

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2012-513399

(P2012-513399A)

(43) 公表日 平成24年6月14日(2012.6.14)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 498/04 (2006.01)	C07D 498/04 116	4C072
A61K 31/553 (2006.01)	C07D 498/04 CSP	4C084
A61K 45/00 (2006.01)	A61K 31/553	4C086
A61P 43/00 (2006.01)	A61K 45/00	
A61P 25/00 (2006.01)	A61P 43/00 121	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 222 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2011-542472 (P2011-542472)	(71) 出願人	596129215
(86) (22) 出願日	平成21年12月18日 (2009.12.18)		シェーリング コーポレイション
(85) 翻訳文提出日	平成23年8月16日 (2011.8.16)		Schering Corporation
(86) 国際出願番号	PCT/US2009/068684		アメリカ合衆国, ニュージャージー O
(87) 国際公開番号	W02010/075203		7065, ローウェイ, アールワイ60
(87) 国際公開日	平成22年7月1日 (2010.7.1)		-30, イースト リンカーン アベニ
(31) 優先権主張番号	61/139,665		ュー 126
(32) 優先日	平成20年12月22日 (2008.12.22)	(74) 代理人	100146318
(33) 優先権主張国	米国 (US)		弁理士 岩瀬 吉和
		(74) 代理人	100114188
			弁理士 小野 誠
		(74) 代理人	100119253
			弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 γ -セクレターゼ調節剤

(57) 【要約】

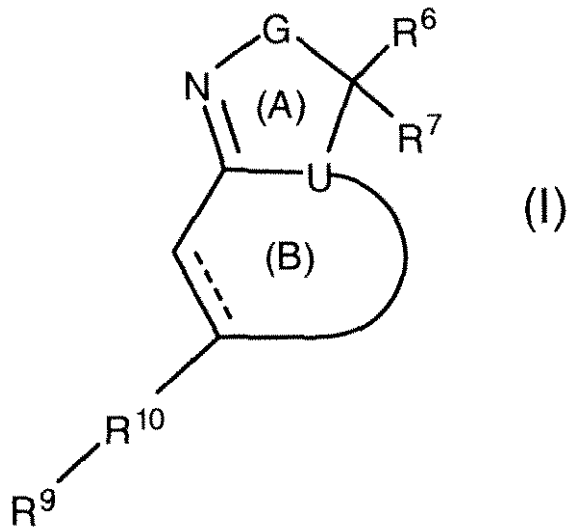
本発明は、 γ -セクレターゼの調節剤である新規化合物を提供する。その化合物は次の式を有する（紙文書の形態で要約に載せる際には、化学式を挿入すべきである。）。式（I）の化合物を用いる γ -セクレターゼ活性の調節方法ならびにアルツハイマー病の治療方法も開示される。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、エステルもしくは溶媒和物。

【化 1】



10

20

[式中、

G、U、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰は独立に選択され；

式 (I) における文字 (A) および (B) は、式 (I) に存在する環を識別するための参照文字であり；

GはC(O)、OおよびSからなる群から選択され；

UはCR⁵またはNであり；

環 (B) における点線は存在しても良い結合を表し；

環 (B) は5から8個の員環であり (環 (A) と共通の原子を含む)、(1) UがCR⁵である場合、前記環 (B) は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個のヘテロ原子を含んでいても良く、(2) UがNである場合、前記環 (B) は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個の別のヘテロ原子を含んでいても良く；前記環 (B) は1から5個の独立に選択されるR²¹基で置換されていても良く；

30

R⁵は、H、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され；前記R⁵アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - 基のそれぞれは1から5個の独立に選択されるR²¹置換基で置換されていても良く；

40

R⁶およびR⁷はそれぞれ独立にH、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル -、ベンゾ縮合シクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；前記R⁶およびR⁷アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 -、複素環アルキル -、ベンゾ縮合シクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロ

50

アリールシクロアルキルおよび縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル基のそれぞれは 1 から 5 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；または

R^6 および R^7 がそれらが結合している炭素原子と一体となって、スピロ環状炭素環部分またはスピロ環状複素環部分を形成しており、

(a) 前記スピロ環状炭素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

(b) 前記スピロ環状複素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

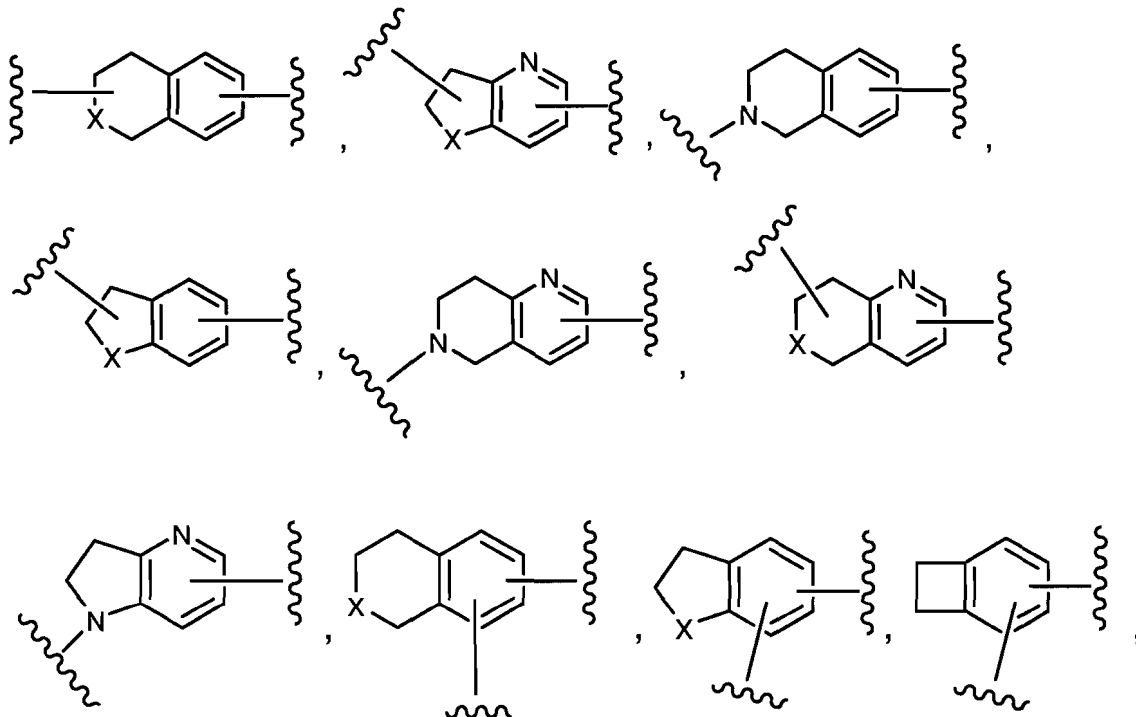
(c) 前記スピロ環状炭素環部分がアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

(d) 前記スピロ環状複素環部分はアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

R^9 は、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され、各 R^9 基は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されていても良く；

R^{10} は、結合、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 -、複素環アルキル -、

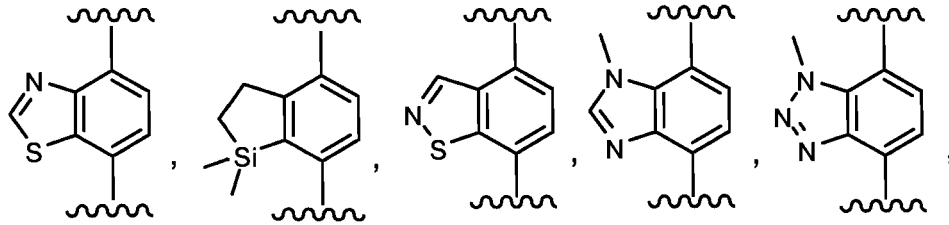
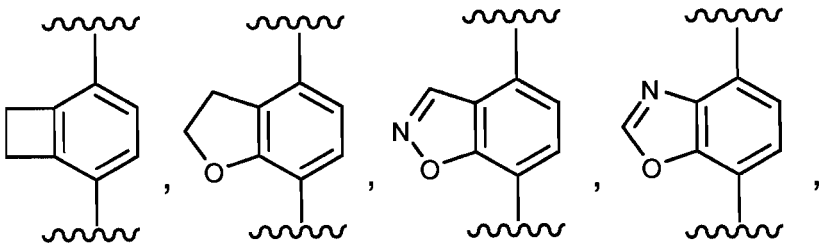
【化 2】



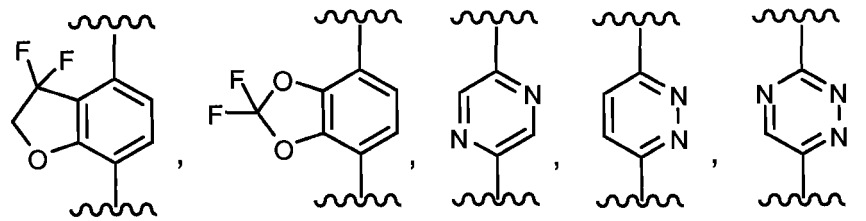
10

30

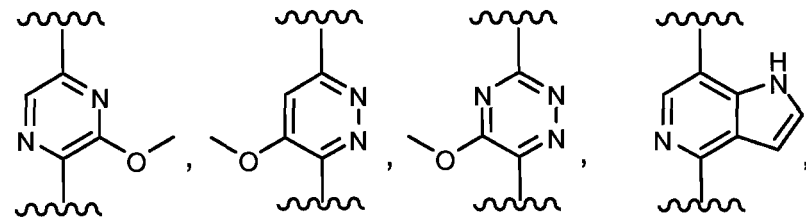
40



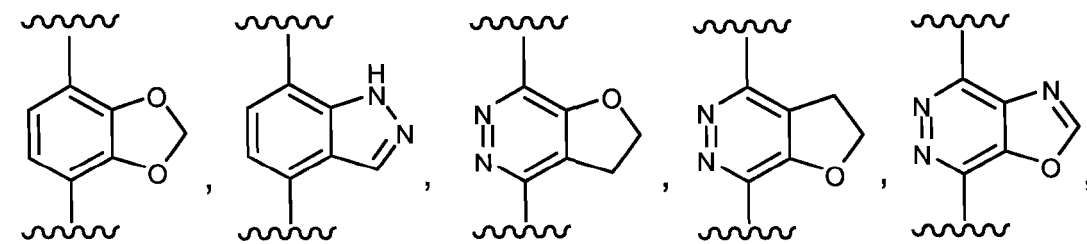
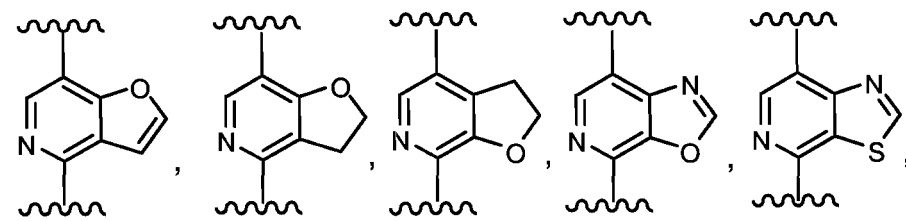
10



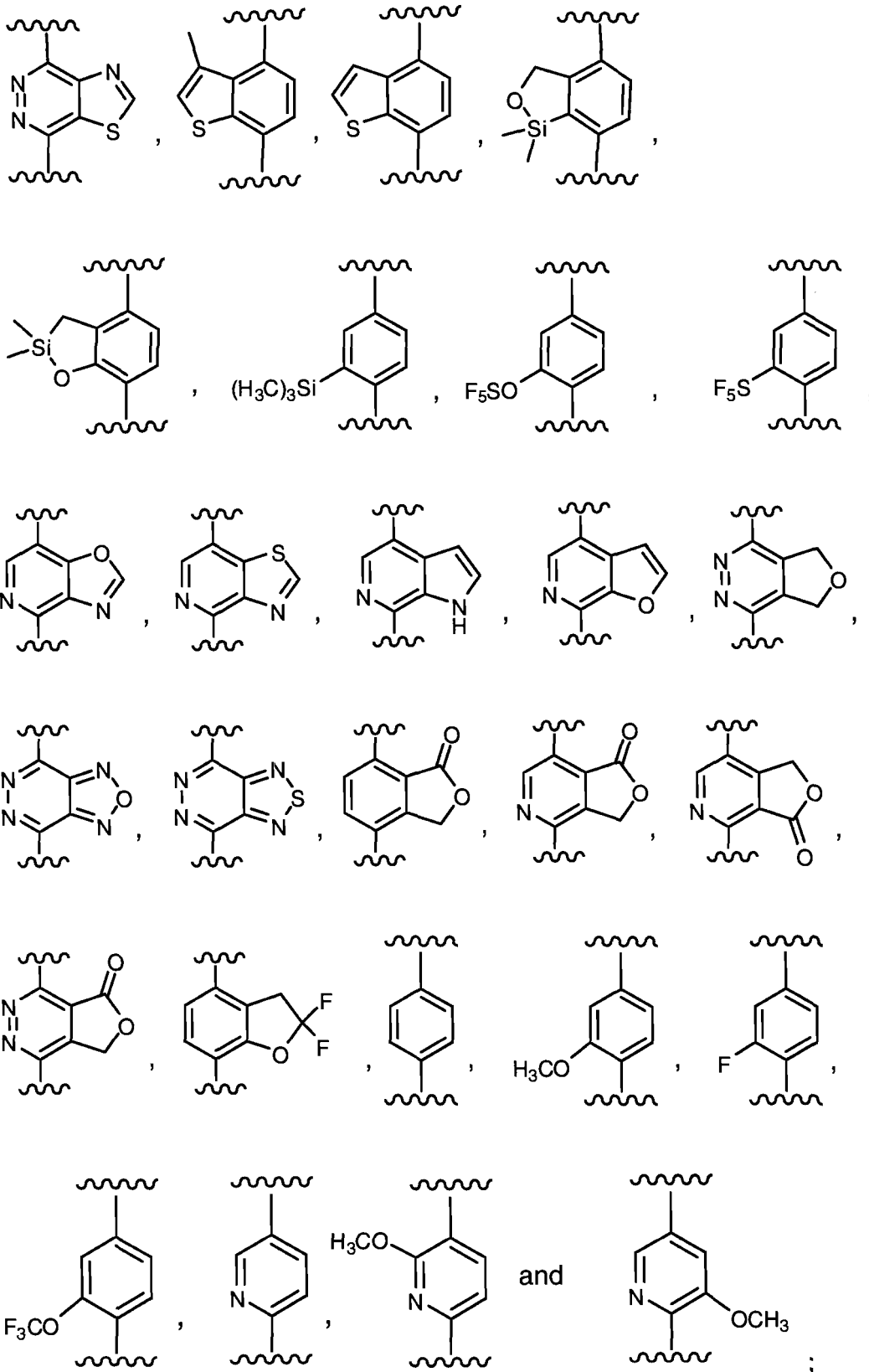
20



30



40



からなる群から選択され；

Xは、O、N (R^{14}) またはSからなる群から選択され；前記 R^{10} 基のそれぞれは1から3個の独立に選択される R^{21} 置換基で置換されていても良く；

R^9 は、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選

扱われ；前記アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - 基のそれぞれは置換されていないか、同一もしくは異なることができる 1 から 3 個の置換基で独立に置換されていることができ、各置換基は独立に下記に示す部分からなる群から選択され；

R^{14} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、アリール、アリールアルキル -、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、
- CN、- C(O) R^{15} 、- C(O) OR R^{15} 、- C(O) N (R^{15}) (R^{16})、
- S(O) N (R^{15}) (R^{16})、- S(O)₂ N (R^{15}) (R^{16})、- C(=N
OR R^{15}) R^{16} および - P(O) (OR R^{15}) (OR R^{16}) からなる群から選択され、
前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シ
クロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、ア
リール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキル基のそれぞれ
は独立に置換されていないか 1 から 5 個の R^{21} 基で置換されており；

各 R^{15A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキル
アルキル -、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、
ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅
- アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアル
キル -、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})
1-5 - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロア
リールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され
；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

各 R^{16A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキル
アルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘ
テロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅ -
アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアル
キル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})₁₋₅ -
アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロア
リールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され；各
基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

R^{15} 、 R^{16} および R^{17} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアル
キル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル
、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環
、(R^{18})₁₋₅ - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ -
シクロアルキルアルキル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アル
キル、(R^{18})₁₋₅ - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})
1-5 - ヘテロアリールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群か
ら独立に選択され；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることが
でき；

各 R^{18} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリ
ールアルケニル、アリールアルキニル、- NO₂、ハロ、ヘテロアリール、HO - アルキ
ロキシアリル、- CF₃、- CN、アルキル - CN、- C(O) R^{19} 、- C(O) O
H、- C(O) OR R^{19} 、- C(O) NHR²⁰、- C(O) NH₂、- C(O) NH₂
- C(O) N (アルキル)₂、- C(O) N (アルキル) (アリール)、- C(O) N (ア
ルキル) (ヘテロアリール)、- SR¹⁹、- S(O)₂ R²⁰、- S(O) NH₂、
- S(O) NH (アルキル)、- S(O) N (アルキル) (アルキル)、- S(O) NH
(アリール)、- S(O)₂ NH₂、- S(O)₂ NHR¹⁹、- S(O)₂ NH (複素
環)、- S(O)₂ N (アルキル)₂、- S(O)₂ N (アルキル) (アリール)、- O
CF₃、- OH、- OR²⁰、- O - 複素環、- O - シクロアルキルアルキル、- O - 複

10

20

30

40

50

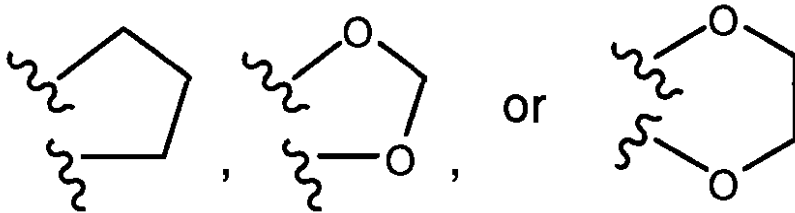
素環アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{20}$ 、 $-N(アルキル)_2$ 、 $-N(アリールアルキル)_2$ 、 $-N(アリールアルキル)-(ヘテロアリールアルキル)$ 、 $-NHC(O)R^{20}$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NH(アルキル)$ 、 $-NHC(O)N(アルキル)(アルキル)$ 、 $-N(アルキル)C(O)MH(アルキル)$ 、 $-N(アルキル)C(O)N(アルキル)(アルキル)$ 、 $-NHS(O)_2R^{20}$ 、 $-NHS(O)_2NH(アルキル)$ 、 $-MHS(O)_2N(アルキル)(アルキル)$ 、 $-N(アルキル)S(O)_2NH(アルキル)$ および $-N(アルキル)S(O)_2N(アルキル)(アルキル)$ からなる群から独立に選択され；

または、隣接する炭素上の二つの R^{18} 部分が、それらが結合している原子と一体とな

って、

10

【化 3】



を形成していることができ；

R^{19} は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

20

R^{20} は、アルキル、シクロアルキル、アリール、八口置換されたアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

各 R^{21} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、八口、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ 、 $-Si(R^{15A})_3$ (各 R^{15A} は独立に選択される。)、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-アルキル-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16A}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16A}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16A}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15A}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ および $-S(O)_2R^{15A}$ からなる群から独立に選択され；前記

30

40

各 R^{22} は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、八口、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-アルキル-C(O)OR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ 、 $-Si(R^{15A})_3$ (各 R^{15A} は独立に選択される。)、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-アルキル-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、-

50

CH₂ - N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、=NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R^{15A}および-S(O)₂R^{15A}からなる群から独立に選択される。]

【請求項2】

前記R¹⁰がアリールおよび1以上のR²¹基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記R⁹基がヘテロアリールおよび1以上のR²¹基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、各R²¹が独立に選択される請求項1に記載の化合物。

10

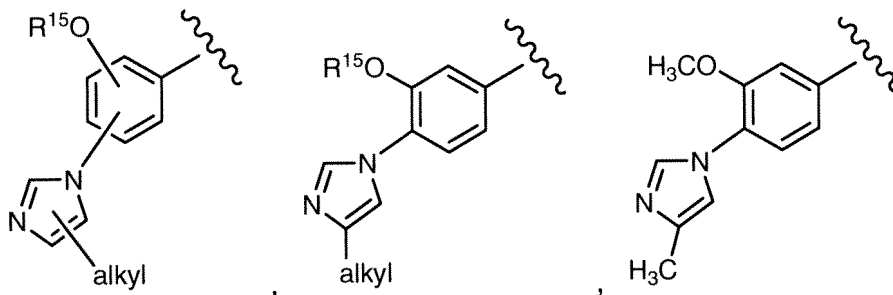
【請求項3】

前記R¹⁰が1個のR²¹基で置換されたフェニルであり、前記R⁹が1個のR²¹基で置換されたイミダゾリルであり、各R²¹が独立に選択される請求項1に記載の化合物。

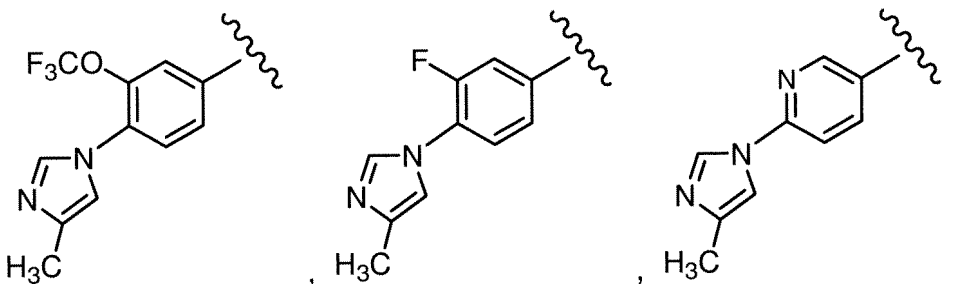
【請求項4】

前記R⁹-R¹⁰-部分が下記のものからなる群から選択される請求項1に記載の化合物。

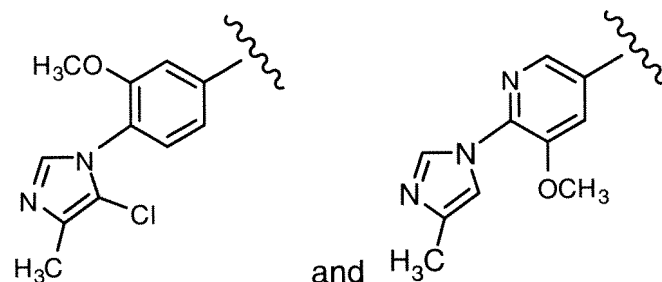
【化4】



20



30



40

【請求項5】

R⁶がアルキルであり、R⁷が置換されたアリール基である請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

50

R⁷が、

フェニル、または

1以上の独立に選択されるR^{2,1}基で置換されたフェニル、または

1から3個の独立に選択されるR^{2,1}基で置換されたフェニル、または

1から3個のR^{2,1}基で置換されたフェニルであって、各R^{2,1}基は同一もしくは異なるハロゲンであるフェニル、または

1から3個のFで置換されたフェニル、または

1個の-CN基で置換されたフェニル、または

1もしくは2個の-CF₃基で置換されたフェニル、または

R^{2,1}基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個のR^{2,1}基が-SF₅、-OSF₅および-Si(R^{1,5A})₃からなる群から選択され、各R^{1,5A}が独立に選択されるフェニル、または

10

R^{2,1}基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個のR^{2,1}基が-SF₅、-OSF₅および-Si(R^{1,5A})₃からなる群から選択され、各R^{1,5A}が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

R^{2,1}基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個のR^{2,1}基が-SF₅、-OSF₅および-Si(R^{1,5A})₃からなる群から選択され、各R^{1,5A}が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

R^{2,1}基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個のR^{2,1}基が-SF₅、-OSF₅および-Si(CH₃)₃からなる群から選択されるフェニル

20

である請求項1に記載の化合物。

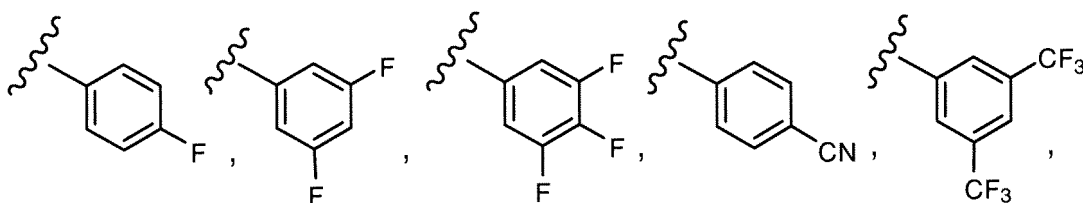
【請求項7】

R⁶がアルキルである請求項6に記載の化合物。

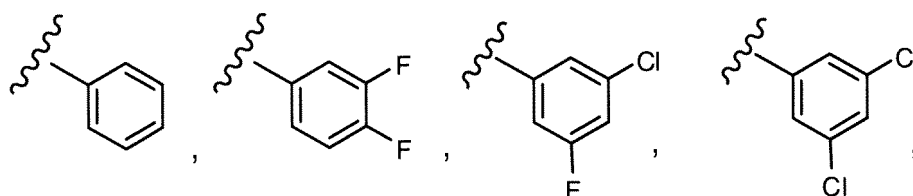
【請求項8】

R⁷が

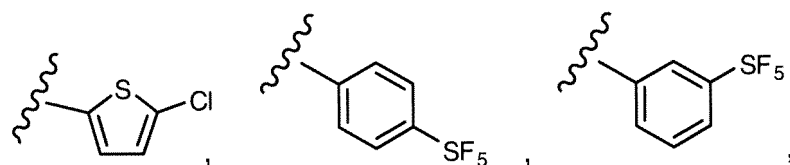
【化5】

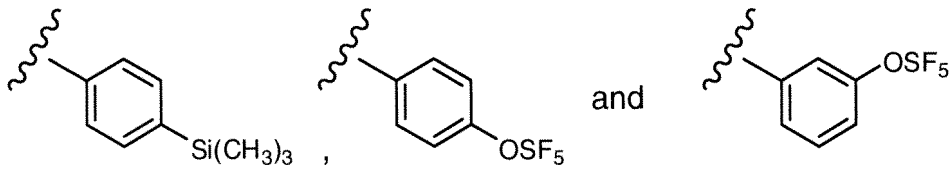


30



40





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 9】

R⁶ がアルキルである請求項 8 に記載の化合物。

10

【請求項 10】

- (a) G が O であり、U が C R⁵ であり、
- (b) G が O であり、U が N であり、
- (c) G が S であり、U が C R⁵ であり、
- (d) G が S であり、U が N であり、
- (e) G が C (O) であり、U が C R⁵ であり、
- (f) G が C (O) であり、U が N であり、
- (g) G が N (R¹⁻⁴) であり、U が C R⁵ であり、または
- (h) G が N (R¹⁻⁴) であり、U が N である

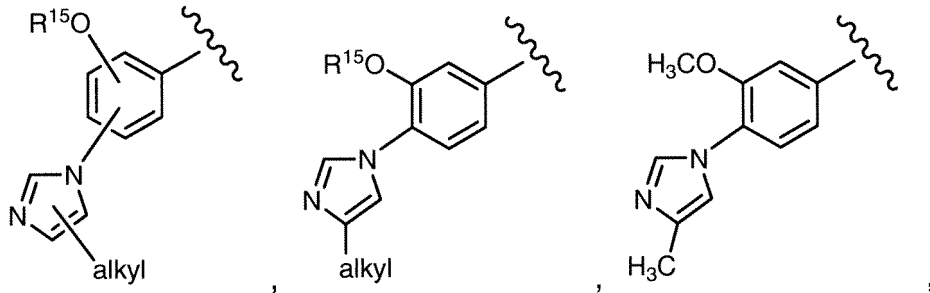
請求項 1 に記載の化合物。

20

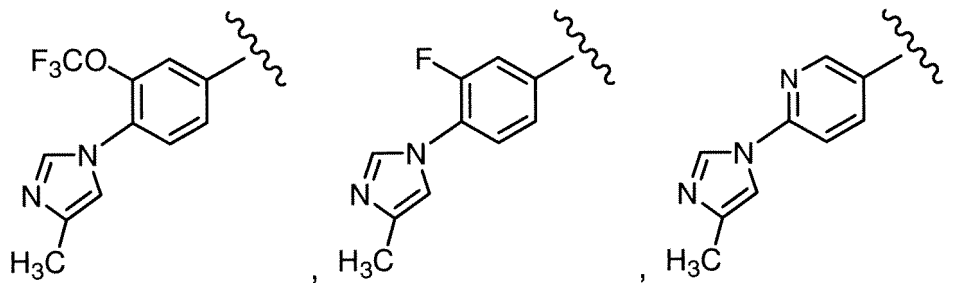
【請求項 11】

- (a) 前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分が

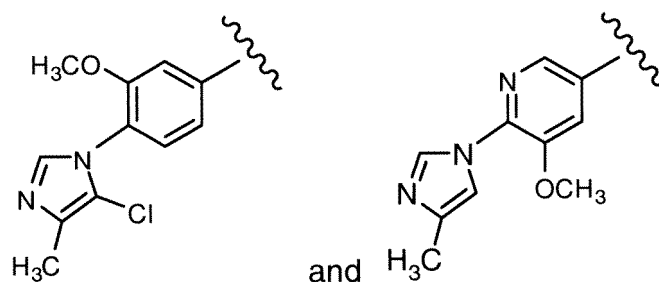
【化 6】



30



40



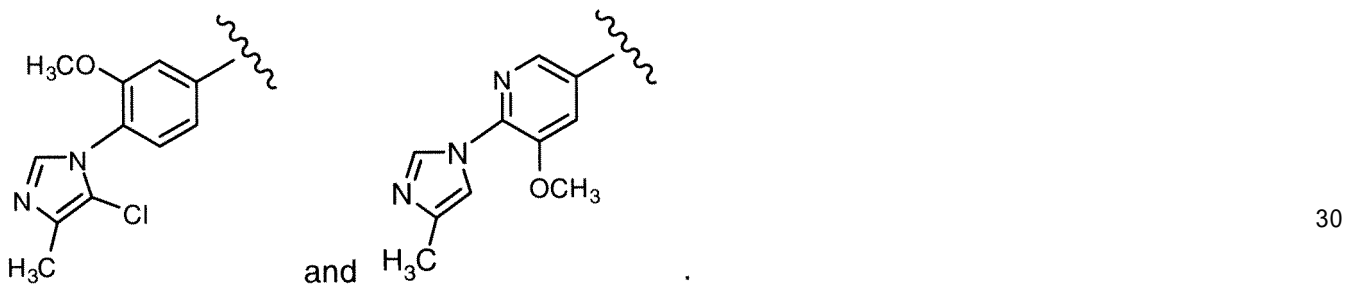
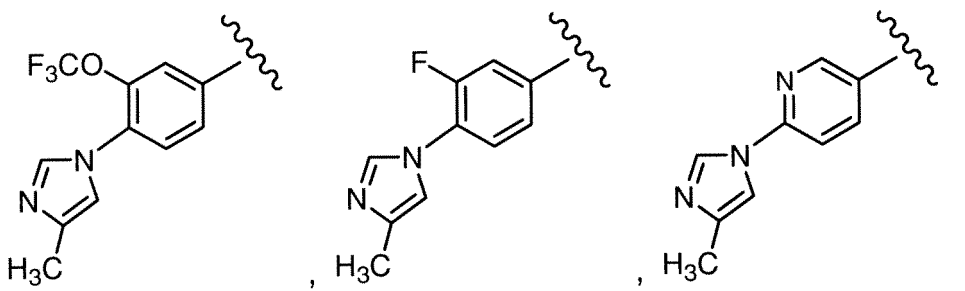
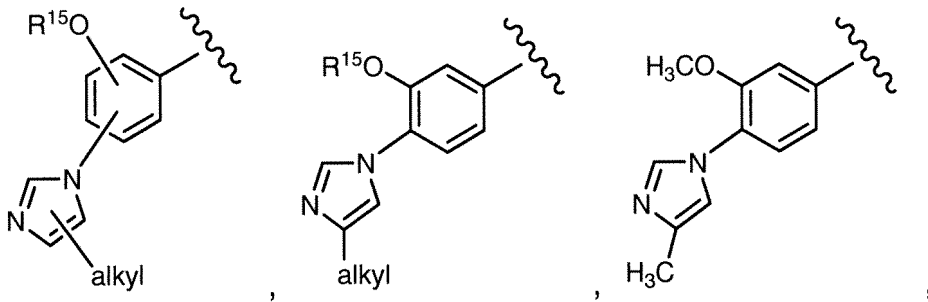
50

からなる群から選択される請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

(a) 前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分が

【化 7】

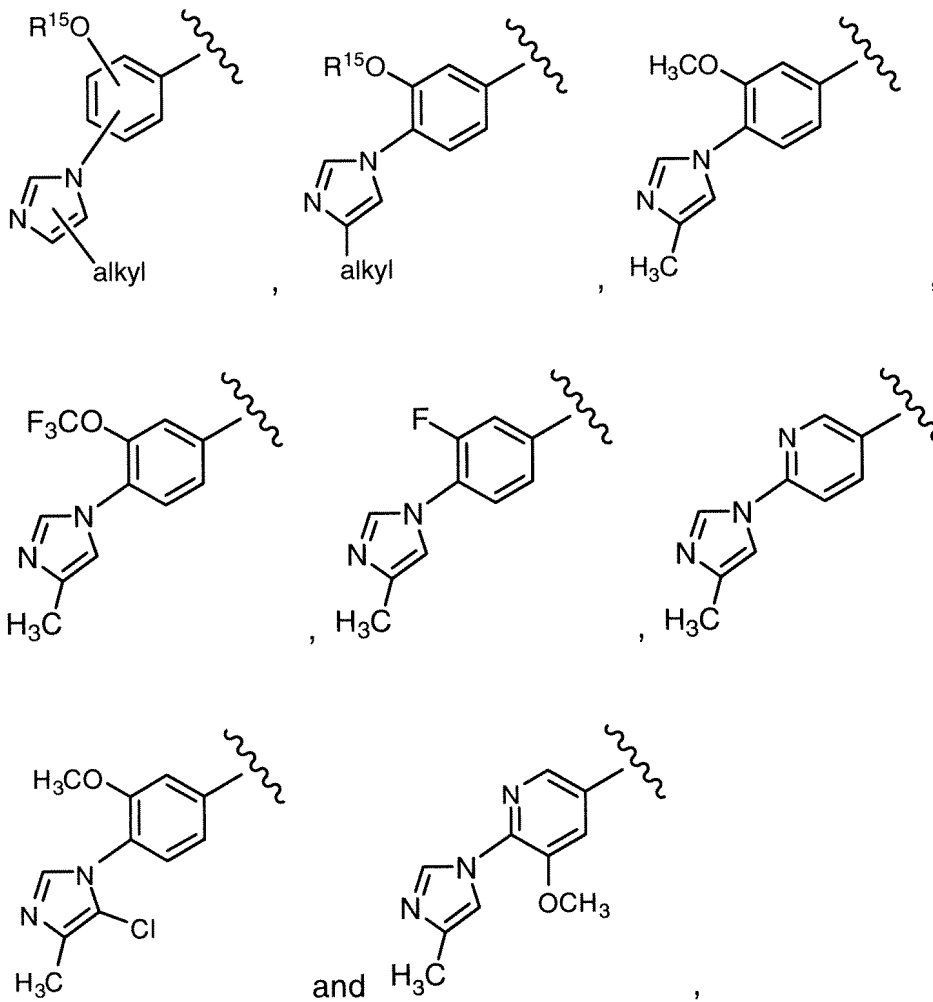


からなる群から選択される請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

(a) 前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分が

【化 8】



10

20

からなる群から選択され、(b) R^6 がアルキルであり、(c) R^7 が置換されたアール基であり、(d) GおよびUが、(i) GがOであり、Uが CR^5 である、(ii) GがOであり、UがNである、(iii) GがSであり、Uが CR^5 である、(iv) GがSであり、UがNである、(v) GがC(O)であり、Uが CR^5 である、(vi) GがC(O)であり、UがNである、(vii) GがN(R^{14})であり、Uが CR^5 である、(viii) GがN(R^{14})であり、UがNであるからなる群から選択される請求項1に記載の化合物。

30

【請求項14】

R^7 が、

フェニル、または

1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニル、または

1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニル、または

40

1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであって、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるハロゲンであるフェニル、または

1から3個のFで置換されたフェニル、または

1個の-CN基で置換されたフェニル、または

1もしくは2個の $-CF_3$ 基で置換されたフェニル、または

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が独立に選択されるフェニル、または

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が同一もしくは

50

異なるアルキル基であるフェニル、または

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

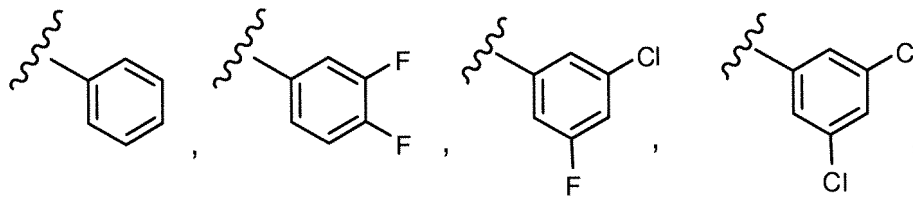
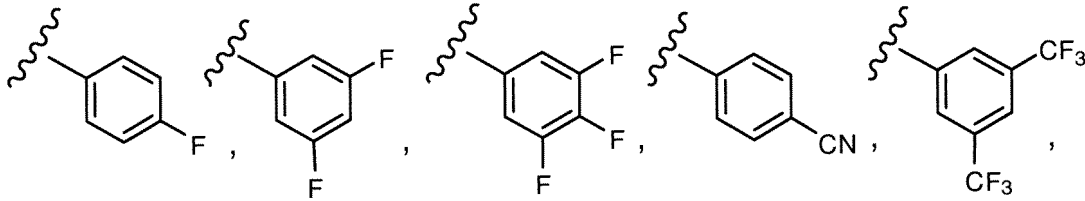
R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択されるフェニルである請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

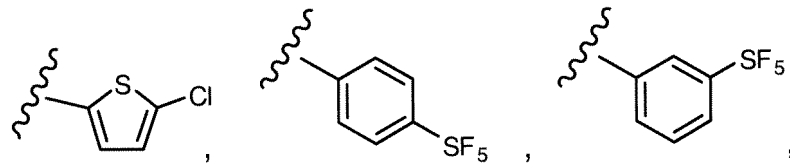
R^7 が

【化 9】

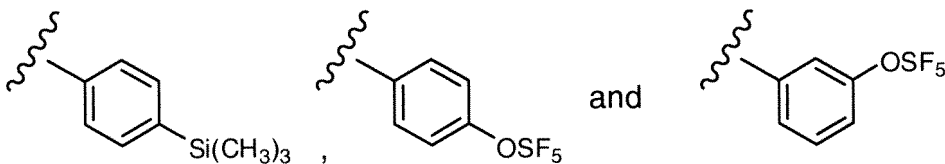
10



20



30



からなる群から選択される請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

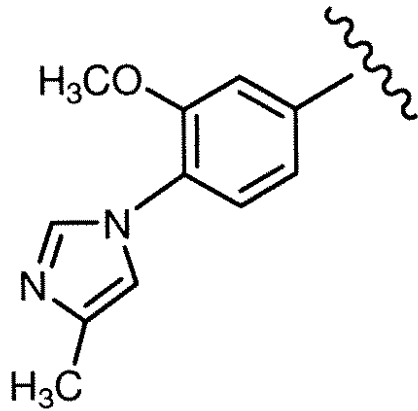
40

前記式 (I) の化合物が、2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4P および 5P 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 17】

前記 $R^9 - R^{10}$ - 部分が、

【化 1 0】



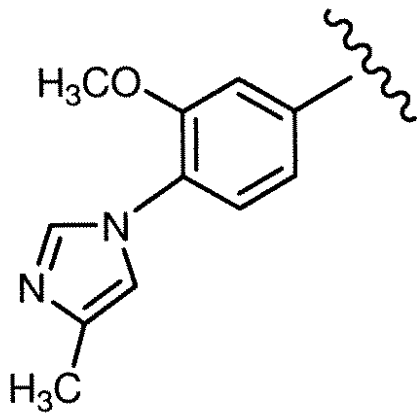
10

である請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分が、

【化 1 1】



20

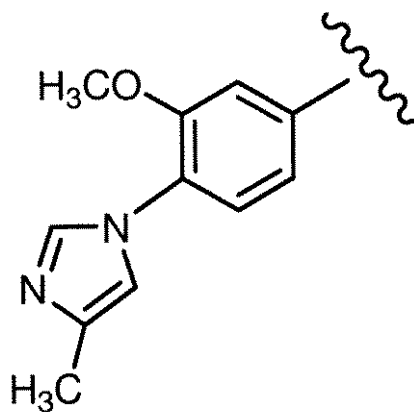
である請求項 1 4 に記載の化合物。

30

【請求項 1 9】

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分が、

【化 1 2】



40

である請求項 1 5 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

R⁶ がアルキルであり；R⁷ が、

50

フェニル、または

1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニル、または

1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニル、または

1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであって、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるハロゲンであるフェニル、または

1から3個のFで置換されたフェニル、または

1個の-CN基で置換されたフェニル、または

1もしくは2個の $-CF_3$ 基で置換されたフェニル、または

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が独立に選択されるフェニル、または

10

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

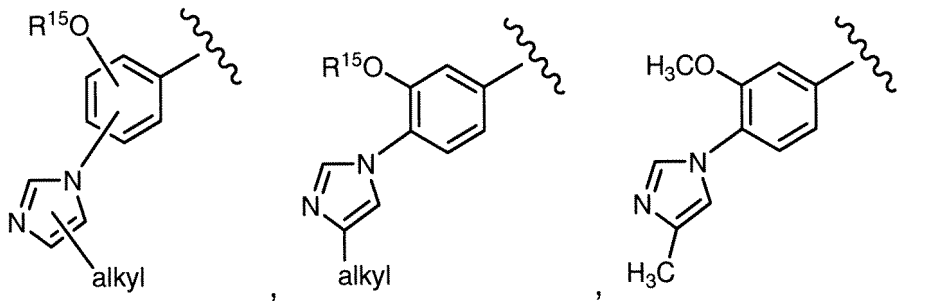
R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

R^{21} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択されるフェニルであり；

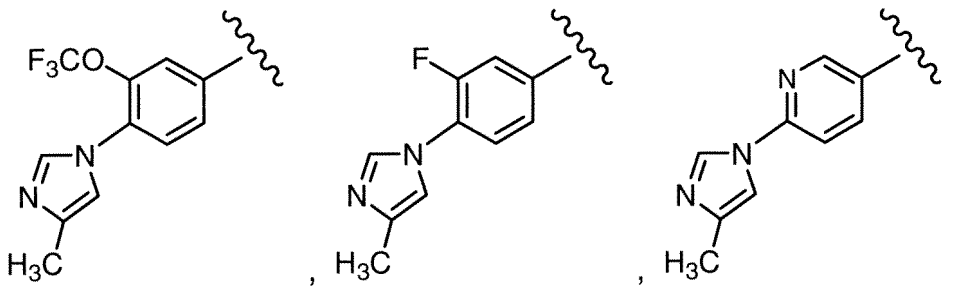
前記 $R^9 - R^{10}$ -部分が

20

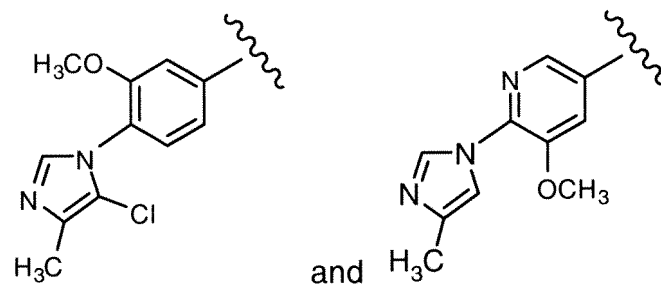
【化13】



30



40



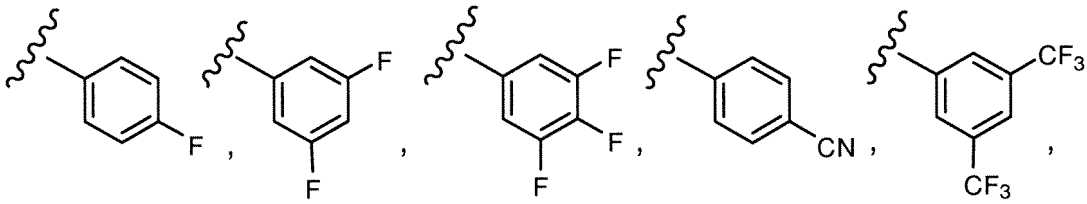
からなる群から選択される請求項16に記載の化合物。

【請求項21】

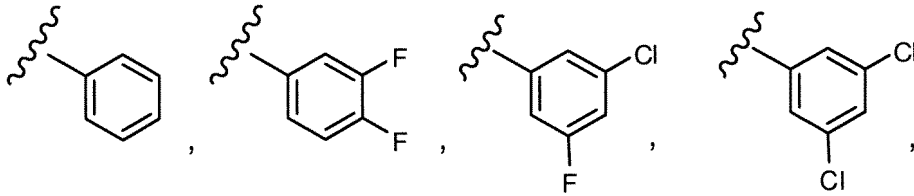
50

R⁷が

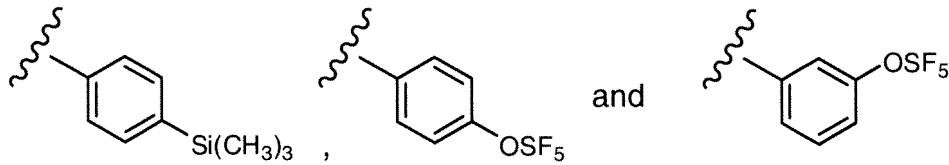
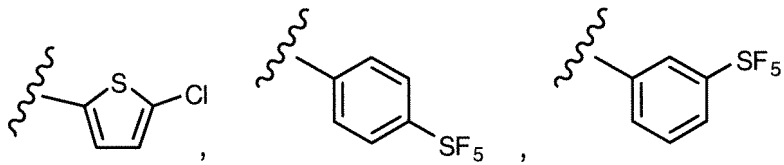
【化14】



10



20



からなる群から選択される請求項20に記載の化合物。

30

【請求項22】

化合物9および15から26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23】

前記化合物が化合物9である請求項1に記載の化合物。

【請求項24】

前記化合物が化合物15である請求項1に記載の化合物。

【請求項25】

前記化合物が化合物16である請求項1に記載の化合物。

【請求項26】

前記化合物が化合物17である請求項1に記載の化合物。

【請求項27】

前記化合物が化合物18である請求項1に記載の化合物。

40

【請求項28】

前記化合物が化合物20である請求項1に記載の化合物。

【請求項29】

前記化合物が化合物21である請求項1に記載の化合物。

【請求項30】

前記化合物が化合物22である請求項1に記載の化合物。

【請求項31】

前記化合物が化合物23である請求項1に記載の化合物。

【請求項32】

50

前記化合物が化合物 2 4 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 3】

前記化合物が化合物 2 5 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

前記化合物が化合物 2 6 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

(a) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体；または

(b) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体ならびに治療上有効量の B A C E 阻害薬；ムスカリン性拮抗薬；コリンエステラーゼ阻害薬； α -セクレターゼ阻害薬； α -セクレターゼ調節剤；H M G - C o A レダクターゼ阻害薬；非ステロイド系抗炎症剤；N - メチル - D - アスパラギン酸受容体拮抗薬；抗アミロイド抗体；ビタミン E；ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬；C B 1 受容体逆作動薬または C B 1 受容体拮抗薬；抗生物質；成長ホルモン分泌促進物質；ヒスタミン H 3 拮抗薬；A M P A 作動薬；P D E 4 阻害薬；G A B A_A 逆作動薬；アミロイド凝集阻害薬；グリコーゲンシンターゼキナーゼ 阻害薬； α -セクレターゼ活性促進剤；P D E - 1 0 阻害薬；エクセロン（リバスティグミン）；コグネックス（タクリン）；タウキナーゼ阻害薬（例えば、G S K 3 阻害薬、c d k 5 阻害薬または E R K 阻害薬）；抗 A β ワクチン；A P P リガンド；インシュリンを上昇させる薬剤、コレステロール降下剤（例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチンなどのスタチン類）；コレステロール吸収阻害薬（エゼチミブなど）；フィブラート類（例えばクロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラートおよびアルミニウムクロフィブラートなど）；L X R 作動薬；L R P 模倣薬；ニコチン性受容体作動薬；H 3 受容体拮抗薬；ヒストンデアセチラーゼ阻害薬；h s p 9 0 阻害薬；m 1 ムスカリン性受容体作動薬；5 - H T 6 受容体拮抗薬；m G l u R 1；m G l u R 5；陽性アロステリック調節剤または作動薬；m G l u R 2 / 3 拮抗薬；神経炎症を軽減することができる抗炎症剤；プロスタグランジン E P 2 受容体拮抗薬；P A I - 1 阻害薬；およびゲルソリンなどの A β 流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される 1 以上の化合物を含む医薬組成物。

10

20

30

【請求項 3 6】

(a) 処置を必要とする患者に対して治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を投与する段階；または

(a) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体を含む治療上有効量の医薬組成物を投与する段階；または

(b) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体ならびに治療上有効量の B A C E 阻害薬；ムスカリン性拮抗薬；コリンエステラーゼ阻害薬； α -セクレターゼ阻害薬； α -セクレターゼ調節剤；H M G - C o A レダクターゼ阻害薬；非ステロイド系抗炎症剤；N - メチル - D - アスパラギン酸受容体拮抗薬；抗アミロイド抗体；ビタミン E；ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬；C B 1 受容体逆作動薬または C B 1 受容体拮抗薬；抗生物質；成長ホルモン分泌促進物質；ヒスタミン H 3 拮抗薬；A M P A 作動薬；P D E 4 阻害薬；G A B A_A 逆作動薬；アミロイド凝集阻害薬；グリコーゲンシンターゼキナーゼ 阻害薬； α -セクレターゼ活性促進剤；P D E - 1 0 阻害薬；エクセロン；コグネックス；タウキナーゼ阻害薬；抗 A β ワクチン；A P P リガンド；インシュリンを上昇させる薬剤、コレステロール降下剤；コレステロール吸収阻害薬；フィブラート類；L X R 作動薬；L R P 模倣薬；ニコチン性受容体

40

50

作動薬；H3受容体拮抗薬；ヒストンデアセチラーゼ阻害薬；hsp90阻害薬；m1ムスカリン性受容体作動薬；5-HT6受容体拮抗薬；mGluR1；mGluR5；陽性アロステリック調節剤または作動薬；mGluR2/3拮抗薬；神経炎症を軽減することができる抗炎症剤；プロスタグランジンEP2受容体拮抗薬；PAI-1阻害薬；およびゲルソリンなどのA流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される1以上の化合物を含む治療上有効量の医薬組成物を投与する段階を有する、中枢神経系障害、軽度認識障害、緑内障、脳アミロイド血管症、卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症または嗅覚機能喪失の治療方法。

【請求項37】

(a) 処置を必要とする患者に対して治療上有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を投与する段階；または

(b) 処置を必要とする患者に対して治療上有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を治療上有効量のBACE阻害薬と組み合わせて投与する段階を有するアルツハイマー病の治療方法。

【請求項38】

処置を必要とする患者に対して治療上有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、ダウン症候群の治療方法。

【請求項39】

(a) 処置を必要とする患者に対して有効量の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、
- セクレターゼ活性を調節する；または

(b) 処置を必要とする患者に対して有効量の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、
- アミロイドタンパク質の沈着を阻害する；または

(c) 処置を必要とする患者に対して有効量の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、1以上の神経変性疾患を治療する方法。

【請求項40】

(1) 処置を必要とする患者に対して、有効量のBACE阻害薬；ムスカリン性拮抗薬；コリンエステラーゼ阻害薬；
- セクレターゼ阻害薬；
- セクレターゼ調節剤；HMGC-CoAレダクターゼ阻害薬；非ステロイド系抗炎症剤；N-メチル-D-アスパラギン酸受容体拮抗薬；抗アミロイド抗体；ビタミンE；ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬；CB1受容体逆作動薬またはCB1受容体拮抗薬；抗生物質；成長ホルモン分泌促進物質；ヒスタミンH3拮抗薬；AMPA作動薬；PDE4阻害薬；GABA_A逆作動薬；アミロイド凝集阻害薬；グリコーゲンシンターゼキナーゼ阻害薬；
- セクレターゼ活性促進剤；PDE-10阻害薬；エクセロン；コグネックス；タウキナーゼ阻害薬；抗Aワクチン；APPRリガンド；インシュリンを上昇させる薬剤、コレステロール降下剤；コレステロール吸収阻害薬；フィブラート類；LXR作動薬；LRP模倣薬；ニコチン性受容体作動薬；H3受容体拮抗薬；ヒストンデアセチラーゼ阻害薬；hsp90阻害薬；m1ムスカリン性受容体作動薬；5-HT6受容体拮抗薬；mGluR1；mGluR5；陽性アロステリック調節剤または作動薬；mGluR2/3拮抗薬；神経炎症を軽減することができる抗炎症剤；プロスタグランジンEP2受容体拮抗薬；PAI-1阻害薬；およびゲルソリンなどのA流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される1以上の他の医薬有効成分と組み合わせて1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有するアルツハイマー病の治療方法。

【請求項41】

(1) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、軽度認識障害を治療する；または

(2) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、緑内障を治療する；または

(3) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、脳アミロイド血管症を治療する；または

(4) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与

10

20

30

40

50

する段階を有する、卒中を治療する；または

(5) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、認知症を治療する；または

(6) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、小膠細胞症を治療する；または

(7) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、脳の炎症を治療する；または

(8) 処置を必要とする患者に対して有効量の1以上の請求項1に記載の化合物を投与する段階を有する、嗅覚機能喪失を治療する方法。

【請求項42】

前記式(I)の化合物が化合物9および15から26からなる群から選択される請求項37に記載の方法。

【請求項43】

前記式(I)の化合物が化合物9および15から26からなる群から選択される請求項40に記載の方法。

【請求項44】

前記式(I)の化合物が化合物9および15から26からなる群から選択される請求項41に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本願は、2008年12月22日出願の米国暫定特許出願第61/139665号の恩恵を主張するものである。

【0002】

本発明は、セクレターゼ調節剤(阻害薬、拮抗薬など)として有用なある種の複素環化合物、その化合物を含む医薬組成物、およびその化合物および組成物を用いる各種疾患の治療方法に関するものである。疾患および状態の例には、例えばアルツハイマー病、軽度認知障害(MCI)、ダウン症候群、緑内障、脳アミロイド血管症、卒中もしくは認知症、小膠細胞症および脳の炎症および嗅覚機能喪失などがある。

【背景技術】

【0003】

アルツハイマー病は、ニューロンの変性および損失を特徴とし、また、老人斑の形成および神経原線維変化も特徴とする疾患である。現在、アルツハイマー病の治療は、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤によって代表される症状改善剤を用いた対症療法に限られており、その疾患の進行を阻止する根本的な治療法は開発されていない。アルツハイマー病の根本的な治療法を創出するために、病的状態の発現の原因を抑制する方法を開発する必要がある。

【0004】

アミロイド前駆体タンパク質(以下、APPと称する)の代謝産物であるA_βタンパク質は、ニューロンの変性および損失ならびに認知症の状態の発現に大きく関与していると考えられる(例えば、可逆的記憶喪失に対する分子的基礎を示唆している、Klein W L et al., *Proceeding National Academy of Science USA*, 2003, Sep. 2, 100(18), 10417-22参照)。

【0005】

Nitsch R Mおよびその他16名(*Antibodies against amyloid slow cognitive decline in Alzheimer's disease*, *Neuron*, 2003, May 22, 38(4), 547-554)は、A_βタンパク質の主成分が、40のアミノ酸からなるA_β40、およびC末端に2つの追加のアミノ酸を有するA_β42であるということを示

10

20

30

40

50

唆している。A 40およびA 42は会合し(例えば、Jarrell J T et al., The carboxy terminus of the amyloid protein is critical for the seeding of amyloid formation: implications for the pathogenesis of Alzheimer's disease, *Biochemistry*, 1993, May 11, 32(18), 4693-4697を参照)、老人斑の主成分を構成する傾向がある(例えば、Glennner GG et al., Alzheimer's disease: initial report of the purification and characterization of a novel cerebrovascular amyloid protein, *Biochemical and Biophysical Research Communications*, 1984, May 16, 120(3), 885-90。また、Masters CL et al., Amyloid plaque core protein in Alzheimer disease and Down syndrome, *Proceeding National Academy of Science USA*, 1985, June, 82(12), 4245-4249も参照)。

【0006】

さらに、家族性アルツハイマー病において認められるAPPおよびプレセニン遺伝子の変異は、A 40およびA 42の産生を増大させることが公知である(例えば、Gouras GK et al., Intraneuronal A 142 accumulation in human brain, *American Journal of Pathology*, 2000, January, 156(1), 15-20を参照。また、Scheuner D et al., *Nature Medicine*, 1996, August, 2(8), 864-870;およびForman MS et al., Differential effects of the Swedish mutant amyloid precursor protein on β -amyloid accumulation and secretion in neurons and nonneuronal cells, *Journal of Biological Chemistry*, 1997, Dec. 19, 272(51), 32247-32253も参照)。したがって、A 40およびA 42の産生を低減させる化合物は、アルツハイマー病の進行を抑制するかまたはアルツハイマー病を防止するための薬剤として期待される。

【先行技術文献】

【非特許文献】

【0007】

【非特許文献1】Klein W L et al., *Proceeding National Academy of Science USA*, 2003, Sep. 2, 100(18), 10417-22.

