17】

R<sup>2</sup>は、メチルであり；

q は、0 であり；

Q は、フェニルであり；

m は、1 であり；

R<sup>1</sup>は、それぞれで場合により、独立して、メトキシ、ハロゲン、OCF<sub>3</sub>、メチル、NH<sub>2</sub>、およびNH C(=O)CH<sub>3</sub>から選択される1、2または3個の置換基で置換されたフェニルまたはヘテロアリールであり；そして

R<sup>3</sup>は、メチルである、

請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

R<sup>2</sup>は、メチルであり；

q は、1 であり；

X は、C<sub>2</sub>アルキルであり；

Q は、フェニルであり；

m は、1 であり；

R<sup>1</sup>は、それぞれ場合により、独立して、メトキシ、ハロゲン、OCF<sub>3</sub>、メチル、NH<sub>2</sub>、およびNH C(=O)CH<sub>3</sub>から選択される1、2または3個の置換基で置換されたフェニルまたはヘテロアリールであり；そして

R<sup>3</sup>は、メチルである、

請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 19】

q は、1 であり；

X は、C<sub>2</sub>アルキルであり；

Q は、フェニルであり；

m は、1 であり；そして

R<sup>1</sup>は、それぞれ場合により、独立して、メトキシ、ハロゲン、OCF<sub>3</sub>、メチル、NH<sub>2</sub>、およびNH C(=O)CH<sub>3</sub>から選択される1、2または3個の置換基で置換されたフェニルまたはヘテロアリールである、

請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 20】

以下から選択される請求項 1 に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体：

2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ナフタレン - 2 - イル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン；

2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル ) - フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン；

2 - アミノ - 6 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル ) - 6 - エチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン；

2 - アミノ - 6 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル ) - 6 - イソブチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン；

2 - アミノ - 6 - ( 3, 4 - ジクロロフェニル ) - 3 - メチル - 6 - ( 2 - フェニルエチル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン；

2 - アミノ - 6 - ( 3 - ブロモ - 4 - クロロフェニル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン；

2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 2 - フェニルエチル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン；

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 - ブロモ - フェニル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン；

2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジ

ヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - メチル - 6 - ( 3 - フェノキシフェニル ) - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 - ブロモ - 4 - クロロフェニル ) - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - メトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル - 3 - イル ) - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - メチル - 6 - [ 3 - ( 5 - メチルチエン - 2 - イル ) フェニル ] - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - ブトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル - 3 - イル ) - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 6 - クロロ - 3 ' - メトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル - 3 - イル ) - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 3 , 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 5 - メチルチエン - 2 - イル ) フェニル ] - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - イソプロポキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル - 3 - イル ) - 3 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 6 - クロロ - 3 ' - メトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル - 3 - イル ) - 3 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 4 - クロロ - 3 - キノリン - 5 - イル - フェニル ) - 3 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - メチル - 6 - キノリン - 6 - イル - 5 , 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 3 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 - ブロモフェニル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 2 - ブロモフェニル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 - ブロモフェニル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) エチル ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - ( 2 - ナフチル ) エチル ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 3 - ( 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル ) - 6 - [ 2 - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) エチル ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 - チエニル ) フェニル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 4 ' - ( メチルスルホニル ) ビフェニル - 3 - イル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;

2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 1 H - インドール - 5 - イル ) フェニル ] エチル } -

- 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル ) フェニル ] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 ' - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ビフェニル - 3 - イル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル ) フェニル ] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 - ( 1 H - ピロール - 2 - イル ) フェニル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- メチル 3 ' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル ) エチル ] ビフェニル - 4 - カルボキシラート ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 ' - ( ヒドロキシメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 6 - [ 2 - ( 3 ' - アセチルビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 2 - アミノ - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - ( 3 - ピリジン - 4 - イルフェニル ) エチル ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 - ( 5 - メチル - 2 - チエニル ) フェニル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - メトキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 - ( 4 - メチル - 2 - チエニル ) フェニル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 - ビフェニル - 3 - イルエチル ) - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 ' - クロロビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- { 3 ' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル ) エチル ] ビフェニル - 4 - イル } アセトニトリル ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 3 - ( 3 - チエニル ) フェニル ] エチル } ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 ' - メトキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 - { 3 - [ 5 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - チエニル ] フェニル } エチル ) - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - ( 3 - ピリジン - 3 - イルフェニル ) エチル ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - エトキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 3 - フリル ) フェニル ] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 2 ' - メトキシビフェニル - 3 - イル ) エチル ] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 3 ' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリミジン -



4 - イル) エチル] - N - (tert - ブチル) ビフェニル - 2 - スルホンアミド;  
 メチル 3' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル) エチル] ビフェニル - 2 - カルボキシラート;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 2 - ( 2 - チエニル) フェニル] エチル} ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3' - ( ヒドロキシメチル) ビフェニル - 4 - イル] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3', 4' - ジメトキシビフェニル - 4 - イル) エチル] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3' - メトキシビフェニル - 4 - イル) エチル] - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - { 2 - [ 4 - ( 2 - チエニル) フェニル] エチル} ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 1, 1' - ビフェニル - 3 - イル) エチル] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 N - { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル} - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} アセトアミド;  
 N - { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル} - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} ブタンアミド;  
 1 - { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル} - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} ピロリジン - 2, 5 - ジオン;  
 メチル 3 - ( { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} アミノ ) - 3 - オキソプロパノアート;  
 メチル 5 - ( { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} アミノ ) - 5 - オキソペンタノアート;  
 メチル 6 - ( { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} アミノ ) - 6 - オキソヘキサノアート;  
 6 - ( { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル} アミノ ) - 6 - オキソヘキサン酸;  
 N - { 2 - [ 2 - アミノ - 4 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 6 - オキソピリミジン - 1 ( 6 H ) - イル] エチル } - 2 - メトキシアセトアミド;  
 2 - アミノ - 3 - [ 2 - ( ベンジルアミノ) エチル] - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル} ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル } - 3 - { 2 - [ ( 3 - メトキシベンジル) アミノ] エチル} ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 酢酸 2 - ( { 3' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル) エチル] - 1, 1' - ビフェニル - 3 - イル } オキシ ) エチル;  
 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3' - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) - 1, 1' - ビフェニル - 3 - イル] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3' - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 1, 1' - ビフェニル - 3 - イル] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 酢酸 2 - ( { 3' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 - イル) エチル] - 1, 1' - ビフェニル - 4 - イル } オキシ ) エチル;  
 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 4' - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 1, 1' - ビフェニル - 3 - イル] エチル } - 3 - メチルピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;  
 2 - アミノ - 3 - [ 2 - ( ベンジルオキシ) エチル] - 6 - { 2 - [ 3 - ( 2 - フリル) フェニル] エチル} ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン;

- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - ( 3 ' - メチル - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - エトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 3 ' - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロ - ピリミジン - 4 - イルメチル ) - ビフェニル - 3 - カルボニトリル ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - ( 3 ' - ビニル - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - イソプロピル - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 3 - メトキシフェニル ) フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 6 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 3 - メトキシフェニル ) フェニル ] - 3 - メチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- ( R ) - 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 2 ' - フルオロ - 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 2 - [ 3 - ( 5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル ) - フェニル ] - エチル } - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 - フラン - 2 - イル - フェニル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' , 5 ' - ジメトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 - ビフェニル - 3 - イル - エチル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - [ 2 - ( 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 6 - メチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- N - { 3 ' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 4 - イル ) - エチル ] - ビフェニル - 3 - イル } - アセトアミド ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' - ヒドロキシメチル - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - メチル - 6 - ナフタレン - 2 - イル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - [ 2 - ( 3 - ブロモ - フェニル ) - エチル ] - 6 - メチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 4 ' - メタンスルホニル - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - ( 3 ' , 4 ' - ジメトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - エチル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 3 ' - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 4 - イル ) - エチル ] - ビフェニル - 4 - スルホン酸ジメチルアミド ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - フルオロ - 3 ' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - 3 ,

- 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' , 5 ' - ジメトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - エチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - エチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 - イソキノリン - 5 - イルフェニル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 ' - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - イソプロポキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - エトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 2 ' - ( トリフルオロメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - クロロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - フルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - メトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - エトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - エトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' , 6 ' - ジメチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 ' - ( トリフルオロメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 4 ' - ( トリフルオロメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 ' , 5 ' - ビス ( トリフルオロメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - tert - ブチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' , 4 ' - ジメトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 4 ' - フェノキシビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' , 4 ' - ジメトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 1 - ベンゾフラン - 2 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 1, 3 - ベンゾジオキサール - 5 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 ' - ( トリフルオロメトキシ ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 ' - ( ヒドロキシメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジ

メチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 1 - ナフチル ) フェニル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 1, 1' : 3', 1'' - テルフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 4' - ( ベンジルオキシ ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3' - ( ベンジルオキシ ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4' - プチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2, 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 4' - プロピルビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 2', 3' - ジメトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 3 - カルボン酸 ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3 - チアントレン - 1 - イルフェニル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 1, 1' : 2', 1'' - テルフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 2 - チエニル ) フェニル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 3 - チエニル ) フェニル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3', 5' - ジメチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 2 - ナフチル ) フェニル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 4' - ( ヒドロキシメチル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 6 - ( 4' - アセチルビフェニル - 3 - イル ) - 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 6 - ( 3' - アセチルビフェニル - 3 - イル ) - 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 1 - ベンゾチエン - 2 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3', 4', 5' - トリメトキシビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 6 - [ 3 - ( 5 - アセチル - 2 - チエニル ) フェニル ] - 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 (3H) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3' - フルオロ - 1, 1' : 4', 1'' - テルフェニル - 3 - イル )

- 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3 - ピリジン - 3 - イルフェニル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 1 - ベンゾチエン - 3 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 3 - カルボニトリル ;
- 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - カルボニトリル ;
- 6 - ( 2 ' - アセチルビフェニル - 3 - イル ) - 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 4 ' - ( メチルスルホニル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - シクロヘキシルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3 ' , 4 ' , 5 ' - トリフルオロビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 4 ' - ( エチルスルホニル ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - ヒドロキシ - 3 ' - メトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - ヒドロキシ - 3 ' , 5 ' - ジメチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 5 - [ 3 - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) フェニル ] チオフェン - 2 - カルボニトリル ;
- N - [ 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - イル ] アセトアミド ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - { 3 - [ 1 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インドール - 3 - イル ] フェニル } - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 5 - ベンゾジオキセピン - 7 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 6 - エトキシ - 2 - ナフチル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3 ' - プロボキシビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- メチル 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - カルボキシラート ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 2 ' - フェノキシビフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4 ' - イソブチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 ' - ( ベンジルオキシ ) ビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- メチル 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 3 - カルボキシラート ;
- ベンジル 3 ' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒ

ドロピリミジン - 4 - イル) ビフェニル - 3 - カルボキシラート ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 2' - メトキシ - 5' - メチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 -  
 ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4' - メトキシ - 3', 5' - ジメチルビフェニル - 3 - イル ) -  
 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 ベンジル [ 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラ  
 ヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - イル ] カルバマート ;  
 エチル 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒド  
 ロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - カルボキシラート ;  
 ベンジル 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒ  
 ドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - カルボキシラート ;  
 N - [ 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒド  
 ロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 2 - イル ] メタンスルホンアミド ;  
 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリ  
 ミジン - 4 - イル ) - N - ( tert - ブチル ) ビフェニル - 2 - スルホンアミド ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル ) フェニル ]  
 - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 N - [ 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒド  
 ロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 3 - イル ] アセトアミド ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 2', 6' - ジクロロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル -  
 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3' - クロロ - 2' - フルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 -  
 ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4' - ブトキシ - 3' - クロロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 -  
 ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 [ 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピ  
 リミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 3 - イル ] ホルムアミド ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2 - フルオロピリジン - 3 - イル ) フェニル ] - 3, 6 - ジ  
 メチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3' - プロモ - 2' - エトキシ - 5' - メチルビフェニル - 3 - イ  
 ル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2 - エトキシ - 1 - ナフチル ) フェニル ] - 3, 6 - ジメチ  
 ル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 4' - ( ベンジルオキシ ) - 2' - フルオロビフェニル - 3 - イル  
 ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 2' - ( モルホリン - 4 - イルメチル ) ビフェ  
 ニル - 3 - イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリ  
 ミジン - 4 - イル ) - 3 - フルオロビフェニル - 4 - カルバルデヒド ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 4' - ( トリメチルシリル ) ビフェニル - 3 -  
 イル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3' - ブトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6  
 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 2', 4', 6' - トリメチルビフェニル - 3 -  
 イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 3 - フルオロピリジン - 4 - イル ) フェニル ]  
 - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 5' - クロロ - 2' - メチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジ  
 メチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 2', 5' - ジフルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル

- 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 1, 1' : 4', 1'' - テルフェニル - 3 - イル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3' - クロロ - 4' - フルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4' - フルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 - ジベンゾ [ b, d ] チエン - 4 - イルフェニル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ビフェニル - 3 - イル - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2', 3' - ジメチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 3 - [ ( E ) - 2 - ビフェニル - 4 - イルビニル ] フェニル } - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 4' - ( ベンジルオキシ ) - 3' - クロロビフェニル - 3 - イル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4' - ブトキシ - 2' - メチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 2 - カルバルデヒド ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3' - プロモ - 2' - イソプロボキシ - 5' - メチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 3' - ( 2 - アミノ - 1, 4 - ジメチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジン - 4 - イル ) ビフェニル - 4 - カルボキサミド ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3', 5' - ジフルオロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - [ 3 - ( 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) フェニル ] - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ( 3 - キノリン - 5 - イルフェニル ) - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 2', 5' - ジメトキシビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3' - クロロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 4' - クロロビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3' - プロモ - 2' - ブトキシ - 5' - メチルビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - アミノフェニル ) フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( p - トリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( m - トリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( o - トリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - [ 4 - ( ヒドロキシメチル ) フェニル ] フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 4 - エチルスルホニルフェニル ) フェニル ] エチル ]

- 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - [ 2 - ( ヒドロキシメチル ) フェニル ] フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 - メチル - フェニル ) フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル ) フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 5 - クロロ - 2 - チエニル ) フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 6 - [ 2 - [ 3 - ( 5 - アセチル - 2 - チエニル ) フェニル ] エチル ] - 2 - アミノ - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - [ 4 - ( メトキシメチル ) フェニル ] フェニル ] エチル ] - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 4 - [ 3 - [ 2 - ( 2 - アミノ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 4 - イル ) エチル ] フェニル ] ベンズアミド ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - メチルスルホニルフェニル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 5 - キノリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - ( シクロヘキシルメチル ) - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( 3 - ヒドロキシプロピル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) メチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ [ 3 - ( 1 H - テトラゾール - 5 - イル ) フェニル ] メチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 3 - [ [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - ( 3 - フラン - 2 - イル - フェニル ) - エチル ] - 6 - オキソ - 6 H - ピリミジン - 1 - イルメチル ] - ベンゾニトリル ;
- 3 - [ [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] メチル ] 安息香酸 ;
- 3 - [ [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 6 H - ピリミジン - 1 - イル ] メチル ] 安息香酸メチルエステル ;
- 3 - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルアミノ ] - 3 - オキソ - プロパン酸 ;
- 2 - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルカルバモイル ] 安息香酸 ;
- 2 - アミノ - 6 - ( 3 ' - エチル - ビフェニル - 3 - イルメチル ) - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 3 - [ ( E ) - 2 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - ビニル ] - ベンジル } - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 3 - [ 2 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - ベンジル } - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( ( E ) - スチリル ) - ベンジル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 6 - { 3 - [ ( E ) - 2 - ( 4 - メトキシ - フェニル ) - ビニル ] - ベンジル } - 3 - メチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;
- 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( ( E ) - 3 - メチル - ペンタ - 1 - エニル ) -



ベンジル] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( ( E ) - 4 - メチル - ペンタ - 1 - エニル ) -  
 ベンジル] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - ( 3 - フェネチル - ベンジル ) - 3 H - ピリミジン - 4  
 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( 2 - ピリジン - 4 - イル - エチル ) - ベンジル  
 ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( 3 - メチル - ペンチル ) - ベンジル ] - 3 H -  
 ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 3 - ( 4 - メチル - ペンチル ) - ベンジル ] - 3 H -  
 ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3, 6 - ジメチル - 6 - ナフタレン - 1 - イル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H -  
 ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4 - クロロ - 3 - ナフタレン - 1 - イル - フェニル ) - 3, 6 - ジ  
 メチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 6, 4' - ジクロロ - ビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル -  
 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4 - クロロ - 3 - イソキノリン - 5 - イル - フェニル ) - 3, 6 -  
 ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 6 - クロロ - 4' - ヒドロキシ - ビフェニル - 3 - イル - フェニル  
 ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 4 - クロロ - 3 - ジベンゾフラン - 4 - イル - フェニル ) - 3, 6  
 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ 1, 4 ] ジオキシン -  
 6 - イル - フェニル ] - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - ( 3 - プロモ - フェニル ) - 6 - メチル - 5, 6 - ジ  
 ヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 4 - クロロ - 3 - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) - フェニル ] -  
 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - ( 3' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - 6 - メ  
 チル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - メチル - 6 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピ  
 リミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 6 - クロロ - ビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 -  
 ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 6 - クロロ - 4' - メトキシ - ビフェニル - 3 - イル ) - 3, 6 -  
 ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - ( 3 - メトキシ - フェニル ) - 3, 6 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ -  
 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - チエニル ) フェニル ] エチル ] - 3  
 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 3 - メトキシフェニル ) フェニル ] エチル ] - 3, 6  
 - ジメチル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;  
 2 - アミノ - 3 - メチル - 6 - フェニル - 5, 6 - ジヒドロ - 3 H - ピリミジン - 4 -  
 オン ;  
 3 - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 -  
 オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルカルバモイル ] 安息香酸 ;  
 2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - ( 1 H  
 - イミダゾール - 1 - イル ) エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 3 - [ 2 - [ ビス ( 3 - フリルメチル ) アミノ ] エチル ] - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

N - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチル ] - 2 - ( 1 H - テトラゾール - 5 - イル ) アセトアミド ;

5 - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルアミノ ] - 5 - オキソ - ペンタン酸 ;

酢酸 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルカルバモイルメチルエステル ;

N - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチル ] - 3 - ヒドロキシ - ベンズアミド ;

N - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチル ] - 4 - ヒドロキシ - ベンズアミド ;

4 - アミノ - N - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチル ] ベンズアミド ;

N - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチル ] ピペリジン - 4 - カルボキサミド ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( 2 - フェネチルアミノエチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

4 - [ 2 - [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] エチルアミノメチル ] 安息香酸 ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - [ ( 3 - ヒドロキシフェニル ) メチルアミノ ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - [ [ 4 - ( 2 - ヒドロキシエトキシ ) フェニル ] メチルアミノ ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( 2 - イソブチルアミノエチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - ( 1 H - インドール - 5 - イルメチルアミノ ) エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - [ ( 4 - ヒドロキシフェニル ) メチルアミノ ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - ( 3 - ピリジルメチルアミノ ) エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 3 - ベンジル - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - イソペンチル - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - [ ( 1 - ヒドロキシ - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - 4 - ピペリジル ) アミノ ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - [ ( 1 - ヒドロキシ - 2, 2, 6, 6 - テトラメチル - 4 - ピペリジル ) アミノ ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 3 - [ 2 - ( 1, 3 - ジオキサソ - 2 - イル ) エチル ] - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

4 - [ [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] メチル ] ベンゾニトリル ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ [ 4 - ( 1 H - テトラゾール - 5 - イル ) フェニル ] メチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - ( 2 - モルホリノエチル ) - 3 H - ピリミジン - 4 - オン ;

2 - [ [ 2 - アミノ - 4 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 6 - オキソ - 1 H - ピリミジン - 1 - イル ] メチル ] ベンゾニトリル ; および

2 - アミノ - 6 - [ 2 - [ 3 - ( 2 - フリル ) フェニル ] エチル ] - 3 - [ 2 - ( 1 - ピペリジル ) エチル ] - 3 H - ピリミジン - 4 - オン。

【請求項 2 1】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体の、医薬としての使用。

【請求項 2 2】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体の、A に関連する病状を治療または予防するための医薬としての使用。

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体の、A に関連する病状を治療または予防するための医薬としての使用であって、該 A に関連する病状は、ダウン症候群、  
- アミロイド血管症、脳のアミロイド血管症、遺伝性の脳出血、認知障害に関連する障害、MCI (「軽度認知機能障害」)、アルツハイマー病、記憶障害、アルツハイマー病に関連する注意欠陥症状、アルツハイマー病に関連する神経変性、血管性起源の混合型認知症、変性性起源の認知症、初老期認知症、老年認知症、パーキンソン病に関連する認知症、進行性核上麻痺、または皮質基底の変性症である、上記使用。

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体の、A に関連する病状を治療または予防するための医薬の製造における使用。

【請求項 2 5】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体の、A に関連する病状を治療または予防するための医薬の製造における使用であって、該 A に関連する病状は、ダウン症候群、  
- アミロイド血管症、脳のアミロイド血管症、遺伝性の脳出血、認知障害に関連する障害、MCI (「軽度認知機能障害」)、アルツハイマー病、記憶障害、アルツハイマー病に関連する注意欠陥症状、アルツハイマー病に関連する神経変性、血管性起源の混合型認知症、変性性起源の認知症、初老期認知症、老年認知症、パーキンソン病に関連する認知症、進行性核上麻痺、または皮質基底の変性症である、上記使用。

【請求項 2 6】

BACE と、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体とを接触させることを含む、BACE の活性を阻害する方法。

【請求項 2 7】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体、および少なくとも 1 種の向知性薬、記憶増強剤、またはコリンエステラーゼ阻害剤を含む、哺乳動物において A に関連する病状を治療または予防するための医薬。

【請求項 2 8】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物、またはそれらの製薬上許容できる塩、互変異性体、もしくは生体内で加水分解可能な前駆体、および少なくとも 1 種の製薬上許容できるキャリアー、希釈剤または賦形剤を含む医薬組成物。