【非特許文献2】Antibodies against β -amyloid slow cognitive decline in Alzheimer's disease, *Neuron*, 2003, May 22, 38(4), 547-554.

【非特許文献3】Jarrell J T et al., The carboxy terminus of the amyloid protein is critical for the seeding of amyloid formation: implications for the pathogenesis of Alzheimer's disease, *Biochemistry*, 1993, May 11, 32(18), 4693-4697.

【非特許文献4】Glennner GG et al., Alzheimer's d

isease: initial report of the purification and characterization of a novel cerebrovascular amyloid protein, *Biochemical and Biophysical Research Communications*, 1984, May 16, 120(3), 885-90.

【非特許文献5】Masters C L et al., Amyloid plaque core protein in Alzheimer disease and Down syndrome, *Proceeding National Academy of Science USA*, 1985, June, 82(12), 4245-4249.

【非特許文献6】Gouras G K et al., Intraneuronal A₁₄₂ accumulation in human brain, *American Journal of Pathology*, 2000, January, 156(1), 15-20.

【非特許文献7】Scheuner D et al., *Nature Medicine*, 1996, August, 2(8), 864-870.

【非特許文献8】Forman M S et al., Differential effects of the Swedish mutant amyloid precursor protein on β -amyloid accumulation and secretion in neurons and nonneuronal cells, *Journal of Biological Chemistry*, 1997, Dec. 19, 272(51), 32247-32253.

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0008】

これらのAは、APPが β -セクレターゼによって開裂され、続いて γ -セクレターゼによって切断される際に産生する。このことを考慮して、Aの産生を低減させる目的で、 β -セクレターゼおよび γ -セクレターゼの阻害剤の創出が試みられてきた。公知のこれらのセクレターゼ阻害剤の多くは、L-685458など、ペプチドまたはペプチド模倣薬である。L-685458、アスパルチルプロテアーゼ遷移状態模倣体は、 β -セクレターゼ活性の強力な阻害剤である(*Biochemistry*, 2000 Aug. 1, 39(30), 8698-8704)。

【0009】

本発明に関連して、さらに興味深いのは、US2007/0117798(Eisai、2007年5月24日公開)；US2007/0117839(Eisai、2007年5月24日公開)；US2006/0004013(Eisai、2006年1月5日公開)；WO2005/110422(Boehringer Ingelheim、2005年11月24日公開)；WO2006/045554(Cellzone AG、2006年5月4日公開)；WO2004/110350(Neurogenetics、2004年12月23日公開)；WO2004/071431(Myriad Genetics、2004年8月26日公開)；US2005/0042284(Myriad Genetics、2005年2月23日公開)およびWO2006/001877(Myriad Genetics、2006年1月5日公開)である。

【0010】

Aに関連する疾患および障害を治療するための新規な化合物、製剤、処置および治療法が必要とされている。従って本発明の目的は、そうした疾患および障害を治療または防止または改善するのに有用な化合物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0011】

本発明は、その多くの実施形態において、 β -セクレターゼ調節剤(阻害剤および拮抗

10

20

30

40

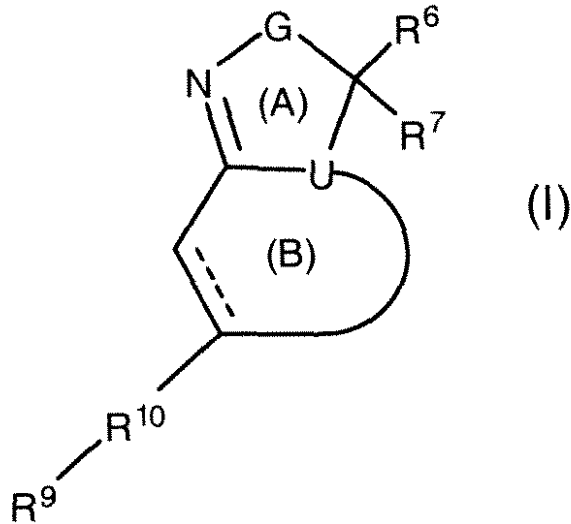
50

薬などを含める)としての新規な種類の化合物、そうした化合物を製造する方法、1以上のそうした化合物を含む医薬組成物、1以上のそうした化合物を含む医薬製剤を調製する方法、およびそうした化合物または医薬組成物を使用してAに関連する1以上の疾患を治療、予防、阻害または改善する方法を提供する。

【0012】

本発明は、下記式の -セクレターゼ調節剤であり新規化合物またはその製薬上許容される塩、エステルもしくは溶媒和物を提供する。

【化1】



10

20

【0013】

式中、置換基はいずれも下記で定義されており、いずれの置換基も独立に選択される。

【0014】

本発明は、式(I)の化合物も提供する。

【0015】

本発明は、全ての単離された形での式Iの化合物も含む。

【0016】

本発明は、純粋な単離された形態での式(I)の化合物も提供する。

30

【0017】

本発明は、化合物2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4P、5Pおよび化合物9および15から26からなる群から選択される式(I)の化合物も提供する。

【0018】

本発明は、化合物2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4Pおよび5Pからなる群から選択される式(I)の化合物も提供する。

40

【0019】

本発明は、化合物9および15から26からなる群から選択される式(I)の化合物も提供する。

50

【0020】

本発明は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物またはその製薬上許容される塩、エステルもしくは溶媒和物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物も提供する。

【0021】

本発明は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物またはその製薬上許容される塩、エステルもしくは溶媒和物および有効量の1以上（例えば、1）の他の医薬有効成分（例えば、薬剤）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物も提供する。

【0022】

式（I）の化合物は、
- セクレターゼ調節剤として有用であることができ、例えば、アルツハイマー病およびダウン症候群などの中枢神経系障害などの疾患の治療および予防に有用であることができる。

10

【0023】

したがって、本発明は、（1）
- セクレターゼを調節（阻害および拮抗などを含める）する、（2）1以上の神経変性疾患を治療する、（3）神経組織（例えば、脳）の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドタンパク質）の沈着を阻害する、（4）アルツハイマー病、および（5）ダウン症候群を治療するための方法も提供し、ここで各方法は、有効量の1つまたは複数（例えば、1）の式（I）の化合物を、そうした治療を必要とする患者に投与する段階を含む。

【0024】

本発明は、（1）
- セクレターゼを調節する、または（2）1以上の神経変性疾患を治療する、または（3）神経組織（例えば、脳）の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドタンパク質）の沈着を阻害する、または（4）アルツハイマー病を治療するための併用療法も提供する。その併用療法は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物の投与、および有効量の1以上（例えば、1）の他の医薬有効成分（例えば、薬物）の投与を含む方法を対象とする。

20

【0025】

本発明は、（1）軽度認知障害を治療する、（2）緑内障を治療する、（3）脳アミロイド脈管障害を治療する、（4）脳卒中を治療する、（5）認知症を治療する、（6）小膠細胞症を治療する、（7）脳炎を治療する、および（8）嗅覚機能喪失を治療する方法も提供し、各方法は、有効量の1以上（例えば、1つ）の式（I）の化合物を、そうした治療を必要とする患者に投与する段階を含む。

30

【0026】

本発明は、単一のパッケージ中の別々の容器内に、組み合わせて使用するための医薬組成物を含むキットであって、一つの容器が製薬上許容される担体中に有効量の式（I）の化合物を含み、別の容器（即ち、第2の容器）が有効量の別の医薬有効成分（下記の記載）を含み、式（I）の化合物および他の医薬有効成分を合わせた量が、上記方法のいずれかで述べた疾患または状態を治療するのに有効であるキットも提供する。

【0027】

本発明は、前記式（I）の化合物が2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4Pおよび5Pからなる群から選択される、上記で言及される方法、医薬組成物またはキットのいずれかも提供する。

40

【0028】

本発明は、前記式（I）の化合物が化合物9および15から26からなる群から選択される、上記で言及される方法、医薬組成物またはキットのいずれかも提供する。

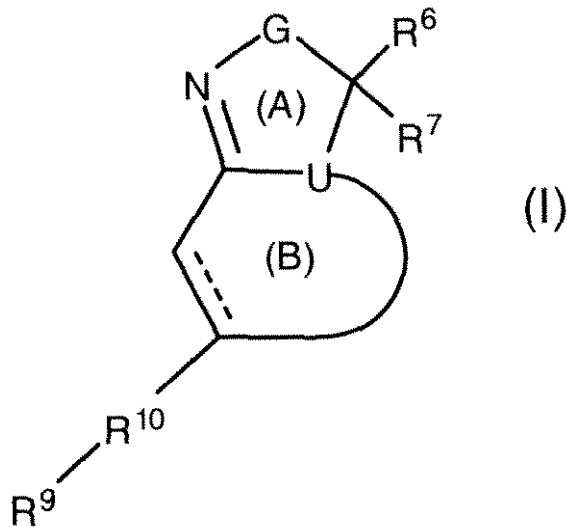
50

【発明を実施するための形態】

【0029】

本発明は、下記式(I)の -セクレターゼ調節剤として有用な化合物またはその製薬上許容される塩、エステルもしくは溶媒和物を提供する。

【化2】



10

20

【0030】

式中、

G、U、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰は独立に選択され；

式(I)における文字(A)および(B)は、式(I)に存在する環を識別するための参照文字であり；

GはN(R¹⁴)、C(O)、OおよびSからなる群から選択され；

UはCR⁵またはNであり；

環(B)における点線は存在しても良い結合を表し；

環(B)は5から8個の員環であり(環(A)と共通の原子を含む)、(1)UがCR⁵である場合、前記環(B)は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個のヘテロ原子を含んでいても良く、(2)UがNである場合、前記環(B)は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個の別のヘテロ原子を含んでいても良く；前記環(B)は1から5個の独立に選択されるR²¹基で置換されていても良く；

30

各R²は、H、-OH、-O-アルキル(すなわち、アルコキシ)、-O-(八口置換されたアルキル)(例えば、-O-フルオロアルキルなど)、-NH(R⁴)、-N(R⁴)₂(各R⁴は独立に選択される。)、-NH₂、-S(O)R⁴、-S(O)(OR⁴)、-S(O)₂R⁴、-S(O)₂(OR⁴)、-S(O)NHR⁴、-S(O)N(R⁴)₂、-S(O)NH₂、-S(O)₂NHR⁴、-S(O)₂N(R⁴)₂、-S(O)₂NH₂、-CN、-C(O)₂R⁴、-C(O)NHR⁴、-C(O)N(R⁴)₂、-C(O)NH₂、-C(O)R⁴、置換されていないアリール、置換されているアリール、置換されていないヘテロアリール、置換されているヘテロアリール、置換されていないアルキル、置換されているアルキル、置換されていないアリールアルキル-、置換されているアリールアルキル-、置換されていないヘテロアリールアルキル-、置換されているヘテロアリールアルキル-、置換されていないアルケニル、置換されているアルケニル、置換されていないアルキニル、置換されているアルキニル、置換されていないシクロアルキルおよび置換されているシクロアルキルからなる群から独立に選択され、前記置換されているアリール、ヘテロアリール、アルキル、アリールアルキル-、ヘテロアリールアルキル-、アルケニル、アルキニルおよびシクロアルキル基は1から5個の独立に選択されるR²¹基で置換されており；

40

50

各 R^4 は、置換されていないアリール、置換されているアリール、置換されていないヘテロアリール、置換されているヘテロアリール、置換されていないアルキル、置換されているアルキル、置換されていないアリールアルキル -、置換されているアリールアルキル -、置換されていないヘテロアリールアルキル -、置換されているヘテロアリールアルキル -、置換されていないアルケニル、置換されているアルケニル、置換されていないアルキニル、置換されているアルキニル、置換されていないシクロアルキルおよび置換されているシクロアルキルからなる群から独立に選択され、前記置換されているアリール、ヘテロアリール、アルキル、アリールアルキル -、ヘテロアリールアルキル -、アルケニル、アルキニルおよびシクロアルキル基は 1 から 5 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されており；

10

R^5 は、H、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され；前記 R^5 アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - 基のそれぞれは 1 から 5 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

R^6 および R^7 はそれぞれ独立に H、 $-C(O)R^{1,5}$ 、 $-C(O)OR^{1,5}$ 、 $-C(O)N(R^{1,5})(R^{1,6})$ 、 $-C(=NOR^{1,5})R^{1,6}$ 、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル -、ベンゾ縮合シクロアルキル（すなわち、縮合ベンゾシクロアルキル）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；前記 R^6 および R^7 アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 -、複素環アルキル -、ベンゾ縮合シクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルおよび縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル基のそれぞれは 1 から 5 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；または

20

30

R^6 および R^7 がそれらが結合している炭素原子と一体となって、スピロ環状炭素環部分またはスピロ環状複素環部分を形成しており、

(a) 前記スピロ環状炭素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

(b) 前記スピロ環状複素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

(c) 前記スピロ環状炭素環部分がアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

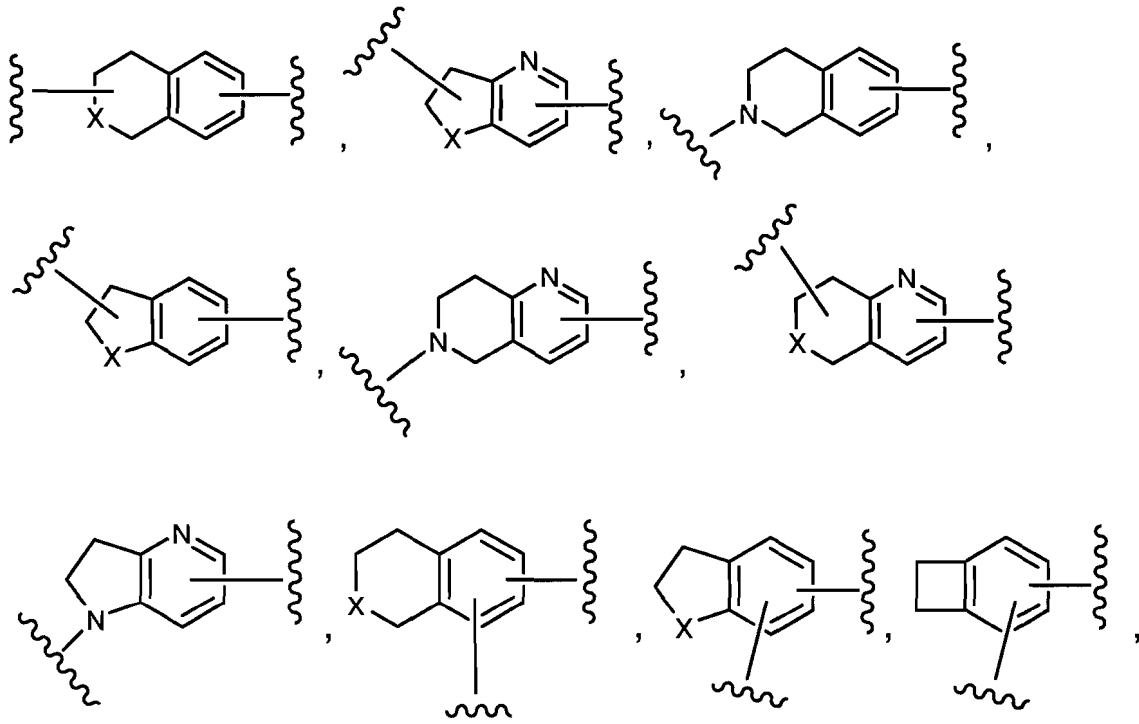
(d) 前記スピロ環状複素環部分はアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

40

R^9 は、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され、各 R^9 基は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されていても良く；

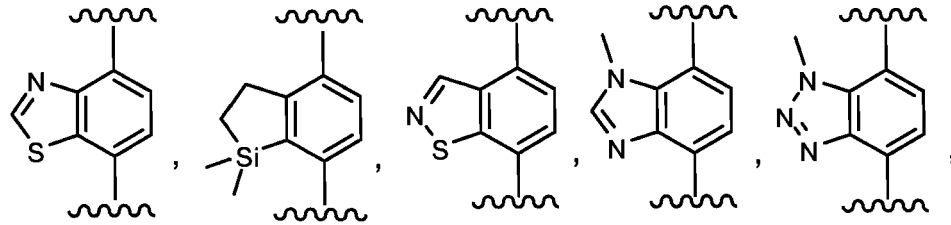
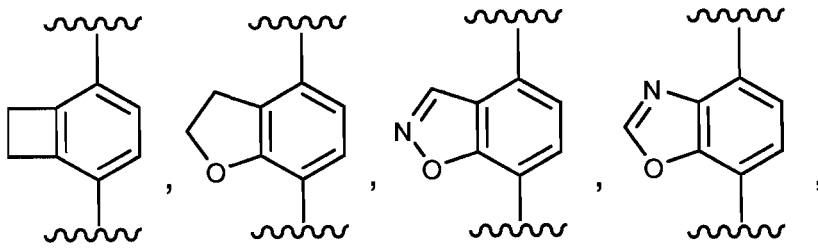
$R^{1,0}$ は、結合、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 -、複素環アルキル -、

【化 3】

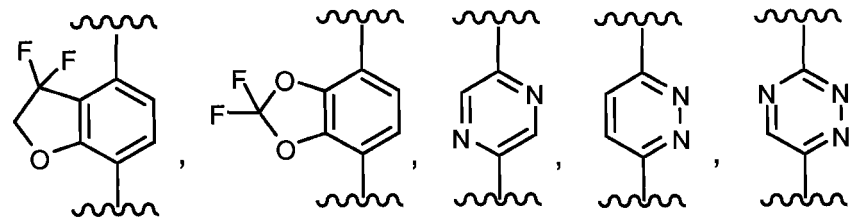


10

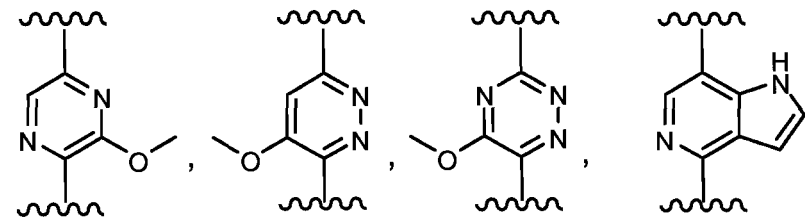
20



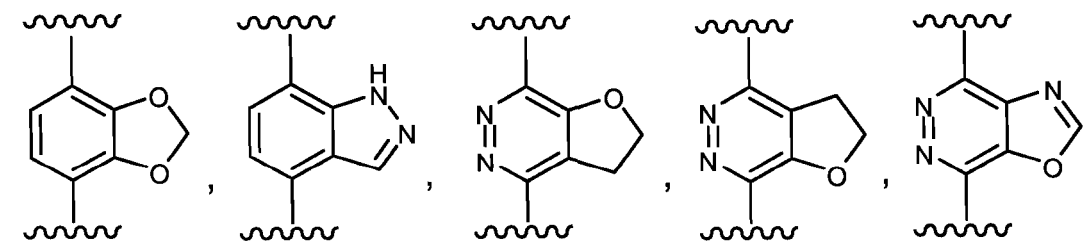
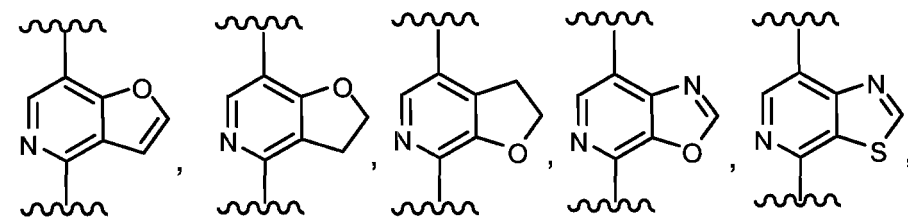
10



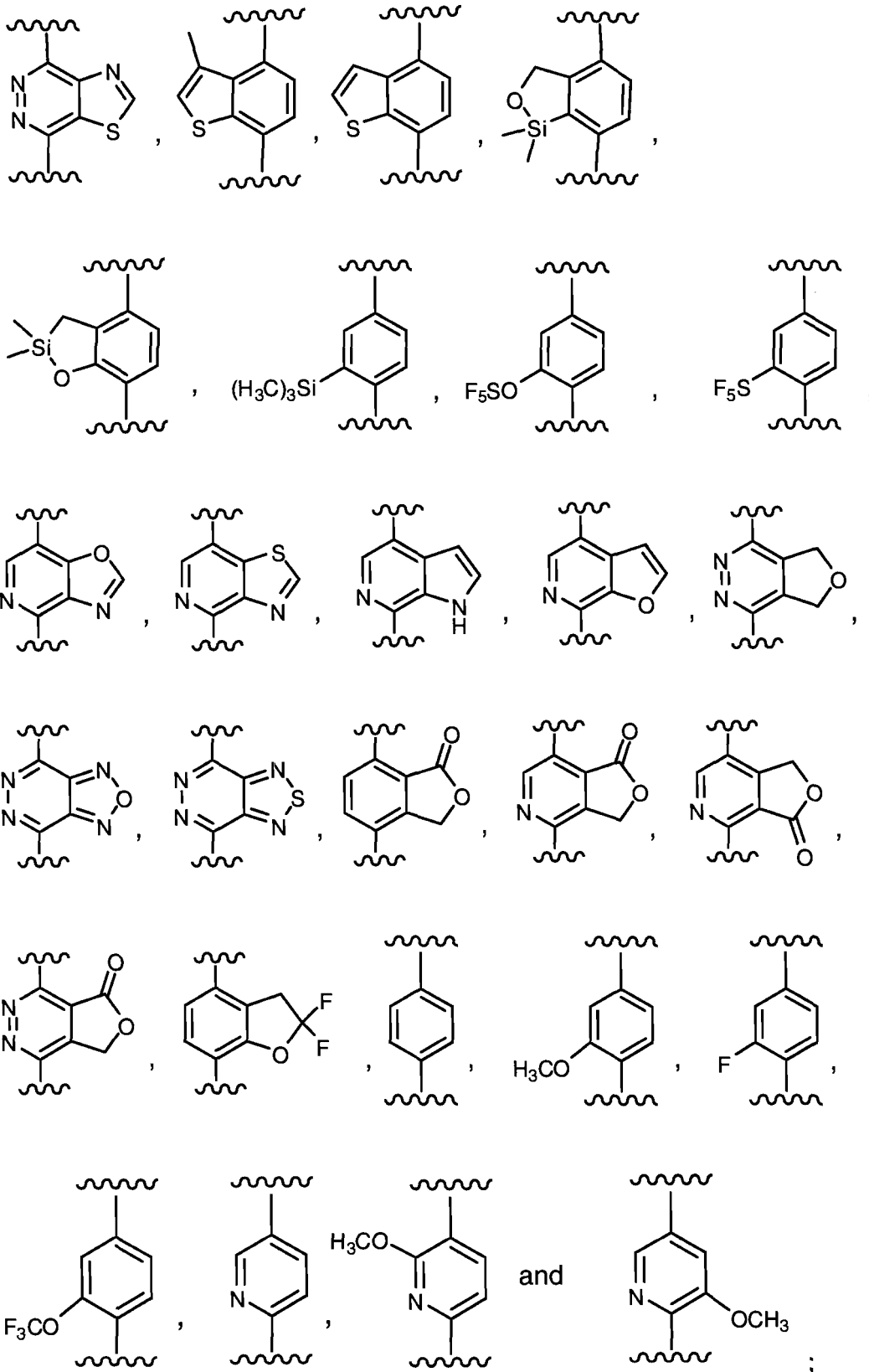
20



30



40



からなる群から選択され；

Xは、O、N (R^{14}) または S からなる群から選択され；前記 R^{10} 基のそれぞれは 1 から 3 個の独立に選択される R^{21} 置換基で置換されていても良く；

R^9 は、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリ

ール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され；前記アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - 基のそれぞれは置換されていないか、同一もしくは異なることができる 1 から 3 個の置換基で独立に置換されていることができ、各置換基は独立に下記に示す部分からなる群から選択され；

R^{14} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、アリール、アリールアルキル -、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、
 - CN、- C(O) R^{15} 、- C(O) OR R^{15} 、- C(O) N (R^{15}) (R^{16})、
 - S(O) N (R^{15}) (R^{16})、- S(O)₂ N (R^{15}) (R^{16})、- C(=N OR R^{15}) R^{16} および - P(O) (OR R^{15}) (OR R^{16}) からなる群から選択され、
 前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキル基のそれぞれは独立に置換されていないか 1 から 5 個の R^{21} 基で置換されており；

各 R^{15A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル -、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅
 - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアル
 キル -、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})
 1-5 - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロア
 リールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され
 ；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

各 R^{16A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅
 - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアル
 キル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})₁₋₅
 5 - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロア
 リールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され；各
 基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

R^{15} 、 R^{16} および R^{17} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅
 - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅
 - シクロアルキルアルキル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アル
 キル、(R^{18})₁₋₅ - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})
 1-5 - ヘテロアリールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群か
 ら独立に選択され；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることが
 でき；

各 R^{18} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ア
 リールアルケニル、アリールアルキニル、- NO₂、ハロ、ヘテロアリール、HO - アルキ
 ロキシアルキル、- CF₃、- CN、アルキル - CN、- C(O) R^{19} 、- C(O) O
 H、- C(O) OR R^{19} 、- C(O) NHR²⁰、- C(O) NH₂、- C(O) NH₂
 - C(O) N (アルキル)₂、- C(O) N (アルキル) (アリール)、- C(O) N (ア
 ルキル) (ヘテロアリール)、- SR¹⁹、- S(O)₂ R²⁰、- S(O) NH₂、
 - S(O) NH (アルキル)、- S(O) N (アルキル) (アルキル)、- S(O) NH
 (アリール)、- S(O)₂ NH₂、- S(O)₂ NHR¹⁹、- S(O)₂ NH (複素
 環)、- S(O)₂ N (アルキル)₂、- S(O)₂ N (アルキル) (アリール)、- O

10

20

30

40

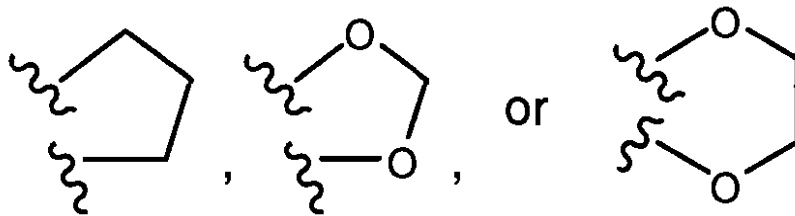
50

CF₃、-OH、-OR²⁰、-O-複素環、-O-シクロアルキルアルキル、-O-複素環アルキル、-NH₂、-NHR²⁰、-N(アルキル)₂、-N(アリールアルキル)₂、-N(アリールアルキル)-(ヘテロアリールアルキル)、-NHC(O)R²⁰、-NHC(O)NH₂、-NHC(O)NH(アルキル)、-NHC(O)N(アルキル)(アルキル)、-N(アルキル)C(O)NH(アルキル)、-N(アルキル)C(O)N(アルキル)(アルキル)、-NHS(O)₂R²⁰、-NHS(O)₂NH(アルキル)、-NHS(O)₂N(アルキル)(アルキル)、-N(アルキル)S(O)₂NH(アルキル)および-N(アルキル)S(O)₂N(アルキル)(アルキル)からなる群から独立に選択され；

または、隣接する炭素上の二つのR¹⁸部分が、それらが結合している原子と一体とな

10

【化4】



【0032】

20

を形成していることができ；

R¹⁹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R²⁰は、アルキル、シクロアルキル、アリール、八口置換されたアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

各R²¹は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、八口、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SF₅、-OSF₅、-Si(R^{15A})₃(各R^{15A}は独立に選択される。)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-アルキル-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R^{16A}、-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R^{15A}、-N₃、-NO₂および-S(O)₂R^{15A}からなる群から独立に選択され；前記アルキル、シクロアルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アルケニルおよびアルキニルR²¹基のそれぞれが1から5個の独立に選択されるR²²基で置換されていても良く；

30

40

各R²²は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、八口、-CF₃、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-アルキル-C(O)OR¹⁵、C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SF₅、-OSF₅、-Si(R^{15A})₃(各R^{15A}は独立に選択される。)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)

50

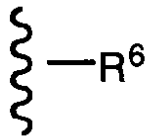
、 - C (= N O R ^{1 5}) R ^{1 6}、 - P (O) (O R ^{1 5}) (O R ^{1 6})、 - N (R ^{1 5}) (R ^{1 6})、 - アルキル - N (R ^{1 5}) (R ^{1 6})、 - N (R ^{1 5}) C (O) R ^{1 6}、 - C H ₂ - N (R ^{1 5}) C (O) R ^{1 6}、 - N (R ^{1 5}) S (O) R ^{1 6 A}、 - N (R ^{1 5}) S (O) ₂ R ^{1 6 A}、 - C H ₂ - N (R ^{1 5}) S (O) ₂ R ^{1 6 A}、 - N (R ^{1 5}) S (O) ₂ N (R ^{1 6}) (R ^{1 7})、 - N (R ^{1 5}) S (O) N (R ^{1 6}) (R ^{1 7})、 - N (R ^{1 5}) C (O) N (R ^{1 6}) (R ^{1 7})、 - C H ₂ - N (R ^{1 5}) C (O) N (R ^{1 6}) (R ^{1 7})、 - N (R ^{1 5}) C (O) O R ^{1 6}、 - C H ₂ - N (R ^{1 5}) C (O) O R ^{1 6}、 - N ₃、 = N O R ^{1 5}、 - N O ₂、 - S (O) R ^{1 5 A} および - S (O) ₂ R ^{1 5 A} からなる群から独立に選択される。

【 0 0 3 3 】

10

前記部分：

【 化 5 】

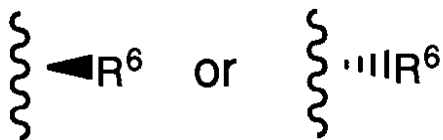


【 0 0 3 4 】

が立体化学：

20

【 化 6 】



【 0 0 3 5 】

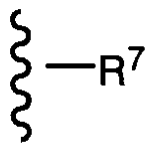
を有することができることは、当業者には明らかであろう。

【 0 0 3 6 】

部分

30

【 化 7 】

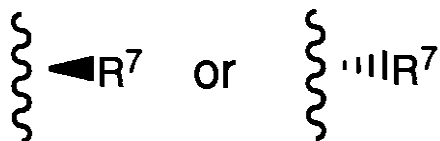


【 0 0 3 7 】

は、立体化学：

【 化 8 】

40



【 0 0 3 8 】

を有することができる。

【 0 0 3 9 】

従って、本発明の 1 実施形態において、前記 R ⁶ および R ⁷ 部分は、立体化学：

【化 9】



【0040】

を有することができる。

【0041】

本発明の別の実施形態において、前記 R⁶ および R⁷ 部分は、立体化学：

【化 10】



【0042】

を有することができる。

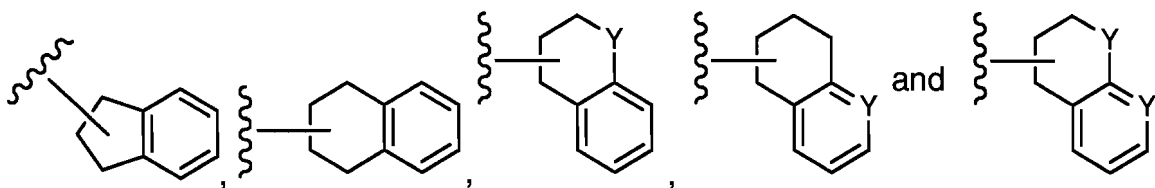
【0043】

R⁶ および R⁷ ベンゾ縮合シクロアルキル（すなわち、縮合ベンゾシクロアルキル）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルおよび縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル基は、1 から 5 個の独立に選択される R^{2 1} 基で置換されていても良い。1 例において、R^{2 1} 基はハロ（例えば、F）である。

【0044】

縮合環 R⁶ および R⁷ 基の例には、

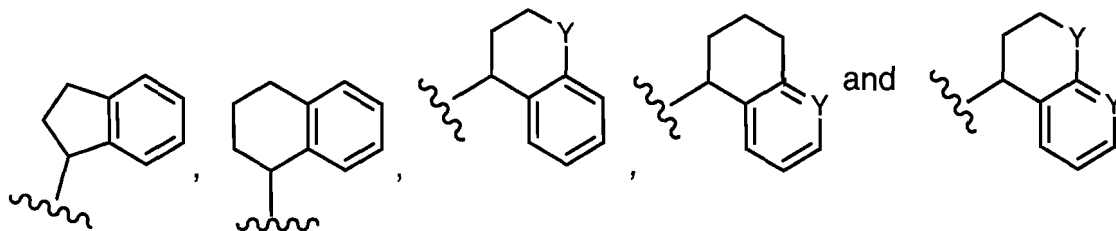
【化 11】



【0045】

などがあるが、これらに限定されるものではなく、各 Y は、- O -、- NR^{1 4} - および - C(R^{2 1})_q - からなる群から独立に選択され（q は 0、1 または 2 であり、各 R^{2 1} は独立に選択される。）、R^{1 4} および R^{2 1} は式 (I) について定義の通りである。これら縮合環 R⁶ および R⁷ 基の例には、例えば

【化 12】



【0046】

などがある。

【0047】

10

20

30

40

50

本発明の化合物は、例えば、アルツハイマー病およびアミロイドタンパク質の沈着が関係する他の疾患などの神経変性疾患のような中枢神経系障害を治療する上で有用である。それらは、例えばアルツハイマー病およびダウン症候群などのA β によって引き起こされる疾患の治療において有効であるアミロイド（以下、A β と称される）産生低下において特に有用である。

【0048】

従って、例えば、本発明の化合物は、アルツハイマー病、軽度認知障害（MCI）、ダウン症候群、緑内障（Guo et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 104, 13444-13449 (2007)）、脳アミロイド血管症、卒中または認知症（Frangione et al., Amyloid: J. Protein folding Disord. 8, suppl. 1, 36-42 (2001)）、小膠細胞症および脳の炎症（M P Lamber, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 95, 6448-53 (1998)）および嗅覚機能喪失（Getchell, et al. Neurobiology of Aging, 663-673, 24, 2003）という疾患および状態を治療するのに用いることができる。

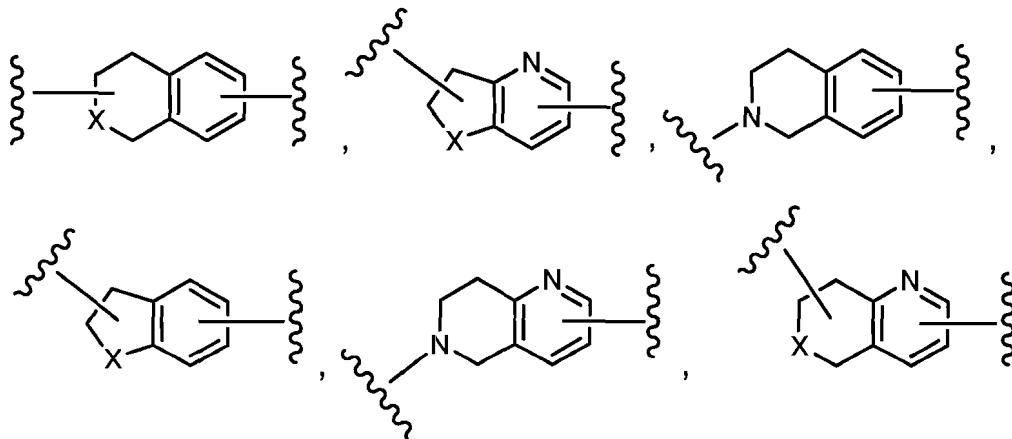
10

【0049】

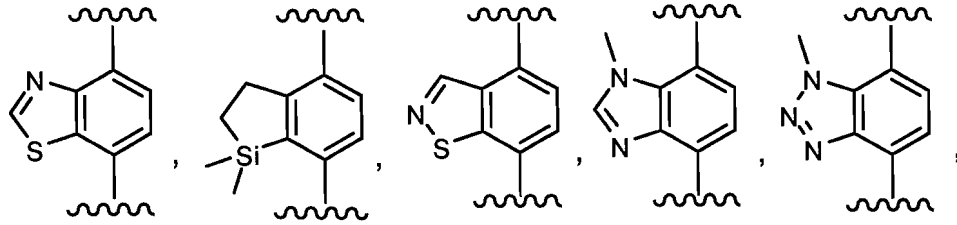
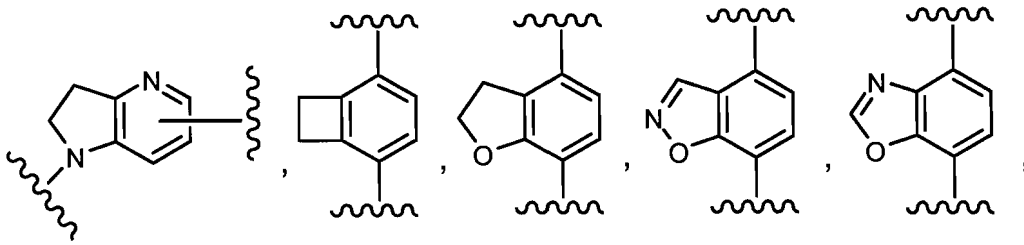
1実施形態において、R¹⁰は、結合、アルキル-、アルケニル-、アルキニル-、アリール-、アリールアルキル-、アルキルアリール-、シクロアルキル-、シクロアルキルアルキル-、ヘテロアリール-、ヘテロアリールアルキル-、複素環-、複素環アルキル-

20

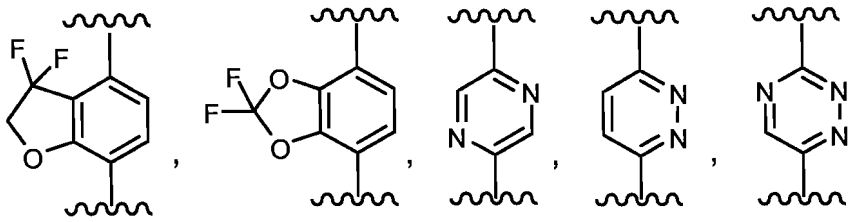
【化13】



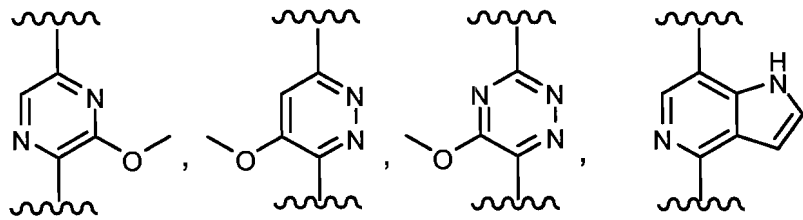
30



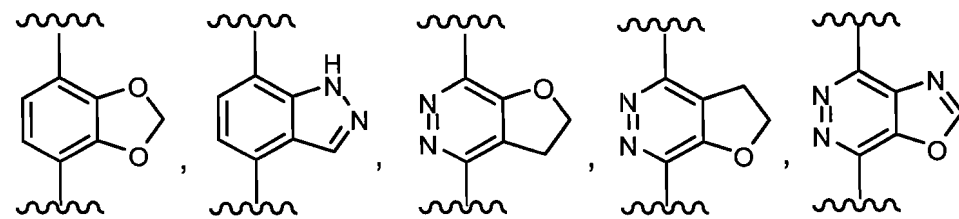
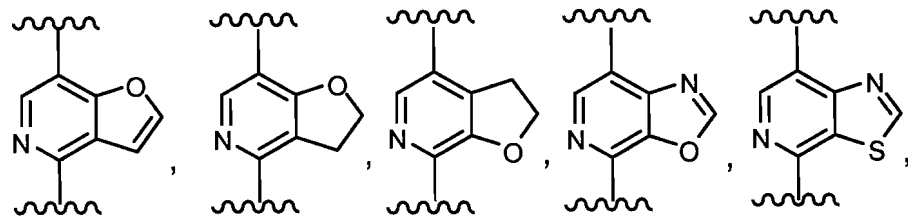
10



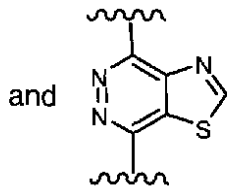
20



30



40



【0050】

からなる群から選択され、XはO、N(R^{14})またはSからなる群から選択され；前記 R^{10} 基のそれぞれは1から3個の独立に選択される R^{21} 置換基で置換されていても良い。

【0051】

本発明の1実施形態において、Uは CR^5 である。

【0052】

本発明の別の実施形態において、UはNである。

【0053】

本発明の1実施形態においてBは5員環である。

【0054】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、適宜の結合が存在する。

【0055】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、適宜の結合は非存在である。

【0056】

本発明の1実施形態においてBは6員環である。

【0057】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、適宜の結合が存在する。

【0058】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、適宜の結合は非存在である。

【0059】

本発明の1実施形態においてBは7員環である。

【0060】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、適宜の結合が存在する。

【0061】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、適宜の結合は非存在である。

【0062】

本発明の1実施形態において、Bは8員環である。

【0063】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、適宜の結合が存在する。

【0064】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、適宜の結合は非存在である。

【0065】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、Uは CR^5 である。

【0066】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0067】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0068】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、Uは CR^5 である。

【0069】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が

10

20

30

40

50

存在する。

【0070】

本発明の別の実施形態において、 B は6員環であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0071】

本発明の1実施形態において B は7員環であり、 U は CR^5 である。

【0072】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0073】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0074】

本発明の1実施形態において、 B は8員環であり、 U は CR^5 である。

【0075】

本発明の別の実施形態において、 B は8員環であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0076】

本発明の別の実施形態において、 B は8員環であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0077】

本発明の1実施形態において B は5員環であり、 U は N である。

【0078】

本発明の別の実施形態において、 B は5員環であり、 U は N であり、適宜の結合が存在する。

【0079】

本発明の別の実施形態において、 B は5員環であり、 U は N であり、適宜の結合は非存在である。

【0080】

本発明の1実施形態において B は6員環であり、 U は N である。

【0081】

本発明の別の実施形態において、 B は6員環であり、 U は N であり、適宜の結合が存在する。

【0082】

本発明の別の実施形態において、 B は6員環であり、 U は N であり、適宜の結合は非存在である。

【0083】

本発明の1実施形態において B は7員環であり、 U は N である。

【0084】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 U は N であり、適宜の結合が存在する。

【0085】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 U は N であり、適宜の結合は非存在である。

【0086】

本発明の1実施形態において、 B は8員環であり、 U は N である。

【0087】

本発明の別の実施形態において、 B は8員環であり、 U は N であり、適宜の結合が存在する。

【0088】

10

20

30

40

50

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0089】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0090】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0091】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

10

【0092】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0093】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0094】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

20

【0095】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0096】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0097】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0098】

30

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0099】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0100】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0101】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

40

【0102】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0103】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0104】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

50

- 【 0 1 0 5 】
 本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。
- 【 0 1 0 6 】
 本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。
- 【 0 1 0 7 】
 本発明の1実施形態においてBは7員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。
- 【 0 1 0 8 】 10
 本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。
- 【 0 1 0 9 】
 本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。
- 【 0 1 1 0 】
 本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。
- 【 0 1 1 1 】 20
 本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。
- 【 0 1 1 2 】
 本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。
- 【 0 1 1 3 】
 本発明の1実施形態において、GはOである。
- 【 0 1 1 4 】
 本発明の別の実施形態において、GはOであり、Uは CR^5 である。
- 【 0 1 1 5 】 30
 本発明の別の実施形態において、GはOであり、UはNである。
- 【 0 1 1 6 】
 本発明の別の実施形態において、GはSである。
- 【 0 1 1 7 】
 本発明の別の実施形態において、GはSであり、Uは CR^5 である。
- 【 0 1 1 8 】
 本発明の別の実施形態において、GはSであり、UはNである。
- 【 0 1 1 9 】
 本発明の1実施形態においてGはC(O)である。
- 【 0 1 2 0 】 40
 本発明の別の実施形態において、GはC(O)であり、Uは CR^5 である。
- 【 0 1 2 1 】
 本発明の別の実施形態において、GはC(O)であり、UはNである。
- 【 0 1 2 2 】
 本発明の別の実施形態において、GはC(O)である。
- 【 0 1 2 3 】
 本発明の別の実施形態において、GはC(O)であり、Uは CR^5 である。
- 【 0 1 2 4 】
 本発明の別の実施形態において、GはC(O)であり、UはNである。
- 【 0 1 2 5 】 50
 本発明の1実施形態においてGは $N(R^{14})$ である。

【 0 1 2 6 】

本発明の別の実施形態において、 G は $N(R^{14})$ であり、 U は CR^5 である。

【 0 1 2 7 】

本発明の別の実施形態において、 G は $N(R^{14})$ であり、 U は N である。

【 0 1 2 8 】

本発明の1実施形態において G は $N(R^{14})$ であり、 R^{14} は H である(すなわち、 G は NH である。)。

【 0 1 2 9 】

本発明の別の実施形態において、 G は $N(R^{14})$ であり、 R^{14} は H であり(すなわち、 G は NH である。)、 U は CR^5 である。

10

【 0 1 3 0 】

本発明の別の実施形態において、 G は $N(R^{14})$ であり、 R^{14} は H であり(すなわち、 G は NH である。)、 U は N である。

【 0 1 3 1 】

本発明の1実施形態において B は5員環であり、 G は O である。

【 0 1 3 2 】

本発明の別の実施形態において、 B は5員環であり、 G は O であり、適宜の結合が存在する。

【 0 1 3 3 】

本発明の別の実施形態において、 B は5員環であり、 G は O であり、適宜の結合は非存在である。

20

【 0 1 3 4 】

本発明の1実施形態において B は6員環であり、 G は O である。

【 0 1 3 5 】

本発明の別の実施形態において、 B は6員環であり、 G は O であり、適宜の結合が存在する。

【 0 1 3 6 】

本発明の別の実施形態において、 B は6員環であり、 G は O であり、適宜の結合は非存在である。

【 0 1 3 7 】

本発明の1実施形態において B は7員環であり、 G は O である。

30

【 0 1 3 8 】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 G は O であり、適宜の結合が存在する。

【 0 1 3 9 】

本発明の別の実施形態において、 B は7員環であり、 G は O であり、適宜の結合は非存在である。

【 0 1 4 0 】

本発明の1実施形態において、 B は8員環であり、 G は O である。

【 0 1 4 1 】

本発明の別の実施形態において、 B は8員環であり、 G は O であり、適宜の結合が存在する。

40

【 0 1 4 2 】

本発明の別の実施形態において、 B は8員環であり、 G は O であり、適宜の結合は非存在である。

【 0 1 4 3 】

本発明の1実施形態において B は5員環であり、 G は O であり、 U は CR^5 である。

【 0 1 4 4 】

本発明の別の実施形態において、 B は5員環であり、 G は O であり、 U は CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

50

- 【0145】
本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。
- 【0146】
本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵である。
- 【0147】
本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。
- 【0148】
本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。 10
- 【0149】
本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵である。
- 【0150】
本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。
- 【0151】
本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。 20
- 【0152】
本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵である。
- 【0153】
本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。
- 【0154】
本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。
- 【0155】
本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはOであり、UはNである。 30
- 【0156】
本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。
- 【0157】
本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。
- 【0158】
本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはNである。
- 【0159】
本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。 40
- 【0160】
本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。
- 【0161】
本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはNである。
- 【0162】
本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。
- 【0163】
本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、適 50

宜の結合は非存在である。

【0164】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNである。

【0165】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0166】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0167】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0168】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0169】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0170】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0171】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0172】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0173】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0174】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0175】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0176】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0177】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0178】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0179】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0180】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環

10

20

30

40

50

Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0181】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0182】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0183】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

10

【0184】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0185】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0186】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0187】

20

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0188】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0189】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0190】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

30

【0191】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはSである。

【0192】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、適宜の結合が存在する。

【0193】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、適宜の結合は非存在である。

【0194】

40

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはSである。

【0195】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、適宜の結合が存在する。

【0196】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、適宜の結合は非存在である。

【0197】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはSである。

【0198】

50

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、適宜の結合が存在する。

【0199】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、適宜の結合は非存在である。

【0200】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはSである。

【0201】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、適宜の結合が存在する。

10

【0202】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、適宜の結合は非存在である。

【0203】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはSであり、Uは CR^5 である。

【0204】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0205】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

20

【0206】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはSであり、Uは CR^5 である。

【0207】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0208】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0209】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはSであり、Uは CR^5 である。

30

【0210】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0211】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0212】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、Uは CR^5 である。

【0213】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

40

【0214】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0215】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはSであり、UはNである。

【0216】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

50

【0217】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0218】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはSであり、UはNである。

【0219】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0220】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

10

【0221】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはSであり、UはNである。

【0222】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0223】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0224】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、UはNである。

20

【0225】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0226】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0227】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

30

【0228】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0229】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0230】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0231】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

40

【0232】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0233】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0234】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり

50

、環 B に 1 もしくは 2 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0235】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は S であり、U は C R⁵ であり、環 B に 1 もしくは 2 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0236】

本発明の 1 実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は C R⁵ であり、環 B に 1 もしくは 2 個のヘテロ原子が存在する。

【0237】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は C R⁵ であり、環 B に 1 もしくは 2 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0238】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は C R⁵ であり、環 B に 1 もしくは 2 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0239】

本発明の 1 実施形態において B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0240】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0241】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

20

【0242】

本発明の 1 実施形態において B は 6 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0243】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は S であり、U は N であり、適宜の結合が存在する。

【0244】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

30

【0245】

本発明の 1 実施形態において B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0246】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0247】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

40

【0248】

本発明の 1 実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0249】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0250】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 もしくは 2 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0251】

50

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)である。

【0252】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合が存在する。

【0253】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合は非存在である。

【0254】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)である。

【0255】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合が存在する。

【0256】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合は非存在である。

【0257】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)である。

【0258】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合が存在する。

【0259】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合は非存在である。

【0260】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)である。

【0261】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合が存在する。

【0262】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、適宜の結合は非存在である。

【0263】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵である。

【0264】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。

【0265】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。

【0266】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵である。

【0267】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。

【0268】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。

【0269】

10

20

30

40

50

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵である。

【0270】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。

【0271】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。

【0272】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵である。 10

【0273】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合が存在する。

【0274】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、適宜の結合は非存在である。

【0275】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはNである。

【0276】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。 20

【0277】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0278】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)であり、UはNである。

【0279】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。 30

【0280】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0281】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)であり、UはNである。

【0282】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0283】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。 40

【0284】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNである。

【0285】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0286】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。 50

【0287】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0288】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0289】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0290】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

10

【0291】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0292】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0293】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

20

【0294】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0295】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0296】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

30

【0297】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0298】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0299】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0300】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

40

【0301】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0302】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0303】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはNであ

50

り、適宜の結合が存在する。

【0304】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0305】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0306】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0307】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0308】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0309】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0310】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

20

【0311】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはN(R¹₄)である。

【0312】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合が存在する。

【0313】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合は非存在である。

30

【0314】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはN(R¹₄)である。

【0315】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合が存在する。

【0316】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合は非存在である。

【0317】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはN(R¹₄)である。

40

【0318】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合が存在する。

【0319】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の結合は非存在である。

【0320】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹₄)である。

【0321】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹₄)であり、適宜の

50

結合が存在する。

【0322】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、適宜の結合は非存在である。

【0323】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 である。

【0324】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

10

【0325】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

【0326】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 である。

【0327】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0328】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

20

【0329】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 である。

【0330】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0331】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

30

【0332】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 である。

【0333】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合が存在する。

【0334】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、適宜の結合は非存在である。

40

【0335】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNである。

【0336】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0337】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0338】

50

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNである。

【0339】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0340】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0341】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNである。 10

【0342】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0343】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0344】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNである。 20

【0345】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0346】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはNであり、適宜の結合は非存在である。

【0347】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0348】 30

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0349】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0350】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0351】 40

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0352】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0353】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、Uは CR^5 であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0354】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、Gは $N(R^{14})$ であり、UはC 50

R⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0355】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはC R⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0356】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはC R⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在する。

【0357】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはC R⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0358】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはC R⁵であり、環Bに1もしくは2個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0359】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0360】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0361】

20

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0362】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0363】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、適宜の結合が存在する。

【0364】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

30

【0365】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0366】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0367】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

40

【0368】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在する。

【0369】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0370】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹⁴)であり、UはNであり、環Bに1もしくは2個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0371】

50

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0372】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0373】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0374】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。 10

【0375】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0376】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0377】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。 20

【0378】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0379】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0380】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0381】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。 30

【0382】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0383】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0384】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。 40

【0385】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0386】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0387】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。 50

【0388】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0389】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0390】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0391】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

10

【0392】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0393】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはOであり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0394】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

20

【0395】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0396】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0397】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

30

【0398】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0399】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0400】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0401】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

40

【0402】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0403】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0404】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはSであり、UはCR⁵であり

50

、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0405】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は CR^5 であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0406】

本発明の 1 実施形態において B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0407】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0408】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0409】

本発明の 1 実施形態において B は 6 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0410】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0411】

本発明の 1 実施形態において B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

20

【0412】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0413】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0414】

本発明の 1 実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

30

【0415】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0416】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は S であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0417】

本発明の 1 実施形態において B は 5 員環であり、G は $N(R^{14})$ であり、U は CR^5 であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在する。

40

【0418】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は $N(R^{14})$ であり、U は CR^5 であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0419】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は $N(R^{14})$ であり、U は CR^5 であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0420】

本発明の 1 実施形態において、B は 6 員環であり、G は $N(R^{14})$ であり、U は CR^5 であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在する。

【0421】

50

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0422】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0423】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0424】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0425】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0426】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0427】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

20

【0428】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0429】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0430】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0431】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

30

【0432】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0433】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0434】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

40

【0435】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0436】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0437】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

50

【0438】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹₄)であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0439】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R¹₄)であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0440】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0441】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

10

【0442】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0443】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0444】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

20

【0445】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0446】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0447】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

30

【0448】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0449】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0450】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0451】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはC(O)であり、UはCR⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

40

【0452】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0453】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0454】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはC(O)であり、UはNであ

50

り、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0455】

本発明の 1 実施形態において B は 6 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0456】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0457】

本発明の 1 実施形態において B は 7 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

10

【0458】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0459】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0460】

本発明の 1 実施形態において、B は 8 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在する。

【0461】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

20

【0462】

本発明の別の実施形態において、B は 8 員環であり、G は C (O) であり、U は N であり、環 B に 1 個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0463】

本発明の 1 実施形態において B は 5 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在する。

【0464】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

30

【0465】

本発明の別の実施形態において、B は 5 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0466】

本発明の 1 実施形態において B は 6 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在する。

【0467】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

40

【0468】

本発明の別の実施形態において、B は 6 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0469】

本発明の 1 実施形態において B は 7 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在する。

【0470】

本発明の別の実施形態において、B は 7 員環であり、G は N (R ^{1 4}) であり、U は C R ⁵ であり、環 B に 1 個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0471】

50

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0472】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在する。

【0473】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0474】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはC R⁵であり、環Bに1個のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

10

【0475】

本発明の1実施形態においてBは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0476】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

【0477】

本発明の別の実施形態において、Bは5員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

20

【0478】

本発明の1実施形態においてBは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0479】

本発明の別の実施形態において、Bは6員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0480】

本発明の1実施形態においてBは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0481】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

30

【0482】

本発明の別の実施形態において、Bは7員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0483】

本発明の1実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在する。

【0484】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合が存在する。

40

【0485】

本発明の別の実施形態において、Bは8員環であり、GはN(R^{1 4})であり、UはNであり、環Bに1個の別のヘテロ原子が存在し、適宜の結合は非存在である。

【0486】

本発明の他の実施形態は、GがN(R^{1 4})であり、R^{1 4}がHである(すなわち、GがNHである。)上記実施形態のいずれかに関するものである。

【0487】

1実施形態において、(NR²部分の)R²はHである。

【0488】

50

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は、例えばメチル、エチルまたはイソプロピルなどのアルキルである。

【0489】

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は、例えばフェニルなどのアリアルである。

【0490】

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は、例えば置換されたフェニルなどの置換されたアリアルである。

【0491】

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は-C(O)R⁴であり、R⁴はアルキル(例えば、メチル、エチルまたはイソプロピルなど)である。

10

【0492】

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は-C(O)R⁴であり、R⁴は例えばフェニルなどのアリアルである。

【0493】

別の実施形態において、(NR²部分の)R²は-C(O)R⁴であり、R⁴は例えば置換されているフェニルなどの置換されたアリアルである。

【0494】

本発明の別の実施形態において、R⁵はHである。

【0495】

本発明の別の実施形態は、UがCR⁵であり、R⁵がHである環(B)に関しての上記実施形態のいずれかに関するものである。

20

【0496】

本発明の別の実施形態において、環(B)はR^{2 1}基で全く置換されていない。

【0497】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、少なくとも一つ(例えば、1から2)のR^{2 1}が-SF₅、-OSF₅および-Si(R^{1 5 A})₃からなる群から選択され、各R^{1 5 A}は独立に選択される。

【0498】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、少なくとも1個のR^{2 1}が-SF₅および-Si(R^{1 5 A})₃からなる群から選択され、各R^{1 5 A}は同一もしくは異なるアルキル基である。

30

【0499】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、少なくとも1個のR^{2 1}が-SF₅、-OSF₅および-Si(CH₃)₃からなる群から選択される。

【0500】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、R^{2 1}基のうちの1個が-SF₅、-OSF₅および-Si(CH₃)₃からなる群から選択される。

40

【0501】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、R^{2 1}基のうちの1個が-SF₅、OSF₅および-Si(R^{1 5 A})₃からなる群から選択され、各R^{1 5 A}は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0502】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個のR^{2 1}基が存在し、R^{2 1}基のうちの1個が-SF₅、-OSF₅および-Si(CH₃)₃からなる群から選択される。

【0503】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個のR^{2 1}基が存在し、R^{2 1}基

50

のうちの2個が $-SF_5$ 、 OSF_5 および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0504】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ 、 OSF_5 および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0505】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

10

【0506】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、少なくとも一つ(例えば、1から2)の R^{21} が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0507】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、少なくとも1個の R^{21} が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0508】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、少なくとも1個の R^{21} が $-SF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

20

【0509】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択される。

【0510】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0511】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-SF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

30

【0512】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0513】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0514】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

40

【0515】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-SF_5$ である。

【0516】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-SF_5$ である。

【0517】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基

50

のうちの1個が $-OSF_5$ である。

【0518】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-OSF_5$ である。

【0519】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-Si(R^{15A})_3$ である。

【0520】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} が同一もしくは異なるアルキル基である。 10

【0521】

本発明の別の実施形態において、式(I)に1から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの1個が $-Si(CH_3)_3$ である。

【0522】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が同一または異なる $-Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0523】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が同一または異なる $-Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。 20

【0524】

本発明の別の実施形態において、式(I)に2から5個の R^{21} 基が存在し、 R^{21} 基のうちの2個が $-Si(CH_3)_3$ である。

【0525】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの少なくとも一つ(例えば1から2)が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0526】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの少なくとも一つ(例えば1から2)が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。 30

【0527】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの少なくとも一つ(例えば1から2)が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0528】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。 40

【0529】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0530】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0531】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、2個の R^{21} 基が 50

- SF_5 、- OSF_5 および - $Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0532】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、2個の R^{21} 基が - SF_5 、- OSF_5 および - $Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0533】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、2個の R^{21} 基が - SF_5 、- OSF_5 および - $Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0534】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が - SF_5 である。

【0535】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、2個の R^{21} 基が - SF_5 である。

【0536】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が - OSF_5 である。

【0537】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、2個の R^{21} 基が - OSF_5 である。

【0538】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が - $Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0539】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が - $Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0540】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、1個の R^{21} 基が - $Si(CH_3)_3$ である。

【0541】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの2個が同一または異なる - $Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0542】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの2個が同一または異なる - $Si(R^{15A})_3$ 基であり、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0543】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されており、 R^{21} 基のうちの2個が - $Si(CH_3)_3$ である。

【0544】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、少なくとも一つ（例えば、1から2）の R^{21} 基が - SF_5 、- OSF_5 および - $Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0545】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、少なくとも一つ（例えば、1から2）の R^{21} 基が - SF_5 、- OSF_5 および - $Si(R^{15A})_3$ からなる群から選択され、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0546】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、少な

10

20

30

40

50

くとも一つ（例えば、1から2）の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0547】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、少なくとも一つ（例えば、1から2）の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は独立に選択される。

【0548】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、少なくとも一つ（例えば、1から2）の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は同一もしくは異なるアルキル基である。

10

【0549】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、少なくとも一つ（例えば、1から2）の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0550】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の少なくとも一つの（例えば、1または2） $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は独立に選択される。

20

【0551】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の少なくとも一つの（例えば、1または2） $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0552】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の少なくとも一つの（例えば、1または2） $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

30

【0553】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は独立に選択される。

40

【0554】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0555】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$

50

、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0556】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも2個（例えば、2から3または2もしくは3）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の2個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は独立に選択される。

【0557】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも2個（例えば、2から3または2もしくは3）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の2個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(R^{1,5A})_3$ からなる群から選択され、各 $R^{1,5A}$ は同一もしくは異なるアルキル基である。

10

【0558】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも2個（例えば、2から3または2もしくは3）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の2個の $R^{2,1}$ 基が $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ および $-Si(CH_3)_3$ からなる群から選択される。

【0559】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基は $-SF_5$ である。

20

【0560】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基は $-OSF_5$ である。

【0561】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基は $-Si(R^{1,5A})_3$ であり、各 $R^{1,5A}$ は独立に選択される。

30

【0562】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基は $-Si(R^{1,5A})_3$ であり、各 $R^{1,5A}$ は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0563】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも一つ（例えば、1から3または1から2）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の1個の $R^{2,1}$ 基は $-Si(CH_3)_3$ である。

40

【0564】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも2個（例えば、2から3）の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記フェニル上の $R^{2,1}$ 基のうち2個が $-SF_5$ である。

【0565】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は $R^{2,1}$ 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも2個（例えば、2から3）の

50

R^{21} 基で置換されており、前記フェニル上の R^{21} 基のうちの 2 個が $-OSF_5$ である。

【0566】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも 2 個（例えば、2 から 3）の R^{21} 基で置換されており、前記フェニル上の R^{21} 基のうちの 2 個が $-Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は独立に選択される。

【0567】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも 2 個（例えば、2 から 3）の R^{21} 基で置換されており、前記フェニル上の R^{21} 基のうちの 2 個が $-Si(R^{15A})_3$ であり、各 R^{15A} は同一もしくは異なるアルキル基である。

10

【0568】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は R^{21} 基で置換されたアリール基であり、前記アリール部分はフェニルであり、前記フェニルは少なくとも 2 個（例えば、2 から 3）の R^{21} 基で置換されており、前記フェニル上の R^{21} 基のうちの 2 個が $-Si(CH_3)_3$ である。

【0569】

本発明の別の実施形態において、 R^6 はアルキルである。

【0570】

本発明の別の実施形態において、 R^6 は C_1 から C_3 アルキル基である。

20

【0571】

本発明の別の実施形態において、 R^6 はメチルである。

【0572】

本発明の別の実施形態において、 R^6 はエチルである。

【0573】

本発明の別の実施形態において、 R^6 は C_3 アルキル基である。

【0574】

本発明の別の実施形態において、 R^6 はイソプロピルである。

【0575】

別の実施形態において、 R^6 は $-C(O)OR^{15}$ である。

30

【0576】

別の実施形態において、 R^6 は $-C(O)OR^{15}$ であり、 R^{15} はアルキルである。

【0577】

別の実施形態において、 R^6 は $-C(O)OR^{15}$ であり、 R^{15} はメチルである。

【0578】

別の実施形態において、 R^6 は、1 から 5 個の R^{21} 基で置換されたアルキルである。

【0579】

別の実施形態において、 R^6 は、1 個の R^{21} 基で置換されたアルキルである。

【0580】

別の実施形態において、 R^6 は、1 個の R^{21} 基で置換されたアルキルであり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ である。

40

【0581】

別の実施形態において、 R^6 は、1 個の R^{21} 基で置換されたアルキルであり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はアルキルである。

【0582】

別の実施形態において、 R^6 は、1 個の R^{21} 基で置換されたアルキルであり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はメチルである。

【0583】

別の実施形態において、 R^6 は $-CH_2R^{21}$ である（すなわち 1 個の R^{21} で置換さ

50

れたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- である。)。

【0584】

別の実施形態において、R⁶ は -CH₂OR¹⁵ である (すなわち1個のR²¹ で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)。

【0585】

別の実施形態において、R⁶ は -CH₂OR¹⁵ であり (すなわち1個のR²¹ で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)、前記R¹⁵ 基はアルキルである。

【0586】

別の実施形態において、R⁶ は -CH₂OR¹⁵ であり (すなわち1個のR²¹ で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)、前記R¹⁵ 基はメチルである。

【0587】

別の実施形態において、R⁶ は -C(O)NR¹⁵R¹⁶ である。

【0588】

別の実施形態において、R⁶ は -C(O)NR¹⁵R¹⁶ であり、R¹⁵ およびR¹⁶ はそれぞれ独立にHおよびアルキルからなる群から選択される。

【0589】

別の実施形態において、R⁶ は -C(O)NR¹⁵R¹⁶ であり、R¹⁵ およびR¹⁶ は同一もしくは異なるアルキルである。

【0590】

別の実施形態において、R⁶ は -C(O)NR¹⁵R¹⁶ であり、R¹⁵ およびR¹⁶ はそれぞれ独立にHおよびメチルからなる群から選択される。

【0591】

別の実施形態において、R⁶ は -C(O)NR¹⁵R¹⁶ であり、R¹⁵ およびR¹⁶ はそれぞれメチルである。

【0592】

本発明の他の実施形態は、R⁶ がアルキルである環(B)に関しての上記実施形態のいずれかに関するものである。一つのそのような実施形態において、R⁶ はC₁ からC₃ アルキル基である。別の実施形態において、R⁶ はメチルである。別の実施形態において、R⁶ はエチルである。別の実施形態において、R⁶ はC₃ アルキル基である。別の実施形態において、R⁶ はイソプロピルである。

【0593】

本発明の別の実施形態において、R⁷ は置換されていないアリール基である (例えば、置換されていないフェニル基)。従って、別の実施形態において、R⁷ はフェニルである。

【0594】

本発明の別の実施形態において、R⁷ は置換されたアリール基である (例えば、置換されたフェニル基)。従って、別の実施形態において、R⁷ は置換されたフェニル基である。

【0595】

本発明の別の実施形態において、R⁷ は、1から3個の独立に選択されるR²¹ 基で置換されたアリール基である。

【0596】

本発明の別の実施形態において、R⁷ は、1から3個のR²¹ 基で置換されたアリール基であり、各R²¹ 基は同一または異なる入口である。

【0597】

本発明の別の実施形態において、R⁷ は1から3個のR²¹ 基で置換されたアリール基であり、各R²¹ 基はFである。

10

20

30

40

50

【0598】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0599】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1から3個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0600】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1または2個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0601】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されている。

10

【0602】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1から3個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は同一または異なるハ口である。

【0603】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは3個の $R^{2,1}$ ハ口基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は同一または異なるハ口である。

【0604】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは2個の $R^{2,1}$ ハ口基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は同一または異なるハ口である。

20

【0605】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1個の $R^{2,1}$ ハ口基で置換されている。

【0606】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1から3個の F で置換されている（すなわち、前記フェニルは1から3個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口は F である。）。

【0607】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1個の F で置換されている（すなわち、前記フェニルは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口は F である。）。

30

【0608】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは2個の F 原子で置換されている（すなわち、前記フェニルは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口は F である。）。

【0609】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは3個の F 原子で置換されている（すなわち、前記フェニルは3個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口は F である。）。

40

【0610】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1個の -CN 基で置換されている。

【0611】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1もしくは2個の $R^{2,1}$ アルキル基（例えばメチル基）で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は1から3個の $R^{2,2}$ ハ口基（例えば F 基）で置換されている。

【0612】

本発明の別の実施形態において、 R^7 はフェニルであり、前記フェニルは1もしくは2個の -CF₃ 基で置換されている（すなわち、それぞれ3個の $R^{2,2}$ ハ口（すなわち、F

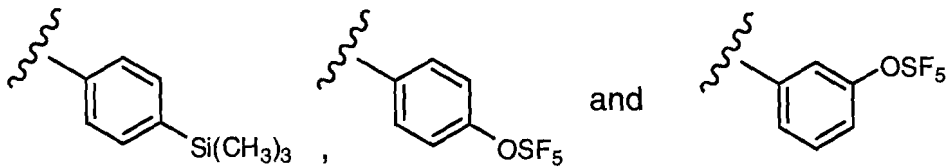
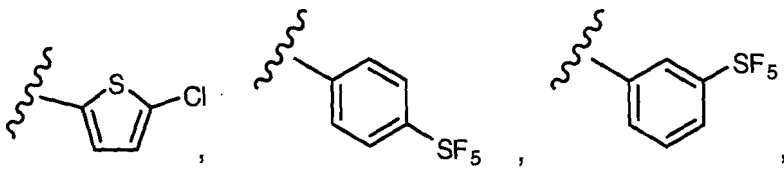
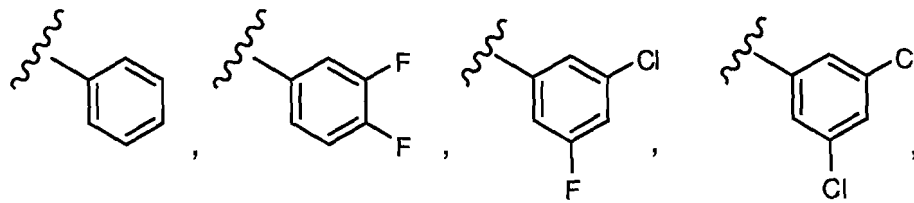
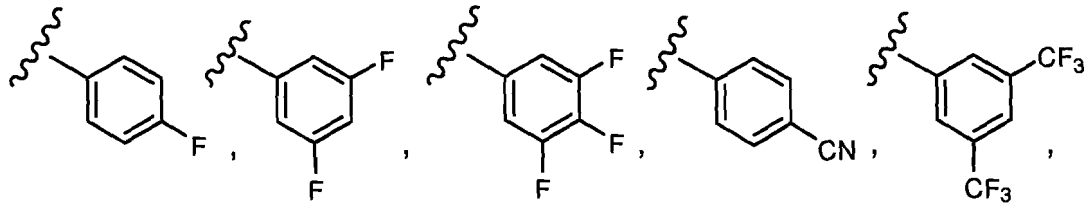
50

) 基で置換された 1 もしくは 2 個の $R^{2,1}$ アルキル基 (すなわち、メチル基) がある。)

【0613】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化14】



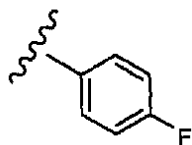
【0614】

からなる群から選択される。

【0615】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化15】



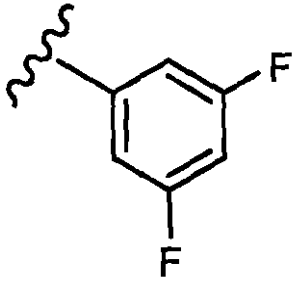
【0616】

である。

【0617】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化 1 6】



10

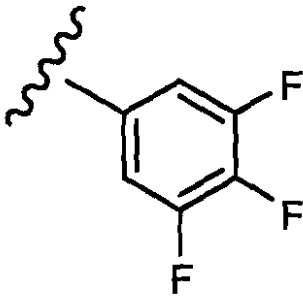
【 0 6 1 8】

である。

【 0 6 1 9】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化 1 7】



20

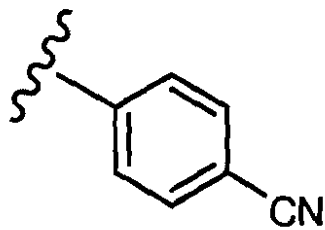
【 0 6 2 0】

である。

【 0 6 2 1】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化 1 8】



30

【 0 6 2 2】

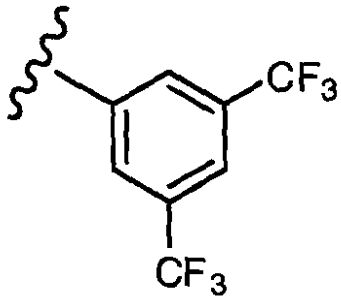
である。

【 0 6 2 3】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

40

【化19】



10

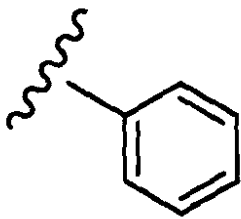
【0624】

である。

【0625】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化20】



20

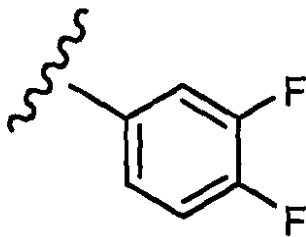
【0626】

である。

【0627】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化21】



30

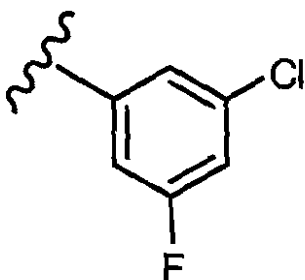
【0628】

である。

【0629】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化22】



50

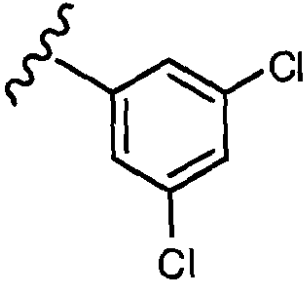
【0630】

である。

【0631】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化23】



10

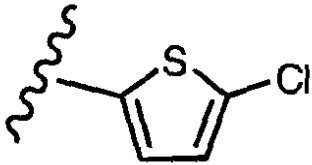
【0632】

である。

【0633】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化24】



20

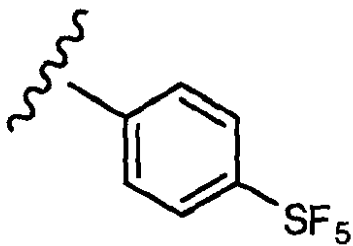
【0634】

である。

【0635】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化25】



30

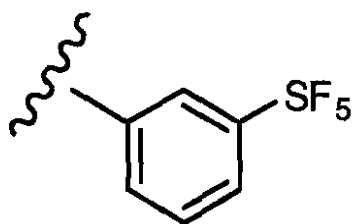
【0636】

である。

【0637】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化26】



40

【0638】

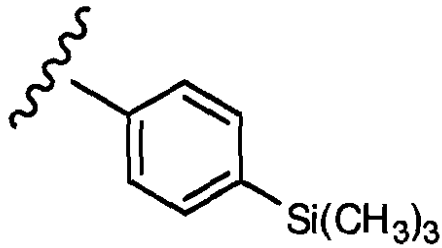
50

である。

【0639】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化27】



10

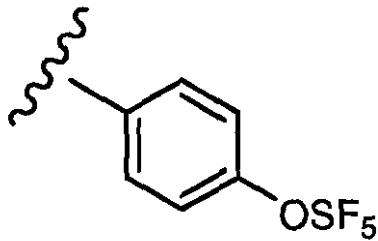
【0640】

である。

【0641】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化28】



20

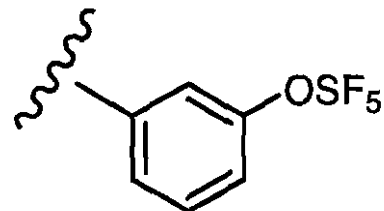
【0642】

である。

【0643】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化29】



30

【0644】

である。

【0645】

本発明の他の実施形態は、

(a) R^6 が、

(1) アルキル、もしくは

(2) C_1 から C_3 アルキル、もしくは

(3) メチル、もしくは

(4) エチル、もしくは

(5) C_3 アルキル基、もしくは

(6) イソプロピル、もしくは

(7) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、もしくは

(8) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ (R^{15} はアルキルである。)、もしくは

40

50

- (9) - C(O)OR¹⁵ (R¹⁵ はメチルである。)、もしくは
 (10) 1 から 5 個の R²¹ 基で置換されたアルキル、もしくは
 (11) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル、もしくは
 (12) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)
)、もしくは
 (13) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ であり、
 前記 R¹⁵ はアルキルである。)、もしくは
 (14) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ であり、
 前記 R¹⁵ はメチルである。)、もしくは
 (15) -CH₂R²¹ (すなわち 1 個の R²¹ で置換されたアルキルであり、前記
 アルキルは -CH₂- である。)、もしくは 10
 (16) -CH₂OR¹⁵ (すなわち 1 個の R²¹ で置換されたアルキルであり、前
 記アルキルは -CH₂- であり、前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)、もしくは
 (17) -CH₂OR¹⁵ (すなわち 1 個の R²¹ で置換されたアルキルであり、前
 記アルキルは -CH₂- であり、前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)(前記 R¹⁵ 基は
 アルキルである。)、もしくは
 (18) -CH₂OR¹⁵ (すなわち 1 個の R²¹ で置換されたアルキルであり、前
 記アルキルは -CH₂- であり、前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ である。)(前記 R¹⁵ 基は
 メチルである。)、もしくは
 (19) -C(O)NR¹⁵R¹⁶、もしくは 20
 (20) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵ および R¹⁶ はそれぞれ独立に H および
 アルキルからなる群から選択される。)、もしくは
 (21) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵ および R¹⁶ は同一もしくは異なるアル
 キルである。)、もしくは
 (22) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵ および R¹⁶ はそれぞれ独立に H および
 メチルからなる群から選択される。もしくは
 (23) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵ および R¹⁶ はそれぞれメチルである。
)
 であり ;
 (b) R⁷ が、R⁷ に関しての上記実施形態のいずれかで定義の通りである、環 (B) 30
 に関しての上記実施形態のいずれかに関するものである。
 【0646】
 本発明の他の実施形態は、
 (a) R⁶ が、
 (1) アルキル、もしくは
 (2) C₁ から C₃ アルキル、もしくは
 (3) メチル、もしくは
 (4) エチル、もしくは
 (5) C₃ アルキル基、もしくは
 (6) イソプロピル、もしくは 40
 (7) -C(O)OR¹⁵、もしくは
 (8) -C(O)OR¹⁵ (R¹⁵ はアルキルである。)、もしくは
 (9) -C(O)OR¹⁵ (R¹⁵ はメチルである。)、もしくは
 (10) 1 から 5 個の R²¹ 基で置換されたアルキル、もしくは
 (11) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル、もしくは
 (12) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ である。
)、もしくは
 (13) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ であり、
 前記 R¹⁵ はアルキルである。)、もしくは
 (14) 1 個の R²¹ 基で置換されたアルキル (前記 R²¹ 基は -OR¹⁵ であり、 50

前記 R¹⁵ はメチルである。)、もしくは

(15) -CH₂R²¹ (すなわち1個のR²¹で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- である。)、もしくは

(16) -CH₂OR¹⁵ (すなわち1個のR²¹で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹基は -OR¹⁵ である。)、もしくは

(17) -CH₂OR¹⁵ (すなわち1個のR²¹で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹基は -OR¹⁵ である。)(前記R¹⁵基はアルキルである。)、もしくは

(18) -CH₂OR¹⁵ (すなわち1個のR²¹で置換されたアルキルであり、前記アルキルは -CH₂- であり、前記R²¹基は -OR¹⁵ である。)(前記R¹⁵基はメチルである。)、もしくは

(19) -C(O)NR¹⁵R¹⁶、もしくは

(20) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵およびR¹⁶はそれぞれ独立にHおよびアルキルからなる群から選択される。)、もしくは

(21) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵およびR¹⁶は同一もしくは異なるアルキルである。)、もしくは

(22) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵およびR¹⁶はそれぞれ独立にHおよびメチルからなる群から選択される。もしくは

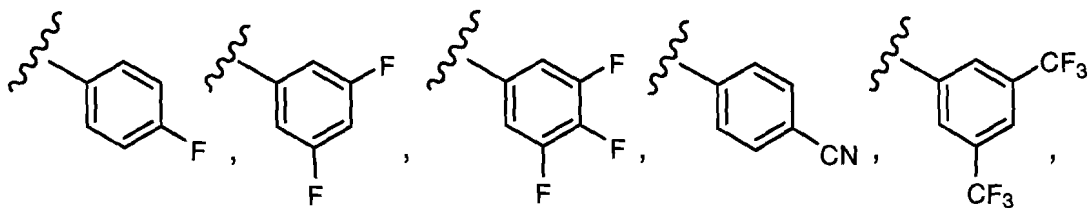
(23) -C(O)NR¹⁵R¹⁶ (R¹⁵およびR¹⁶はそれぞれメチルである。

)

であり;

(b) R⁷が

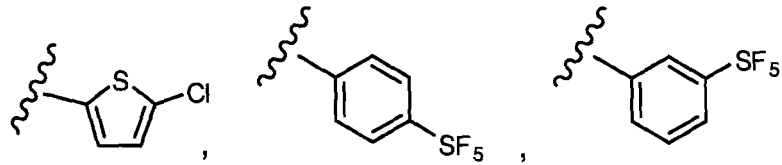
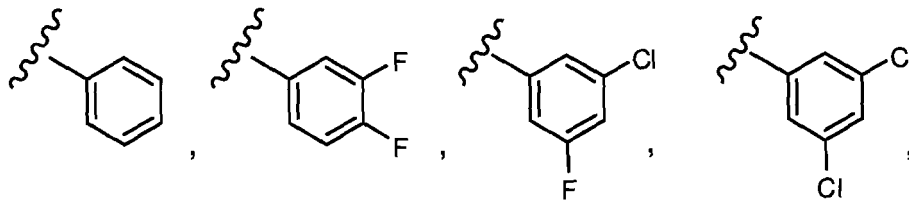
【化30】



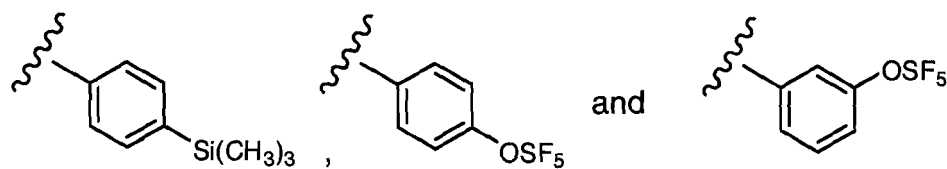
10

20

30



10



20

【0647】

からなる群から選択される、環(B)に関しての上記実施形態のいずれかに関するものである。

【0648】

本発明の他の実施形態は、

(a) R^6 が、

(1) アルキル、もしくは

(2) C_1 から C_3 アルキル、もしくは

(3) メチル、もしくは

(4) エチル、もしくは

30

(5) C_3 アルキル基、もしくは

(6) イソプロピル、もしくは

(7) $-C(O)OR^{15}$ 、もしくは

(8) $-C(O)OR^{15}$ (R^{15} はアルキルである。)、もしくは

(9) $-C(O)OR^{15}$ (R^{15} はメチルである。)、もしくは

(10) 1 から 5 個の R^{21} 基で置換されたアルキル、もしくは

(11) 1 個の R^{21} 基で置換されたアルキル、もしくは

(12) 1 個の R^{21} 基で置換されたアルキル (前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ である。)

)、もしくは

(13) 1 個の R^{21} 基で置換されたアルキル (前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はアルキルである。)、もしくは

(14) 1 個の R^{21} 基で置換されたアルキル (前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はメチルである。)、もしくは

(15) $-CH_2R^{21}$ (すなわち 1 個の R^{21} で置換されたアルキルであり、前記アルキルは $-CH_2-$ である。)、もしくは

(16) $-CH_2OR^{15}$ (すなわち 1 個の R^{21} で置換されたアルキルであり、前記アルキルは $-CH_2-$ であり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ である。)、もしくは

(17) $-CH_2OR^{15}$ (すなわち 1 個の R^{21} で置換されたアルキルであり、前記アルキルは $-CH_2-$ であり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ である。)(前記 R^{15} 基はアルキルである。)、もしくは

50

(18) $-CH_2OR^{15}$ (すなわち1個の R^{21} で置換されたアルキルであり、前記アルキルは $-CH_2-$ であり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ である。)(前記 R^{15} 基はメチルである。)、もしくは

(19) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ 、もしくは

(20) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ (R^{15} および R^{16} はそれぞれ独立にHおよびアルキルからなる群から選択される。)、もしくは

(21) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ (R^{15} および R^{16} は同一もしくは異なるアルキルである。)、もしくは

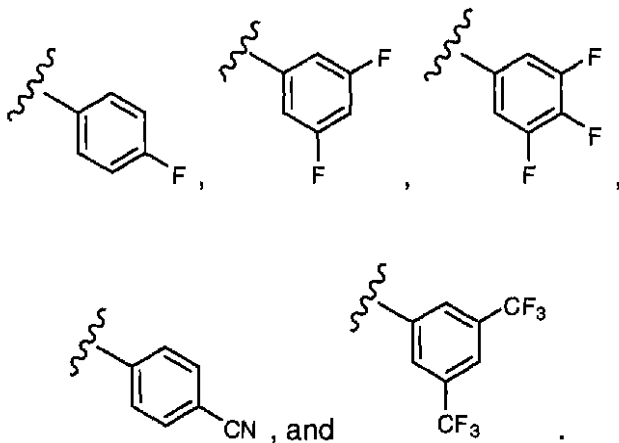
(22) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ (R^{15} および R^{16} はそれぞれ独立にHおよびメチルからなる群から選択される。もしくは

(23) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ (R^{15} および R^{16} はそれぞれメチルである。)

であり;

(b) R^7 が

【化31】



【0649】

からなる群から選択される、環(B)に関しての上記実施形態のいずれかに関するものである。

【0650】

本発明の他の実施形態は、 R^6 がアルキルであり、 R^7 が R^7 に関する上記実施形態のいずれかで定義の通りである環(B)に関する上記の実施形態のいずれかに関するものである。あるそのような実施形態において、 R^6 は C_1 から C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はメチルである。別の実施形態において、 R^6 はエチルである。別の実施形態において、 R^6 は C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はイソプロピルである。

【0651】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はアリーールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたアリーールからなる群から選択される。

【0652】

本発明の別の実施形態において、 R^9 はヘテロアリーールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリーールからなる群から選択され、各 R^{21} は独立に選択される。

【0653】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はアリーールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたアリーールからなる群から選択され、 R^9 はヘテロアリーールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリーールからなる群から選択され、各 R^{21} は独立に選択される。

【0654】

本発明の他の実施形態は、 R^6 がアルキルであり、 R^7 が R^7 に関する上記実施形態のいずれかで定義の通りであり、 R^{10} がアリーールおよび1以上の独立に選択される R^{21}

10

20

30

40

50

基で置換されたアリールからなる群から選択され、 R^9 がヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される環(B)に関して上記の実施形態のいずれかに関するものである。あるそのような実施形態において、 R^6 は C_1 から C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はメチルである。別の実施形態において、 R^6 はエチルである。別の実施形態において、 R^6 は C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はイソプロピルである。

【0655】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はヘテロアリール(例えばピリジル)である。

【0656】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリール(例えば、1以上の R^{21} 基で置換されたピリジル)である。

10

【0657】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はヘテロアリールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、 R^9 基はヘテロアリールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、各 R^{21} は独立に選択される。

【0658】

本発明の他の実施形態は、 R^{10} がヘテロアリールまたは1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリールであり、 R^9 がヘテロアリール(例えば、イミダゾリル)または1以上の(例えば、1もしくは2個または1個) R^{21} 基(例えばメチルなどのアルキル)で置換されたヘテロアリール(例えば、イミダゾリル)である式(I)の化合物に関するものである。

20

【0659】

本発明の他の実施形態は、 R^6 がアルキルであり、 R^7 が R^7 に関する上記実施形態のいずれかで定義の通りであり、 R^{10} がヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、 R^9 がヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される環(B)に関して上記の実施形態のいずれかに関するものである。あるそのような実施形態において、 R^6 は C_1 から C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はメチルである。別の実施形態において、 R^6 はエチルである。別の実施形態において、 R^6 は C_3 アルキル基である。別の実施形態において、 R^6 はイソプロピルである。

30

【0660】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はアリールである。

【0661】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} アリールはアリールであり、前記アリールはフェニルである。

【0662】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の R^{21} 基で置換されたアリールである。

【0663】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の R^{21} 基で置換されたアリールであり、前記アリールはフェニルであり、すなわち前記 R^{10} 基は、1以上の R^{21} 基で置換されたフェニルである。

40

【0664】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、各 R^{21} 基は同一または異なる-OR¹⁵基である。

【0665】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、各 R^{21} 基は同一または異なる-OR¹⁵基であり、前記 R^{15} はアルキルであり、各アルキルは独立に選択される。

50

【0666】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はアルキルである。

【0667】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は $-OR^{15}$ であり、前記 R^{15} はアルキルであり、前記アルキルはメチルである。

【0668】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の（例えば、1もしくは2個または1個）独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルである。

10

【0669】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口である。

【0670】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基はFである。

【0671】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} は $-OR^{15}$ 基であり、 R^{15} は $(R^{18})_n$ アルキル基であり、 R^{18} は八口であり、 n は1から3であり、各八口は独立に選択される。

20

【0672】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} は $-OR^{15}$ 基であり、 R^{15} は $(R^{18})_n$ アルキル基であり、 R^{18} はFであり、 n は3である。

【0673】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} は $-OR^{15}$ 基であり、 R^{15} は $(R^{18})_n$ アルキル基であり、 R^{18} はFであり、 n は3であり、前記アルキルはメチルである（すなわち、 R^{21} 置換基は $-OCF_3$ である。）。

【0674】

本発明の別の実施形態において、 R^9 はヘテロアリアルである。

30

【0675】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリアルである。

【0676】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリアルであり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキルである。

【0677】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1個の R^{21} 基で置換されたヘテロアリアルであり、前記 R^{21} はアルキルである。

40

【0678】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1個の R^{21} 基で置換されたヘテロアリアルであり、前記 R^{21} はアルキルであり、前記アルキルはメチルである。

【0679】

本発明の別の実施形態において、 R^9 はであり、前記ヘテロアリアルはイミダゾリル(imidazolyl)である。

【0680】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1以上の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルである。

【0681】

50

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1以上の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルであり、前記 R^{21} 基は同一または異なるアルキルである。

【0682】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1個の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルであり、前記 R^{21} はアルキルである。

【0683】

本発明の別の実施形態において、 R^9 は1個の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルであり、前記 R^{21} はアルキルであり、前記アルキルはメチルである。

【0684】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} はアリールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記 R^9 基はヘテロアリールおよび1以上の R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、各 R^{21} は独立に選択される。

10

【0685】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1以上の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルであり、各 R^{21} は独立に選択される。

【0686】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1個の R^{21} 基で置換されたイミダゾリルであり、各 R^{21} は独立に選択される。

20

【0687】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の独立に選択される $-OR^{15}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルである。

【0688】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1以上の独立に選択される $-OR^{15}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルであり、各 R^{15} は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0689】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の $-OR^{15}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1個のアルキル基で置換されたイミダゾリルである。

30

【0690】

本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の $-OR^{15}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1個のアルキル基で置換されたイミダゾリルであり、 R^{15} はアルキルであり、前記 R^{15} アルキル基および前記イミダゾリル上のアルキル基は独立に選択される。

【0691】

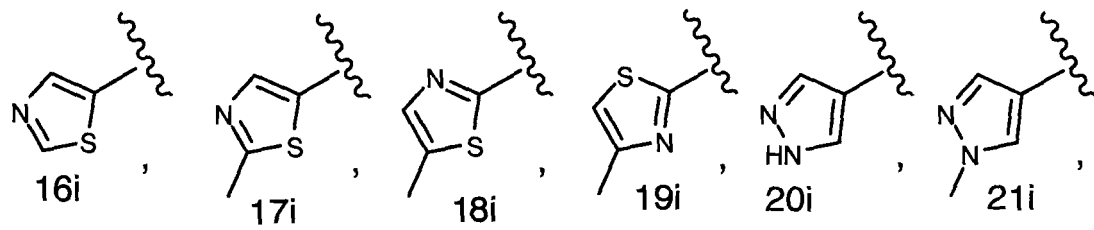
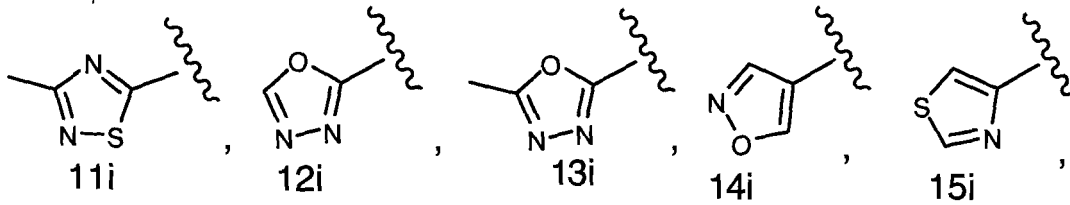
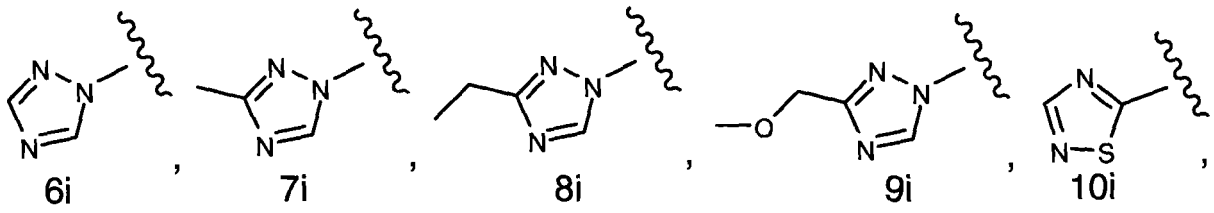
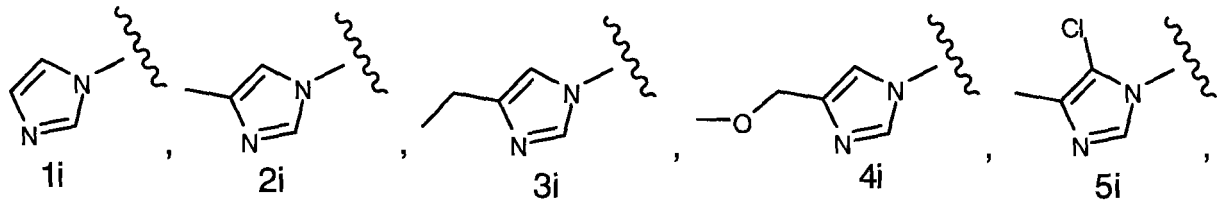
本発明の別の実施形態において、 R^{10} は、1個の $-OR^{15}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 R^9 は1個のメチル基で置換されたイミダゾリルであり、 R^{15} はメチルであり、前記 R^{15} アルキル基および前記イミダゾリル上のアルキル基は独立に選択される。

40

【0692】

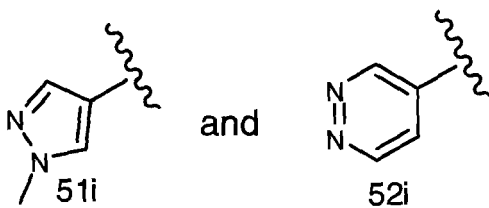
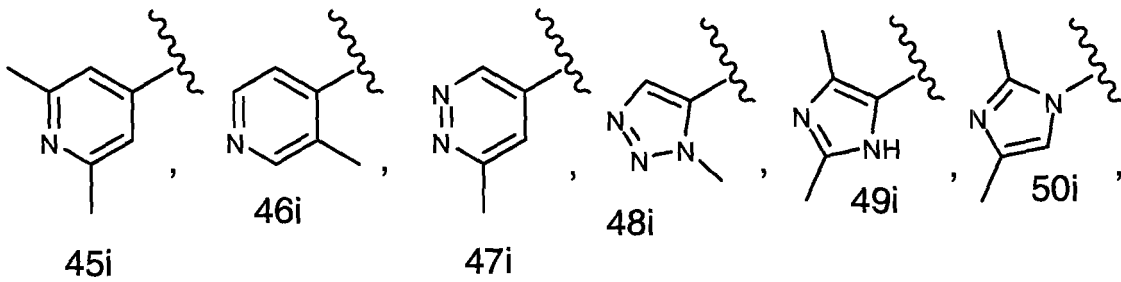
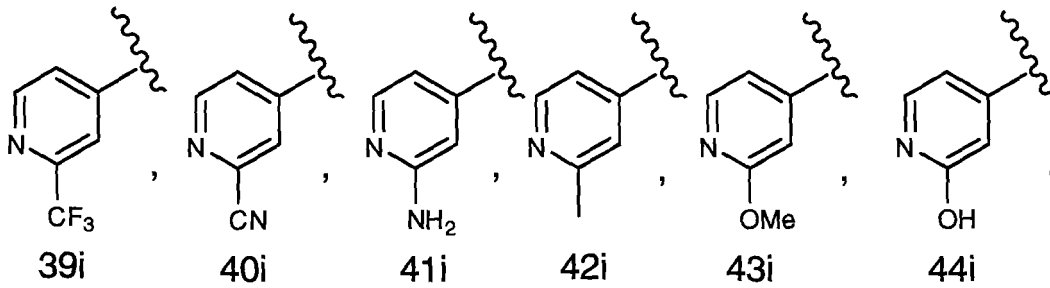
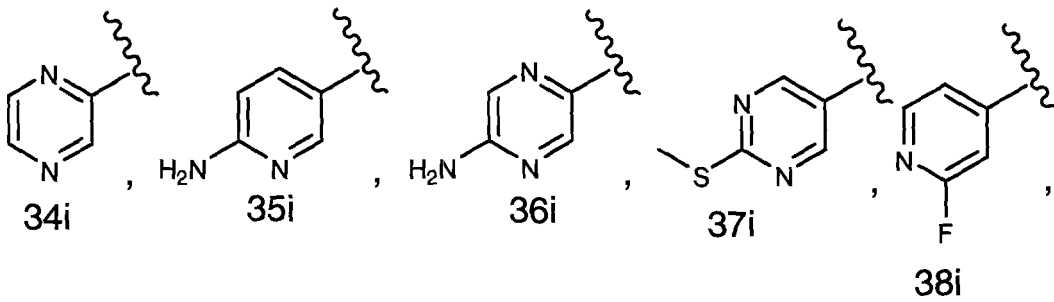
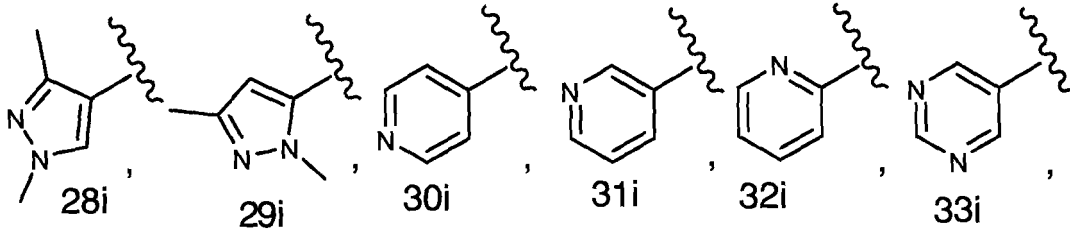
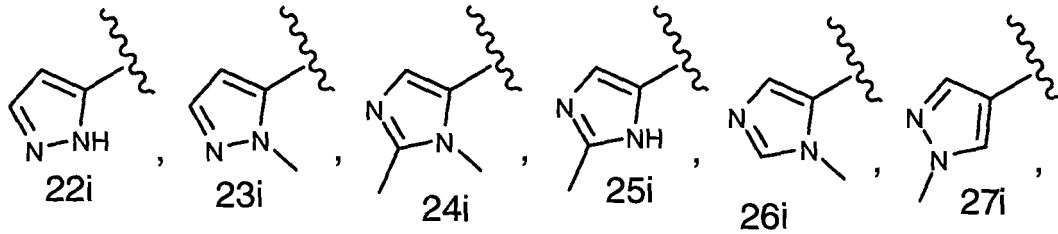
式(I)の化合物の他の実施形態は、 R^9 が下記のものである上記実施形態のいずれかに関するものである。

【化 3 2】



10

20



10

20

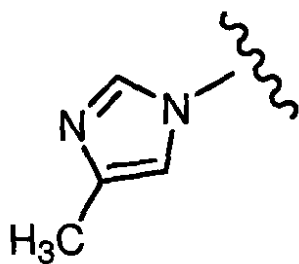
30

40

【 0 6 9 3 】

式 (I) の化合物の他の実施形態は、 R^9 が下記のものである上記実施形態のいずれかに関するものである。

【化 3 3】

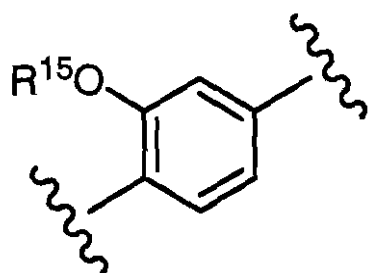


【0694】

10

式 (I) の化合物の他の実施形態は、 R^{10} が下記のものである上記実施形態のいずれかに関するものである。

【化 3 4】

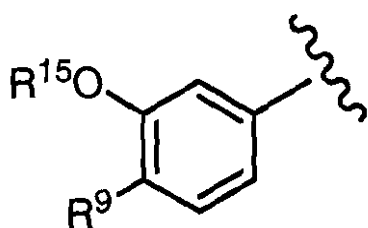


20

【0695】

(式中、 $-OR^{15}$ は R^9 が結合している炭素に対してオルトである、すなわち、 $R^9 - R^{10}$ - 部分は

【化 3 5】



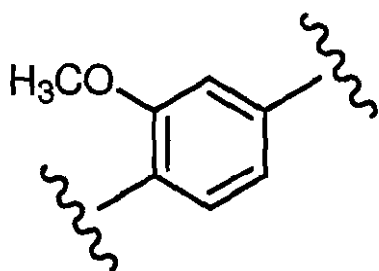
30

【0696】

である。)

式 (I) の化合物の他の実施形態は、 R^{10} が下記のものである上記実施形態のいずれかに関するものである。

【化 3 6】

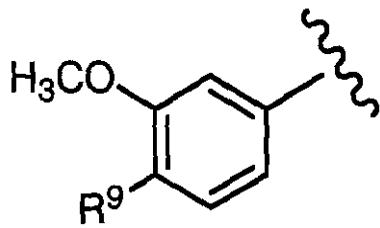


40

【0697】

(式中、 $-OCH_3$ は R^9 が結合している炭素に対してオルトである、すなわち、 $R^9 - R^{10}$ - 部分は

【化 3 7】



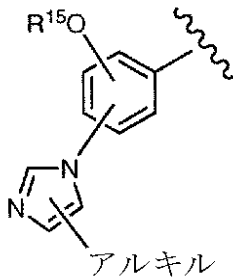
【 0 6 9 8】

である。)

10

本発明の別の実施形態において、前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は下記のものである。

【化 3 8】

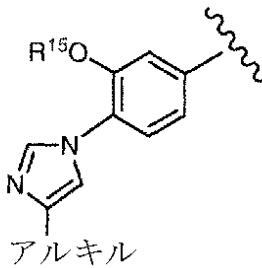


20

【 0 6 9 9】

本発明の別の実施形態において、前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は下記のものである。

【化 3 9】

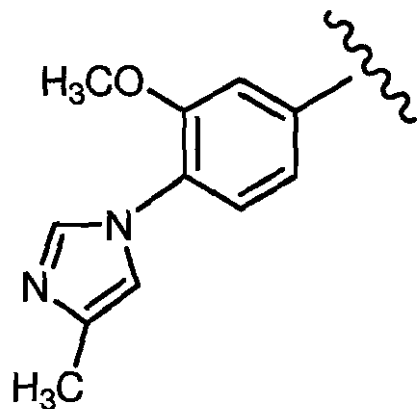


30

【 0 7 0 0】

本発明の別の実施形態において、前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は下記のものである。

【化 4 0】

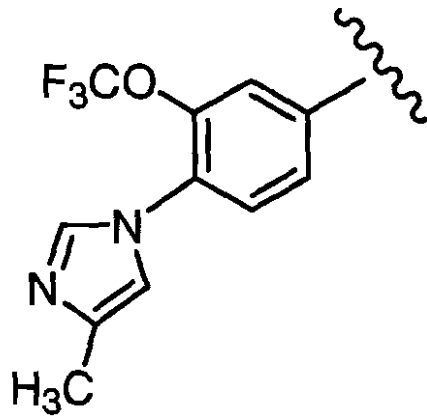


40

【 0 7 0 1】

本発明の別の実施形態において、前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は下記のものである。

【化 4 1】

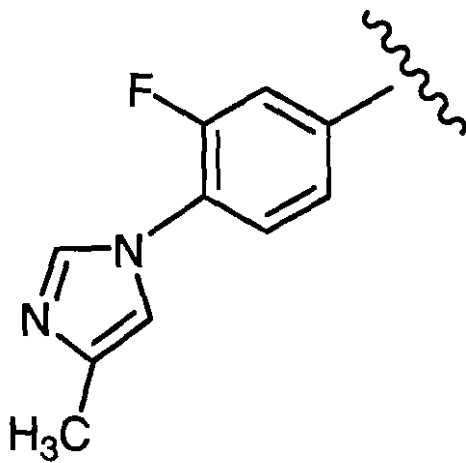


10

【0702】

本発明の別の実施形態において、前記 $\text{R}^9 - \text{R}^{10}$ - 部分は下記のものである。

【化 4 2】



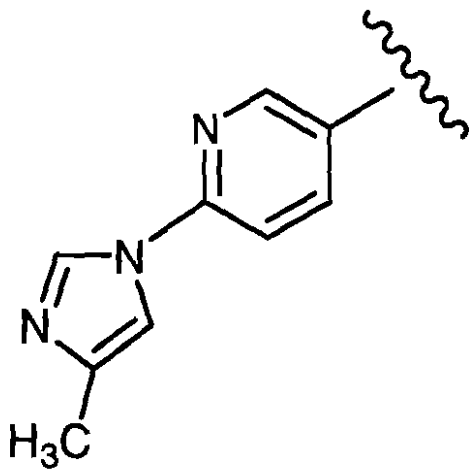
20

30

【0703】

本発明の別の実施形態において、前記 $\text{R}^9 - \text{R}^{10}$ - 部分は下記のものである。

【化 4 3】



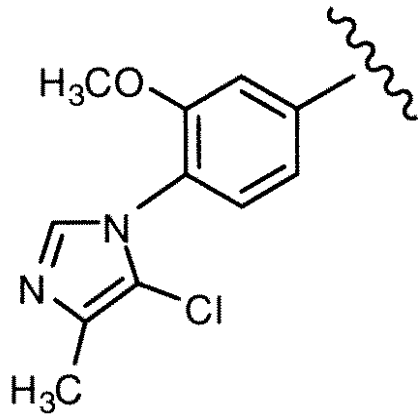
40

【0704】

本発明の別の実施形態において、前記 $\text{R}^9 - \text{R}^{10}$ - 部分は下記のものである。

50

【化 4 4】

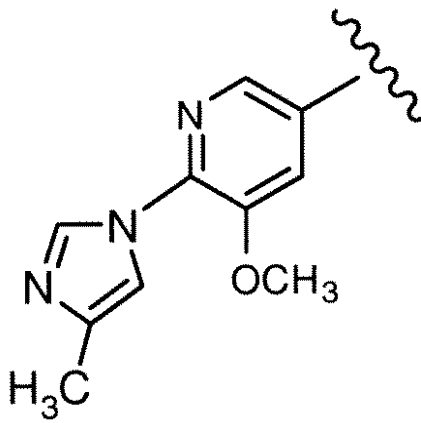


10

【0705】

本発明の別の実施形態において、前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は下記のものである。

【化 4 5】



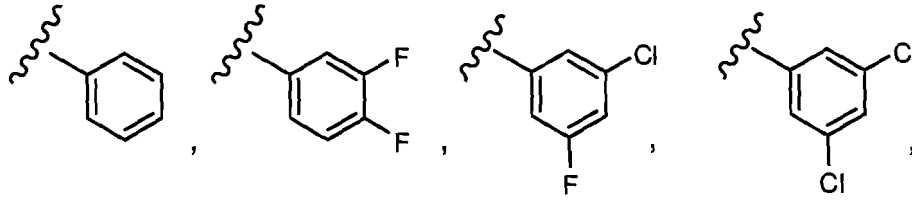
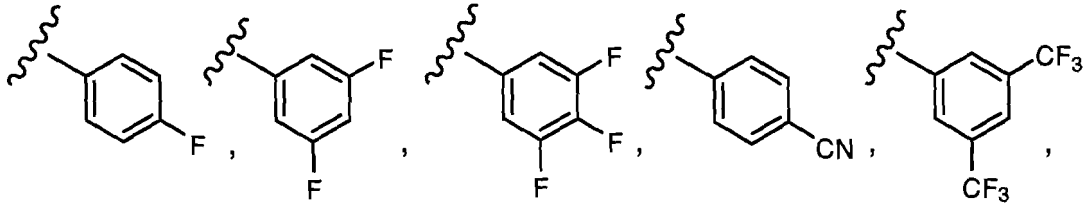
20

【0706】

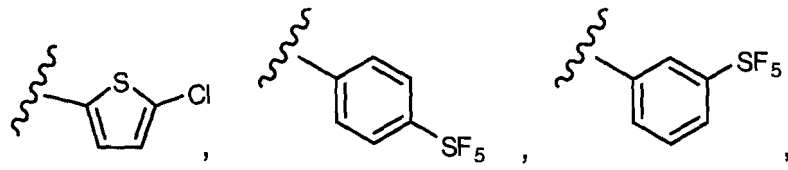
本発明の別の実施形態において、R⁷は

30

【化 4 6】

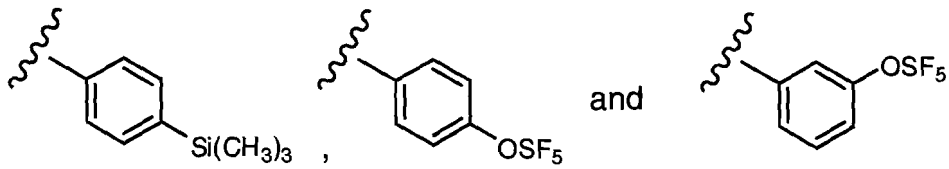


10



20

【 0 7 0 7 】

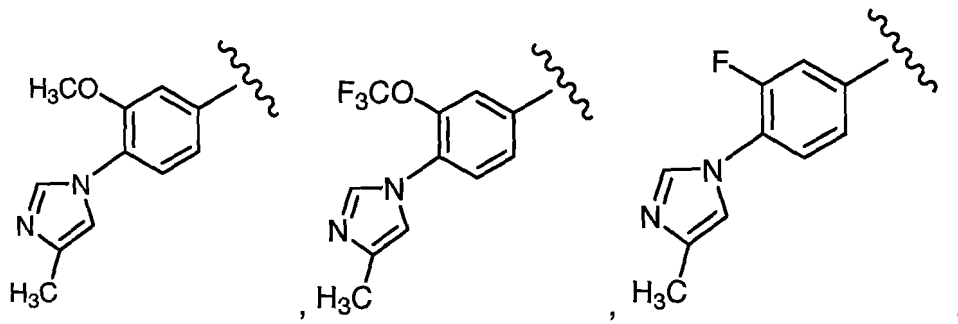


【 0 7 0 8 】

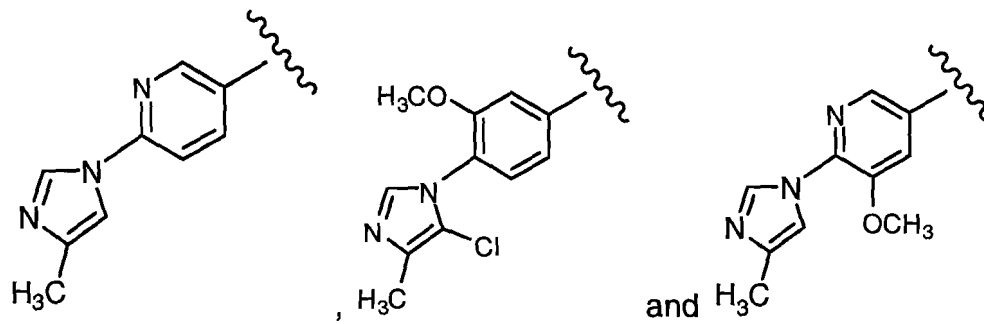
30

からなる群から選択され；
前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化47】



10



20

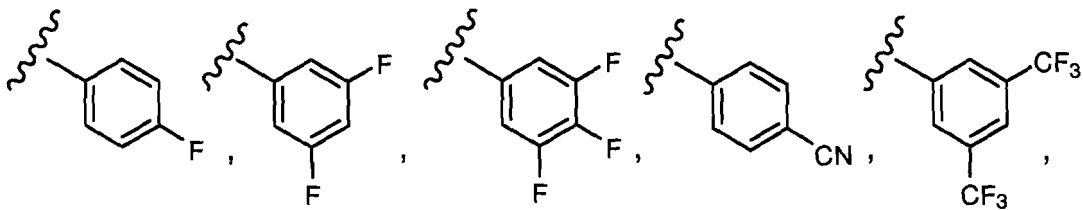
【0709】

からなる群から選択される。

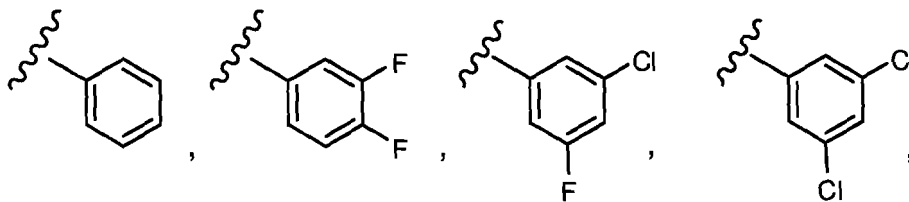
【0710】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

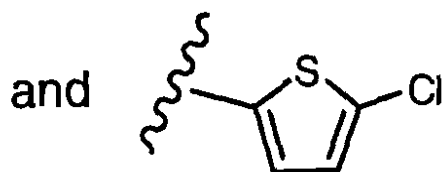
【化48】



30



40

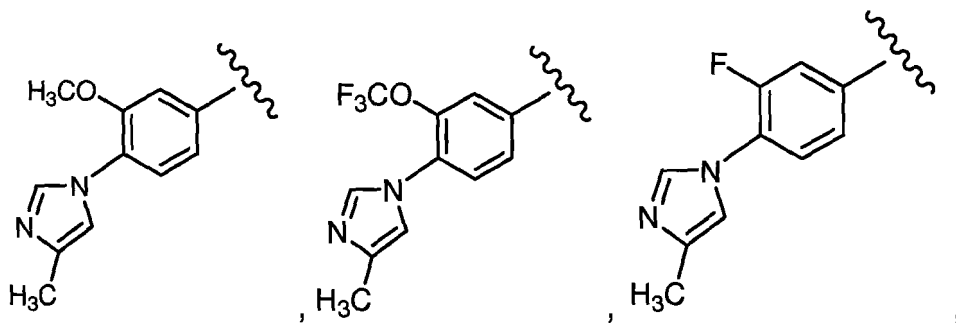


【0711】

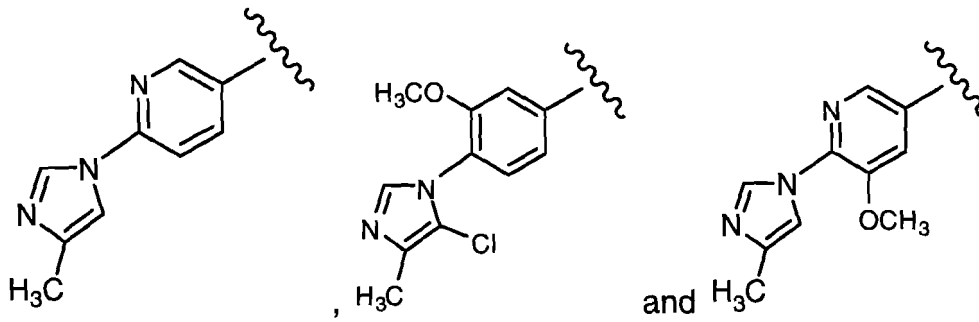
からなる群から選択され；

50

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は
【化 49】



10



20

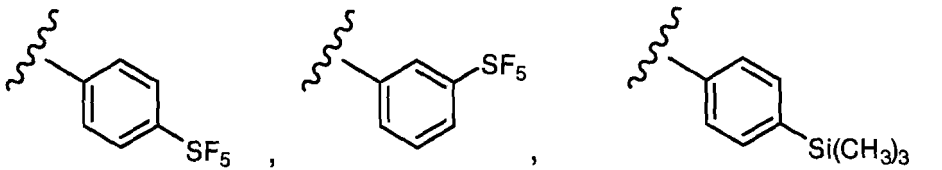
【0712】

からなる群から選択される。

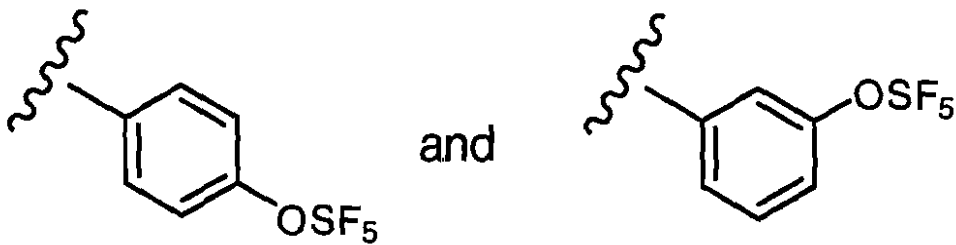
【0713】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化 50】



30



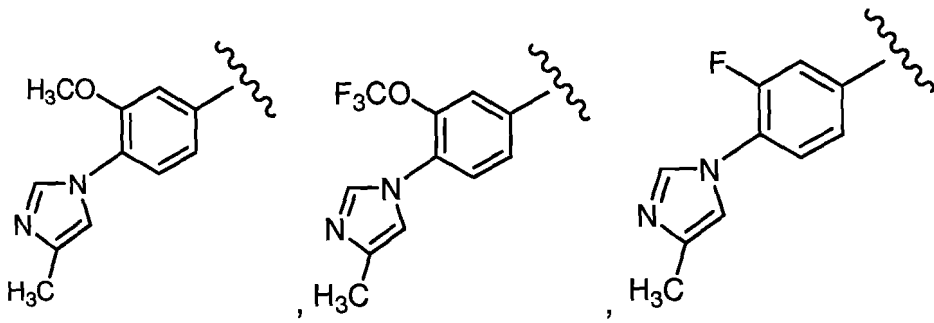
40

【0714】

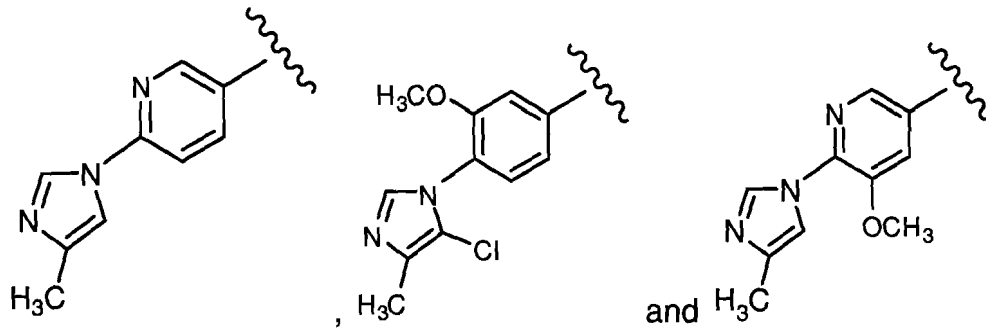
からなる群から選択され；

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化51】



10



20

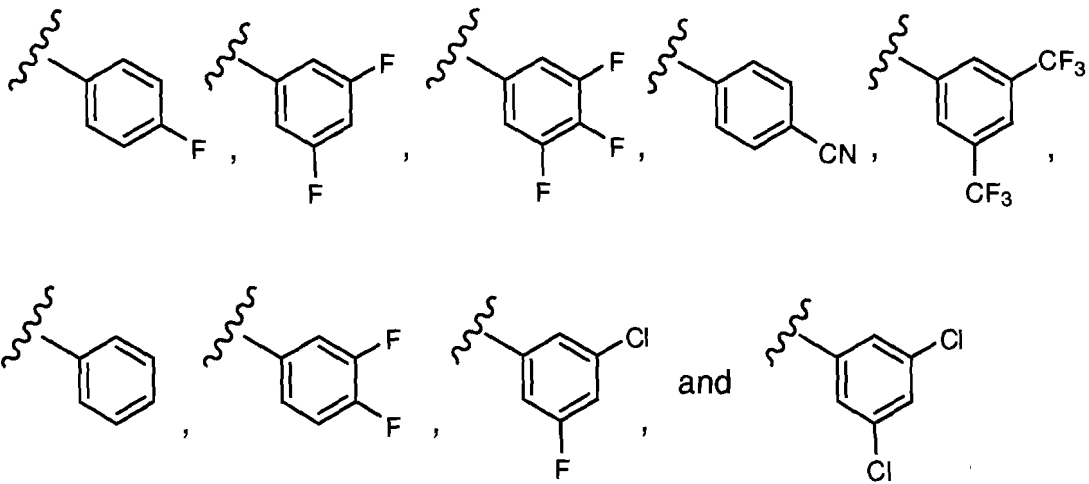
【0715】

からなる群から選択される。

【0716】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化52】



30

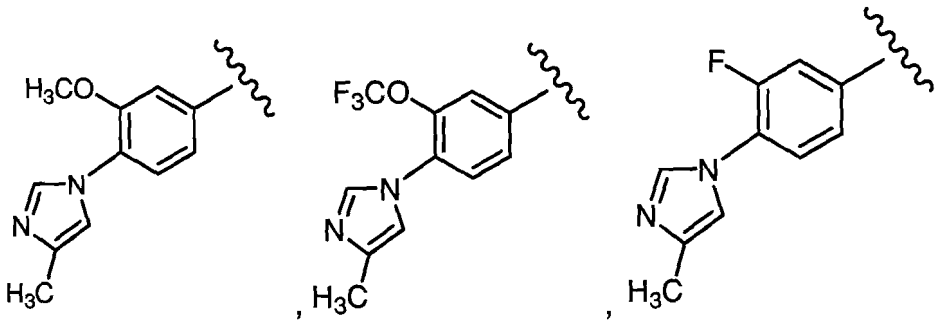
【0717】

からなる群から選択され；

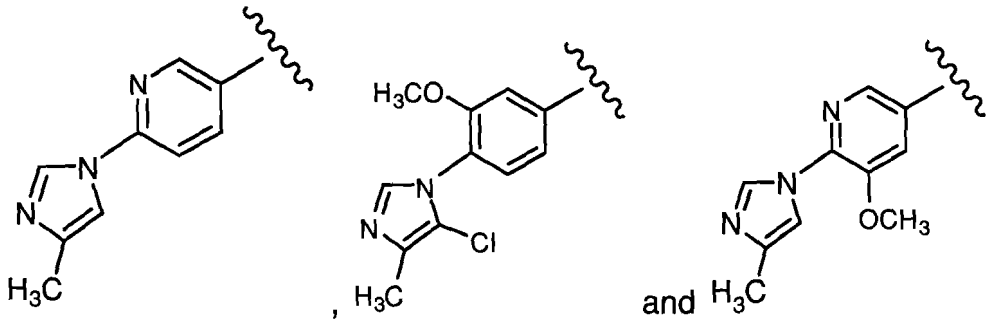
前記 R^9 - R^{10} - 部分は

40

【化53】



10



20

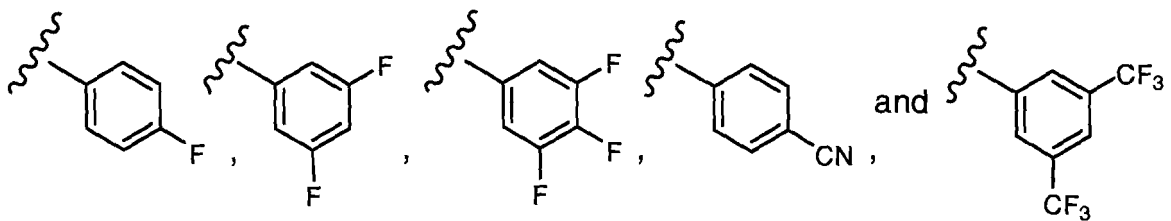
【0718】

からなる群から選択される。

【0719】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化54】



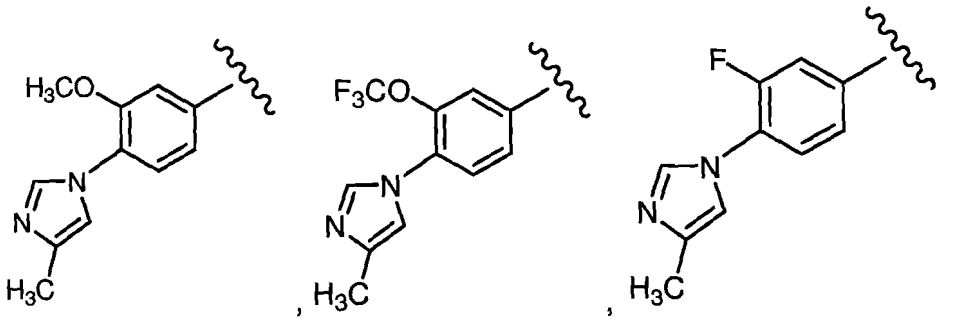
30

【0720】

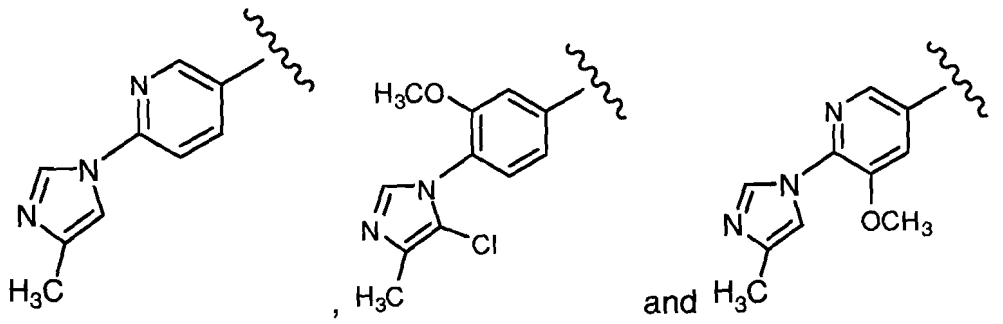
からなる群から選択され；

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化55】



10



20

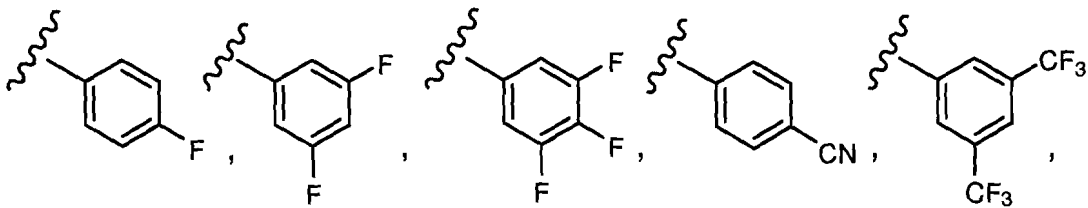
【0721】

からなる群から選択される。

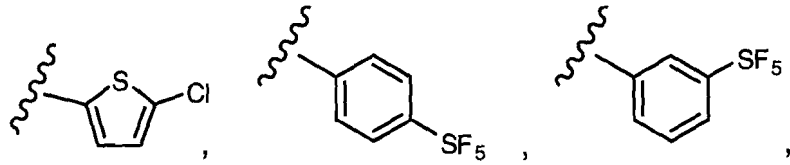
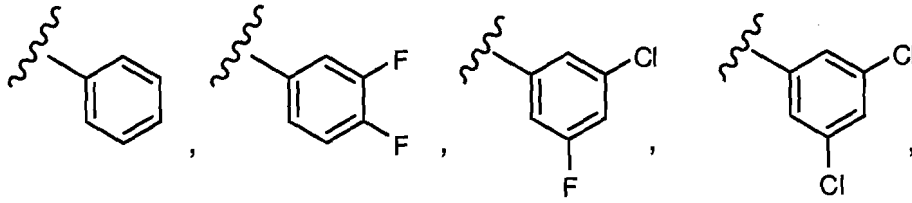
【0722】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

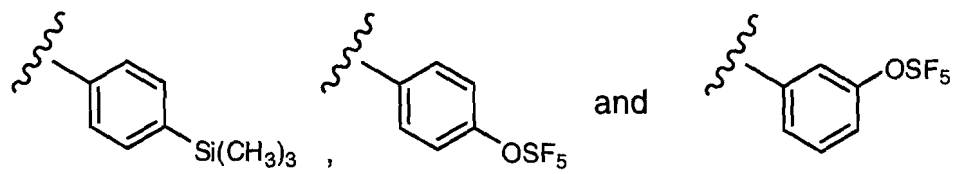
【化56】



30



10



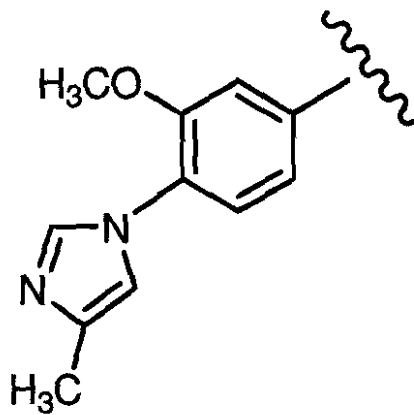
20

【0723】

からなる群から選択され；

前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化57】



30

【0724】

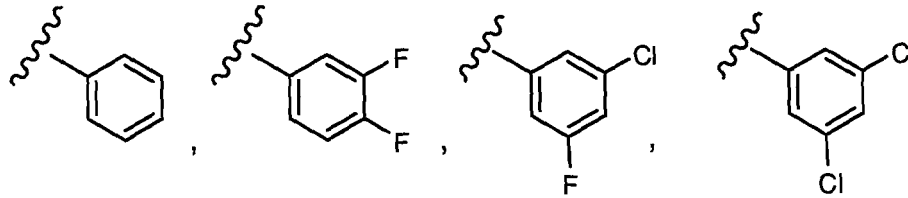
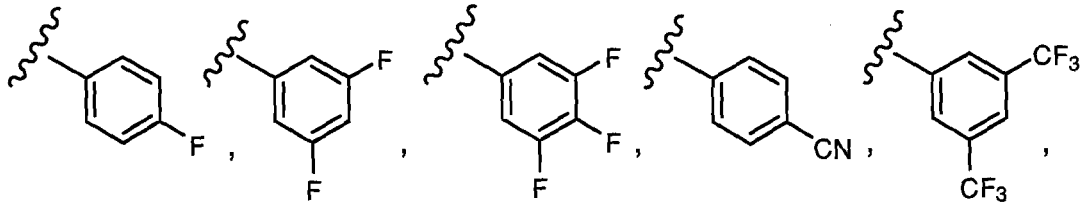
である。

【0725】

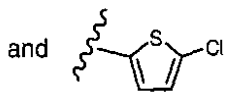
本発明の別の実施形態において、R⁷は

40

【化58】



10

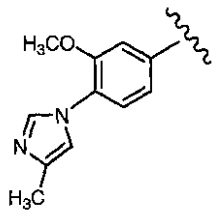


【0726】

からなる群から選択され；
前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

20

【化59】



【0727】

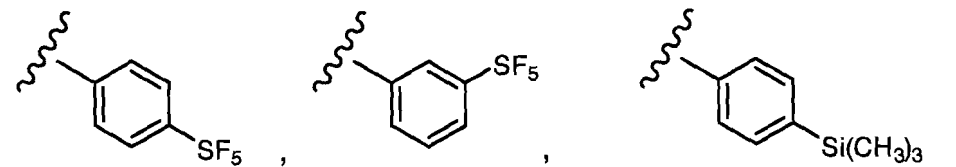
である。

30

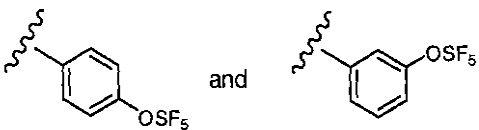
【0728】

本発明の別の実施形態において、R⁷は

【化60】



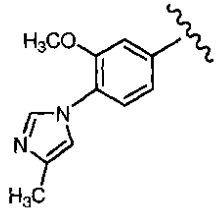
40



【0729】

からなる群から選択され；
前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化 6 1】



【 0 7 3 0】

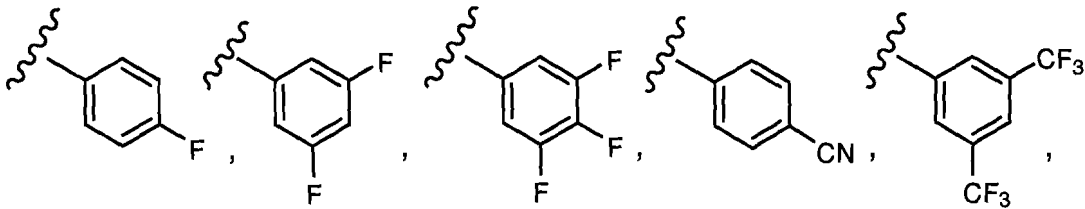
である。

10

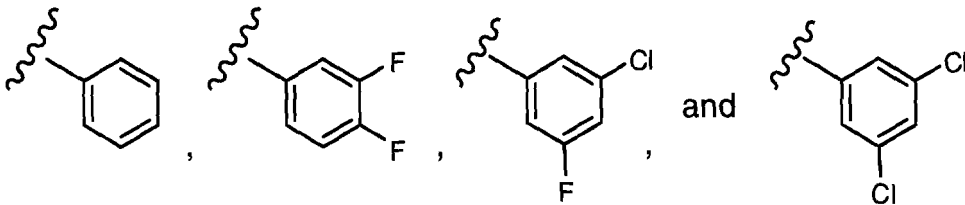
【 0 7 3 1】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

【化 6 2】



20



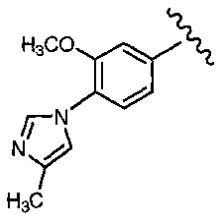
【 0 7 3 2】

からなる群から選択され；

30

前記 $\text{R}^9 - \text{R}^{10}$ - 部分は

【化 6 3】



【 0 7 3 3】

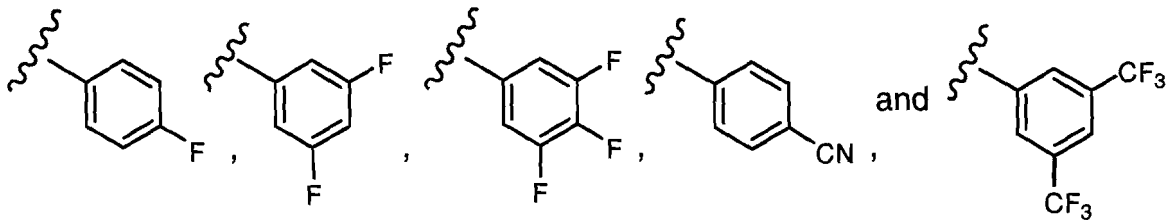
である。

40

【 0 7 3 4】

本発明の別の実施形態において、 R^7 は

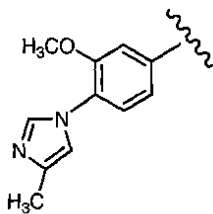
【化64】



【0735】

からなる群から選択され；
前記 R⁹ - R¹⁰ - 部分は

【化65】



【0736】

である。

【0737】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶ はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R⁷ はアリール基であり、または R⁷ は 1 から 3 個の独立に選択される R²¹ 基で置換されたアリール基であり、(c) R¹⁰ はアリールおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R⁹ はヘテロアリールおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される。

【0738】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶ はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R⁷ はフェニルであり、または R⁷ は 1 から 3 個の独立に選択される R²¹ 基で置換されたフェニルであり、(c) R¹⁰ はアリールおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R⁹ はヘテロアリールおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される。

【0739】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶ はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R⁷ はフェニルであり、または R⁷ は 1 から 3 個の独立に選択される R²¹ 基で置換されたフェニルであり、(c) R¹⁰ はフェニルおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹ はイミダゾリルおよび 1 以上の独立に選択される R²¹ 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0740】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶ はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R⁷ はフェニルであり、または R⁷ は 1 から 3 個の独立に選択される R²¹ 基で置換されたフェニルであり、(c) R¹⁰ はフェニルおよび 1 以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹ はイミダゾリルおよび 1 以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0741】

10

20

30

40

50

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、または R^7 は 1 から 2 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 八口基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0742】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 八口基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

10

【0743】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、または R^7 は 1 から 3 個の F で置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は 1 から 3 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基は八口であり、前記八口は F である。）、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

20

【0744】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、または R^7 は 1 から 2 個の F で置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は、1 から 2 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基は八口であり、前記八口は F である。）、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

30

【0745】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、または R^7 は 1 個の F で置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基は八口であり、前記八口は F である。）、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

40

【0746】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はアリーールおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたアリーールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリーールおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたヘテロアリーールからなる群から選択される。

50

【0747】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0748】

50

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0749】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から2個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

10

【0750】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1個の R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0751】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から3個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。）、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

20

【0752】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から2個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は、1から2個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。）、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

30

【0753】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。）、(b) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

40

【0754】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される。

【0755】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(

50

b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0756】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

10

【0757】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0758】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

20

【0759】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【0760】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

30

【0761】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

40

【0762】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はアリール基であるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0763】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換され

50

たフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0764】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

10

【0765】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はからなる群から選択されフェニルおよびで置換されたフェニル1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基、(d) R^9 はからなる群から選択されイミダゾリルおよびで置換されたイミダゾリル1以上の独立に選択されるアルキル基、(e) GはOである。

【0766】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は、1から2個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

20

【0767】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1個の R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリル基からなる群から選択され、(e) GはOである。

30

【0768】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

40

【0769】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から2個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0770】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(

50

b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 はで 1 個の F 置換されたフェニルであり (すなわち、 R^7 は 1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハロゲンであり、前記ハロゲンは F である。)、(b) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

【0771】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はアリーールおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたアリーールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリーールおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたヘテロアリーールからなる群から選択され、(e) G は O である。

10

【0772】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

【0773】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ ハロゲン基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 以上の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

20

【0774】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は、1 から 2 個の独立に選択される $R^{2,1}$ ハロゲン基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

30

【0775】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ ハロゲン基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

【0776】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は 1 から 3 個の F で置換されたフェニルであり (すなわち、 R^7 は、1 から 3 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハロゲンであり、前記ハロゲンは F である。)、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR^{1,5} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は O である。

40

【0777】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 は 1 から 2 個の F で置換されたフェニルであり (すなわち、 R^7 は 1 から 2 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハロゲンであり、前記ハロゲンは F である

50

。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0778】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基はハロゲンであり、前記ハロゲンはFである。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

10

【0779】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0780】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

20

【0781】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

30

【0782】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0783】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

40

【0784】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0785】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(

50

b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

【0786】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(b) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはOである。

10

【0787】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はアリール基であるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0788】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはSである。

20

【0789】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

30

【0790】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0791】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から2個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよびイミダゾリル1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたからなる群から選択され、(e) GはSである。

40

【0792】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1個の R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾ

50

リルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0793】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から3個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1,5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

10

【0794】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から2個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1,5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0795】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1,5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

20

【0796】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はアリールおよび1以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはSである。

30

【0797】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0798】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される $R^{2,1}$ ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1以上の独立に選択される-OR^{1,5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

40

【0799】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から2個の独立に選択される $R^{2,1}$ ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) $R^{1,0}$ はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1,5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 $R^{1,5}$ はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからな

50

る群から選択され、(e) GはSである。

【0800】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷は1個のR^{2 1}ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はアルキルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0801】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から3個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

10

【0802】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から2個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

20

【0803】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-OR^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

30

【0804】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであり、(c) R^{1 0}はアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R⁹はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0805】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

40

【0806】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1以上の独立に選択される-OR^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

50

【0807】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0808】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

10

【0809】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

【0810】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

20

【0811】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはSである。

30

【0812】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はアリール基であるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0813】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

40

【0814】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであるか、 R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G

50

はC(O)である。

【0815】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1以上の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0816】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から2個の独立に選択されるR^{2 1}ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はアルキルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよびイミダゾリル1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

10

【0817】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1個のR^{2 1}ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はアルキルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

20

【0818】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から3個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

30

【0819】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から2個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0820】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はメチルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

40

【0821】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はアリーールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたアリーールからなる

50

る群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリアルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリアルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0822】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0823】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

10

【0824】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から2個の独立に選択される R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

20

【0825】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1個の R^{21} 八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0826】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

30

【0827】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1から2個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。)、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

40

【0828】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、 R^7 は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基は八口であり、前記八口はFである。)、(b) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフ

50

フェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0829】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0830】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0831】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0832】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0833】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0834】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0835】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0836】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R^7 はフェニルであり、(b) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{15} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換

10

20

30

40

50

されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはC(O)である。

【0837】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はアリール基であるか、R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたアリールであり、(c) R^{1 0}はアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R⁹はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

【0838】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R⁹はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

10

【0839】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるR^{2 1}基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

20

【0840】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個の独立に選択されるR^{2 1}八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1以上の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

【0841】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から2個の独立に選択されるR^{2 1}八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はアルキルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよびイミダゾリル1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

30

【0842】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1個のR^{2 1}八口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される-O R^{1 5}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{1 5}はアルキルであり、(d) R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{1 4})である(1例において、GはNHである。)

40

【0843】

本発明の別の実施形態において、(a) R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b) R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から3個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から3個のR^{2 1}基で置換されたフェニルであり、前記R^{2 1}基は八口であり、前記八口はFである。)、(c) R^{1 0}はフェニルおよび1もしくは2個の独立に

50

選択される -OR¹⁵基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R¹⁵はメチルであり、(d)R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

【0844】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷はフェニルであるか、R⁷は1から2個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1から2個のR²¹基で置換されたフェニルであり、前記R²¹基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(c)R¹⁰はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R¹⁵はメチル

10

【0845】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷はフェニルであるか、R⁷は1個のFで置換されたフェニルであり(すなわち、R⁷は1個のR²¹基で置換されたフェニルであり、前記R²¹基はハ口であり、前記ハ口はFである。)、(b)R¹⁰はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R¹⁵はメチルであり、(d)R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

20

【0846】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷は1から3個の独立に選択されるR²¹基で置換されたフェニルであり、(c)R¹⁰はアリールおよび1以上の独立に選択されるR²¹基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d)R⁹はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択されるR²¹基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

【0847】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷は1から3個の独立に選択されるR²¹基で置換されたフェニルであり、(c)R¹⁰はフェニルおよび1以上の独立に選択されるR²¹基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d)R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるR²¹基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

30

【0848】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷は1から3個の独立に選択されるR²¹ハ口基で置換されたフェニルであり、(c)R¹⁰はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d)R⁹はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

40

【0849】

本発明の別の実施形態において、(a)R⁶はアルキル(例えば、メチル)であり、(b)R⁷は1から2個の独立に選択されるR²¹ハ口基で置換されたフェニルであり、(c)R¹⁰はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R¹⁵はアルキルであり、(d)R⁹はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e)GはN(R¹⁴)である(1例において、GはNHである。)

50

。

【0850】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1個の R^{21} ハ口基で置換されたフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

【0851】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から3個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は1から3個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基はハ口であり、前記ハ口はFである。）、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

10

【0852】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1から2個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は1から2個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基はハ口であり、前記ハ口はFである。）、(c) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

20

【0853】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 は1個のFで置換されたフェニルであり（すなわち、 R^7 は1個の R^{21} 基で置換されたフェニルであり、前記 R^{21} 基はハ口であり、前記ハ口はFである。）、(b) R^{10} はフェニルおよび1もしくは2個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1もしくは2個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

30

【0854】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたアリールからなる群から選択され、(d) R^9 はヘテロアリールおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

40

【0855】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルおよび1以上の独立に選択される R^{21} 基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) GはN(R^{14})である（1例において、GはNHである。）。

【0856】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル（例えば、メチル）であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび1以上の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、(d) R^9 はイミダゾリルお

50

よび 1 以上の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0857】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0858】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はアルキルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0859】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0860】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 はフェニルであり、(c) R^{10} はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0861】

本発明の別の実施形態において、(a) R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、(b) R^7 はフェニルであり、(b) R^{10} はフェニルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択される -OR¹⁵ 基で置換されたフェニルからなる群から選択され、 R^{15} はメチルであり、(d) R^9 はイミダゾリルおよび 1 もしくは 2 個の独立に選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、(e) G は $N(R^{14})$ である (1 例において、G は NH である。)。

【0862】

本発明の他の実施形態は、環 B が上記環 B に関する実施形態のいずれかで定義の通りである上記実施形態 (G が O、C(O)、 $N(R^{14})$ (NH など) または S である、 R^6 と R^7 および R^{10} と R^9 の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0863】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在する上記実施形態 (G が O、C(O)、 $N(R^{14})$ (NH など) または S である、 R^6 と R^7 および R^{10} と R^9 の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0864】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が N である上記実施形態 (G が O、C(O)、 $N(R^{14})$ (NH など) または S である、 R^6 と R^7 および R^{10} と R^9 の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0865】

10

20

30

40

50

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が N であり、環 B が 5 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0866】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が N であり、環 B が 6 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0867】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が N であり、環 B が 7 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

10

【0868】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0869】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、環 B が 5 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0870】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、環 B が 6 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

20

【0871】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、環 B が 7 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0872】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、R⁵ が H である。上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

30

【0873】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、R⁵ が H であり、環 B が 5 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0874】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、R⁵ が H であり、環 B が 6 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

40

【0875】

本発明の他の実施形態は、環 B における適宜の結合が存在し、U が CR⁵ であり、R⁵ が H であり、環 B が 7 員環である上記実施形態 (G が O、C (O)、N (R^{1 4}) (NH など) または S である、R⁶ と R⁷ および R^{1 0} と R⁹ の組み合わせに関するもの) に関するものである。

【0876】

本発明の他の実施形態は、環 B が 1 もしくは 2 個の R^{2 1} 基で置換されている上記実施形態のいずれかに関するものである。1 例において、各 R^{2 1} 基は同一もしくは異なるアルキル基である。別の例において、各 R^{2 1} はメチルである。別の例では環 B は 2 個の R

50

$R^{2,1}$ 基で置換されている。別の例では環Bは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各基は同一もしくは異なるアルキル基である。別の例では環Bは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各基はメチル基である。別の例では環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されている。別の例では環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はアルキルである。別の例では環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はアルキルであり、前記アルキル基はメチルである。

【0877】

本発明の別の実施形態において、環Bは1もしくは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0878】

本発明の別の実施形態において、環Bは1または2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は同一もしくは異なるアルキル基である。

10

【0879】

本発明の別の実施形態において、環Bは1または2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基はメチルである。

【0880】

本発明の別の実施形態において、環Bは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0881】

本発明の別の実施形態において、環Bは2個の $R^{2,1}$ 基置換されており、各 $R^{2,1}$ 基は同一もしくは異なるアルキル基である。

【0882】

20

本発明の別の実施形態において、環Bは2個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、各 $R^{2,1}$ 基はメチルである。

【0883】

本発明の別の実施形態において、環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されている。

【0884】

本発明の別の実施形態において、環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はアルキル基である。

【0885】

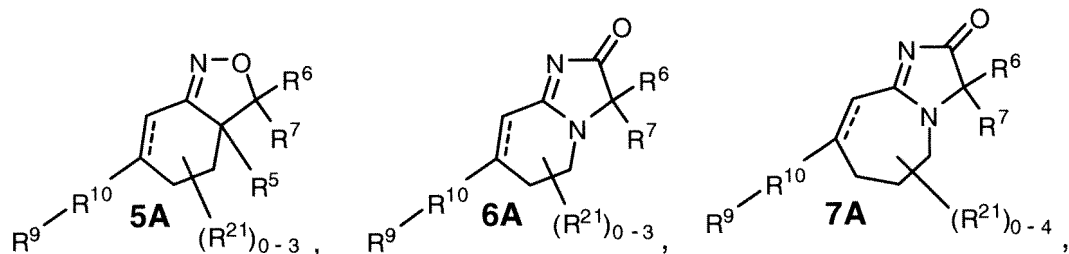
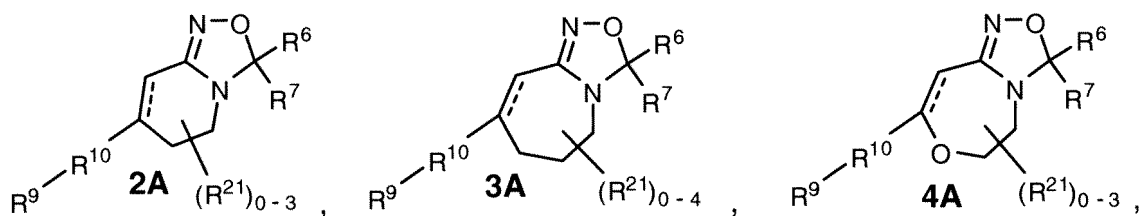
本発明の別の実施形態において、環Bは1個の $R^{2,1}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,1}$ 基はメチルである。

30

【0886】

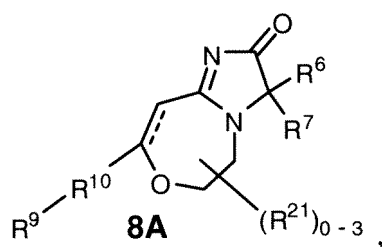
本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、

【化 6 6】



10

and



20

【 0 8 8 7】

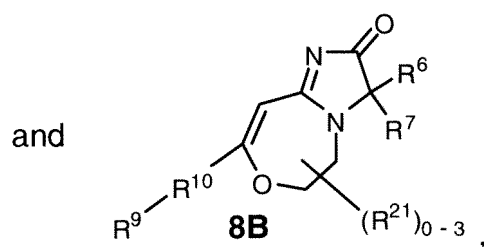
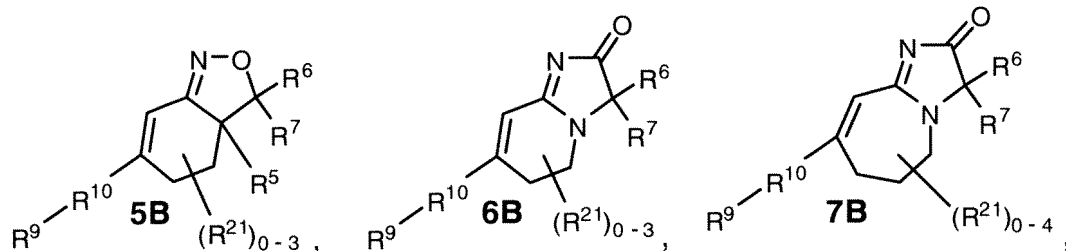
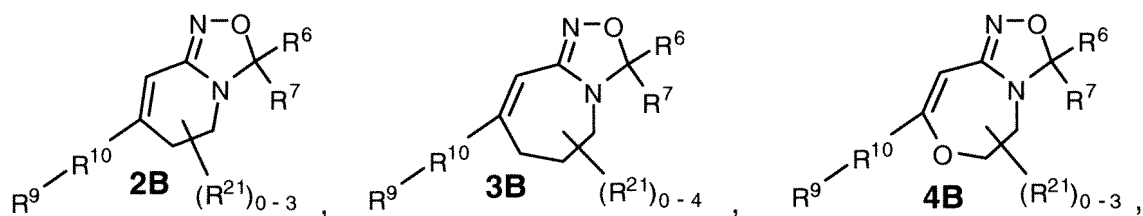
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基 (すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。) がある。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基が同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

30

【 0 8 8 8】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、

【化 6 7】



【 0 8 8 9】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基 (すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。) がある。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基が同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基が同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

【 0 8 9 0】

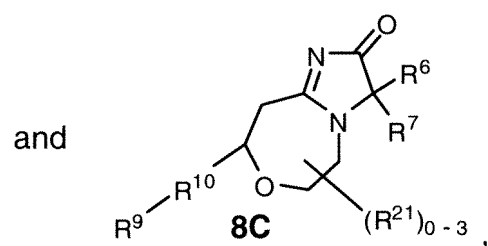
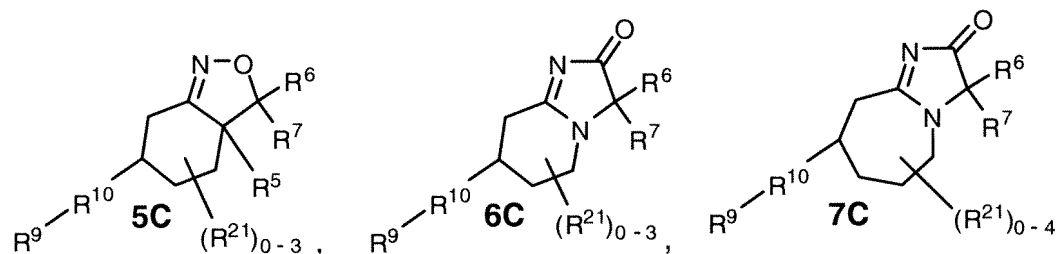
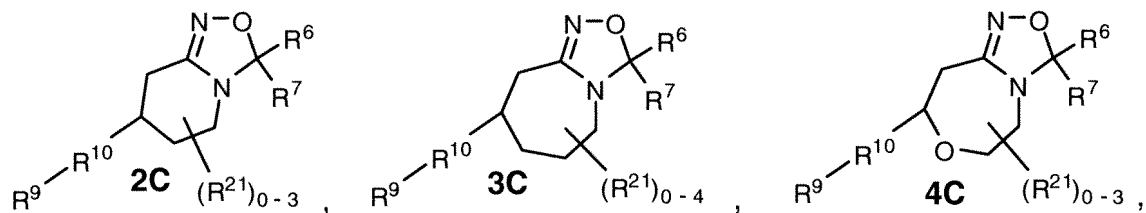
本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、

10

20

30

【化 6 8】



10

20

30

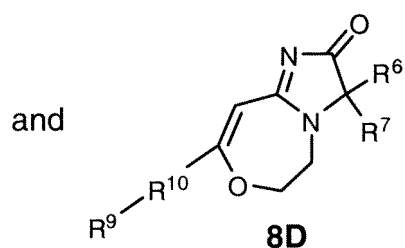
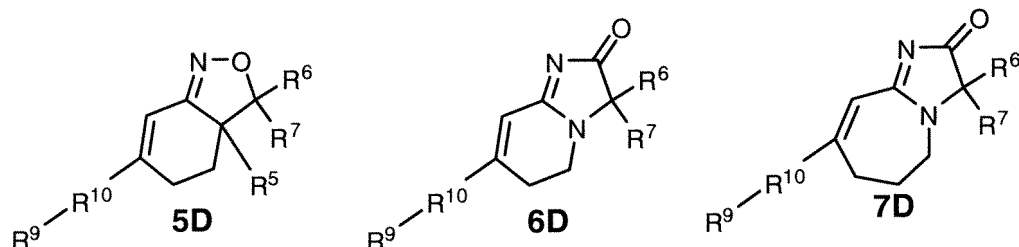
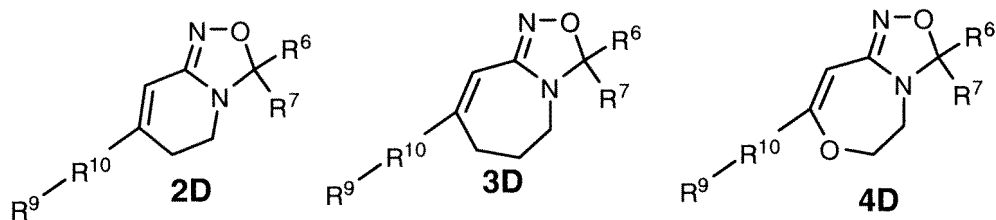
【0891】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基 (すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。) がある。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の1例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基が同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基が同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

【0892】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、

【化69】



10

20

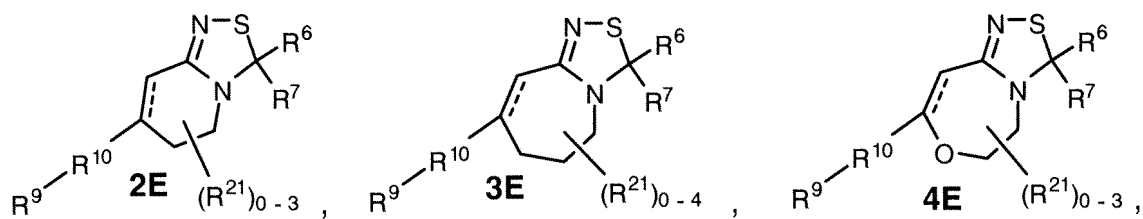
【0893】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は式(I)またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。

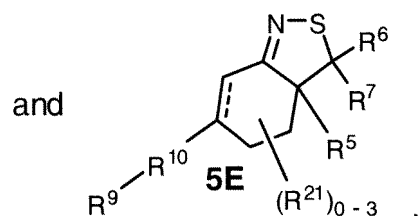
【0894】

本発明の別の実施形態において、前記式(I)の化合物は、

【化70】



30



40

【0895】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式(I)またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基がある(すなわち、 R^{21} 基がないか、1個の R^{21} 基があるか、2個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環Bに1個の R^{21} 基がある。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は

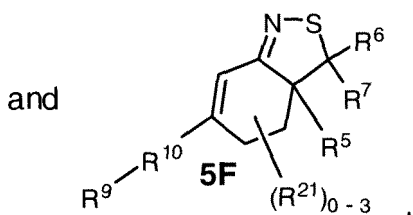
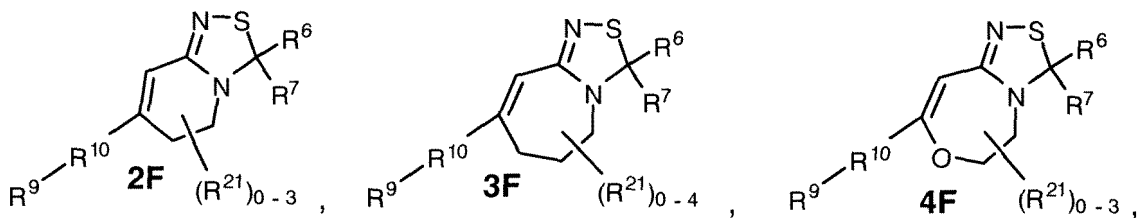
50

同一もしくは異なるアルキル基（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えば、メチル）である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

【0896】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、

【化71】



【0897】

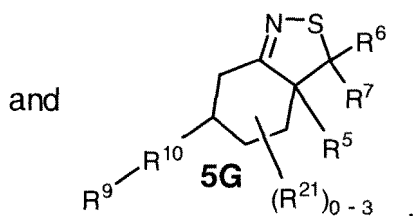
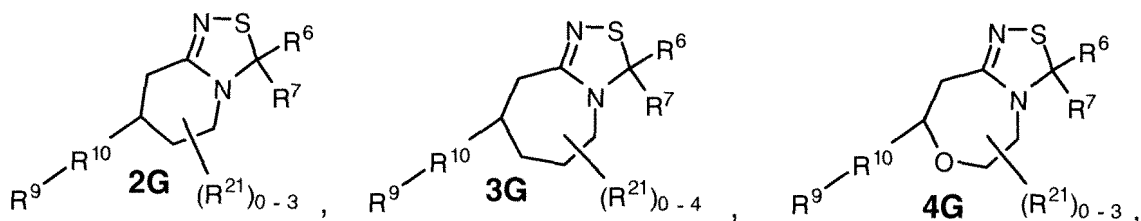
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基がある（すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。）。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えば、メチル）である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル（例えばメチル）である。

30

【0898】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

【化72】



【0899】

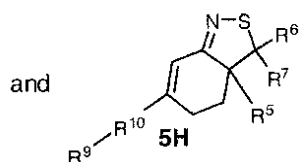
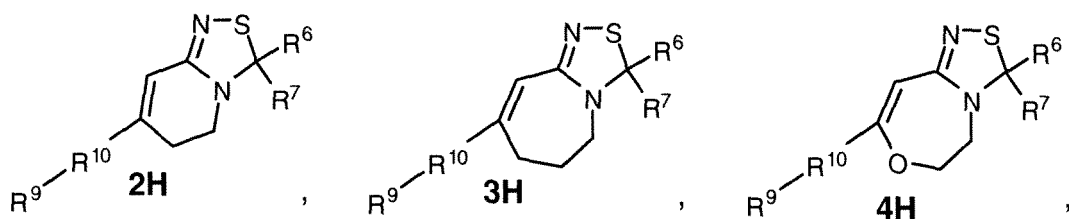
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基がある (すなわち、 R^{21} 基がないか、1個の R^{21} 基があるか、2個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環Bに1個の R^{21} 基がある。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環Bに R^{21} 基がない。

10

【0900】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

【化73】



【0901】

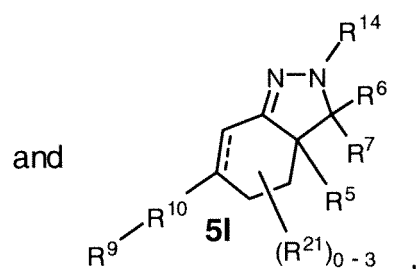
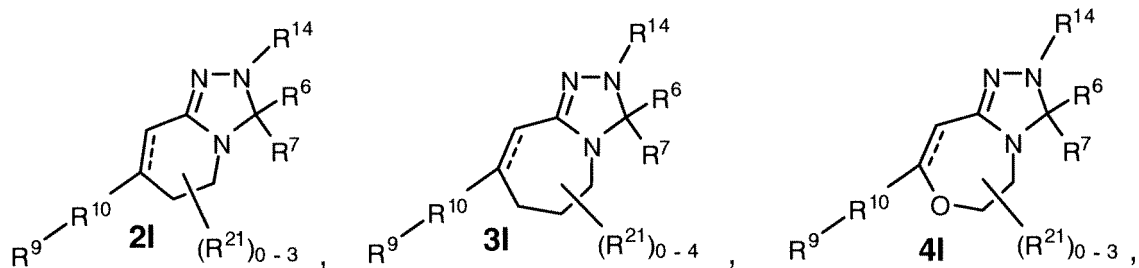
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。

30

【0902】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

【化74】



【0903】

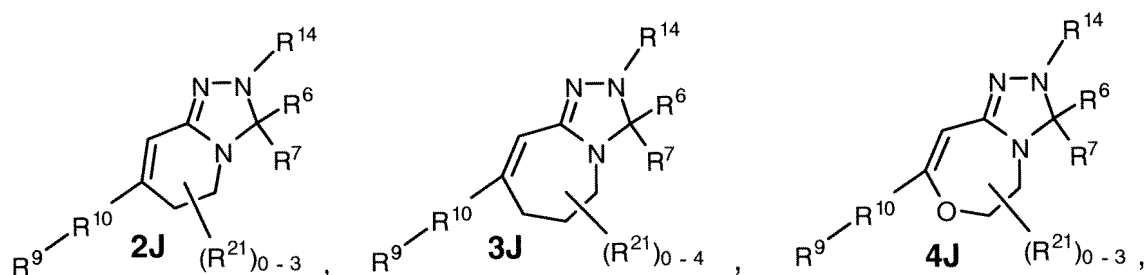
50

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{14} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基がある (すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

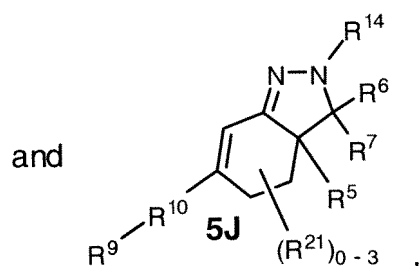
10

【0904】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は
【化75】



20



30

【0905】

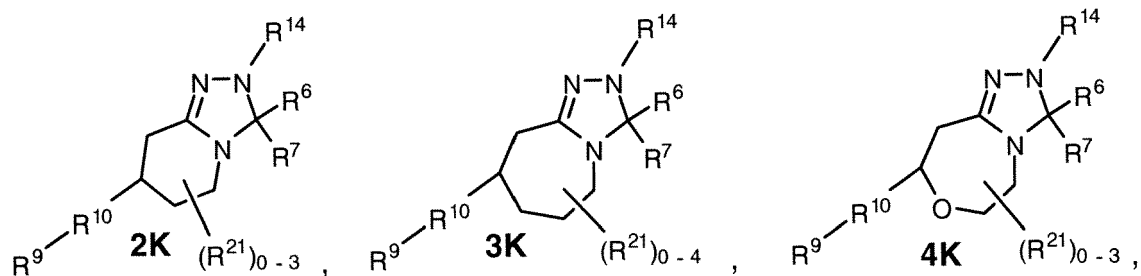
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{14} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基がある (すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

40

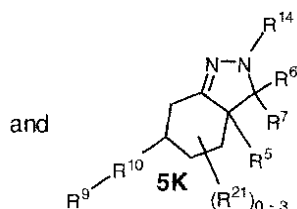
【0906】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

【化76】



10



【0907】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{14} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基がある (すなわち、 R^{21} 基がないか、1個の R^{21} 基があるか、2個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環Bに1個の R^{21} 基がある。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基 (例えば、メチル) である。この実施形態の別の例では、1個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル (例えばメチル) である。この実施形態の別の例では、環Bに R^{21} 基がない。

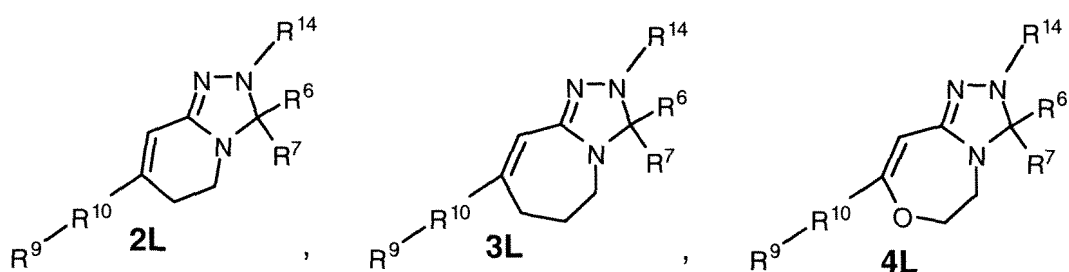
20

【0908】

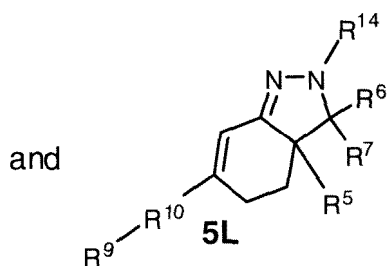
本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

30

【化77】



40



【0909】

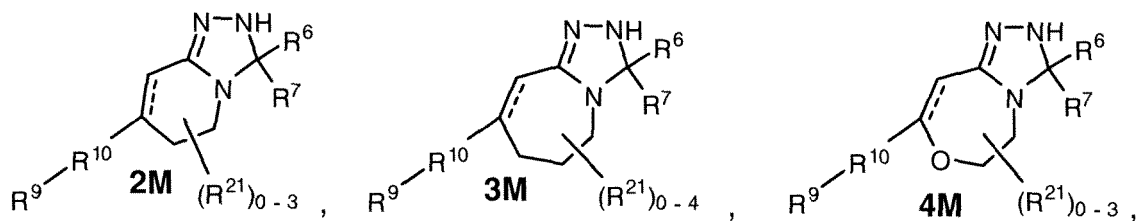
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{14} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。

50

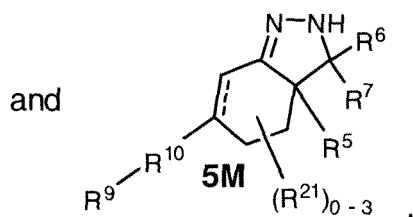
【0910】

本発明の別の実施形態において、前記式(I)の化合物は

【化78】



10



【0911】

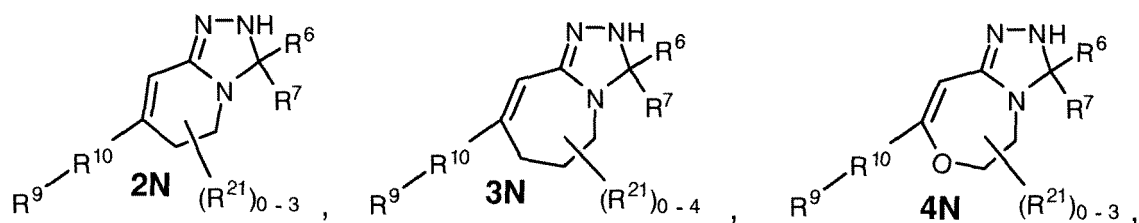
からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式(I)またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基がある(すなわち、 R^{21} 基がないか、1個の R^{21} 基があるか、2個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環Bに1個の R^{21} 基がある。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基(例えばメチル)である。この実施形態の別の例では、環Bに2個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基(例えば、メチル)である。この実施形態の別の例では、1個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル(例えばメチル)である。この実施形態の別の例では、環Bに R^{21} 基がない。

20

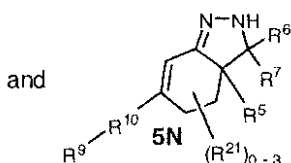
【0912】

本発明の別の実施形態において、前記式(I)の化合物は

【化79】



30



40

【0913】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式(I)またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の1例では、環Bに0から2個の R^{21} 基がある(すなわち、 R^{21} 基がないか、1個の R^{21} 基があるか、2個の独立に選択される R^{21} 基がある。)。この実施形態の別の例では、環Bに2個

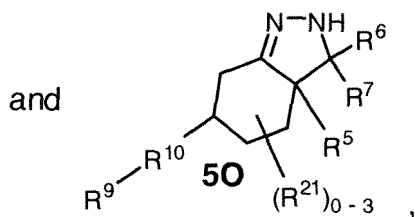
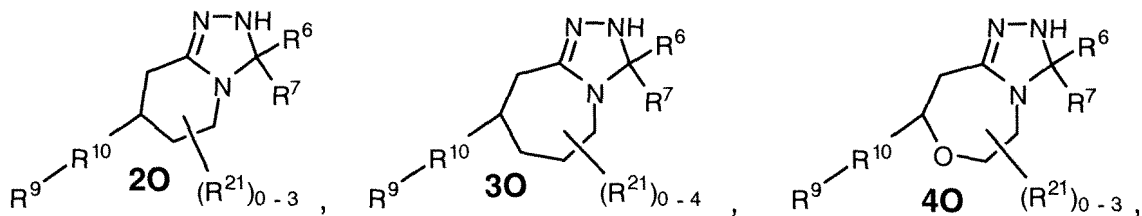
50

の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えば、メチル）である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

【0914】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

【化80】



【0915】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} および R^{21} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基がある（すなわち、 R^{21} 基がないか、1 個の R^{21} 基があるか、2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。）。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基がある。この実施形態の別の例では、環 B に 1 個の R^{21} 基がある。この実施形態の 1 例では、環 B に 0 から 2 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に 2 個の独立に選択される R^{21} 基があり、各 R^{21} 基は同一もしくは異なるアルキル基（例えば、メチル）である。この実施形態の別の例では、1 個の R^{21} 基があり、前記 R^{21} 基はアルキル（例えばメチル）である。この実施形態の別の例では、環 B に R^{21} 基がない。

【0916】

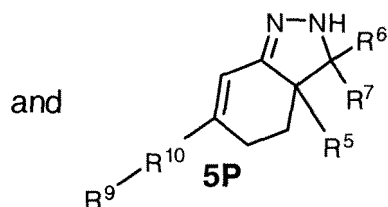
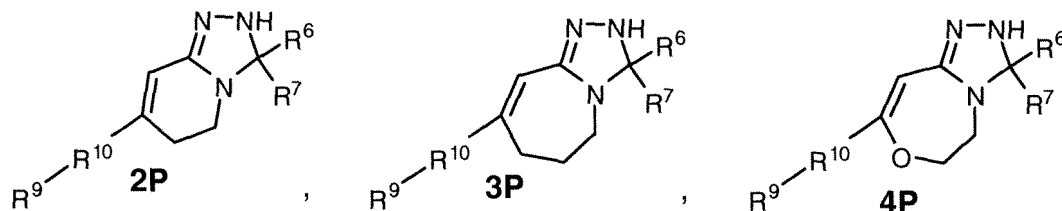
本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は

10

20

30

【化 8 1】



10

【0917】

からなる群から選択され、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 および R^{10} は式 (I) またはその実施形態のいずれかについて定義の通りである。

【0918】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 A の化合物である。

20

【0919】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 A の化合物である。

【0920】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 A の化合物である。

【0921】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 A の化合物である。

【0922】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 6 A の化合物である。

【0923】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 7 A の化合物である。

30

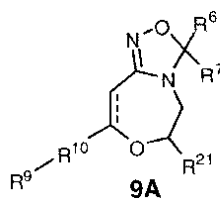
【0924】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 8 A の化合物である。

【0925】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 9 A の化合物である。

【化 8 2】



40

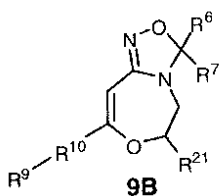
【0926】

式中、1例では環 $B R^{21}$ 基はアルキルであり、別の例では環 $B R^{21}$ 基はメチルである。

【0927】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 9 A の化合物である。

【化 8 3】



【 0 9 2 8】

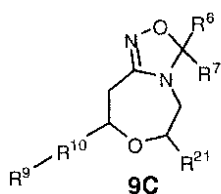
式中、1例では環 B R²¹ 基はアルキルであり、別の例では環 B R²¹ 基はメチルである。

10

【 0 9 2 9】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 9 A の化合物である。

【化 8 4】



【 0 9 3 0】

式中、1例では環 B R²¹ 基はアルキルであり、別の例では環 B R²¹ 基はメチルである。

20

【 0 9 3 1】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 E の化合物である。

【 0 9 3 2】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 E の化合物である。

【 0 9 3 3】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 E の化合物である。

【 0 9 3 4】

本発明の別の実施形態において、式 5 E 前記式 (I) の化合物は、5 E の化合物である。

30

【 0 9 3 5】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 F の化合物である。

【 0 9 3 6】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 F の化合物である。

【 0 9 3 7】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 F の化合物である。

【 0 9 3 8】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 F の化合物である。

【 0 9 3 9】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 G の化合物である。

40

【 0 9 4 0】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 G の化合物である。

【 0 9 4 1】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 G の化合物である。

【 0 9 4 2】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 G の化合物である。

【 0 9 4 3】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 H の化合物である。

【 0 9 4 4】

50

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 N の化合物である。

【 0 9 7 0 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 N の化合物である。

【 0 9 7 1 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 O の化合物である。

【 0 9 7 2 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 O の化合物である。

【 0 9 7 3 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 O の化合物である。

【 0 9 7 4 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 O の化合物である。

【 0 9 7 5 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 2 P の化合物である。

【 0 9 7 6 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 3 P の化合物である。

【 0 9 7 7 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 4 P の化合物である。

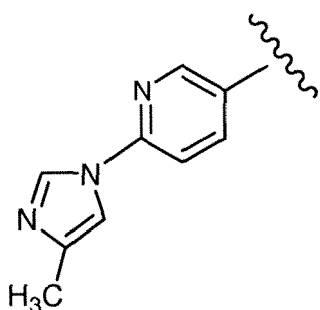
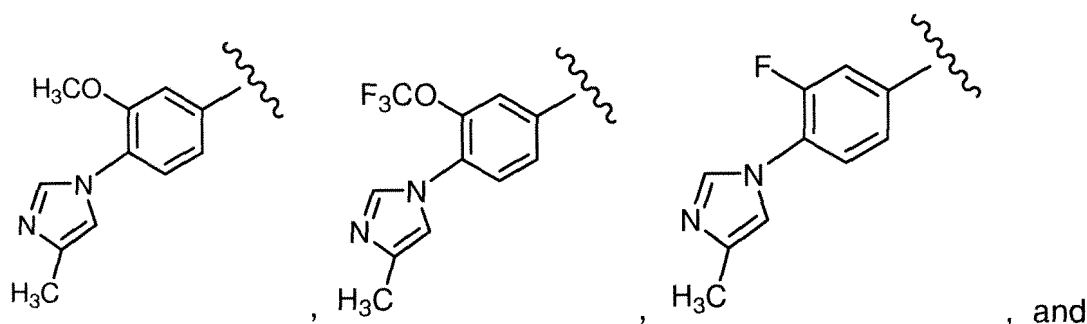
【 0 9 7 8 】

本発明の別の実施形態において、前記式 (I) の化合物は、式 5 P の化合物である。

【 0 9 7 9 】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【 化 8 5 】



【 0 9 8 0 】

からなる群から選択される 2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D、8 D、2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P、および 5 P (例も含めて上記で定義の通りのもの) からなる群から選択される。

【 0 9 8 1 】

10

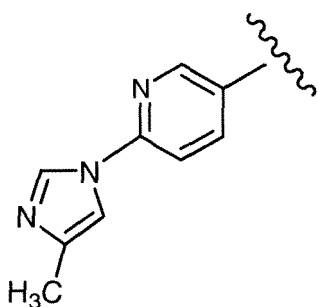
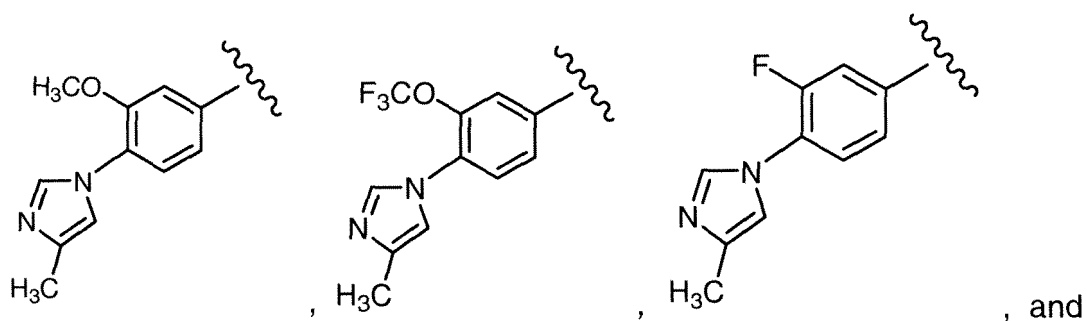
20

30

40

50

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化 8 6】

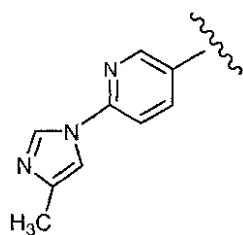
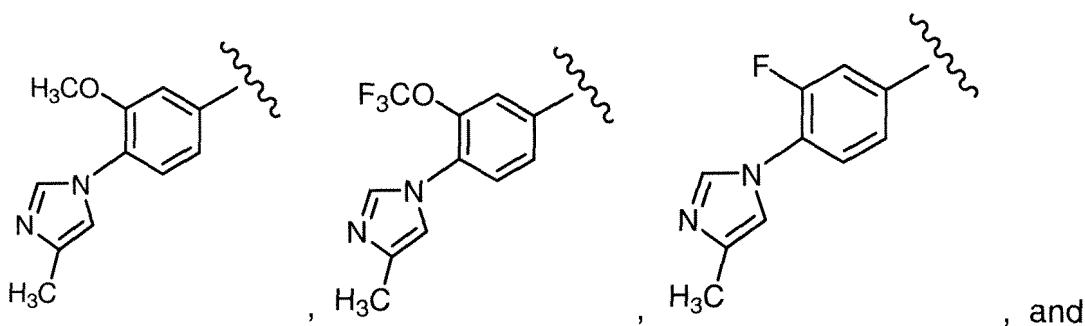


【0982】

からなる群から選択される 2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D および 8 D (例も含めて上記で定義の通りのもの) からなる群から選択される。

【0983】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化 8 7】



【0984】

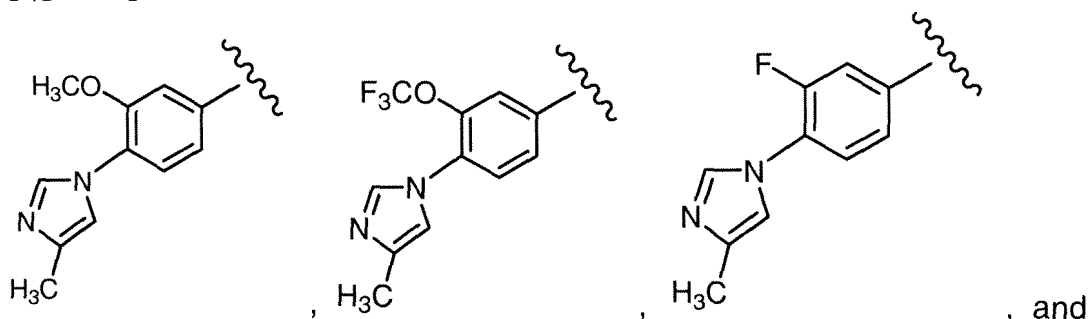
(R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、 R^7 は置換されたフェニル (例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えば p - F - フェニルなど) である。) からなる群から選択される 2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7

50

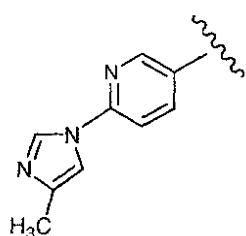
B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D、8 D、2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L H、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 Pおよび5 P（例も含めて上記で定義の通りのもの）からなる群から選択される。

【0985】

本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化88】



10



20

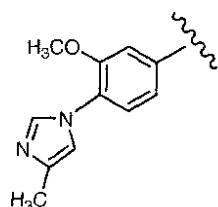
【0986】

(R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、 R^7 は置換されたフェニル(例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えばp-F-フェニルなど)である。)からなる群から選択される2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 Dおよび8 D（例も含めて上記で定義の通りのもの）からなる群から選択される。

30

【0987】

本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化89】



40

【0988】

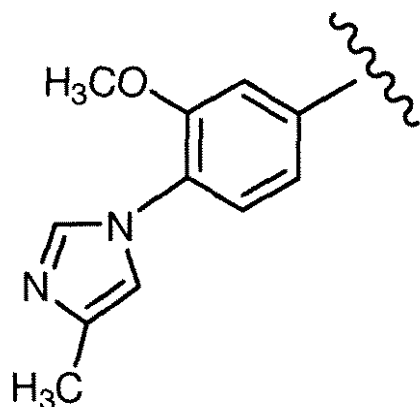
からなる群から選択される2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D、8 D、2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L H、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 Pおよび5 P（例も含めて上記で定義の通りのもの）からなる群から選択される。

50

【0989】

本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【化90】



10

【0990】

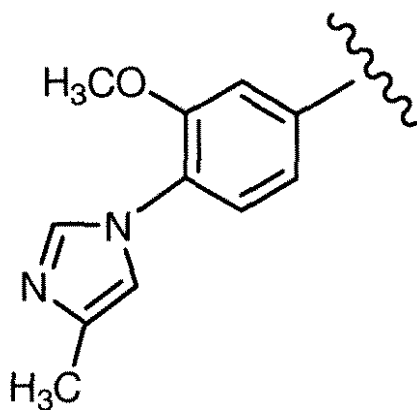
からなる群から選択される2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7Dおよび8D（例も含めて上記で定義の通りのもの）からなる群

20

【0991】

本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【化91】



30

【0992】

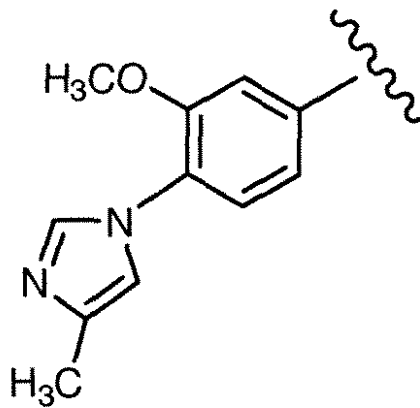
(R^6 はアルキル(例えば、メチル)であり、 R^7 は置換されたフェニル(例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えばp-F-フェニルなど)である。)からなる群から選択される2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4L、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4Pおよび5P（例も含めて上記で定義の通りのもの）からなる群から選択される。

40

【0993】

本発明の別の実施形態において、式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【化 9 2】



10

【0994】

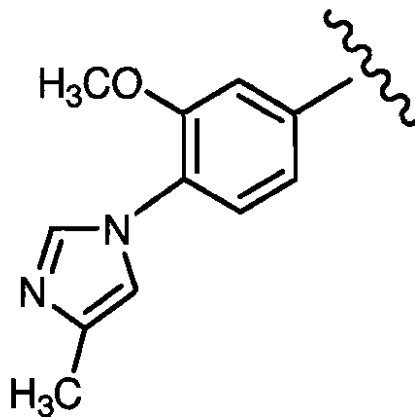
(R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、 R^7 は置換されたフェニル (例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えば p - F - フェニルなど) である。) からなる群から選択される 2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D および 8 D (例も含めて上記で定義の通りのもの) からなる群から選択される。

20

【0995】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 9 3】



30

【0996】

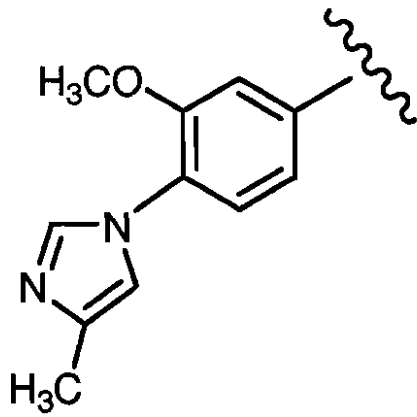
であり、 R^6 がアルキル (例えば、メチル) であり、 R^7 が置換されたフェニル (例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル) である 2 A である。

【0997】

40

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 9 4】



10

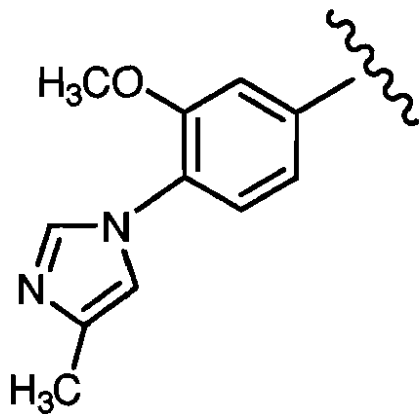
【0998】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 3 A である。

【0999】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

20



30

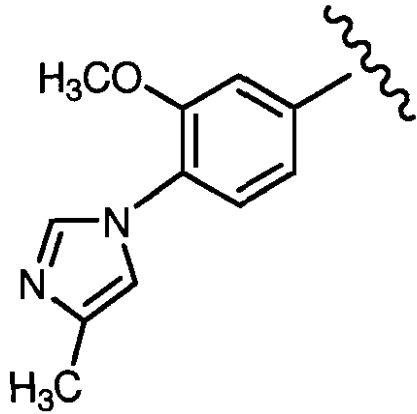
【1000】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 4 A である。

【1001】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 9 6】



10

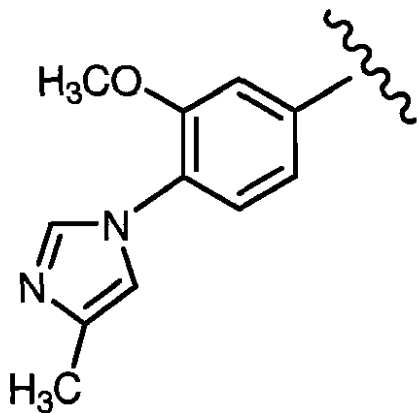
【1002】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 5 A である。

【1003】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

20



30

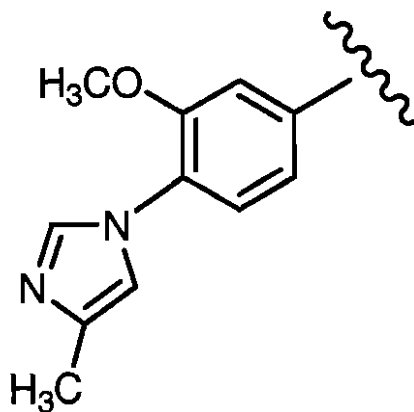
【1004】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 6 A である。

【1005】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

40



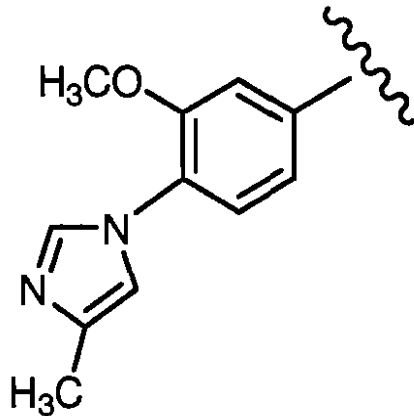
50

【1006】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 7 A である。

【1007】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化 99】



10

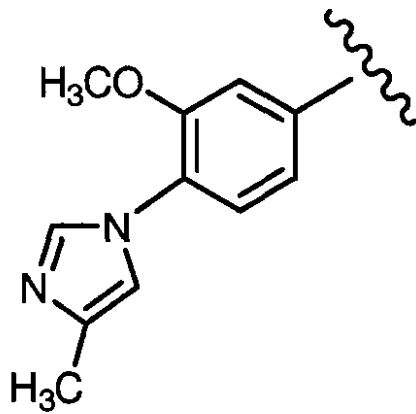
【1008】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 8 A である。

20

【1009】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が
【化 100】



30

【1010】

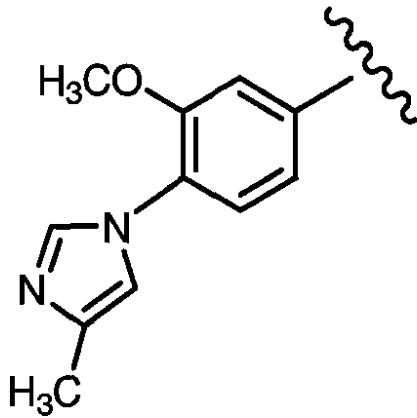
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 2 B である。

40

【1011】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 0 1】



10

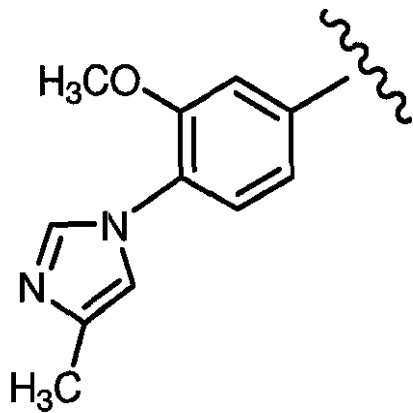
【 1 0 1 2】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 3 B である。

【 1 0 1 3】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 0 2】



20

30

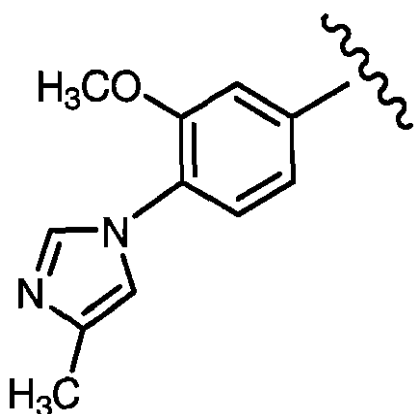
【 1 0 1 4】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 4 B である。

【 1 0 1 5】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 0 3】



40

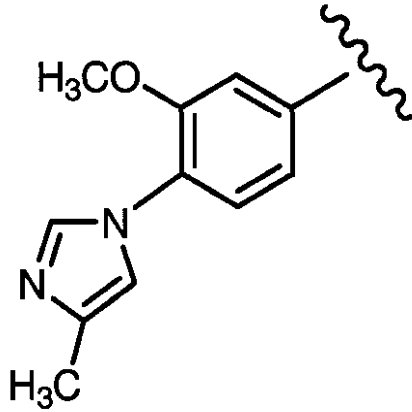
50

【1016】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である5Bである。

【1017】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化104】



10

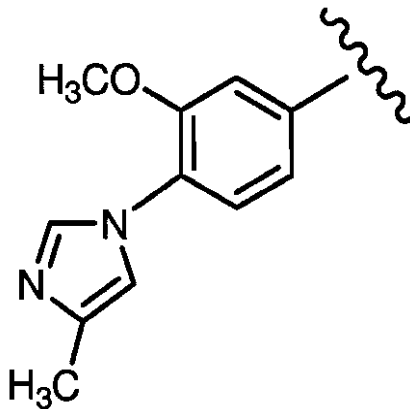
【1018】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である6Bである。

20

【1019】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化105】



30

【1020】

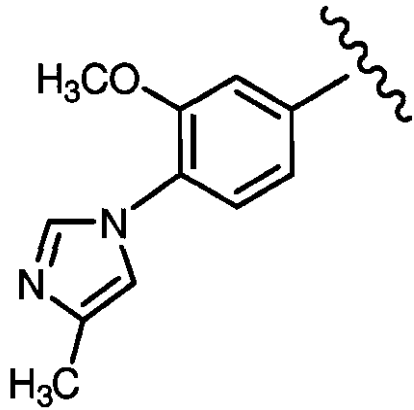
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である7Bである。

【1021】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

40

【化 1 0 6】



10

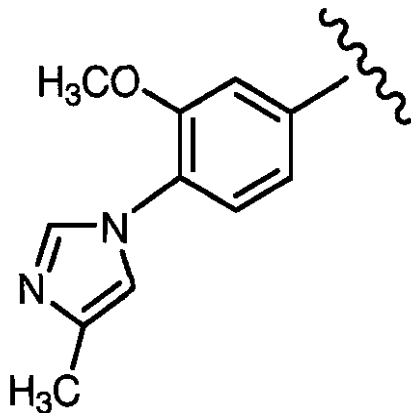
【 1 0 2 2】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 8 B である。

【 1 0 2 3】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 0 7】



20

30

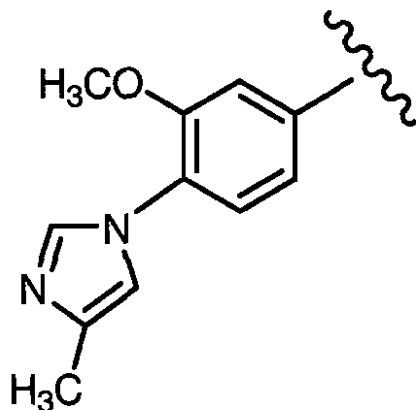
【 1 0 2 4】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 2 C である。

【 1 0 2 5】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 0 8】



40

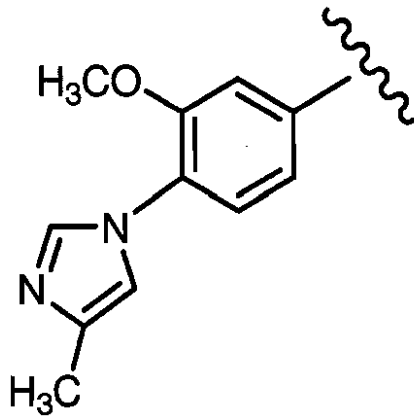
50

【1026】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である3Cである。

【1027】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化109】



10

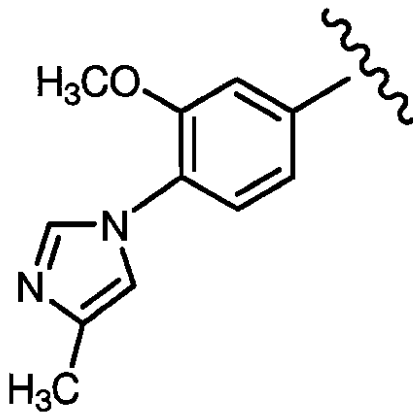
【1028】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である4Cである。

20

【1029】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化110】



30

【1030】

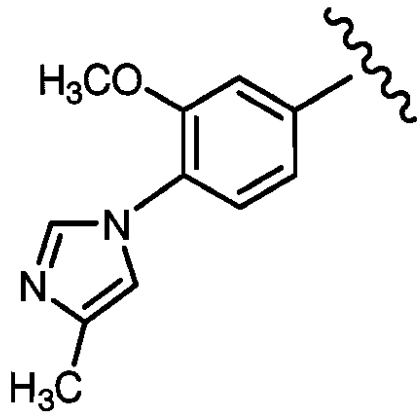
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である5Cである。

40

【1031】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【化 1 1 1】



10

【 1 0 3 2】

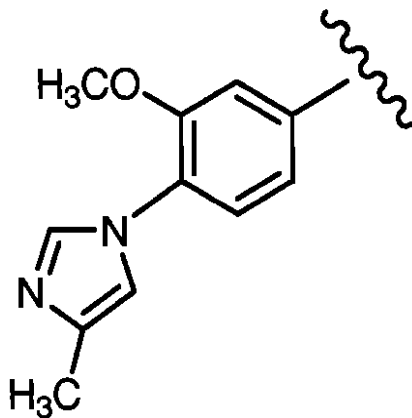
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 6 C である。

【 1 0 3 3】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

20

【化 1 1 2】



30

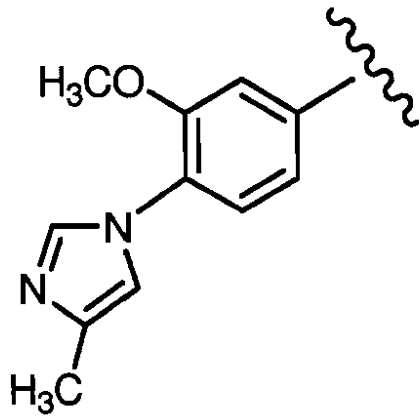
【 1 0 3 4】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 7 C である。

【 1 0 3 5】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 1 3】



10

【 1 0 3 6】

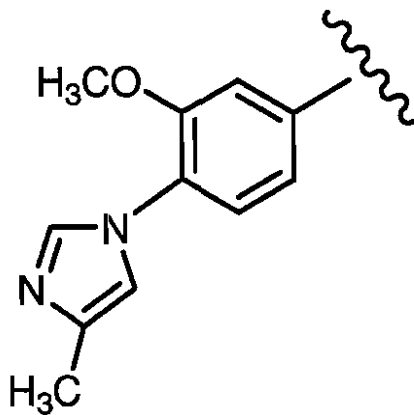
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 8 C である。

【 1 0 3 7】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

20

【化 1 1 4】



30

【 1 0 3 8】

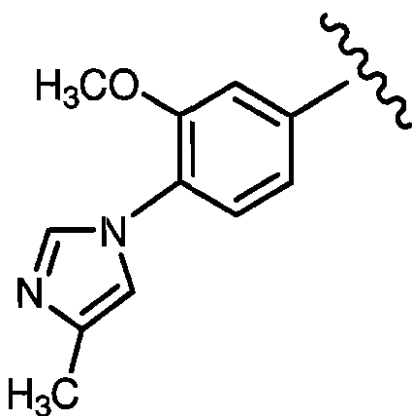
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 2 D である。

【 1 0 3 9】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

40

【化 1 1 5】



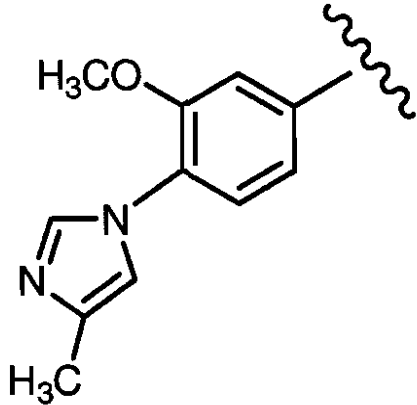
50

【1040】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である3Dである。

【1041】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化116】



10

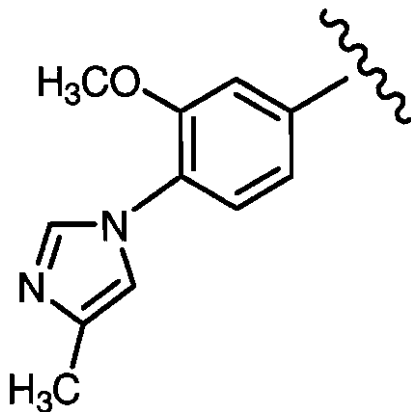
【1042】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である4Dである。

20

【1043】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が
【化117】



30

【1044】

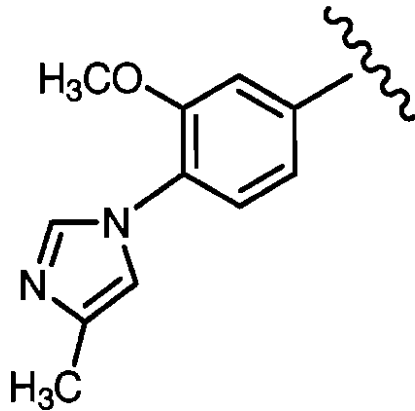
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である5Dである。

40

【1045】

本発明の1実施形態において、前記式(I)の化合物は、 $-R^{10}-R^9$ 部分が

【化 1 1 8】



10

【 1 0 4 6】

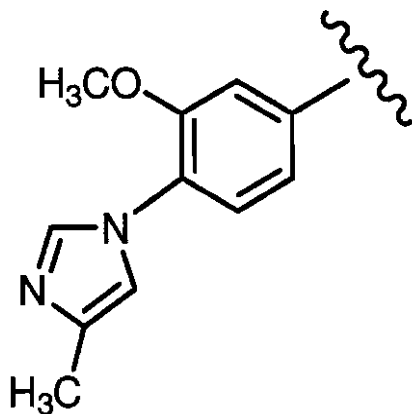
であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 6 D である。

【 1 0 4 7】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 1 9】

20



30

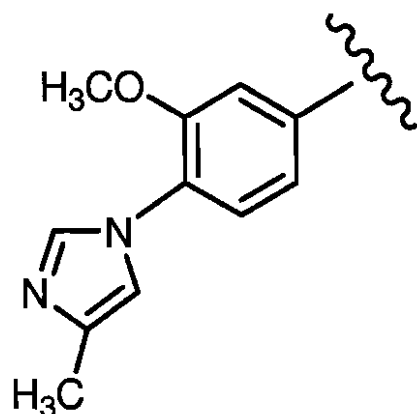
【 1 0 4 8】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p -F-フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 7 D である。

【 1 0 4 9】

本発明の 1 実施形態において、前記式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 2 0】



10

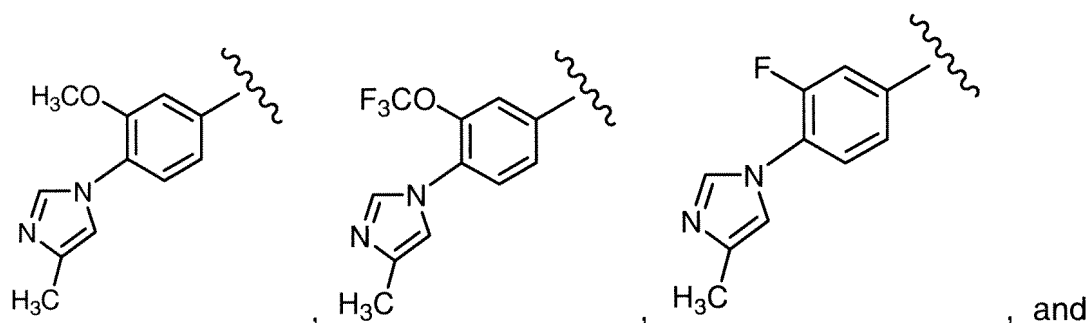
【 1 0 5 0】

であり、 R^6 がアルキル（例えば、メチル）であり、 R^7 が置換されたフェニル（例えば p - F - フェニルなどのフルオロ置換されたフェニル）である 8 D である。

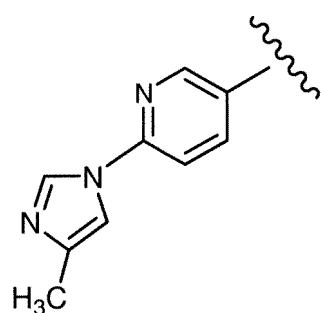
【 1 0 5 1】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 2 1】



20



30

【 1 0 5 2】

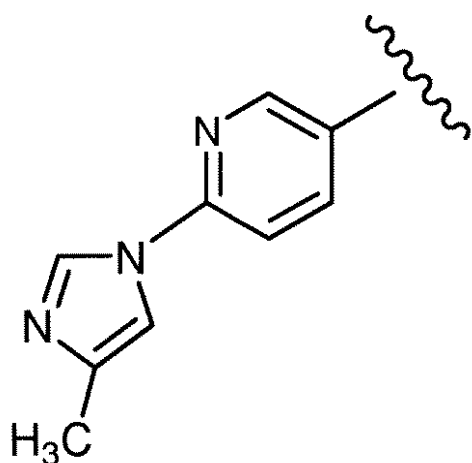
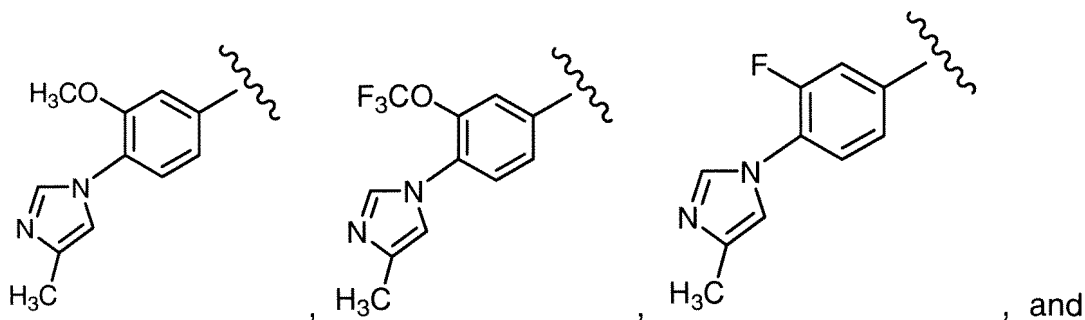
からなる群から選択される 2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P および 5 P からなる群から選択される。

40

【 1 0 5 3】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 2 2】



【 1 0 5 4】

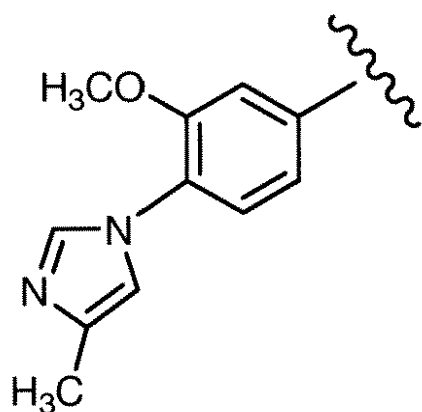
(R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、 R^7 は置換されたフェニル (例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えば p - F - フェニルなど) である。) からなる群から選択される 2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P および 5 P からなる群から選択される。

30

【 1 0 5 5】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化 1 2 3】



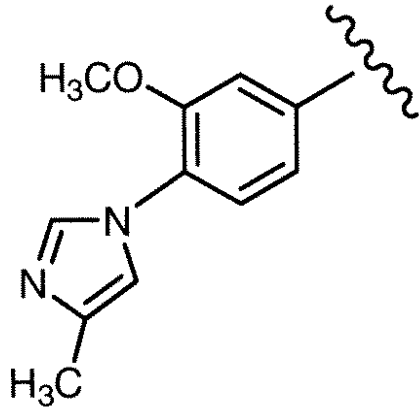
【 1 0 5 6】

からなる群から選択される 2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L H、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P および 5 P からなる群から選択される。

【1057】

本発明の別の実施形態において、式 (I) の化合物は、 $-R^{10} - R^9$ 部分が

【化124】



10

20

【1058】

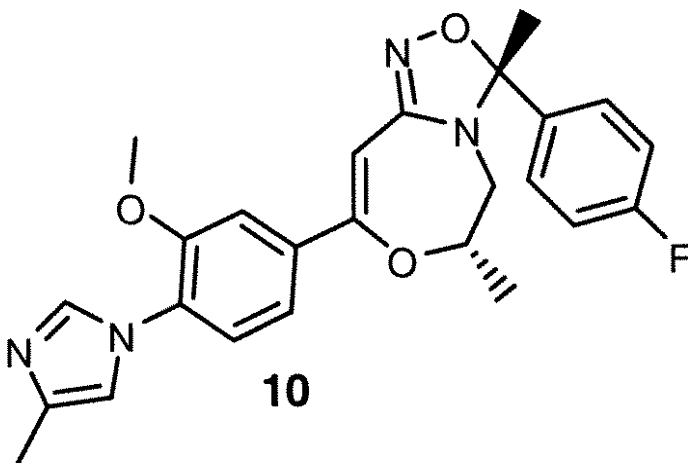
(R^6 はアルキル (例えば、メチル) であり、 R^7 は置換されたフェニル (例えば、フルオロ置換されたフェニル、例えば p-F-フェニルなど) である。) からなる群から選択される 2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L H、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P および 5 P からなる群から選択される。

【1059】

本発明の代表的化合物は、

30

【化125】



40

【1060】

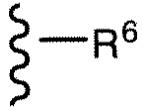
である。

【1061】

従って、化合物 2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、

50

5 D、6 D、7 Dおよび8 Dに関する上記の実施形態において、
【化126】



【1062】
は、下記の立体化学：
【化127】



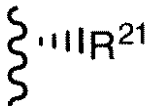
10

【1063】
を有することができる。

【1064】
さらに、化合物2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 Cおよび8 Cに関する上記の実施形態において、環B上のR²¹基は、下記の立体化学：

20

【化128】

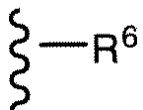


【1065】
を有することができる。

【1066】
さらに、化合物2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 Pおよび5 Pに関する上記の実施形態において、

30

【化129】



40

【1067】
は、下記の立体化学：
【化130】



【1068】

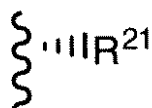
50

を有することができる。

【1069】

さらに、化合物 2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O および 5 O に関する上記の実施形態において、環 B 上の R^{21} 基は、下記の立体化学：

【化131】



10

【1070】

を有することができる。

【1071】

本発明の別の実施形態において、 R^{21} はアルキル、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ および 1 から 5 個の独立に選択される R^{22} 基（例えば、F、Cl および Br などのハロゲン）で置換されたアルキルからなる群から選択される。

【1072】

本発明の別の実施形態において、 R^{21} はアルキル、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{15}R^{16}$ および 1 から 5 個の独立に選択される R^{22} 基で置換されたアルキル（例えば、F、Cl および Br などのハロゲンであり、1 例では R^{21} 基で置換されたアルキルは $-CF_3$ である。）からなる群から選択され、 R^{15} および R^{16} は H、アルキル、 $(R^{18})_n$ -アリールアルキル（例えば、n は 1 であり、 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、 R^{20} はアルキル（例えば、メチル）である。）、シクロアルキル（例えば、シクロブチル）および $(R^{18})_n$ -アルキル（例えば、n は 1 であり、 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、 R^{20} はアルキル（例えば、メチル）である。）からなる群から独立に選択される。

20

【1073】

本発明の別の実施形態において、 R^{21} は、(a) アルキル、 $-OR^{15}$ (R^{15} はアルキル、例えばメチルおよびエチルである。)、(b) $-C(O)OR^{15}$ (R^{15} はアルキル、例えばメチルである。)、(c) $-C(O)NR^{15}R^{16}$ (R^{15} および R^{16} は、H、アルキル、 $(R^{18})_n$ -アリールアルキル（例えば、n は 1 であり、 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、 R^{20} はアルキル（例えば、メチル）である。）、シクロアルキル（例えば、シクロブチル）および $(R^{18})_n$ -アルキル（例えば、n は 1 であり、 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、 R^{20} はアルキル（例えば、メチル）である。）からなる群から独立に選択され、1 例では、 R^{15} および R^{16} のうちの一つのみが H である。）および (d) 1 から 5 個の独立に選択される R^{22} 基で置換されたアルキル（例えば、F、Cl および Br などのハロゲンであり、1 例では R^{21} 基で置換されたアルキルは $-CF_3$ である。）からなる群から選択される。

30

40

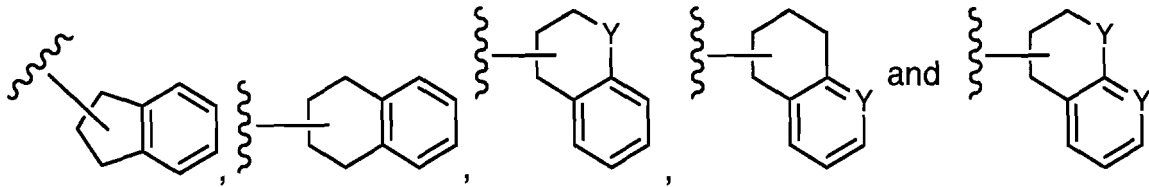
【1074】

本発明の他の実施形態は、 R^{1A} がベンゾ縮合シクロアルキル（すなわち、縮合ベンゾシクロアルキル）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、前記 R^{1A} 基が 1 から 5 個の独立に選択される R^{21} 基で置換されていても良い式 (I) の化合物に関するものである。1 例において、 R^{21} 基はハロゲン（例えば、F）である。

【1075】

縮合環 R^6 または R^7 基の例には、

【化132】

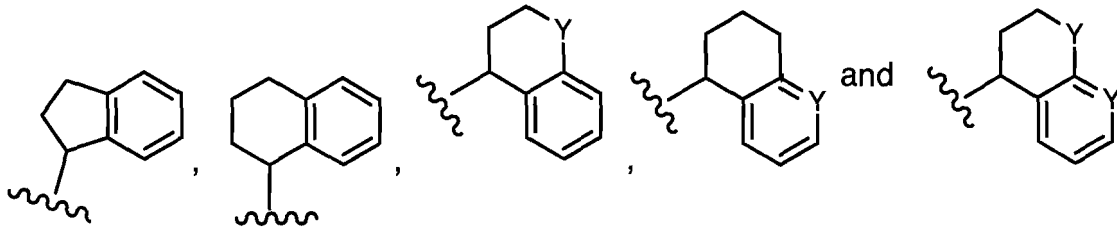


【1076】

などがあるが、これらに限定されるものではなく、各Yは - O - 、 - NR¹⁴ - および - C(R²¹)_q - (qは0、1または2であり、各R²¹は独立に選択される。) からなる群から独立に選択され、R¹⁴およびR²¹は式(I)について定義の通りである。これらの縮合環R⁶またはR⁷基の例には、例えば

10

【化133】



【1077】

などがある。

20

【1078】

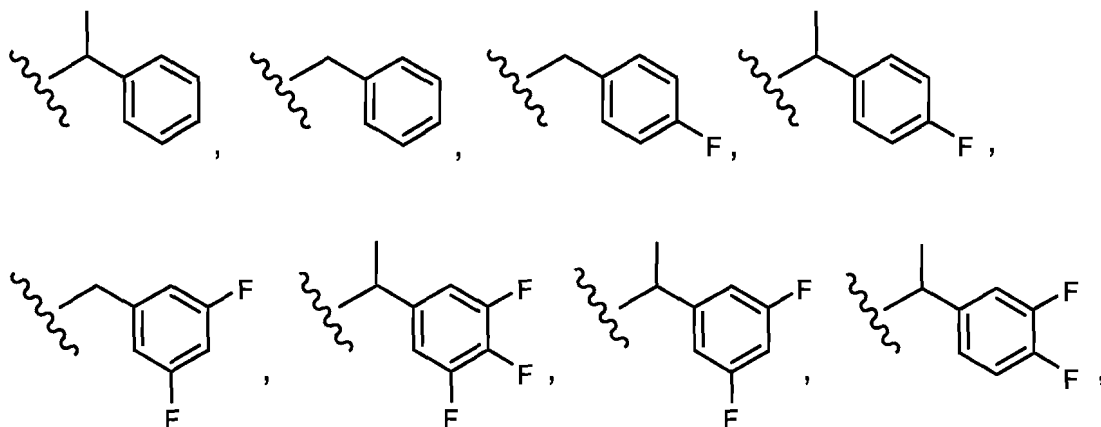
式(I)の化合物は、R⁶またはR⁷が1個のR²¹基で置換されたアルキル基(例えば、メチルまたはエチル)である化合物をも含む。そのような基の例には、R²¹部分アリール(例えば、フェニルまたはナフチル)で置換されたアルキル(例えば、メチルまたはエチル)などがある。前記R⁶またはR⁷基の例には、R²¹部分アリール(例えば、フェニルまたはナフチル)で置換されたアルキル(例えば、メチルまたはエチル)もあり、その部分は1以上の(例えば、1個もしくは2個)独立に選択されるR²²基(例えば、R²²はFなどのハロゲンである。)で置換されている。

30

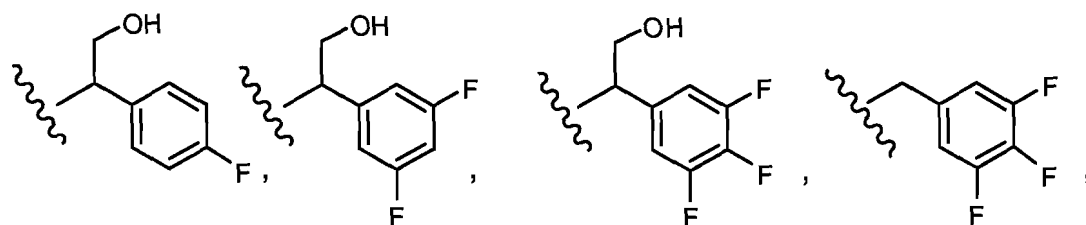
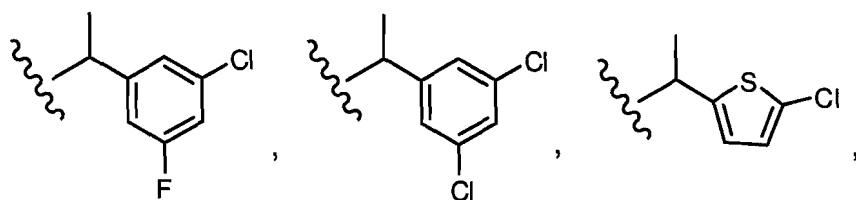
【1079】

置換されたR⁶またはR⁷アルキル基の例には、

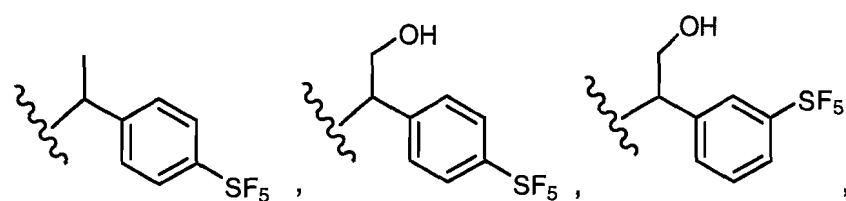
【化134】



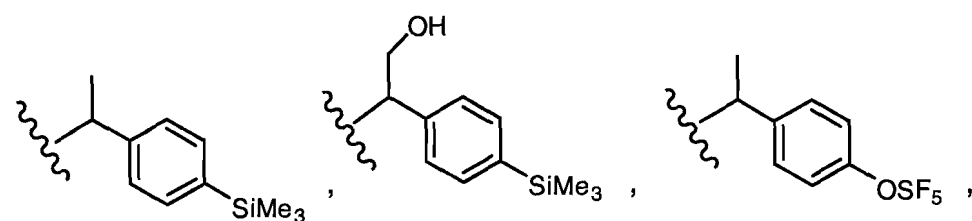
40



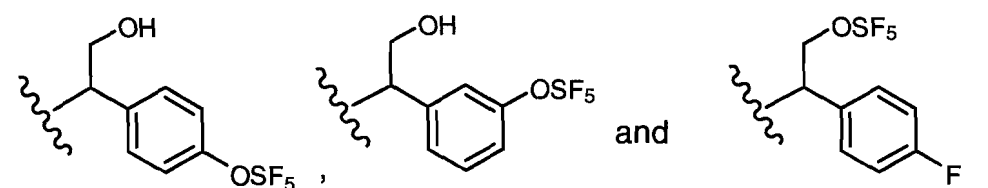
10



20



30



40

【1080】

などがあるが、これらに限定されるものではない。

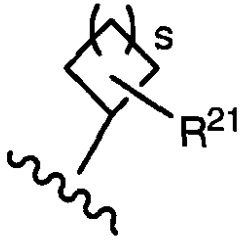
【1081】

本発明の他の実施形態は、 R^6 または R^7 が 1 個の R^{21} 基（例えばフェニルなどのアリール）で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロプロピルまたはシクロブチル）または 1 以上の（例えば、1 または 2 個）独立に選択される R^{22} 基（例えば F などのハロゲン）で置換されている 1 個の R^{21} 基（例えばフェニルなどのアリール）で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロペンチルまたはシクロヘキシル）である式（I）の化合物に関するものである。1 例において、前記 R^{21} 基は、 R^6 または R^7 基を分子の残りの部分に結合させている R^6 または R^7 基の同一酸素に結合している。

【1082】

シクロアルキル R^6 または R^7 基の例には、

【化 1 3 5】

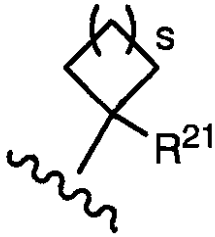


【 1 0 8 3】

10

などがあるが、これらに限定されるものではなく、例えば

【化 1 3 6】

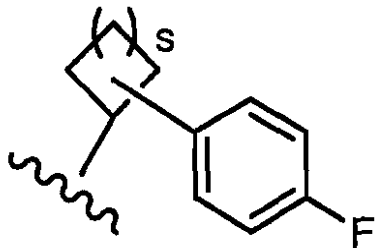


20

【 1 0 8 4】

などがあり、s は 0 (すなわち、環はシクロプロピルである。) または 1 (すなわち、環はシクロブチル) である。これら R⁶ または R⁷ 基の例には、

【化 1 3 7】

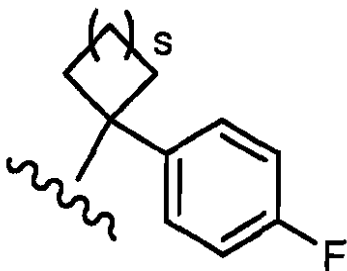


30

【 1 0 8 5】

などがあるが、これに限定されるものではなく、例えば

【化 1 3 8】



40

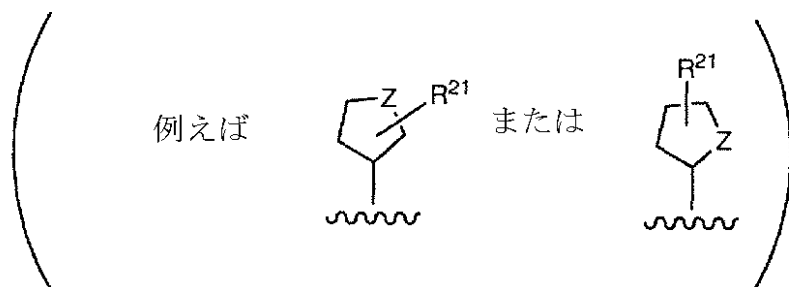
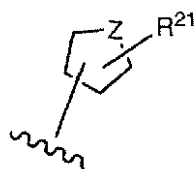
【 1 0 8 6】

などがあり、s は 0 (すなわち、環はシクロプロピルである) または 1 (すなわち、環はシクロブチルである。) である。

【 1 0 8 7】

本発明の他の実施形態は、R⁶ または R⁷ が

【化139】



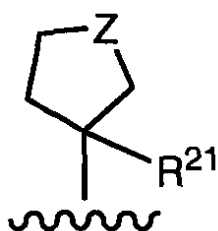
10

【1088】

であり、Zが(1) - O -、(2) - NR¹⁴ -、(3) - C(R²¹)_q - (qは0、1または2であり、各R²¹は独立に選択される。)、(4) - C(R²¹)_q - C(R²¹)_q - (各qは独立に0、1または2であり、各R²¹は独立に選択される。)、(5) - (C(R²¹)_q)_q - O - (C(R²¹)_q)_q - (各qは独立に0、1または2であり、各R²¹は独立に選択される。)および(6) - (C(R²¹)_q)_q - N(R¹⁴) - (C(R²¹)_q)_q - (各qは独立に0、1または2であり、各R²¹は独立に選択される。)からなる群から選択される式(I)の化合物に関するものである。R²¹の例には、アリール(例えば、フェニル)および1以上の(例えば、1もしくは2個または1個)独立に選択されるR²²基(例えばFなどのハロゲン)で置換されたアリール(例えば、フェニル)などがあるが、これらに限定されるものではない。このR⁶またはR⁷の例には

20

【化140】



30

【1089】

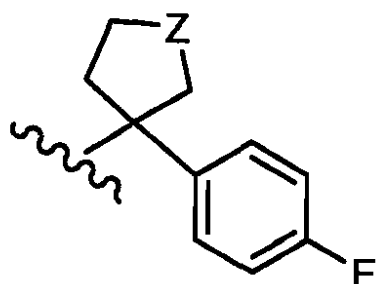
などがあるが、これらに限定されるものではない。

【1090】

従って、このR⁶またはR⁷基の例には、

40

【化141】



【1091】

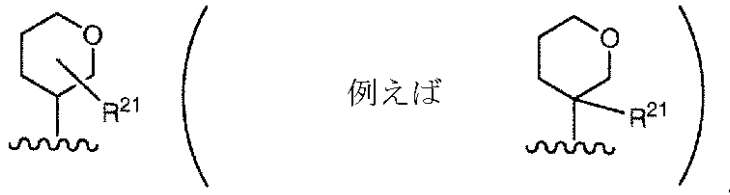
50

などがあるが、これらに限定されるものではない。

【1092】

R⁶ または R⁷ 基の例には、

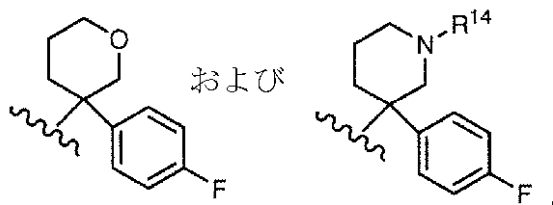
【化142】



10



20



【1093】

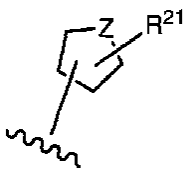
などもあるが、これらに限定されるものではない。

【1094】

R⁶ または R⁷ 基：

30

【化143】



【1095】

の例には、

【化144】

40



【1096】

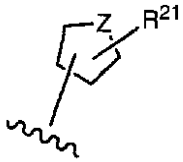
などもあるが、これらに限定されるものではない。

【1097】

R⁶ または R⁷ 基：

50

【化145】



【1098】

の例には、

【化146】



10

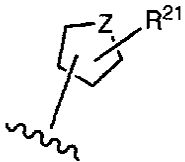
【1099】

などもあるが、これらに限定されるものではない。

【1100】

R⁶ または R⁷ 基：

【化147】

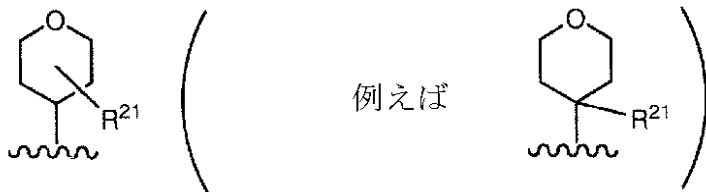


20

【1101】

の例には、

【化148】



30

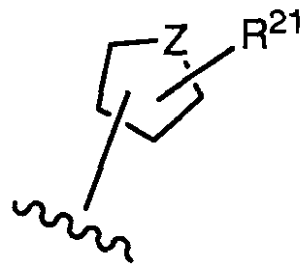
【1102】

などもあるが、これらに限定されるものではない。

【1103】

R⁶ または R⁷ 基：

【化149】



40

【1104】

の例には、

【化150】



【1105】

などもあるが、これらに限定されるものではない。

【1106】

10

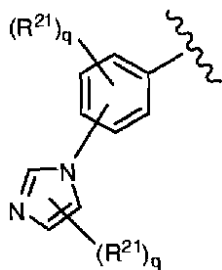
本発明の他の実施形態は、 R^{10} がアリール（例えば、フェニル）または1以上の（例えば、1もしくは2個または1個） R^{21} 基（例えば、 $-OR^{15}$ 、例えば R^{15} は例えばメチルなどのアルキルである。）で置換されたアリール（例えば、フェニル）であり、 R^9 がヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）またはヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）で置換された1以上の（例えば、1もしくは2個または1個） R^{21} 基（例えばメチルなどのアルキル）である式（I）の化合物に関するものである。

【1107】

従って、本発明の化合物の $-R^{10}-R^9$ 部分の例には、

【化151】

20

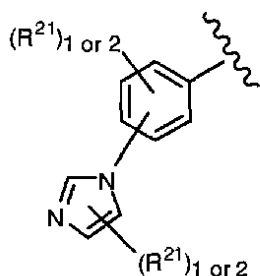


【1108】

（ q は 0、1 または 2 である。）などがあるが、これに限定されるものではなく、例えば

30

【化152】

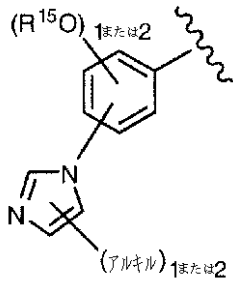


【1109】

40

であり、例えば：

【化 1 5 3】

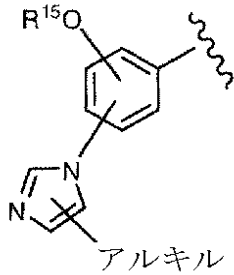


10

【 1 1 1 0】

(R ^{1 5} はアルキル (例えばメチル) である。) であり、例えば :

【化 1 5 4】

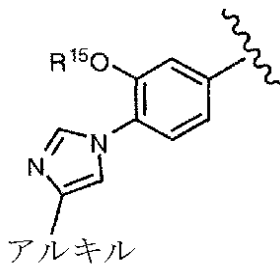


20

【 1 1 1 1】

(R ^{1 5} はアルキル (例えばメチル) である。) であり、例えば :

【化 1 5 5】

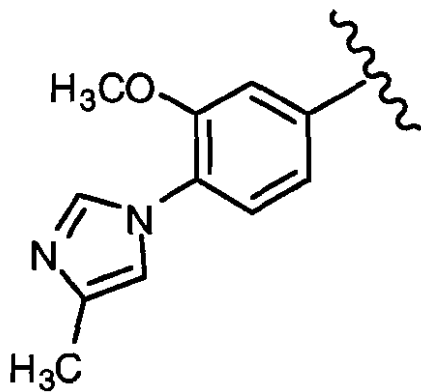


30

【 1 1 1 2】

(R ^{1 5} はアルキル (例えばメチル) である。) であり、例えば :

【化 1 5 6】



40

【 1 1 1 3】

である。

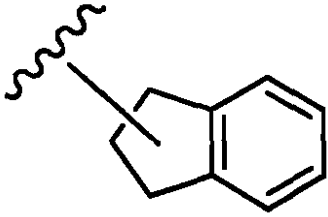
【 1 1 1 4】

50

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 はベンゾ縮合シクロアルキルである。

【 1 1 1 5 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化 1 5 7】



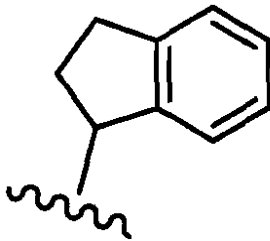
10

【 1 1 1 6 】

である。

【 1 1 1 7 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化 1 5 8】



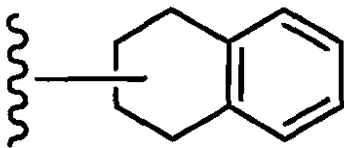
20

【 1 1 1 8 】

である。

【 1 1 1 9 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化 1 5 9】



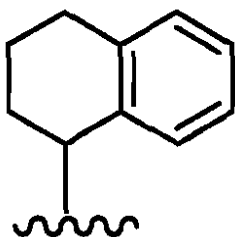
30

【 1 1 2 0 】

である。

【 1 1 2 1 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化 1 6 0】



40

【 1 1 2 2 】

である。

【 1 1 2 3 】

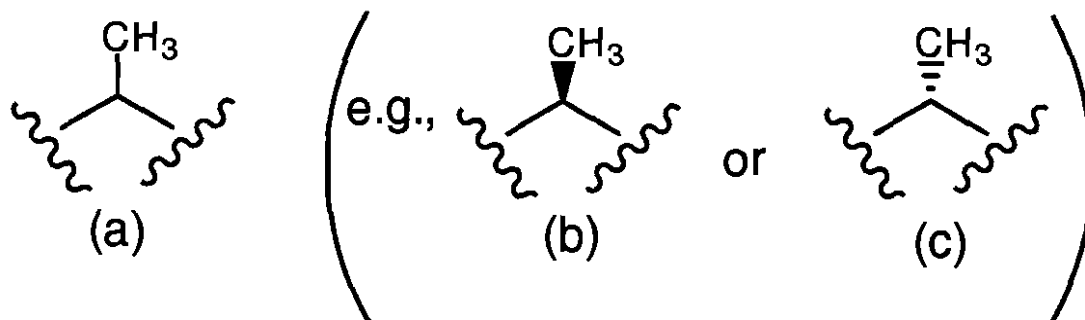
50

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルである。

【1124】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記アルキルは

【化161】



10

【1125】

である。

【1126】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は 1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキル (例えば上記で記載の (a)、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールである。

20

【1127】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は 1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキル (例えば上記で記載の (a)、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基はフェニルである。

【1128】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は 1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキル (例えば上記で記載の (a)、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基はナフチルである。

30

【1129】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【1130】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基は 1 個の $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【1131】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されている。

40

【1132】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 1 個の $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【1133】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【1134】

50

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【 1 1 3 5 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 1 個の $R^{2,2}$ 基で置換されている。

【 1 1 3 6 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されており、各 $R^{2,2}$ はハロゲンである。

【 1 1 3 7 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 1 個の $R^{2,2}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,2}$ はハロゲンである。

【 1 1 3 8 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 2 個の独立に選択される $R^{2,2}$ 基で置換されており、各 $R^{2,2}$ は F である。

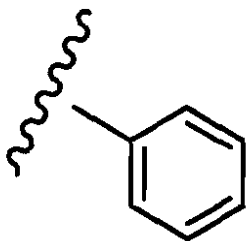
【 1 1 3 9 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は、1 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたアルキルであり、前記 $R^{2,1}$ 基はアリールであり、前記アルキル基は上記で記載の (a) (例えば、(b) または (c)) であり、前記 $R^{2,1}$ 基は 1 個の $R^{2,2}$ 基で置換されており、前記 $R^{2,2}$ は F である。

【 1 1 4 0 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【 化 1 6 2 】



【 1 1 4 1 】

である。

【 1 1 4 2 】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

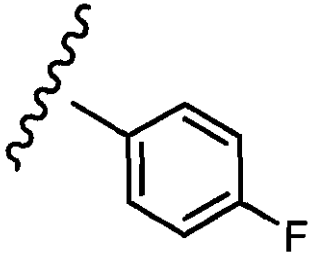
10

20

30

40

【化 1 6 3】



【 1 1 4 3】

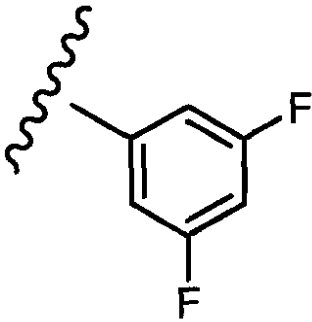
10

である。

【 1 1 4 4】

前記式 (I) の化合物の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 6 4】



20

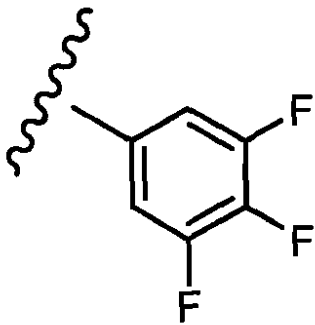
【 1 1 4 5】

である。

【 1 1 4 6】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 6 5】



30

【 1 1 4 7】

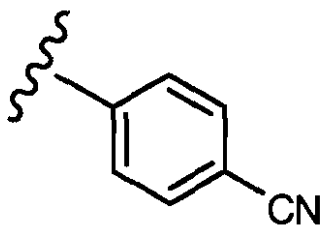
である。

40

【 1 1 4 8】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 6 6】



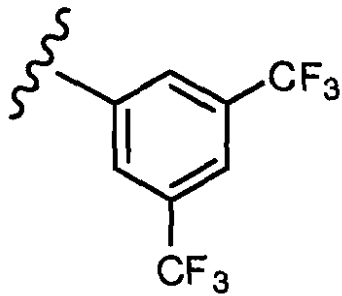
50

【1149】

である。

【1150】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化167】



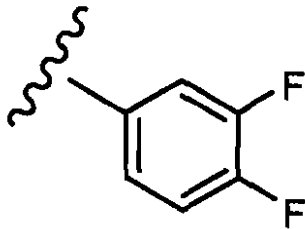
10

【1151】

である。

【1152】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化168】



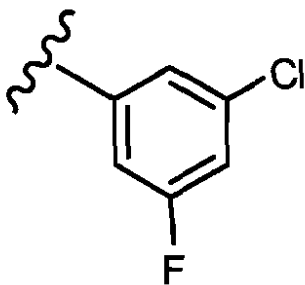
20

【1153】

である。

【1154】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は
【化169】



30

【1155】

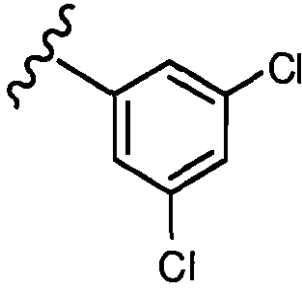
である。

【1156】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

40

【化 1 7 0】



10

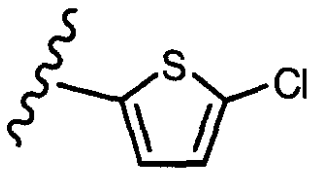
【 1 1 5 7 】

である。

【 1 1 5 8 】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 7 1】



20

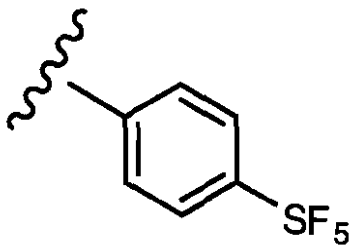
【 1 1 5 9 】

である。

【 1 1 6 0 】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 7 2】



30

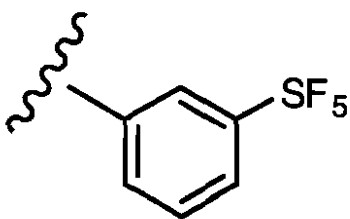
【 1 1 6 1 】

である。

【 1 1 6 2 】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化 1 7 3】



40

【 1 1 6 3 】

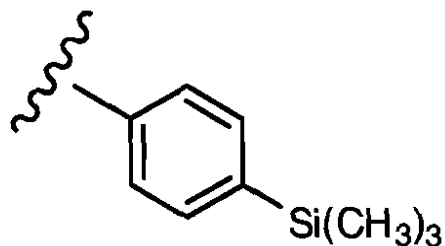
である。

【 1 1 6 4 】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

50

【化174】



【1165】

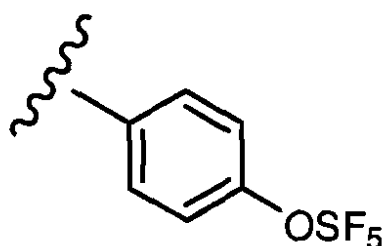
10

である。

【1166】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化175】



20

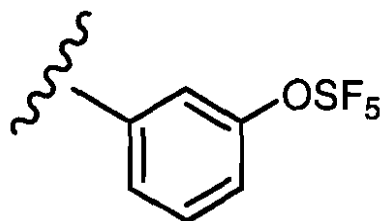
【1167】

である。

【1168】

本発明の別の実施形態において、 R^6 または R^7 は

【化176】



30

【1169】

である。

【1170】

R^{21} 基の例には、 $-OR^{15}$ などがあり、例えば R^{15} はアルキル（メチルまたはエチルなど）であるか、 R^{15} はシクロアルキルアルキル（例えば $-CH_2-$ シクロプロピルなど）であるか、 R^{15} は $-アルキル-(R^{18})_n$ （例えば、前記 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、前記 R^{20} はアルキルであり、前記 $-アルキル-(R^{18})_n$ 部分の例には $-(CH_2)_2OCH_3$ がある。）である。

40

【1171】

本発明の実施形態における R^{21} 部分の例には、(a) $-OR^{15}$ 、(b) $-OR^{15}$ (R^{15} はアルキルである。)、(c) $-OR^{15}$ (R^{15} はアルキルであり、前記アルキルはメチルまたはエチルである。)、(d) $-OR^{15}$ (R^{15} はシクロアルキルアルキルである。)、(e) $-OR^{15}$ (R^{15} は $-アルキル-(R^{18})_n$ である。)、(f) $-OR^{15}$ (R^{15} は $-アルキル-(R^{18})_n$ であり、前記 R^{18} は $-OR^{20}$ である。)、(g) $-OR^{15}$ (R^{15} は $-アルキル-(R^{18})_n$ であり、前記 R^{18} は $-OR^{20}$ であり、前記 R^{20} はアルキルである。) などがあるが、これらに限定される

50

ものではない。

【1172】

R^{2 1}部分の例には、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-O(CH₂)₂OCH₃および-CH₂-シクロプロピルなどがあるが、これらに限定されるものではない。

【1173】

R^{2 1}の例には、-C(O)OR^{1 5}もあり、例えばR^{1 5}はアルキル(例えばメチルなど)である。

【1174】

R^{2 1}の例には、-C(O)NR^{1 5}R^{1 6}もあり、例えば、R^{1 5}またはR^{1 6}のうちの一つがHであり、他方は(R^{1 8})_n-アリールアルキル-、(R^{1 8})_n-アルキル-およびシクロアルキルからなる群から選択される。この-C(O)NR^{1 5}R^{1 6}部分の1例において、R^{1 8}は-OR^{2 0}であり、nは1であり、R^{2 0}はアルキルであり、前記シクロアルキルはシクロブチルであり、前記アリールアルキル-はベンジルである。

10

【1175】

R^{2 1}の例には、ハロ(例えば、Br、ClまたはF)もある。

【1176】

R^{2 1}の例には、例えばベンジルなどのアリールアルキルもある。

【1177】

下記の実施形態において、群A、BおよびCは、

20

(1) 群A: 2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8D、2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4P、5Pならびに化合物9および15から26;

(2) 群B: 2A、3A、4A、5A、6A、7A、8A、2B、3B、4B、5B、6B、7B、8B、2C、3C、4C、5C、6C、7C、8C、2D、3D、4D、5D、6D、7D、8Dならびに化合物9および15から26;

30

(3) 群C: 2E、3E、4E、5E、2F、3F、4F、5F、2G、3G、4G、5G、2H、3H、4H、5H、2I、3I、4I、5I、2J、3J、4J、5J、2K、3K、4K、5K、2L、3L、4LH、5L、2M、3M、4M、5M、2N、3N、4N、5N、2O、3O、4O、5O、2P、3P、4Pおよび5P

と定義される。

【1178】

本発明の1実施形態は、式(I)の化合物に関するものである。

【1179】

本発明の別の実施形態は、式(I)の化合物の製薬上許容される塩に関するものである。1例では前記塩は、群Aからなる群から選択される化合物の塩である。別の例では前記塩は、群Bからなる群から選択される化合物の塩である。別の例では前記塩は、群Cからなる群から選択される化合物の塩である。別の例では前記塩は、群Bからなる群から選択される化合物の塩である。別の例では前記塩は、化合物9および15から16からなる群から選択される化合物の塩である。

40

【1180】

本発明の別の実施形態は、式(I)の化合物の製薬上許容されるエステルに関するものである。1例では前記エステルは、群Aからなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では前記エステルは、群Bからなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では前記エステルは、群Cからなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では前記エステルは、群Bからなる群から選択される化合物のエステルである。別

50

の例では前記エステルは、化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される化合物のエステルである。

【1181】

本発明の別の実施形態は、式 (I) の化合物の溶媒和物に関するものである。1 例では前記溶媒和物は、群 A からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では前記溶媒和物は、群 B からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では前記溶媒和物は、群 C からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では前記溶媒和物は、群 B からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では前記溶媒和物は、化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。

10

【1182】

本発明の別の実施形態は、純粋な単離された形態での式 (I) の化合物に関するものである。1 例では、前記式 (I) の化合物は化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される。

【1183】

本発明の別の実施形態は、純粋な形態での式 (I) の化合物に関するものである。1 例では、前記式 (I) の化合物は化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される。

【1184】

本発明の別の実施形態は、単離された形態での式 (I) の化合物に関するものである。1 例では、前記式 (I) の化合物は、化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される。

20

【1185】

本発明の別の実施形態は、化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される式 (I) の化合物に関するものである。

【1186】

本発明の別の実施形態は、式 (I) の化合物の製薬上許容される塩であって、前記化合物が化合物 9 および 15 から 16 からなる群から選択される塩に関するものである。

【1187】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 9 である式 (I) の化合物に関するものである。

30

【1188】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 15 である式 (I) の化合物に関するものである。

【1189】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 16 である式 (I) の化合物に関するものである。

【1190】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 17 である式 (I) の化合物に関するものである。

【1191】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 18 である式 (I) の化合物に関するものである。

40

【1192】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 20 である式 (I) の化合物に関するものである。

【1193】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 21 である式 (I) の化合物に関するものである。

【1194】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 22 である式 (I) の化合物に関するものである。

50

のである。

【 1 1 9 5 】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 2 3 である式 (I) の化合物に関するものである。

【 1 1 9 6 】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 2 4 である式 (I) の化合物に関するものである。

【 1 1 9 7 】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 2 5 である式 (I) の化合物に関するものである。

10

【 1 1 9 8 】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が化合物 2 6 である式 (I) の化合物に関するものである。

【 1 1 9 9 】

本発明の別の実施形態は、化合物 9 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 0 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 5 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 1 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 6 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 2 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 7 の製薬上許容される塩に関するものである。

20

【 1 2 0 3 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 8 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 4 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 0 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 5 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 1 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 6 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 2 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 7 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 3 の製薬上許容される塩に関するものである。

30

【 1 2 0 8 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 4 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 0 9 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 5 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 1 0 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 6 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 1 1 】

本発明の別の実施形態は、化合物 9 の製薬上許容されるエステルに関するものである。

【 1 2 1 2 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 5 の製薬上許容されるエステルに関するものである。

40

。

【 1 2 1 3 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 6 の製薬上許容されるエステルに関するものである。

。

【 1 2 1 4 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 7 の製薬上許容されるエステルに関するものである。

。

【 1 2 1 5 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 8 の製薬上許容されるエステルに関するものである。

50

。

【 1 2 1 6 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 0 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 1 7 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 1 の製薬上許容される塩に関するものである。

【 1 2 1 8 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 2 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 1 9 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 3 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 2 0 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 4 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 2 1 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 5 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 2 2 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 6 の製薬上許容されるエステルに関するものである

。

【 1 2 2 3 】

本発明の別の実施形態は、化合物 9 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 4 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 5 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 5 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 6 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 6 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 7 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 7 】

本発明の別の実施形態は、化合物 1 8 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 8 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 0 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 2 9 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 1 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 0 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 2 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 1 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 3 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 2 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 4 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 3 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 5 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 4 】

本発明の別の実施形態は、化合物 2 6 の溶媒和物に関するものである。

【 1 2 3 5 】

本発明の別の実施形態は、治療上有効量の式 (I) の化合物またはその製薬上許容される塩、溶媒和物もしくはエステルおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 3 6 】

10

20

30

40

50

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1237】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物の製薬上許容される塩および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1238】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物の製薬上許容されるエステルおよび製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1239】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物の溶媒和物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

10

【1240】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物および有効量の1以上（例えば、1）の他の医薬有効成分（例えば、薬剤）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。他の医薬有効成分の例として、（a）アルツハイマー病の治療に有用な薬剤、（b）神経組織（例えば、脳）の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドタンパク質）の沈着を阻害するのに有用な薬剤、（c）神経変性疾患の治療に有用な薬剤、および（d） β -セクレターゼを阻害するのに有用な薬剤からなる群から選択される薬剤などがあるが、これらに限定されるものではない。

20

【1241】

本発明の別の実施形態は、治療上有効量の式（I）の化合物またはその製薬上許容される塩、溶媒和物もしくはエステルおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体および治療上有効量のコリンエステラーゼ阻害薬、A 抗体阻害薬、 β -セクレターゼ阻害薬および β -セクレターゼ阻害薬からなる群から選択される1以上の化合物を含む医薬組成物に関するものである。

【1242】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物および有効量の1以上のBACE阻害薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

30

【1243】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物および有効量の1以上のコリンエステラーゼ阻害薬（例えば、アセチル-および/またはブチリルコリンエステラーゼ阻害薬）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1244】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物および有効量の1以上のムスカリン性拮抗薬（例えば、 m_1 または m_2 拮抗薬）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1245】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式Iの化合物および有効量のエクセロン（リバステイグミン）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

40

【1246】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式Iの化合物および有効量のコグネックス（タクリン）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【1247】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式Iの化合物および有効量のタウキナーゼ阻害薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである

50

。

【 1 2 4 8 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のタウキナーゼ阻害薬（例えば、G S K 3 阻害薬、c d k 阻害薬、E R K 阻害薬）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 4 9 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の一つの抗 A ワクチン（能動免疫）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 0 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の A P P リガンドおよび製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

10

【 1 2 5 1 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のインスリン分解酵素を上昇させる薬剤および / またはネプリライシンおよび製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 2 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のコレステロール降下薬（例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチンなどのスタチン類、およびエゼチミブなどのコレステロール吸収阻害剤）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

20

【 1 2 5 3 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のフィブラート類（例えば、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、アルミニウムクロフィブラート）および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 4 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の L X R 作動薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

30

【 1 2 5 5 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の L R P 模倣薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 6 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の 5 - H T 6 受容体拮抗薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

40

【 1 2 5 7 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のニコチン性受容体作動薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 8 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の H 3 受容体拮抗薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 5 9 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量

50

の 1 以上のヒストンデアセチラーゼ阻害薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 0 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の h s p 9 0 阻害薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 1 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の m 1 ムスカリン性受容体作動薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

10

【 1 2 6 2 】

本発明の別の実施形態は、組み合わせ、すなわち、製薬上許容される担体、有効（すなわち、治療上有効）量のコリンエステラーゼ阻害薬（例えば、(±) - 2, 3 - ジヒドロ - 5, 6 - ジメトキシ - 2 - [[1 - (フェニルメチル) - 4 - ピペリジニル] メチル] - 1 H - インデン - 1 - オン塩酸塩、すなわち、アリセプト（登録商標）の商品名のドネペジル塩酸塩として入手可能なドネペジル塩酸塩など）、A 抗体阻害薬、 - セクレターゼ阻害薬および - セクレターゼ阻害薬からなる群から選択される 1 以上の化合物と組み合わせた有効（すなわち、治療上有効）量の 1 以上の式 (I) の化合物を含む医薬組成物に関するものである。

20

【 1 2 6 3 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の 5 - H T 6 受容体拮抗薬 m G l u R 1 または m G l u R 5 陽性アロステリック調節剤または作動薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 4 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の一つの m G l u R 2 / 3 拮抗薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 5 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の神経炎症を軽減することができる抗炎症剤および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

30

【 1 2 6 6 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のプロスタグランジン E P 2 受容体拮抗薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 7 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上の P A I - 1 阻害薬および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

【 1 2 6 8 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式 I の化合物および有効量の 1 以上のゲルソリンなどの A 流出を誘発することができる薬剤および製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものである。

40

【 1 2 6 9 】

本発明の他の実施形態は、前記式 (I) の化合物が群 A からなる群から選択される医薬組成物に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 2 7 0 】

本発明の他の実施形態は、前記式 (I) の化合物が群 B からなる群から選択される医薬組成物に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 2 7 1 】

50

本発明の他の実施形態は、前記式（I）の化合物が群Cからなる群から選択される医薬組成物に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【1272】

本発明の他の実施形態は、前記式（I）の化合物が化合物9および15から25からなる群から選択される医薬組成物に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【1273】

式（I）の化合物は、 α -セクレターゼ調節剤として有用であることができ、例えば、中枢神経系障害（アルツハイマー病およびダウン症候群など）、軽度認知障害、緑内障、脳アミロイド血管症、卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症および嗅覚機能喪失などの疾患の治療および予防に有用であることができる。

10

【1274】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して治療上有効量の少なくとも一つの式（I）の化合物を投与する段階を有する中枢神経系障害の治療方法に関するものである。

【1275】

本発明の別の実施形態は、治療上有効量の少なくとも一つの式（I）の化合物またはその製薬上許容される塩、溶媒和物もしくはエステルおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体を含む治療上有効量の医薬組成物を投与する段階を有する中枢神経系障害の治療方法に関するものである。

20

【1276】

本発明の別の実施形態は、治療上有効量の式（I）の化合物またはその製薬上許容される塩、溶媒和物もしくはエステルおよび少なくとも一つの製薬上許容される担体および治療上有効量のコリンエステラーゼ阻害薬、A 抗体阻害薬、 α -セクレターゼ阻害薬および β -セクレターゼ阻害薬からなる群から選択される1以上の化合物を含む治療上有効量の医薬組成物を投与する段階を有する中枢神経系障害の治療方法に関するものである。

【1277】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、 α -セクレターゼを調節（阻害および拮抗など）する方法に関するものである。

30

【1278】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の式（I）の化合物を投与する段階を有する、 α -セクレターゼを調節する（阻害する、拮抗するなど）方法に関するものである。

【1279】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、1以上の神経変性疾患を治療する方法に関するものである。

【1280】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の式（I）の化合物を投与する段階を有する、1以上の神経変性疾患を治療する方法に関するものである。

40

【1281】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、神経組織（例えば、脳）の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドタンパク質）の沈着を阻害する方法に関するものである。

【1282】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の式（I）の化合物を投与する段階を有する、神経組織（例えば、脳）の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドタンパク質）の沈着を阻害する方法に関するものである。

50

【 1 2 8 3 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 2 8 4 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の式（I）の化合物を投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 2 8 5 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効（すなわち、治療上有効）量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、軽度認識障害、緑内障、脳アミロイド血管症、卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症または嗅覚機能喪失の治療方法に関するものである。

10

【 1 2 8 6 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効（すなわち、治療上有効）量の式（I）の化合物を投与する段階を有する、軽度認識障害、緑内障、脳アミロイド血管症、卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症または嗅覚機能喪失の治療方法に関するものである。

【 1 2 8 7 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、軽度認識障害の治療方法に関するものである。

20

【 1 2 8 8 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、緑内障の治療方法に関するものである。

【 1 2 8 9 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、脳アミロイド血管症の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 0 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、卒中の治療方法に関するものである。

30

【 1 2 9 1 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、認知症の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 2 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する小膠細胞症の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 3 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する脳の炎症の治療方法に関するものである。

40

【 1 2 9 4 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、嗅覚機能喪失の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 5 】

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を投与する段階を有する、ダウン症候群の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 6 】

50

本発明の別の実施形態は、処置を必要とする患者に対して有効量の式 (I) の化合物を投与する段階を有する、ダウン症候群の治療方法に関するものである。

【 1 2 9 7 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 A からなる群から選択される治療方法に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 2 9 8 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 B からなる群から選択される治療方法に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 2 9 9 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 C からなる群から選択される治療方法に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

10

【 1 3 0 0 】

本発明の他の実施形態は、前記式 (I) の化合物が化合物 9 および 1 5 から 2 5 からなる群から選択される治療方法に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 3 0 1 】

本発明は、(1) - セクレターゼを調節する、または (2) 1 以上の神経変性疾患を治療する、または (3) 神経組織 (例えば、脳) の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質 (例えば、アミロイドタンパク質) の沈着を阻害する、または (4) アルツハイマー病を治療するための併用療法も提供する。その併用療法は、有効量の 1 以上 (例えば、1) の式 (I) の化合物の投与、および有効量の 1 以上 (例えば、1) の他の医薬有効成分 (例えば、薬剤) を投与する段階を含む方法に関するものである。式 (I) の化合物および他の薬剤は、別個に投与することができるか (すなわち、それぞれが、それ自体別の製剤である) 、または式 (I) の化合物を他の薬剤と同じ製剤に組み合わせることができる。

20

【 1 3 0 2 】

したがって、本発明の他の実施形態は、有効量の式 (I) の化合物が、有効量の 1 以上の他の医薬有効成分 (例えば、薬剤) と組み合わせて使用される、本明細書に記載されている治療方法または阻害方法のいずれかに関するものである。他の医薬有効成分 (すなわち、薬剤) は、B A C E 阻害剤 (- セクレターゼ阻害剤) ; ムスカリン拮抗薬 (例えば、 m_1 作動薬または m_2 拮抗薬) ; コリンエステラーゼ阻害剤 (例えば、アセチル - および / またはブチリルコリンエステラーゼ阻害剤) ; - セクレターゼ阻害剤 ; - セクレターゼ調節剤 ; H M G - C o A 還元酵素阻害剤 ; 非ステロイド性抗炎症剤 ; N - メチル - D - アスパラギン酸受容体拮抗薬 ; 抗アミロイド抗体 ; ビタミン E ; ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬 ; C B 1 受容体逆作動薬または C B 1 受容体拮抗薬 ; 抗生物質 ; 成長ホルモン分泌促進物質 ; ヒスタミン H 3 拮抗薬 ; A M P A 作動薬 ; P D E 4 阻害剤 ; G A B A_A 逆作動薬 ; アミロイド凝集の阻害剤 ; グリコーゲン合成酵素キナーゼ阻害剤 ; - セクレターゼ活性の促進剤 ; P D E - 1 0 阻害剤 ; E x e l o n (リバステグミン) ; C o g n e x (タクリン) ; タウキナーゼ阻害剤 (例えば、G S K 3 阻害剤、c d k 5 阻害剤または E R K 阻害剤) ; 抗 A ワクチン ; A P P リガンド ; インスリンを上昇させる薬剤、コレステロール低下薬 (例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチンなどのスタチン) ; コレステロール吸収阻害剤 (エゼチミブなど) ; フィブラート系薬剤 (例えば、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラートおよびアルミニウムクロフィブラートなど) ; L X R 作動薬 ; L R P 模倣剤 ; ニコチン性受容体作動薬 ; H 3 受容体拮抗薬 ; ヒストンデアセチラーゼ阻害剤 ; h s p 9 0 阻害剤 ; m_1 ムスカリン性受容体作動薬 ; 5 - H T 6 受容体拮抗薬 ; m G l u R 1 ; m G l u R 5 ; ポジティブアロステリック調節剤または作動薬 ; m G l u R 2 / 3 拮抗薬 ; 神経炎症を低減することができる抗炎症剤 ; プロスタグランジン E P 2 受容体拮抗薬 ; P A I - 1 阻害剤 ; およびゲルソリンなどの A 流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される。

30

40

【 1 3 0 3 】

50

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を、有効（例えば、治療上有効）量の1以上のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）-2,3-ジヒドロ-5,6-ジメトキシ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチル]-1H-インデン-1-オン塩酸塩、即ち、アリセプト（登録商標）という商品名のドネペジル塩酸塩として市販されているドネペジル塩酸塩など）と組み合わせて、処置を必要とする患者に投与する段階を含む、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1304】

本発明の別の実施形態は、有効量の式（I）の化合物を、有効量の1以上（例えば、1）のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）-2,3-ジヒドロ-5,6-ジメトキシ-2-[[1-(フェニルメチル)-4-ピペリジニル]メチル]-1H-インデン-1-オン塩酸塩、すなわち、アリセプト（登録商標）という商品名のドネペジル塩酸塩として市販されているドネペジル塩酸塩など）と組み合わせて、処置を必要とする患者に対して投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

10

【1305】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を、A抗体阻害剤、 α -セクレターゼ阻害剤および γ -セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される有効量の1以上の化合物と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

20

【1306】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上（例えば、1）の式（I）の化合物を、有効量の1以上のBACE阻害剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1307】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量のエクセロン（リバスティグミン）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1308】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量のコグネックス（タクリン）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

30

【1309】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量のタウキナーゼ阻害薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1310】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のタウキナーゼ阻害薬（例えば、GSK3阻害薬、cdk5阻害薬、ERK阻害薬）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1311】

本発明は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の一つの抗Aワクチン接種（能動免疫）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法も提供する。

40

【1312】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のAPPリガンドと組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1313】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のインスリン分解酵素を上昇させる薬剤および/またはネプリライシンと組み合わせて投与する段

50

階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1314】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のコレステロール降下薬（例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチンなどのスタチン類およびエゼチミブなどのコレステロール吸収阻害剤）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1315】

本発明は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のフィブレート類（例えば、クロフィブレート、クロフィブリド、エトフィブレート、アルミニウムクロフィブレート）と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病を治療する方法も提供する。

10

【1316】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のLXR作動薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1317】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のLRP模倣剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

20

【1318】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上の5-HT₆受容体拮抗薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1319】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のニコチン性受容体作動薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1320】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のH₃受容体拮抗薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

30

【1321】

本発明は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のヒストンデアセチラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病を治療する方法も提供する。

【1322】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のhsp90阻害剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

40

【1323】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上のm1ムスカリン性受容体作動薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1324】

本発明の別の実施形態は、有効量の1以上の式Iの化合物を、有効量の1以上の5-HT₆受容体拮抗薬mGluR1またはmGluR5陽性アロステリック調節剤または作動薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【1325】

50

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上の式 I の化合物を、有効量の 1 以上の m G 1 u R 2 / 3 拮抗薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 3 2 6 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上の式 I の化合物を、神経炎症を低減することができる有効量の 1 以上の抗炎症剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 3 2 7 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上の式 I の化合物を、有効量の 1 以上のプロスタグランジン E P 2 受容体拮抗薬と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

10

【 1 3 2 8 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上の式 I の化合物を、有効量の 1 以上の P A I - 1 阻害剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 3 2 9 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上の式 I の化合物を、ゲルソリンなどの A 流出を誘発することができる有効量の 1 以上の薬剤と組み合わせて投与する段階を有する、アルツハイマー病の治療方法に関するものである。

【 1 3 3 0 】

本発明の別の実施形態は、有効量の 1 以上（例えば、1）の式（I）の化合物を、有効量の 1 以上のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、(±) - 2, 3 - ジヒドロ - 5, 6 - ジメトキシ - 2 - [[1 - (フェニルメチル) - 4 - ピペリジニル] メチル] - 1 H - インデン - 1 - オン塩酸塩、すなわち、アリセプト（登録商標）という商品名のドネペジル塩酸塩として市販されているドネペジル塩酸塩など）と組み合わせて、処置を必要とする患者に投与する段階を有する、ダウン症候群の治療方法に関するものである。

20

【 1 3 3 1 】

本発明の別の実施形態は、有効量の式（I）の化合物を、有効量の 1 以上（例えば、1）のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、(±) - 2, 3 - ジヒドロ - 5, 6 - ジメトキシ - 2 - [[1 - (フェニルメチル) - 4 - ピペリジニル] メチル] - 1 H - インデン - 1 - オン塩酸塩、すなわち、アリセプト（登録商標）という商品名のドネペジル塩酸塩として市販されているドネペジル塩酸塩など）と組み合わせて、処置を必要とする患者に投与する段階を有する、ダウン症候群の治療方法に関するものである。

30

【 1 3 3 2 】

本発明の他の実施形態は、式（I）の化合物が群 A からなる群から選択される、併用療法（すなわち、式（I）の化合物を他の医薬有効成分、すなわち薬剤と組み合わせて使用する上記治療方法）に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 3 3 3 】

本発明の他の実施形態は、式（I）の化合物が群 B からなる群から選択される、併用療法（すなわち、式（I）の化合物を他の医薬有効成分、すなわち薬剤と組み合わせて使用する上記治療方法）に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

40

【 1 3 3 4 】

本発明の他の実施形態は、式（I）の化合物が群 C からなる群から選択される、併用療法（すなわち、式（I）の化合物を他の医薬有効成分、すなわち薬剤と組み合わせて使用する上記治療方法）に関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 3 3 5 】

本発明の他の実施形態は、前記式（I）の化合物が化合物 9 および 15 から 25 からなる群から選択される併用療法に関する上記実施形態のいずれか（すなわち、他の医薬有効成分、すなわち薬剤と組み合わせて式（I）の化合物を用いる上記治療方法）に関するものである。

50

【 1 3 3 6 】

本発明は、組み合わせて使用するための医薬組成物を単一のパッケージ中の別々の容器内に含むキットであって、一つの容器が製薬上許容される担体中に有効量の式 (I) の化合物を含み、別の容器 (すなわち、第 2 の容器) が有効量の別の医薬有効成分 (上述した通り) を含み、式 (I) の化合物および他の医薬有効成分を合わせた量が、 (a) アルツハイマー病を治療する、または (b) 神経組織 (例えば、脳) の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質 (例えば、アミロイドタンパク質) の沈着を阻害する、または (c) 神経変性疾患を治療する、または (d) β -セクレターゼの活性を調節する、あるいは (e) 軽度認知障害を治療する、または (f) 緑内障を治療する、または (g) 脳アミロイド脈管障害を治療する、または (h) 卒中を治療する、または (i) 認知症を治療する、または (j) 小膠細胞症を治療する、または (k) 脳炎を治療する、または (l) 嗅覚機能喪失を治療するのに有効であるキットも提供する。

10

【 1 3 3 7 】

本発明は、組み合わせて使用するための医薬組成物を単一のパッケージ中の別々の容器内に含むキットであって、一つの容器が製薬上許容される担体中に有効量の式 (I) の化合物を含み、別の容器 (すなわち、第 2 の容器) が有効量の別の医薬有効成分 (上述した通り) を含み、式 (I) の化合物および他の医薬有効成分を合わせた量が、 (a) アルツハイマー病を治療する、または (b) 神経組織 (例えば、脳) の中、上または周囲におけるアミロイドタンパク質 (例えば、アミロイドタンパク質) の沈着を阻害する、または (c) 神経変性疾患を治療する、または (d) β -セクレターゼの活性を調節するのに有効であるキットも提供する。

20

【 1 3 3 8 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 A からなる群から選択される、キットに関する上記実施形態のうちのいずれかに関するものである。

【 1 3 3 9 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 B からなる群から選択される、キットに関する上記実施形態のうちのいずれかに関するものである。

【 1 3 4 0 】

本発明の他の実施形態は、式 (I) の化合物が群 C からなる群から選択される、キットに関する上記実施形態のうちのいずれかに関するものである。

30

【 1 3 4 1 】

本発明の他の実施形態は、前記式 (I) の化合物が化合物 9 および 1 5 から 2 6 からなる群から選択されるキットに関する上記実施形態のいずれかに関するものである。

【 1 3 4 2 】

コリンエステラーゼ阻害薬の例には、タクリン、ドネペジル、リバスティグミン、ガラントミン、ピリドスチグミンおよびネオスチグミンがあり、タクリン、ドネペジル、リバスティグミンおよびガラントミンが好ましい。

【 1 3 4 3 】

m_1 拮抗薬の例は当業界で公知である。 m_2 拮抗薬の例も当業界では公知であり、特に m_2 拮抗薬は米国特許第 5, 883, 096 号; 同 6, 037, 352 号; 同 5, 889, 006 号; 同 6, 043, 255 号; 同 5, 952, 349 号; 同 5, 935, 958 号; 同 6, 066, 636 号; 同 5, 977, 138 号; 同 6, 294, 554 号; 同 6, 043, 255 号; および同 6, 458, 812 号; および WO 03/031412 (これらはいずれも参照によって本明細書に組み込まれる。) に開示されている。

40

【 1 3 4 4 】

BACE 阻害薬の例には、06/02/2005 公開の US 2005/0119227 (02/24/2005 公開の WO 2005/016876 も参照。)、02/24/2005 公開の US 2005/0043290 (02/17/2005 公開の WO 2005/014540 も参照。)、06/30/2005 公開の WO 2005/058311 (03/29/2007 公開の US 2007/0072852 も参照。)、05/25/2

50

006 公開の US 2006/0111370 (06/22/2006 公開の WO 2006/065277 も参照。)、02/23/2007 出願の米国特許出願第 11/710582 号、02/23/2006 公開の US 2006/0040994 (02/09/2006 公開の WO 2006/014762 も参照。)、02/09/2006 公開の WO 2006/014944 (02/23/2006 公開の US 2006/0040948 も参照。)、12/28/2006 公開の WO 2006/138266 (01/11/2007 公開の US 2007/0010667 も参照。)、12/28/2006 公開の WO 2006/138265、12/28/2006 公開の WO 2006/138230、12/28/2006 公開の WO 2006/138195 (12/14/2006 公開の US 2006/0281729 も参照。)、12/28/2006 公開の WO 2006/138264 (03/15/2007 公開の US 2007/0060575 も参照。)、12/28/2006 公開の WO 2006/138192 (12/14/2006 公開の US 2006/0281730 も参照。)、12/28/2006 公開の WO 2006/138217 (12/21/2006 公開の US 2006/0287294 も参照。)、05/03/2007 公開の US 2007/0099898 (05/03/2007 公開の WO 2007/050721 も参照。)、05/10/2007 公開の WO 2007/053506 (05/03/2007 公開の US 2007/099875 も参照。)、06/07/2007 出願の米国特許出願第 11/759336 号、12/12/2006 出願の米国特許出願第 60/874362 号および 12/12/2006 出願の米国特許出願第 60/874419 号 (それぞれの開示内容は参照によって本明細書に組み込まれる。) に記載のものなどがある。

【1345】

留意すべき点として、式 (I) および本明細書における他の式の炭素は、全ての価数要件が満足される限りにおいて、1 から 3 個のケイ素原子で置き換わっていても良い。

【1346】

上記および本開示の全体を通して使用される場合に、別断の断りがない限り、下記の用語は、下記の意味を有するものと理解される。

【1347】

「患者」は、ヒトおよび動物の両方を含める。

【1348】

「哺乳動物」は、ヒトおよび他の哺乳動物を意味する。

【1349】

「1 以上の」は、少なくとも一つがあり、複数があっても良いことを意味し、例としては 1、2 もしくは 3、または 1 および 2、または 1 などがある。

【1350】

「少なくとも一つ」は、少なくとも一つがあり、複数があっても良いことを意味し、例としては 1、2 もしくは 3、または 1 および 2、または 1 などがある。

【1351】

医薬組成物での式 (I) の化合物の量を説明したり、または治療方法で使用される式 (I) の化合物の量を説明したり、または治療方法で使用される医薬組成物の量を説明したり、または医薬組成物もしくは治療方法で用いられる他の医薬成分 (すなわち薬剤) の量を説明するのに用いられる「有効量」とは、治療上有効な量を意味する。

【1352】

「Bn」はベンジルを意味する。

【1353】

「Et」はエチルを意味する。

【1354】

「i-pr」はイソプロピルを意味する。

【1355】

「Me」はメチルを意味する。

10

20

30

40

50

【1356】

「Pr」はプロピルを意味する。

【1357】

「t-Bu」はtert-ブチルを意味する。

【1358】

「TBDMSCl」は、tert-ブチルジメチルシリルクロライドを意味する。

【1359】

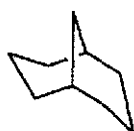
「DMAP」は、4-(ジメチルアミノ)ピリジンを意味する。

【1360】

「炭素環」は、約3から約10個の炭素原子、好ましくは約5から約10個の炭素原子を含む非芳香族飽和もしくは不飽和単環式もしくは多環式環系を意味する。炭素環には、下記で定義のシクロアルキル環類およびシクロアルケニル環類などがある。従って、炭素環の例には、例えば、ノルボルニル、アダマンチル、ノルボルネニルおよび

10

【化177】



ビスクロ [3. 3. 1] ノナン

20

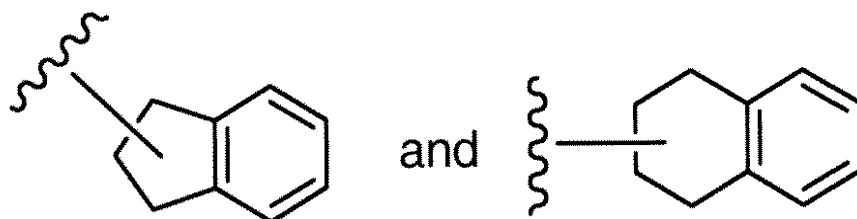
【1361】

などの二環式環類などがある。炭素環類は、1以上の独立に選択される下記で定義の「環系置換基」で置換されていても良い。

【1362】

「縮合ベンゾシクロアルキル環」は、シクロアルキル環（シクロアルキルは下記で定義の通りである。）に縮合したフェニル環を意味し、例えば

【化178】



30

【1363】

などがある。

【1364】

「アルキル」は、直鎖であっても分岐鎖であってもよい、鎖中に約1から約20個の炭素原子を含む脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルキル基は、鎖中に約1から約12個の炭素原子を含有する。より好ましいアルキル基は、鎖中に約1から約6個の炭素原子を含有する。分岐は、メチル、エチルまたはプロピル等の1個または複数の低級アルキル基が、直鎖アルキル鎖に結合していることを意味する。「低級アルキル」は、直鎖であっても分岐鎖であってもよい、鎖中に約1から約6個の炭素原子を有する基を意味する。

40

「アルキル」は、置換されていなくてもよく、また同じであっても異なってもよい1個または複数の置換基で場合によって置換されていてもよく、各置換基は、ハロ、アルキル、アリール、シクロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アミノ、オキシム（例えば = N-OH）、-NH（アルキル）、-NH（シクロアルキル）、-N（アルキル）₂、-O-C(O)-アルキル、-O-C(O)-アリール、-O-C(O)-シクロアルキル、カルボキシおよび-C(O)O-アルキルからなる群から独立に選択される。適切なアルキル基の非限定的な例は、メチル、エチル、n-プロピル、イ

50

ソプロピルおよび *t*-ブチルを含む。

【1365】

「アルケニル」は、少なくとも1個の炭素-炭素二重結合を含有し、直鎖であっても分岐鎖であってもよく、鎖中に約2から約15個の炭素原子を含む脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルケニル基は、鎖中に約2から約12個の炭素原子を有し、より好ましくは、鎖中に約2から約6個の炭素原子を有する。分岐は、メチル、エチルまたはプロピル等の1個または複数の低級アルキル基が、直鎖アルケニル鎖に結合していることを意味する。「低級アルケニル」は、直鎖であっても分岐鎖であってもよい、鎖中の約2から約6個の炭素原子を意味する。「アルケニル」は、置換されていなくてもよく、また同じであっても異なってもよい1個または複数の置換基で場合によって置換されていてもよく、各置換基は、ハロ、アルキル、アリール、シクロアルキル、シアノ、アルコキシおよび-S(アルキル)からなる群から独立に選択される。適切なアルケニル基の非限定的な例は、エテニル、プロペニル、*n*-ブテニル、3-メチルブタ-2-エニル、*n*-ペンテニル、オクテニルおよびデセニルを含む。

10

【1366】

「アルキレン」は、上記で定義されたアルキル基からの水素原子の除去によって得られる二官能基を意味する。アルキレンの非限定的な例は、メチレン、エチレンおよびプロピレンを含む。

【1367】

「アルキニル」は、少なくとも1個の炭素-炭素三重結合を含有し、直鎖であっても分岐鎖であってもよく、鎖中に約2から約15個の炭素原子を含む脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルキニル基は、鎖中に約2から約12個の炭素原子を有し、より好ましくは、鎖中に約2から約4個の炭素原子を有する。分岐は、メチル、エチルまたはプロピル等の1個または複数の低級アルキル基が、直鎖アルキニル鎖に結合していることを意味する。「低級アルキニル」は、直鎖であっても分岐鎖であってもよい、鎖中の約2から約6個の炭素原子を意味する。適切なアルキニル基の非限定的な例は、エチニル、プロピニル、2-ブチニルおよび3-メチルブチニルを含む。「アルキニル」は、置換されていなくてもよく、また同じであっても異なってもよい1個または複数の置換基で場合によって置換されていてもよく、各置換基は、アルキル、アリールおよびシクロアルキルからなる群から独立に選択される。

20

30

【1368】

「アリール」は、約6から約14個の炭素原子、好ましくは約6から約10個の炭素原子を含む芳香族の単環式または多環式環系を意味する。アリール基は、同じであっても異なってもよい、本明細書において定義されている通りの1個または複数の「環系置換基」で場合によって置換されていてもよい。適切なアリール基の非限定的な例は、フェニルおよびナフチルを含む。

【1369】

「ヘテロアリール」は、約5から約14個の環原子、好ましくは約5から約10個の環原子を含む芳香族の単環式または多環式環系を意味し、ここで、その環原子の1個または複数は、炭素以外の元素、例えば、単独でまたは組合せで、窒素、酸素または硫黄である。好ましいヘテロアリールは、約5から約6個の環原子を含有する。「ヘテロアリール」は、同じであっても異なってもよい、本明細書において定義されている通りの1個または複数の「環系置換基」で場合によって置換されていてもよい。ヘテロアリール基名(*root name*)の前の接頭辞アザ、オキサまたはチアは、少なくとも窒素、酸素または硫黄原子が、それぞれ環原子として存在していることを意味する。ヘテロアリールの窒素原子は、対応するN-オキシドに場合によって酸化されていてもよい。「ヘテロアリール」は、上記で定義された通りのアリールと縮合している上記で定義された通りのヘテロアリールも含み得る。適切なヘテロアリールの非限定的な例は、ピリジル、ピラジニル、フラニル、チエニル、ピリミジニル、ピリドン(N置換ピリドン類を含む)、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、フラザニル、ピロリル

40

50

、ピラゾリル、トリアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、キノキサリニル、フトラジニル、オキシインドリル、イミダゾ [1, 2 - a] ピリジニル、イミダゾ [2, 1 - b] チアゾリル、ベンゾフラザニル、インドリル、アザインドリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、イミダゾリル、チエノピリジル、キナゾリニル、チエノピリミジル、ピロロピリジル、イミダゾピリジル、イソキノリニル、ベンゾアザインドリル、1, 2, 4 - トリアジニル、ベンゾチアゾリル等を含む。用語「ヘテロアリール」は、例えば、テトラヒドロイソキノリル、テトラヒドロキノリル等の部分飽和のヘテロアリール部分も指す。

【 1 3 7 0 】

「アラルキル」または「アリールアルキル」は、アリールおよびアルキルが前述の通りであるアリール - アルキル - 基を意味する。好ましいアラルキルは、低級アルキル基を含む。適切なアラルキル基の非限定的な例は、ベンジル、2 - フェネチルおよびナフタレニルメチルを含む。親部分との結合は、アルキルを介する。

10

【 1 3 7 1 】

「アルキルアリール」は、アルキルおよびアリールが前述の通りであるアルキル - アリール - 基を意味する。好ましいアルキルアリールは、低級アルキル基を含む。適切なアルキルアリール基の非限定的な例は、トリルである。親部分との結合は、アリールを介する。

【 1 3 7 2 】

「シクロアルキル」は、約 3 から約 10 個の炭素原子、好ましくは約 5 から約 10 個の炭素原子を含む非芳香族の単または多環式環系を意味する。好ましいシクロアルキル環は、約 5 から約 7 個の環原子を含有する。シクロアルキルは、同じであっても異なってもよい、1 個または複数の「環系置換基」で場合によって置換されていてよく、かつ上記で定義されている通りである。適切な単環式シクロアルキルの非限定的な例は、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル等を含む。適切な多環式シクロアルキルの非限定的な例は、1 - デカリニル、ノルボルニル、アダマンチル等を含む。

20

【 1 3 7 3 】

「シクロアルキルアルキル」は、アルキル部分（上記で定義されたもの）を介して親核と連結している上記で定義された通りのシクロアルキル部分を意味する。適切なシクロアルキルアルキルの非限定的な例は、シクロヘキシルメチル、アダマンチルメチル等を含む。

30

【 1 3 7 4 】

「シクロアルケニル」は、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素二重結合を含有する、約 3 から約 10 個の炭素原子、好ましくは約 5 から約 10 個の炭素原子を含む非芳香族の単または多環式環系を意味する。好ましいシクロアルケニル環は、約 5 から約 7 個の環原子を含有する。シクロアルケニルは、同じであっても異なってもよい、1 個または複数の「環系置換基」で場合によって置換されていてよく、かつ上記で定義されている通りである。適切な単環式シクロアルケニルの非限定的な例は、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプタ - 1, 3 - ジエニル等を含む。適切な多環式シクロアルケニルの非限定的な例は、ノルボルニレニルである。

40

【 1 3 7 5 】

「シクロアルケニルアルキル」は、アルキル部分（上記で定義されたもの）を介して親核と連結している上記で定義された通りのシクロアルケニル部分を意味する。適切なシクロアルケニルアルキルの非限定的な例は、シクロペンテニルメチル、シクロヘキセニルメチル等を含む。

【 1 3 7 6 】

「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を意味する。フッ素、塩素および臭素が好ましい。「ハロ」は、フルオロ、クロロ、プロモまたはヨードを指す。

【 1 3 7 7 】

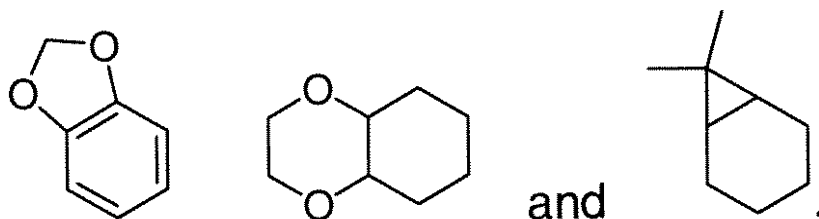
「環系置換基」は、例えば、環系上の利用可能な水素を置き換える芳香族または非芳香

50

族の環系と結合している置換基を意味する。環系置換基は、同じであっても異なってもよく、それぞれ、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アルキルアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、アルキルヘテロアリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、アシル、アロイル、ハロ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アラルコキシカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、アラルキルチオ、ヘテロアラルキルチオ、シクロアルキル、複素環、 $=O$ 、 $=N-OY$ 、 $-O-C(O)-$ アルキル、 $-O-C(O)-$ アリール、 $-O-C(O)-$ シクロアルキル、 $-C(=N-CN)-NH_2$ 、 $-C(=NH)-NH_2$ 、 $-C(=NH)-NH$ (アルキル)、オキシム(例えば $=N-OH$)、 Y_1Y_2N- 、 Y_1Y_2N- アルキル、 $Y_1Y_2NC(O)-$ 、 $Y_1Y_2NSO_2-$ および $SO_2NY_1Y_2$ からなる群から独立に選択され、ここで、 Y_1 および Y_2 は、同じであっても異なってもよく、水素、アルキル、アリール、シクロアルキルおよびアラルキルからなる群から独立に選択される。「環系置換基」は、環系上の2個の隣接する炭素原子上の2個の利用可能な水素(各炭素上の1個のH)を同時に置き換える単一部分も意味し得る。そのような部分の例は、例えば、

10

【化179】



20

【1378】

等の部分を形成する、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、 $-C(CH_3)_2-$ 等である。

【1379】

「ヘテロアリールアルキル」は、アルキル部分(上記で定義されたもの)を介して親核と連結している上記で定義された通りのヘテロアリール部分を意味する。適切なヘテロアリールの非限定的な例は、2-ピリジニルメチル、キノリニルメチル等を含む。

30

【1380】

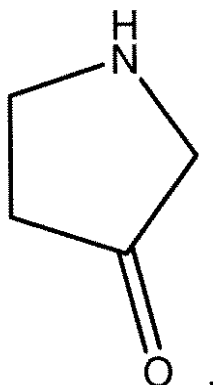
「複素環」または「複素環アルキル」は、約3から約10個の環原子、好ましくは約5から約10個の環原子を含む非芳香族の飽和単環式または多環式環系を意味し、ここで、その環系中の原子の1個または複数は、炭素以外の元素、例えば、単独でまたは組合せて、窒素、酸素または硫黄である。環系中に、隣接する酸素および/または硫黄原子は存在しない。好ましい複素環は、約5から約6個の環原子を含有する。複素環基名の前の接頭辞アザ、オキサまたはチアは、少なくとも窒素、酸素または硫黄原子が、それぞれ環原子として存在していることを意味する。複素環環中の任意の $-NH$ は、例えば、 $-N(Boc)$ 、 $-N(Cbz)$ 、 $-N(Tos)$ 基等として等、保護されて存在することができ、そのような保護も、本発明の一部とみなされる。複素環は、同じであっても異なってもよい、1個または複数の「環系置換基」で場合によって置換されていてよく、かつ本明細書で定義されている通りである。複素環の窒素または硫黄原子は、対応するN-オキシド、S-オキシドまたはS,S-ジオキシドに場合によって酸化されていてよい。適切な単環式複素環環の非限定的な例は、ピペリジル、ピロリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、チアゾリジニル、1,4-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフエニル、ラクタム、ラクトン等を含む。「複素環」は、環系上の同一炭素上に2個の利用可能な水素に $=O$ が代わっている環をも含む(すなわち、複素環には、環中にカルボニルを有する環が含まれる)。そのような部分の例は、ピロリドン

40

50

である。

【化 1 8 0】



10

【 1 3 8 1】

「複素環アルキル」(または「複素環アルキルアルキル」)は、アルキル部分(上記で定義されたもの)を介して親核と連結している上記で定義された通りの複素環部分を意味する。適切な複素環アルキルの非限定的な例は、ピペリジニルメチル、ピペラジニルメチル等を含む。

20

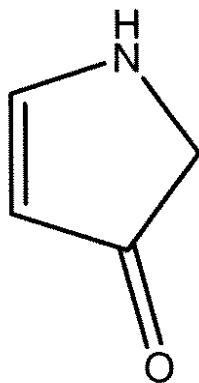
【 1 3 8 2】

「ヘテロシクレニル」(または「複素環アルケニル」)は、約 3 から約 10 個の環原子、好ましくは約 5 から約 10 個の環原子を含む非芳香族の単環式または多環式環系を意味し、ここで、その環系中の原子の 1 個または複数は、炭素以外の元素、例えば、単独でまたは組合せで、窒素、酸素または硫黄原子であり、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素二重結合または炭素 - 窒素二重結合を含有する。環系中に、隣接する酸素および/または硫黄原子は存在しない。好ましいヘテロシクレニル環は、約 5 から約 6 個の環原子を含有する。ヘテロシクレニル基名の前の接頭辞アザ、オキサまたはチアは、少なくとも窒素、酸素または硫黄原子が、それぞれ環原子として存在していることを意味する。ヘテロシクレニルは、1 個または複数の環系置換基で場合によって置換されていてよく、ここで、「環系置換基」は上記で定義されている通りである。ヘテロシクレニルの窒素または硫黄原子は、対応する N - オキシド、S - オキシドまたは S, S - ジオキシドに場合によって酸化されていてよい。適切なヘテロシクレニル基の非限定的な例は、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロピリジニル、1, 2 - ジヒドロピリジニル、1, 4 - ジヒドロピリジニル、1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジニル、1, 4, 5, 6 - テトラヒドロピリミジニル、2 - ピロリニル、3 - ピロリニル、2 - イミダゾリニル、2 - ピラゾリニル、ジヒドロイミダゾリル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジアゾリル、ジヒドロチアゾリル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - ピラニル、ジヒドロフラニル、フルオロジヒドロフラニル、7 - オキサビシクロ[2.2.1]ヘプテニル、ジヒドロチオフエニル、ジヒドロチオピラニル等を含む。「ヘテロシクレニル」は、環系上の同一炭素上に 2 個の利用可能な水素に = O が代わっている環をも含む(すなわち、複素環には、環中にカルボニルを有する環が含まれる)。そのような部分の例は、ピロリジノン:

30

40

【化 1 8 1】



10

【 1 3 8 3】

である。

【 1 3 8 4】

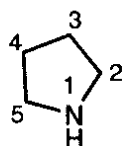
「ヘテロシクレニルアルキル」（または「複素環アルケニルアルキル」）は、アルキル部分（上記で定義されたもの）を介して親核と連結している上記で定義された通りのヘテロシクレニル部分を意味する。

【 1 3 8 5】

20

本発明のヘテロ原子含有環系において、N、OまたはSに隣接する炭素原子上にヒドロキシル基はなく、同様に、別のヘテロ原子に隣接する炭素上にはN基もS基もないことに留意すべきである。よって、例えば、環：

【化 1 8 2】



【 1 3 8 6】

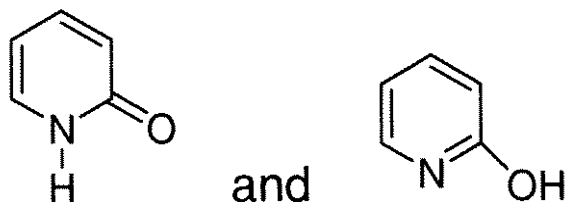
30

中に、2および5とマークされた炭素と直接的に結合している - OHはない。

【 1 3 8 7】

例えば、部分：

【化 1 8 3】



40

【 1 3 8 8】

等の互変異性形態は、本発明のいくつかの実施形態において均等物とみなされることにも留意すべきである。

【 1 3 8 9】

「アルキニルアルキル」は、アルキニルおよびアルキルが前述の通りであるアルキニル - アルキル - 基を意味する。好ましいアルキニルアルキルは、低級アルキニルおよび低級アルキル基を含有する。親部分との結合は、アルキルを介する。適切なアルキニルアルキ

50

ル基の非限定的な例は、プロパルギルメチルを含む。

【1390】

「ヘテロアラルキル」は、ヘテロアリアルおよびアルキルが前述の通りであるヘテロアリアル-アルキル-基を意味する。好ましいヘテロアラルキルは、低級アルキル基を含有する。適切なアラルキル基の非限定的な例は、ピリジルメチルおよびキノリン-3-イルメチルを含む。親部分との結合は、アルキルを介する。

【1391】

「ヒドロキシアルキル」は、アルキルが先に定義された通りであるHO-アルキル-基を意味する。好ましいヒドロキシアルキルは、低級アルキルを含有する。適切なヒドロキシアルキル基の非限定的な例は、ヒドロキシメチルおよび2-ヒドロキシエチルを含む。

10

【1392】

「アシル」は、種々の基が前述の通りであるH-C(O)-、アルキル-C(O)-またはシクロアルキル-C(O)-基を意味する。親部分との結合は、カルボニルを介する。好ましいアシルは、低級アルキルを含有する。適切なアシル基の非限定的な例は、ホルミル、アセチルおよびプロパノイルを含む。

【1393】

「アロイル」は、アリアル基が前述の通りであるアリアル-C(O)-基を意味する。親部分との結合は、カルボニルを介する。適切な基の非限定的な例は、ベンゾイルおよび1-ナフトイルを含む。

【1394】

「アルコキシ」は、アルキル基が前述の通りであるアルキル-O-基を意味する。適切なアルコキシ基の非限定的な例は、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシおよびn-ブトキシを含む。親部分との結合は、エーテル酸素を介する。

20

【1395】

「アリアルオキシ」は、アリアル基が前述の通りであるアリアル-O-基を意味する。適切なアリアルオキシ基の非限定的な例は、フェノキシおよびナフトキシを含む。親部分との結合は、エーテル酸素を介する。

【1396】

「アラルキルオキシ」は、アラルキル基が前述の通りであるアラルキル-O-基を意味する。適切なアラルキルオキシ基の非限定的な例は、ベンジルオキシおよび1-または2-ナフタレンメトキシを含む。親部分との結合は、エーテル酸素を介する。

30

【1397】

「アルキルチオ」は、アルキル基が前述の通りであるアルキル-S-基を意味する。適切なアルキルチオ基の非限定的な例は、メチルチオおよびエチルチオを含む。親部分との結合は、硫黄を介する。

【1398】

「アリアルチオ」は、アリアル基が前述の通りであるアリアル-S-基を意味する。適切なアリアルチオ基の非限定的な例は、フェニルチオおよびナフチルチオを含む。親部分との結合は、硫黄を介する。

【1399】

「アラルキルチオ」は、アラルキル基が前述の通りであるアラルキル-S-基を意味する。適切なアラルキルチオ基の非限定的な例は、ベンジルチオである。親部分との結合は、硫黄を介する。

40

【1400】

「アルコキシカルボニル」は、アルキル-O-CO-基を意味する。適切なアルコキシカルボニル基の非限定的な例は、メトキシカルボニルおよびエトキシカルボニルを含む。親部分との結合は、カルボニルを介する。

【1401】

「アリアルオキシカルボニル」は、アリアル-O-C(O)-基を意味する。適切なアリアルオキシカルボニル基の非限定的な例は、フェノキシカルボニルおよびナフトキシカ

50

ルボニルを含む。親部分との結合は、カルボニルを介する。

【1402】

「アラルコキシカルボニル」は、アラルキル - O - C (O) - 基を意味する。適切なアラルコキシカルボニル基の非限定的な例は、ベンジルオキシカルボニルである。親部分との結合は、カルボニルを介する。

【1403】

「アルキルスルホニル」は、アルキル - S (O₂) - 基を意味する。好ましい基は、アルキル基が低級アルキルであるものである。親部分との結合は、スルホニルを介する。

【1404】

「アリールスルホニル」は、アリール - S (O₂) - 基を意味する。親部分との結合は、スルホニルを介する。

10

【1405】

「置換されている」という用語は、指定された原子上の1個または複数の水素が、示されている基からの選択物で置き換えられている（ただし、存在する環境下で指定された原子の正常な原子価を超えない）ことおよび置換が安定化合物をもたらすことを意味する。置換基および/または可変要素の組合せは、そのような組合せが安定化合物をもたらす場合にのみ容認できる。「安定化合物」または「安定構造」は、反応混合物から有用な純度までの単離および効果的な治療剤への製剤に耐えるだけ十分に堅牢な化合物を意味する。

【1406】

「置換されていても良い」という用語は、特定の基 (group)、基 (radical) または部分での適宜の置換を意味する。

20

【1407】

化合物についての「精製された」、「精製形態で」または「単離および精製された形態で」という用語は、合成過程（例えば、反応混合物から）もしくは天然源またはそれらの組合せから単離された後の、前記化合物の物理的状态を指す。よって、化合物についての「精製された」、「精製形態で」または「単離および精製された形態で」という用語は、本明細書に記載されているまたは当業者に公知の1以上の精製過程（例えば、クロマトグラフィー、再結晶等）から、本明細書に記載されているまたは当業者に公知の標準的な分析技術によって特性決定可能となるのに十分な純度で得られた後の、前記化合物の物理的状态を指す。

30

【1408】

留意すべき点として、本明細書中の本文、図式、実施例および表における原子価を満たしていない炭素およびヘテロ原子は、原子価を満たす十分な数の水素原子（複数可）を有すると仮定される。

【1409】

化合物中の官能基が「保護されている」と称される場合、これは、化合物が反応に供される際に、保護部位における望ましくない副反応を防止するために、その基が修飾された形態であることを意味する。適切な保護基は、当業者によって、そして例えば T. W. Greene et al, Protective Groups in Organic Synthesis (1991), Wiley, New York 等の標準的な教科書の参照によって理解される。

40

【1410】

任意の可変要素または式 I において、任意の可変要素（例えば、アリール、複素環、R²等）が複数回出現する場合、各出現におけるその定義は、他の出現ごとにおけるその定義とは独立している。

【1411】

本明細書において使用される場合、「組成物」という用語は、規定量の規定成分を含む生成物および規定量の規定成分の組合せに直接的または間接的に起因する任意の生成物を網羅することを意図している。

【1412】

50

本発明の化合物のプロドラッグおよび溶媒和物も、本明細書において企図されている。プロドラッグについての考察は、T. Higuchi and V. Stella, Pro-drugs as Novel Delivery Systems (1987), 14 of A.C.S. Symposium Series、ならびに Bioreversible Carriers in Drug Design (1987), Edward B. Roche ed, American Pharmaceutical Association and Pergamon Pressにおいて提供されている。「プロドラッグ」という用語は、インビボで転換されて、式(I)の化合物、またはその化合物の製薬上許容される塩、水和物もしくは溶媒和物を生じさせる化合物(例えば、薬剤前駆体)を意味する。転換は、例えば、血液中での加水分解によって等、種々の機構によって(例えば、代謝過程または化学過程によって)発生し得る。プロドラッグの使用についての考察は、T. Higuchi and W. Stella, Pro-drugs as Novel Delivery Systems, 14 of A.C.S. Symposium Series、ならびに Bioreversible Carriers in Drug Design, Edward B. Roche ed., American Pharmaceutical Association and Pergamon Press, 1987によって提供されている。

10

【1413】

例えば、式(I)の化合物、またはその化合物の製薬上許容される塩、水和物もしくは溶媒和物がカルボン酸官能基を含有する場合、プロドラッグは、例えば、(C₁-C₈)アルキル、(C₂-C₁₂)アルカノイルオキシメチル、4から9個の炭素原子を有する1-(アルカノイルオキシ)エチル、5から10個の炭素原子を有する1-メチル-1-(アルカノイルオキシ)-エチル、3から6個の炭素原子を有するアルコキシカルボニルオキシメチル、4から7個の炭素原子を有する1-(アルコキシカルボニルオキシ)エチル、5から8個の炭素原子を有する1-メチル-1-(アルコキシカルボニルオキシ)エチル、3から9個の炭素原子を有するN-(アルコキシカルボニル)アミノメチル、4から10個の炭素原子を有する1-(N-(アルコキシカルボニル)アミノ)エチル、3-フタリジル、4-クロトノラクトニル、ガンマ-ブチロラクトン-4-イル、ジ-N, N-(C₁-C₂)アルキルアミノ(C₂-C₃)アルキル(-ジメチルアミノエチル等)、カルバモイル-(C₁-C₂)アルキル、N, N-ジ(C₁からC₂)アルキルカルバモイル-(C₁-C₂)アルキルおよびピペリジノ-、ピロリジノ-またはモルホリノ(C₂-C₃)アルキル等のような基による酸基の水素原子の置き換えによって形成されるエステルを含み得る。

20

30

【1414】

同様に、式(I)の化合物がアルコール官能基を含有する場合、プロドラッグは、例えば、(C₁-C₆)アルカノイルオキシメチル、1-((C₁-C₆)アルカノイルオキシ)エチル、1-メチル-1-((C₁-C₆)アルカノイルオキシ)エチル、(C₁-C₆)アルコキシカルボニルオキシメチル、N-(C₁-C₆)アルコキシカルボニルアミノメチル、スクシノイル、(C₁-C₆)アルカノイル、-アミノ(C₁-C₄)アルカニル、アリールアシルおよび-アミノアシルまたは-アミノアシル-アミノアシル[ここで、各-アミノアシル基は、天然に存在するL-アミノ酸、P(O)(OH)₂、-P(O)(O(C₁-C₆)アルキル)₂またはグリコシル(ヘミアセタール形態の炭水化物のヒドロキシル基の除去に由来する基)等から独立に選択される]等の基によるアルコール基の水素原子の置き換えによって形成できる。

40

【1415】

式(I)の化合物がアミン官能基を組み込んでいる場合、プロドラッグは、例えば、R-カルボニル、RO-カルボニル、NRR-カルボニル[ここで、RおよびRは、それぞれ独立に、(C₁-C₁₀)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、ベンジルであるか、あるいはR-カルボニルは天然-アミノアシルまたは天然-アミノアシルで

50

ある]、 $-C(OH)C(O)OY^1$ [ここで、 Y^1 は、H、 $(C_1 - C_6)$ アルキルまたはベンジルである]、 $-C(OY^2)Y^3$ [ここで、 Y^2 は $(C_1 - C_4)$ アルキルであり、 Y^3 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、カルボキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノ $(C_1 - C_4)$ アルキルまたはモノ-N-もしくはジ-N, N- $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノアルキルである]、 $-C(Y^4)Y^5$ [ここで、 Y^4 はHまたはメチルであり、 Y^5 は、モノ-N-もしくはジ-N, N- $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノモルホリノ、ピペリジン-1-イルまたはピロリジン-1-イルである]等の基によるアミン基中の水素原子の置き換えによって形成できる。

【1416】

1種または複数の本発明の化合物は、非溶媒和形態、および水、エタノール等の製薬上許容される溶媒との溶媒和形態で存在し得、本発明は溶媒和および非溶媒和形態の両方を包含することが意図されている。「溶媒和物」は、本発明の化合物の、1個または複数の溶媒分子との物理的結合を意味する。この物理的結合には、水素結合を含む様々な程度のイオン結合および共有結合が含まれる。いくつかの事例において、例えば1個または複数の溶媒分子が結晶性固体の結晶格子に組み込まれている場合、溶媒和物を単離することができる。「溶媒和物」は、液相および単離可能な溶媒和物の両方を網羅する。適切な溶媒和物の非限定的な例は、エタノレート、メタノレート等を含む。「水和物」は、溶媒分子が H_2O である溶媒和物である。

10

【1417】

1種または複数の本発明の化合物は、溶媒和物に場合によって変換できる。溶媒和物の製造は、概して公知である。よって、例えば、M. Cairra et al., J. Pharmaceutical Sci., 93(3), 601-611 (2004年)は、酢酸エチル中でのおよび水からの抗真菌薬フルコナゾールの溶媒和物の製造について記載している。溶媒和物、半溶媒和物、水和物等の同様の製造は、E. C. van Tonder et al., AAPS PharmSciTech., 5(1), article 12 (2004)、およびA. L. Bingham et al., Chem. Commun., 603-604 (2001)によって記載されている。代表的で非限定的な方法は、本発明の化合物を所望量の所望の溶媒(有機もしくは水またはそれらの混合物)に周囲温度よりも高温で溶解する工程と、結晶を形成するのに十分な速度で溶液を冷却し、次いで結晶を標準的な方法によって単離する工程とを含む。例えば赤外分光法等の分析技術は、結晶中の溶媒(または水)の存在を溶媒和物(または水和物)として示す。

20

30

【1418】

「有効量」または「治療上有効量」は、上述の疾患を阻害し、よって、所望の治療効果、改善効果、阻害効果または予防効果をもたらすのに有効な、本発明の化合物または組成物の量を記載することを意味する。

【1419】

式Iの化合物は、やはり本発明の範囲内である塩を形成することができる。本明細書における式Iの化合物への言及は、別段の指示がない限り、その塩への言及を含むものと理解される。「塩(複数可)」という用語は、本明細書において用いられる場合、無機酸および/または有機酸と形成された酸性塩ならびに無機塩基および/または有機塩基と形成された塩基性塩を表す。加えて、式Iの化合物が、ピリジンまたはイミダゾール等であるがこれらに限定されない塩基性部分およびカルボン酸等であるがこれに限定されない酸性部分の両方を含有する場合、両性イオン(「内塩」)が形成され得、本明細書において使用される、「塩(複数可)」という用語内に含まれる。製薬上許容される(すなわち、非毒性で生理的に許容される)塩が好ましいが、他の塩も有用である。式Iの化合物の塩は、例えば、式Iの化合物を、塩が沈殿するもの等の媒質中または水性媒質中、当量等、ある量の酸または塩基と反応させ、続いて凍結乾燥することによって形成できる。

40

【1420】

酸付加塩の例には、酢酸塩、アスコルビン酸塩、安息香酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、

50

重硫酸塩、ホウ酸塩、酪酸塩、クエン酸塩、カンファー酸塩 (camphorate)、樟脳スルホン酸塩、フマル酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、メタンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、硝酸塩、シュウ酸塩、リン酸塩、プロピオン酸塩、サリチル酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、チオシアン酸塩、トルエンスルホン酸塩 (トシレートとしても公知である) などがある。さらに、塩基性医薬化合物からの薬学的に有用な塩の形成に適していると概してみなされる酸については、例えば、P. Stahl et al., Camille G. (ed), Handbook of Pharmaceutical Salts. Properties, Selection and Use (2002), Zurich: Wiley-VCH, S. Berge et al., Journal of Pharmaceutical Sciences (1977), 66(1) 1-19; P. Gould, International J. of Pharmaceutics (1986), 33, 201-217頁; Anderson et al., The Practice of Medicinal Chemistry (1996), Academic Press, New York; The Orange Book (Food & Drug Administration, Washington, D.C., 同局のウェブサイト上にて) で考察されている。これらの開示は、参照により本明細書に組み込まれる。

10

【1421】

塩基性塩の例には、アンモニウム塩、ナトリウム、リチウムおよびカリウム塩等のアルカリ金属塩、カルシウムおよびマグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩、ジシクロヘキシルアミン、*t*-ブチルアミン等の有機塩基 (例えば、有機アミン) との塩、ならびにアルギニン、リシン等のアミノ酸との塩などがある。塩基性窒素含有基は、ハロゲン化低級アルキル (例えば、塩化、臭化およびヨウ化メチル、塩化、臭化およびヨウ化エチル、ならびに塩化、臭化およびヨウ化ブチル)、硫酸ジアルキル (例えば、硫酸ジメチル、硫酸ジエチルおよび硫酸ジブチル)、長鎖ハロゲン化物 (例えば、塩化、臭化およびヨウ化デシル、塩化、臭化およびヨウ化ラウリル、ならびに塩化、臭化およびヨウ化ステアリル)、アラキルハロゲン化物 (例えば、臭化ベンジルおよび臭化フェネチル) 等の作用物質によって四級化することができる。

20

【1422】

そのような酸塩および塩基塩はすべて、本発明の範囲内の製薬上許容される塩であるものであり、すべての酸塩および塩基塩は、本発明に関して相当する化合物の遊離型と等価であるとみなされる。

30

【1423】

本化合物の製薬上許容されるエステルは、下記の群を含む: (1) ヒドロキシ基のエステル化によって得られるカルボン酸エステル、ここで、そのエステルグループのカルボン酸部の非カルボニル部分は、直鎖または分岐鎖のアルキル (例えば、アセチル、*n*-プロピル、*t*-ブチルまたは *n*-ブチル)、アルコキシアルキル (例えば、メトキシメチル)、アラキル (例えば、ベンジル)、アリーロキシアルキル (例えば、フェノキシメチル)、アリール (例えば、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルもしくは C_{1-4} アルコキシまたはアミノで場合によって置換されているフェニル) から選択される; (2) アルキル-またはアラキルスルホニル (例えば、メタンスルホニル) 等のスルホン酸エステル; (3) アミノ酸エステル (例えば、*L*-バリルまたは *L*-イソロイシル); (4) ホスホン酸エステルおよび (5) 一、二または三リン酸エステル。リン酸エステルは、例えば、 C_{1-20} アルコールもしくはその反応性誘導体によって、または 2, 3-ジ (C_{6-24}) アシルグリセロールによってさらにエステル化されてもよい。

40

【1424】

式 (I) の化合物、ならびにその塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグは、それらの互変異性形態で (例えば、アミド、エノール、ケトまたはイミノエーテルとして) 存在し得る。そのような互変異性形態はすべて、本発明の一部として本明細書においては考

50

えられる。

【1425】

式(I)の化合物は、不斉またはキラル中心を含有し得るものであり、したがって、異なる立体異性形態で存在し得る。式(I)の化合物のすべての立体異性形態およびラセミ混合物を含むそれらの混合物は、本発明の一部を形成することが意図されている。加えて、本発明は、すべての幾何および位置異性体を包含する。例えば、式(I)の化合物が二重結合または縮合環を組み込んでいる場合、シスおよびトランス形態の両方ならびに混合物は、本発明の範囲内に包含される。

【1426】

ジアステレオマー混合物は、例えばクロマトグラフィーおよび/または分別結晶によって等、当業者に周知の方法により、その物理化学的差異に基づいて、その個々のジアステレオマーに分離することができる。エナンチオマーは、エナンチオマー混合物を適切な光学活性化合物(例えば、キラルアルコールまたはモッシャーの酸塩化物等のキラル補助基)との反応によってジアステレオマー混合物に変換し、ジアステレオマーを分離し、個々のジアステレオマーを対応する純粋なエナンチオマーに変換する(例えば、加水分解することによって分離できる。また、式(I)の化合物のいくつかはアトロプ異性体(例えば、置換ピアリール)であってもよく、本発明の一部とみなされる。エナンチオマーは、キラルHPLCカラムの使用によって分離することもできる。

10

【1427】

式(I)の化合物が異なる互変異性形態で存在し得ることも可能であり、そのような形態はすべて本発明の範囲内に包含される。また、例えば、その化合物のケト-エノールおよびイミン-エナミン形態はすべて本発明に含まれる。

20

【1428】

エナンチオマー形態(不斉炭素の不在下であっても存在し得る)、回転異性形態、アトロプ異性体およびジアステレオマー形態を含む、種々の置換基上の不斉炭素によって存在し得る化合物等、本化合物のすべての立体異性体(例えば、幾何異性体、光学異性体等)(化合物の塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグならびにプロドラッグの塩、溶媒和物およびエステルの立体異性体を含む)は、位置異性体(例えば、4-ピリジルおよび3-ピリジル等)と同様に、本発明の範囲内に含まれるものである(例えば、式(I)の化合物が二重結合または縮合環を組み込んでいる場合、シスおよびトランス形態の両方ならびに混合物は、本発明の範囲内に包含される。また、例えば、その化合物のケト-エノールおよびイミン-エナミン形態はすべて本発明に含まれる。)。本発明の化合物の個々の立体異性体は、例えば、他の異性体が実質的になくてもよく、または、例えばラセミ体としてまたは他のすべてのもしくは他の選択された立体異性体と混合されていてもよい。本発明のキラル中心は、IUPAC 1974 Recommendationsによって定義されている通りのSまたはR配置を有し得る。「塩」、「溶媒和物」、「エステル」、「プロドラッグ」という用語等の使用は、本発明の化合物のエナンチオマー、立体異性体、回転異性体、互変異性体、位置異性体、ラセミ体またはプロドラッグの塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグに等しく当てはまるものである。

30

【1429】

本発明は、1個または複数の原子が、自然界で通常見られる原子質量または質量数とは異なる原子質量または質量数を有する原子によって置き換えられているという事実を除いては、本明細書において列挙されているものと同一である、本発明の同位体標識された化合物も包含する。本発明の化合物に組み込まれ得る同位体の例は、それぞれ ^2H 、 ^3H 、 ^{11}C 、 ^{13}C 、 ^{14}C 、 ^{15}N 、 ^{18}O 、 ^{17}O 、 ^{31}P 、 ^{32}P 、 ^{35}S 、 ^{18}F 、 ^{36}Cl および ^{123}I 等、水素、炭素、窒素、酸素、リン、フッ素および塩素およびヨウ素の同位体を含む。

40

【1430】

ある種の同位体標識された式(I)の化合物(例えば、 ^3H および ^{14}C で標識されたもの)は、化合物および/または基質組織分布アッセイにおいて有用である。トリチウム

50

化した（すなわち³H）および炭素-14（すなわち¹⁴C）同位体は、それらの製造の容易さおよび検出性から特に好ましい。ある種の同位体標識された式（I）の化合物は、医用画像目的に有用であることができる。例えば、¹¹Cまたは¹⁸Fのような陽電子放出同位体で標識されたものは、陽電子放射型断層撮像法（PET）での適用に有用であることができ、¹²³Iのようなガンマ線放出同位体で標識されたものは、単一光子放射断層撮影（SPECT）での適用に有用であることができる。さらに、重水素（すなわち²H）等のより重い同位体による置換は、より高い代謝安定性に起因する一定の治療的利点（例えば、インビボ半減期の増大または必要用量の減少）をもたらし得るものであることから、状況によっては好ましい場合がある。さらに、重水素（すなわち、²H）などのより重い同位体による置換は、より高い代謝安定性に起因するいくつかの治療的利点（例えば、インビボ半減期の増大または必要用量の減少）をもたらし得るものであることから、状況によっては好ましい場合がある。加えて、エピマー化が起きる部位での同位体置換はエピマー化プロセスを緩慢化または減少させ得ることから、化合物のより活性または効果的な形態をより長い期間保持させ得る。同位体標識された式（I）の化合物、特により長い半減期（ $T_{1/2} > 1$ 日）を有する同位体を含むものは、概して、非同位体標識試薬を適切な同位体標識試薬で代用することによって、本明細書の以下の図式および/または実施例で開示されている手順に類似する下記の手順により調製できる。

【1431】

式（I）の化合物の多形形態ならびに式（I）の化合物の塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグの多形形態は、本発明に含まれるものである。

【1432】

本発明による化合物は、薬理学的特性を有し得るものであり、特に、式（I）の化合物は、ガンマセクレターゼの調節剤（阻害剤、拮抗薬等を含む）となり得る。

【1433】

より具体的には、式（I）の化合物は、例えば、アルツハイマー病、AIDS関連認知症、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、網膜色素変性、脊髄性筋萎縮症および小脳変性症等を含むがこれらに限定されない、中枢神経系の多様な障害の治療において有用となり得る。

【1434】

本発明の別の態様は、治療上有効量の少なくとも1種の式（I）の化合物、または前記化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグを、中枢神経系の疾患または状態に罹患している哺乳動物（例えばヒト）に投与することにより、その哺乳動物を治療する方法である。

【1435】

好ましい用量は、約0.001から500mg/kg/日の式（I）の化合物である。特に好ましい用量は、約0.01から25mg/kg/日の式Iの化合物、または前記化合物の製薬上許容される塩もしくは溶媒和物である。

【1436】

本発明の化合物は、1以上の上記に掲載されたさらなる作用物質との組合せ（一緒にまたは順次に投与する）でも有用となり得る。

【1437】

本発明の化合物は、A 抗体阻害剤、ガンマセクレターゼ阻害剤およびベータセクレターゼ阻害剤からなる群から選択される1以上の化合物との組合せ（一緒にまたは順次に投与する）でも有用となり得る。

【1438】

固定用量として調合される場合、そのような組合せ生成物は、本明細書に記載されている用量範囲内の本発明の化合物およびその用量範囲内の他の医薬活性剤または治療薬を用いる。

【1439】

したがって、1態様において、本発明は、ある量の少なくとも1種の式（I）の化合物

10

20

30

40

50

、またはその製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグ、およびある量の1種もしくは複数の上記に掲載されたさらなる作用物質を含む組合せを含み、ここで、その化合物/治療薬の量は所望の治療効果をもたらす。

【1440】

本発明の化合物の薬理特性は、いくつかの薬理学的アッセイによって確認できる。いくつかのアッセイを本書において後に例示する。

【1441】

本発明は、少なくとも1種の式Iの化合物、または前記化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグ、および少なくとも1種の製薬上許容される担体を含む医薬組成物に関するものでもある。

10

【1442】

本発明によって記載されている化合物から医薬組成物を製造するための、不活性な製薬上許容される担体は、固体または液体のいずれであってもよい。固体製剤は、散剤、錠剤、分散性顆粒剤、カプセル剤、カシェ剤および坐剤を含む。散剤および錠剤は、約5から約95パーセントの有効成分で構成されていてよい。適切な固体担体は当技術分野において公知であり、例えば、炭酸マグネシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、糖またはラクトースである。錠剤、散剤、カシェ剤およびカプセル剤は、経口投与に適した固体製剤として使用され得る。製薬上許容される担体の例および種々の組成物の製造方法は、A. Gennaro (ed.), Remington's Pharmaceutical Sciences, 18 (1990), Mack Publishing Co., Easton, Pennsylvaniaにある。

20

【1443】

液体製剤は、液剤、懸濁剤および乳剤を含む。例として言及され得るのは、非経口注射または甘味料の添加用の水または水-プロピレングリコール液剤、ならびに経口溶液、懸濁剤および乳剤用の乳白剤である。液体形態製剤には、鼻腔内投与用の溶液もあり得る。

【1444】

吸入に適したエアロゾル製剤は、不活性圧縮ガス、例えば窒素等の製薬上許容される担体と組み合わせられていてよい、溶液および粉末形態の固体を含み得る。

【1445】

使用直前に、経口または非経口投与いずれか用の液体製剤に変換するための固体製剤も含まれる。そのような液体形態は、溶液、懸濁液および乳濁液を含む。

30

【1446】

本発明の化合物は、経皮的に送達可能であってもよい。経皮組成物は、クリーム、ローション、エアロゾルおよび/または乳濁液の形態をとってよく、これに関して当技術分野において慣例的であるように、マトリックス型または貯蔵型の経皮パッチに含まれていてよい。

【1447】

本発明の化合物は、皮下送達することもできる。

【1448】

好ましくは、化合物は経口投与される。

40

【1449】

好ましくは、医薬製剤は単位製剤である。そのような形態において、製剤は、適量の、例えば所望の目的を達成するために有効な量の活性成分を含有する適切にサイズ決定された単位用量に細分される。

【1450】

単位用量の製剤における活性化合物の分量は、特定の用途により、約1mgから約100mg、好ましくは約1mgから約50mg、より好ましくは約1mgから約25mgで変動または調整できる。

【1451】

用いられる実際の用量は、患者の必要条件および治療される状態の重度に応じて変動し

50

得る。特定の状況のための適正な投薬計画の決定は、当技術分野の技量の範囲内である。便宜上、総日用量を分割し、必要に応じて1日の中で分けて投与してよい。

【1452】

本発明の化合物および/または製薬上許容されるその塩の投与の量および回数は、患者の年齢、状態および大きさならびに治療される症状の重度等の要因を考慮して、担当臨床医の判断によって調節される。経口投与のための代表的な推奨1日投与法は、2から4回の分割量で、約1mg/日から約500mg/日、好ましくは1mg/日から200mg/日の範囲であってよい。

【1453】

本発明の別の態様は、治療有効量の少なくとも1種の式(I)の化合物、または前記化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグ、および製薬上許容される担体、媒体または希釈剤を含むキットである。

10

【1454】

本発明のさらに別の態様は、ある量の少なくとも1種の式(I)の化合物、または前記化合物の製薬上許容される塩、溶媒和物、エステルもしくはプロドラッグ、およびある量の少なくとも1種の上記に列挙したさらなる作用物質を含むキットであり、ここで、その2種以上の成分の量が所望の治療効果をもたらす。

【1455】

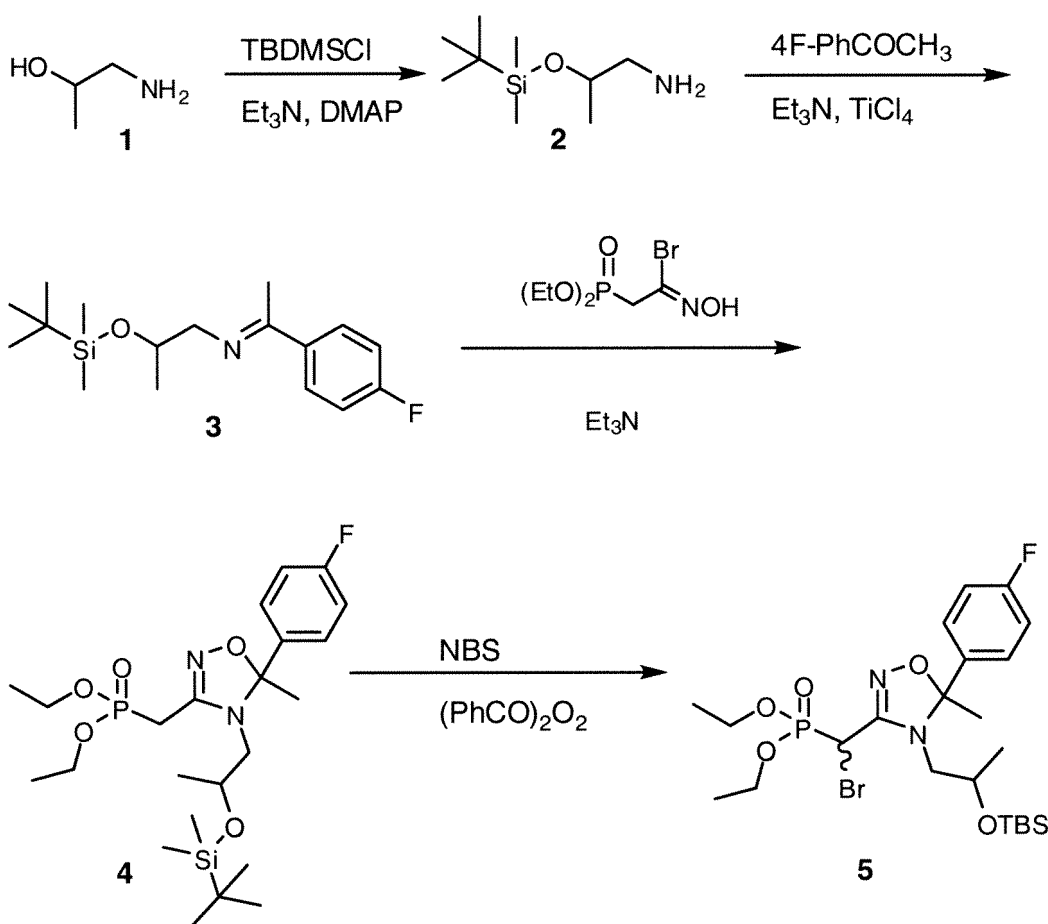
本明細書において開示されている発明を、下記の説明的な図式および実施例によって例示するが、これらは本開示の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。代替的な機構経路および類似構造が当業者には明らかであろう。

20

【1456】

実施例1

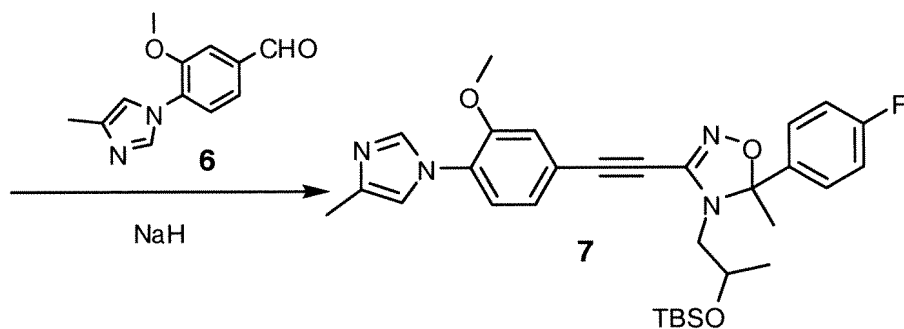
【化184】



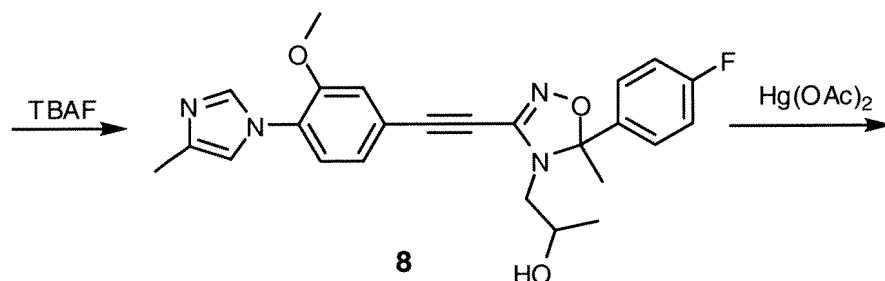
30

40

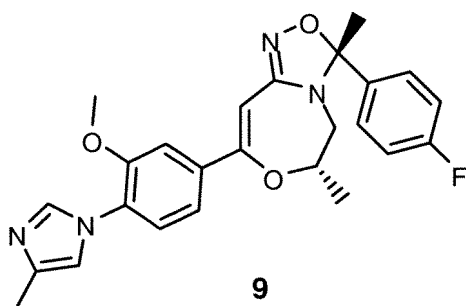
50



10



20



【 1 4 5 7 】

段階 1

30

1 (5 . 0 g 、 6 7 m m o l) 、 トリエチルアミン (9 m L 、 6 7 m m o l) および DMAP (5 0 0 m g 、 4 . 1 m m o l) の塩化メチレン (8 0 m L) 中溶液に、TBDMSCl (1 0 . 5 g 、 7 0 m m o l) を加え、反応溶液を室温で 1 2 時間攪拌した。水を加え、層を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、有機相を無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮して、生成物 2 1 0 . 6 g を得た。

【 1 4 5 8 】

段階 2

40

2 (1 0 . 0 g 、 5 2 . 8 m m o l) および 4 - フルオロアセトフェノン (6 . 6 4 g 、 4 8 . 0 m m o l) の DMF (4 8 m L) および DCM (1 3 m L) 混合液中溶液に、トリエチルアミン (3 4 g 、 3 3 6 m m o l) を加えた。反応溶液を冷却して 0 とし、塩化チタン (IV) (8 . 7 g 、 4 5 . 6 m m o l) の DCM (5 m L) 中溶液を 3 0 分間かけて滴下した。得られた溶液を 4 0 で 1 時間、次に室温で 1 2 時間攪拌した。エーテルで希釈し、濾過によって透明とし、濾液を冷水、ブラインで洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を減圧下に除去して、生成物 3 1 4 . 3 g を得た。

【 1 4 5 9 】

段階 3

N - プロモコハク酸アミド (3 . 6 g 、 2 0 . 5 m m o l) の DMF (2 0 m L) 中溶液を、ホスホン酸ジエチル 2 - (ヒドロキシイミノ) - エチル (4 . 0 g 、 2 0 . 5 m m o l) [*Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* , 1 5 (1) , 2 3 1 - 2 3 4 ; 2 0 0 5] の DMF (5 0 m L) 中溶液に

50

- 20 で15分間かけて滴下した。反応溶液を - 20 で30分間攪拌してから、ゆっくり昇温させて0 とし、その温度で2時間維持した。3 (6.3 g 20.5 mmol) およびトリエチルアミン (2.1 g、20.5 mmol) のDCM (25 mL) 中混合物をゆっくり加え、反応溶液を室温で12時間攪拌した。溶媒を減圧下に除去し、残留物を酢酸エチルに溶かした。有機相をブラインで洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物を、シリカゲル (ヘキサン : 酢酸エチル = 100 : 0 から 0 : 100) を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製して、生成物4 1.53 gを得た。

【1460】

段階4

4 (760 mg、2.0 mmol) のCCl₄ (15 mL) 中溶液に、NBS (383 mg、2.2 mmol) を加え、反応溶液を室温で1時間攪拌した。触媒量の過酸化ベンゾイル (48 mg、0.2 mmol) を加え、反応溶液を60 で12時間攪拌した。反応溶液を濾過によって透明とし、濾液を減圧下に濃縮した。残留物を酢酸エチルで希釈し、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液およびブラインで洗浄した。有機相を無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮して、生成物5 955 mgを1 : 1混合物として得て、それを次の反応にそのまま用いた。

【1461】

段階5

5 (860 mg、1.5 mmol) および6 (318 mg、1.5 mmol) [US 2007/0219181 A1、62頁] のTHF (20 mL) 中溶液に室温で、水素化ナトリウム (90 mg、2.3 mmol、60%) を全量1回で加え、反応溶液を室温で12時間攪拌した。反応溶液を水で反応停止し、酢酸エチルで抽出した。有機相を無水硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をDMF (10 mL) に溶かし、水素化ナトリウム (90 mg、2.3 mmol、60%) で処理した。反応溶液を室温で1時間攪拌してから、それを水で反応停止した。層を分離し、有機層を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。残留物を、シリカゲル (ヘキサン : トリエチルアミン = 99 : 1) を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製して、生成物7 426 mgを得た。

【1462】

段階6

7 (400 mg、0.71 mmol) のTHF (10 mL) 中溶液を氷冷しながら、それにフッ化テトラブチルアンモニウム (2.5 mL、1 M THF 中溶液) を加え、反応溶液を0 で12時間攪拌した。反応溶液を減圧下に濃縮し、残留物を酢酸エチルで希釈した。有機相を0.5 N HClで洗浄し、無水硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物を、シリカゲル (ヘキサン : 酢酸エチル = 100 : 0 から 0 : 100) を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製して生成物8、141 mgを得た。

【1463】

段階7

8 (32 mg、0.07 mmol) のCHCl₃ (2 mL) 中溶液に、トリフルオロ酢酸水銀 (II) (31 mg、0.07 mmol) を加え、反応混合物を室温で12時間攪拌した。粗取得物を、シリカゲル (メタノール : 酢酸エチル = 10 : 90) を用いるカラムクロマトグラフィーによって精製して、生成物9 10 mgを得た。

【1464】

化合物9

¹H-NMR (CDCl₃) (ppm) : 7.73 (s、1H)、7.53 (m、2H)、7.28 (m、3H)、7.11 (m、2H)、6.93 (s、1H)、5.93 (s、1H)、4.55 (m、1H)、3.85 (s、3H)、3.13 (m、2H)、2.30 (s、3H)、1.90 (s、3H)、1.45 (d、3H、J = 6.4 Hz)。MS (ES-LCMS、M+1) 449。

10

20

30

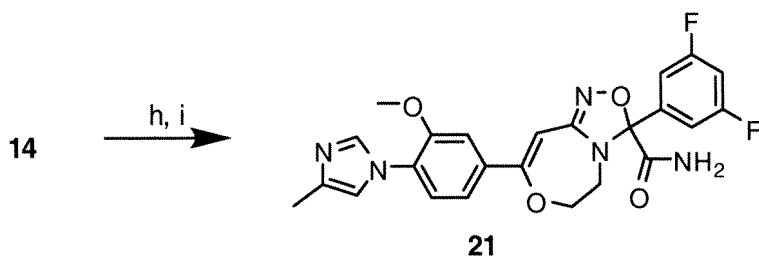
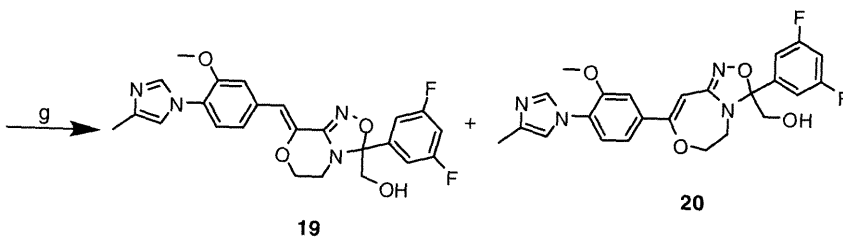
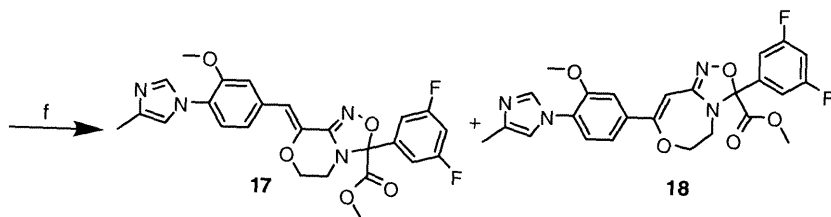
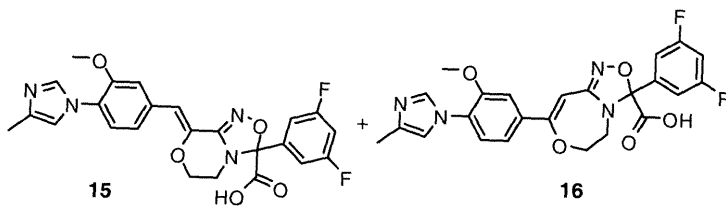
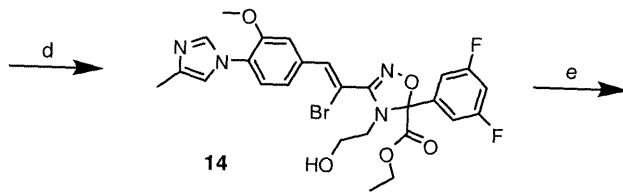
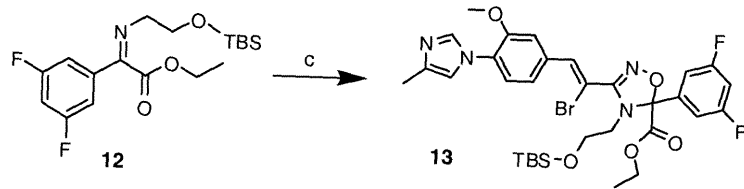
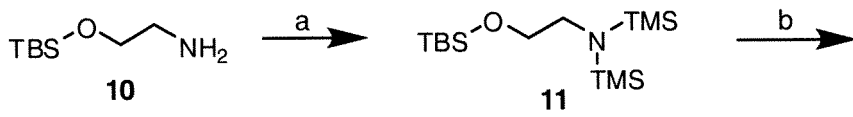
40

50

【 1 4 6 5 】

实施例 2

【 化 1 8 5 】



【 1 4 6 6 】

10

20

30

40

50

段階 a

10 (15 g、85.5 mmol) の脱水 CH_2Cl_2 (300 mL) 中溶液に 0 で、 Et_3N (26 mL、188.2 mmol) をゆっくり加えた。冷却浴を外し、 TMSCl (24 mL、188.2 mmol) を混合物にゆっくり加えた。室温で24時間攪拌後、追加の Et_3N (12 mL、85.5 mmol) および TMSCl (11 mL、85.5 mmol) を加えた。混合物を室温でさらに24時間攪拌した。溶媒を除去し、生成物をエーテル500 mLに溶かし、セライトで濾過し、濃縮して、11 22.5 gを得た(収率82%)。

【1467】

段階 b

11 (22.5 g、70.4 mmol) および 3, 5 - ジフルオロベンゾイルギ酸エチル (11.5 g、53.7 mmol) の脱水 1, 2 - ジクロロエタン (180 mL) 中溶液に、 TMS Tf (0.5 mL、2.69 mmol) を室温に加えた。85 で24時間攪拌後、溶媒を除去し、生成物をエーテル500 mLに溶かし、 H_2O (200 mLで2回) およびブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で脱水し、濾過し、濃縮して、12 22 gを得た(収率100%)。

【1468】

段階 c

実施例1段階3および4と同様の方法で、12 (12 g) から標題化合物 13 5.7 gを得た。

【1469】

段階 d

13 (3.6 g、5.10 mmol) の MeOH (50 mL) 中溶液に、クロルギ酸 1 - クロロエチル (0.83 mL、7.65 mmol) を加えた。室温で0.5時間攪拌後、溶媒を除去し、生成物を、5% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$ を用いる ISCO によって精製して、14 2.8 gを得た(収率: 93%)。 MH^+ : 591.04。

【1470】

段階 e

14 (0.18 g、0.304 mmol) の脱水 THF/DMF (1:1) (4 mL) 中溶液に、 NaH (0.026 g、0.638 mmol) を0 で加えた。0 で45分間攪拌後、追加の NaH (0.012 g、0.304 mmol) を加え、混合物を0 でさらに1.5時間攪拌した。 THF を除去し、残留物を DMF に溶かし、濾過し、逆相 HPLC によって精製して、化合物 15 および 16 0.1 gを得た。 MH^+ : 483.3。15 および 16 の合計収率: 68%。

【1471】

段階 f

15 および 16 (0.092 g、0.19 mmol) のトルエン/ MeOH (4:1) (5 mL) 中溶液に、 TMSCHN_2 (0.2 mL、0.38 mmol) を加えた。室温で24時間攪拌後、溶媒を除去し、残留物を5% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$ を用いる ISCO によって精製して、17 および 18 0.075 gを得て(収率80%)、次に逆相 HPLC を行って、17 0.033 g および 18 0.027 gを得た。 MH^+ : 497.3。

【1472】

段階 g

18 (0.026 g、0.052 mmol) の EtOH/MeOH (1:1) (3 mL) 中溶液に、 NaBH_4 (0.008 g、0.21 mmol) を加えた。室温で1時間攪拌後、溶媒を除去し、残留物を5% $\text{MeOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$ を用いる ISCO によって精製して、20 0.02 gを得た(収率82%)。 MH^+ : 469.3。

【1473】

段階 h および 段階 i

10

20

30

40

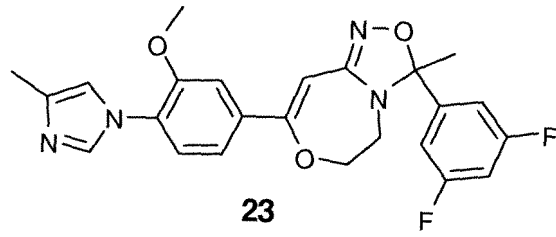
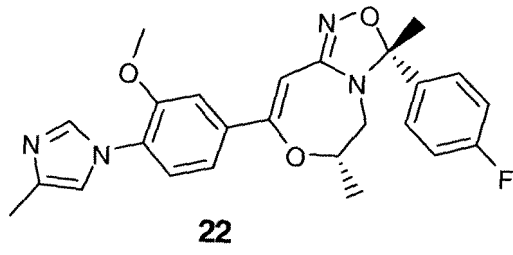
50

14 (0.10 g, 0.17 mmol) の脱水 THF / DMF (1 : 1) (4 mL) 中溶液に、LHMDS (0.42、0.42 mmol) を 0 で加えた。0 で 0.5 時間攪拌後、追加の LHMDS (0.10 mL, 0.10 mmol) を加え、混合物を 0 でさらに 1.5 時間攪拌した。THF を除去し、残留物を 10% MeOH / CH₂Cl₂ および NH₄Cl 水溶液で抽出し、Na₂SO₄ で脱水し、濾過した。濾液を濃縮し、段階 g での TMSCHN₂ で処理して (段階 d と同じ)、21 0.008 g を得た。MH⁺ : 482.3。

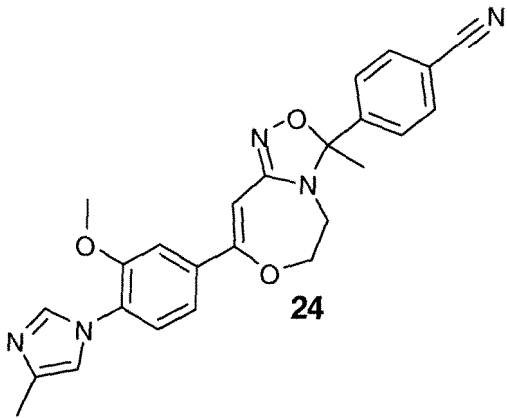
【1474】

実施例 1 および 2 のものと同様の手順に従って、下記の化合物を製造した。

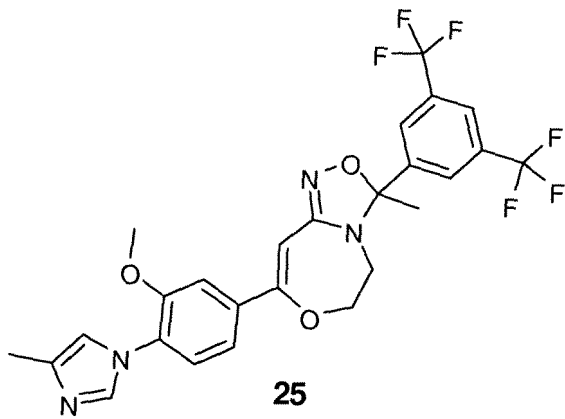
【化 1 8 6】



10

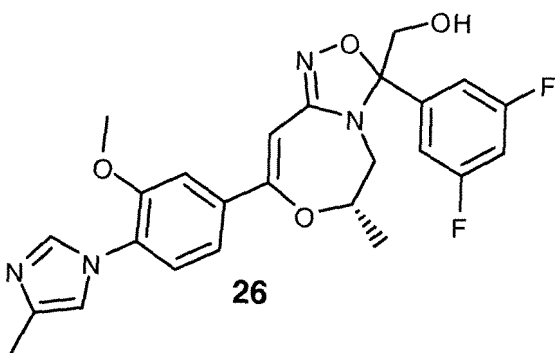


20



30

and

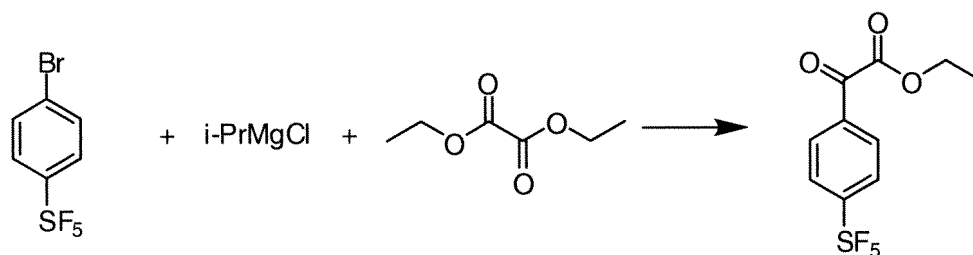


40

【 1 4 7 5 】

実施例 3

【化 1 8 7】



【 1 4 7 6】

10

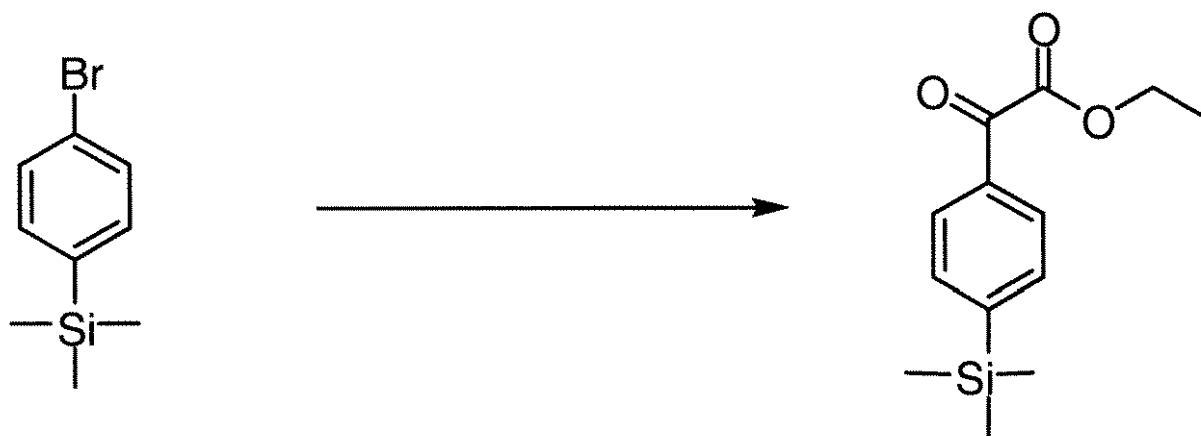
4 - ブロモフェニル硫黄・ペンタブロマイド (5 . 2 g、1 8 . 4 m m o l) を T H F 5 0 m L に溶かし、反応液を冷却して - 4 0 とした。イソプロピルマグネシウムクロライド・塩化リチウム錯体 (1 . 3 M の T H F 中溶液、1 4 . 1 m L) を加え、反応液を 2 時間攪拌しながら、その間に浴温は 0 まで上昇した。この溶液をカニュレを用いて、シュウ酸ジエチル (2 . 6 8 g、1 8 . 4 m m o l) の T H F (5 0 m L) 中溶液に - 7 8 で移し入れた。反応液を 3 時間攪拌しながら、その間に温度は室温までゆっくり上昇した。水 2 0 0 m L および E t O A c 2 0 0 m L を加えた。有機層を水で洗浄し (2 0 0 m L で 2 回)、 Na_2SO_4 で脱水し、濃縮した。残留物を、カラム (E t O A c / ヘキサン : 4 5 分以内で 0 / 1 0 0 から 2 5 / 7 5) によって精製した。収量 : 2 . 0 g 。 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 4 0 0 M H z) : 8 . 1 6 (d、 $J = 8 . 8 \text{ Hz}$ 、2 H)、7 . 9 1 (d、 $J = 8 . 8 \text{ Hz}$ 、2 H)、4 . 4 7 (q、 $J = 7 . 3 \text{ Hz}$ 、2 H)、1 . 4 4 (t、 $J = 7 . 3 \text{ Hz}$ 、3 H)。

20

【 1 4 7 7】

同様の手順に従って、下記の化合物が製造される。

【化 1 8 8】



30

【 1 4 7 8】

これらの手順および当業界で公知の技術に従って、 $-\text{SF}_5$ 、 $-\text{OSF}_5$ または $-\text{Si}(\text{R}^{15})_3$ を有する化合物が製造される。

40

【 1 4 7 9】

アッセイ

細胞全体におけるセクレターゼ反応および A 分析 : スウェーデン型およびロンドン型変異で A P P を過剰発現する H E K 2 9 3 細胞を、1 0 % のウシ胎仔血清を含む D M E M 培地 1 0 0 m L の中で、5 時間 3 7 で、指定された化合物で処理した。インキュベーション終了後、A、A 4 0 および A 4 2 の総量を、サンドイッチ免疫アッセイをもとにした電気化学発光法 (E C L) を使用して測定した。A の総量を、抗体 T A G - W 0 2 とビオチン - 4 G 8 のペアを使用して測定した。A 4 0 を T A G - G 2 - 1 0 とビオチン - 4 G 8 との抗体ペアで特定し、A 4 2 を T A G - G 2 - 1 1 およびビオチン - 4

50

G 8で特定した。ECLシグナルを、SectorImager2400(Meso Scale Discovery)を使用して測定した。

【1480】

A プロファイルのMS分析：馴化培地中におけるA プロファイルを、表面増強レーザー脱離/イオン化(SELDI)質量分析法を使用して測定した。馴化培地を、抗体W02をコーティングしたPS20タンパク質チップアレイでインキュベートした。アレイ上に捕捉されたA の質量スペクトルを、SELDI ProteinChip Reader(Bio-Rad)で、メーカーの説明書に従って読み取った。

【1481】

CSFA 分析：ラットCSFにおけるA を、上述した通りのMSD技術を使用して決定した。A 40を、Tag-G2-10とビオチン-4G8の抗体ペアを使用して測定する一方、A 42を、Tag-抗A 42(Meso Scale Discovery)およびビオチン-4G8を使用して測定した。ECLシグナルは、SectorImager2400(Meso Scale Discovery)を使用して測定した。

10

【1482】

A のマトリックス支援レーザー脱離/イオン化質量分析法(MALDI MS)分析を、 Voyager-DESTR質量分析計(ABI, Framingham, MA)で実施する。その装置は、パルス型の窒素レーザー(337nm)を備えている。質量スペクトルは、20kVの加速電圧を用いて線形モードで取得する。この試験で示される各スペクトルは、平均256レーザーショットを示す。試料-マトリックス溶液を製造するために、免疫沈降A 試料1μLを、0.1%TFA/アセトニトリル中の飽和 -シアノ-4-ヒドロキシ桂皮酸溶液3μLと混合する。試料-マトリックス溶液を、次いで、試料プレートに塗布し、周辺温度で乾燥し、続いて質量分析法分析を行う。すべてのスペクトラムを、ウシインスリンとACTHとの混合物を用いて外部較正する(18から39クリップ)。

20

【1483】

化合物15から26は、約51から約13932nMの範囲内のA 42 IC₅₀を有していた。

【1484】

本発明を、上記に示した特定の実施形態とともに説明してきたが、当業者には、多くのこの代替形態、改変形態および他の変更形態が明らかであろう。そうしたすべての代替形態、改変形態および変更形態は、本発明の精神および範囲内に包含されるものとする。

30

【手続補正書】

【提出日】平成23年8月23日(2011.8.23)

【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

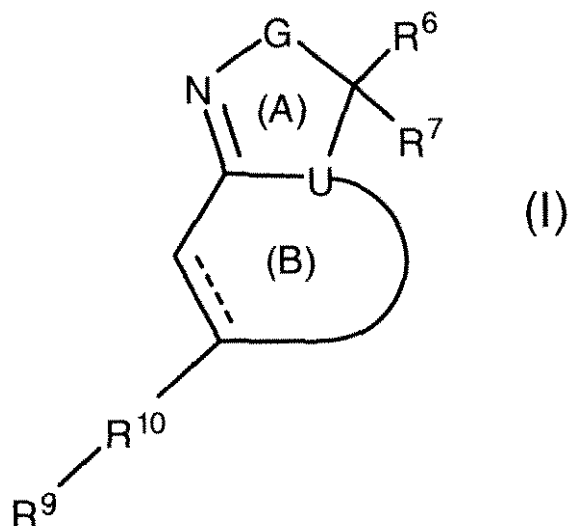
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化 1】



〔式中、

G、U、R⁶、R⁷、R⁹およびR¹⁰は独立に選択され；

式（I）における文字（A）および（B）は、式（I）に存在する環を識別するための参照文字であり；

GはC（O）、OおよびSからなる群から選択され；

UはCR⁵またはNであり；

環（B）における点線は存在しても良い結合を表し；

環（B）は5から8個の員環であり（環（A）と共通の原子を含む）、（1）UがCR⁵である場合、前記環（B）は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個のヘテロ原子を含んでいても良く、（2）UがNである場合、前記環（B）は独立にO、NR²およびSからなる群から選択される1から2個の別のヘテロ原子を含んでいても良く；前記環（B）は1から5個の独立に選択されるR²¹基で置換されていても良く；

R⁵は、H、アルキル-、アルケニル-およびアルキニル-、アリール-、アリールアルキル-、アルキルアリール-、シクロアルキル-、シクロアルキルアルキル-、ヘテロアリール-、ヘテロアリールアルキル-、複素環-および複素環アルキル-からなる群から選択され；前記R⁵アルキル-、アルケニル-、アルキニル-、アリール-、アリールアルキル-、アルキルアリール-、シクロアルキル-、シクロアルキルアルキル-、ヘテロアリール-、ヘテロアリールアルキル-、複素環-および複素環アルキル-基のそれぞれは1から5個の独立に選択されるR²¹置換基で置換されていても良く；

R⁶およびR⁷はそれぞれ独立にH、-C（O）R¹⁵、-C（O）OR¹⁵、-C（O）N（R¹⁵）（R¹⁶）、-C（=NOR¹⁵）R¹⁶、アルキル-、アルケニル-およびアルキニル-、アリール-、アリールアルキル-、アルキルアリール-、シクロアルキル-、シクロアルキルアルキル-、ヘテロアリール-、ヘテロアリールアルキル-、複素環-および複素環アルキル-、ベンゾ縮合シクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；前記R⁶およびR⁷アルキル-、アルケニル-、アルキニル-、アリール-、アリールアルキル-、アルキルアリール-、シクロアルキル-、シクロアルキルアルキル-、ヘテロアリール-、ヘテロアリールアルキル-、複素環-、複素環アルキル-、ベンゾ縮合シクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルおよび縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル基のそれぞれは1から5個の独立に選択されるR²¹置換基で置換されていても良く；または

R⁶およびR⁷がそれらが結合している炭素原子と一体となって、スピロ環状炭素環部分またはスピロ環状複素環部分を形成しており、

(a) 前記スピロ環状炭素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

(b) 前記スピロ環状複素環部分は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く、

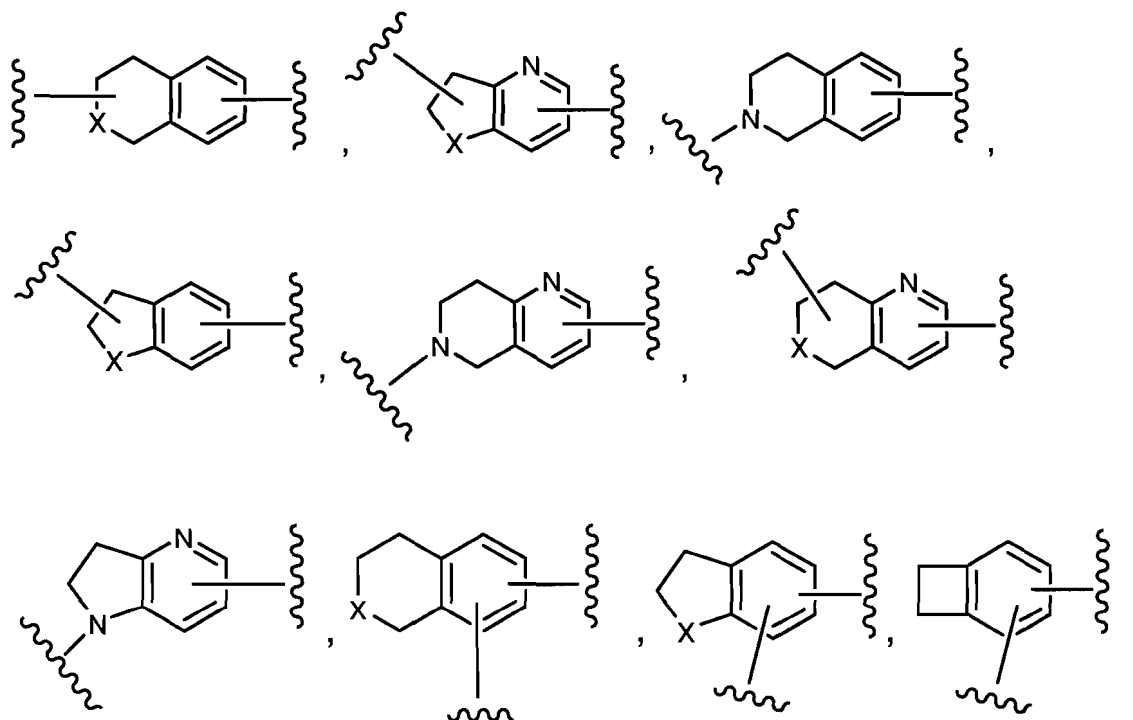
(c) 前記スピロ環状炭素環部分がアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

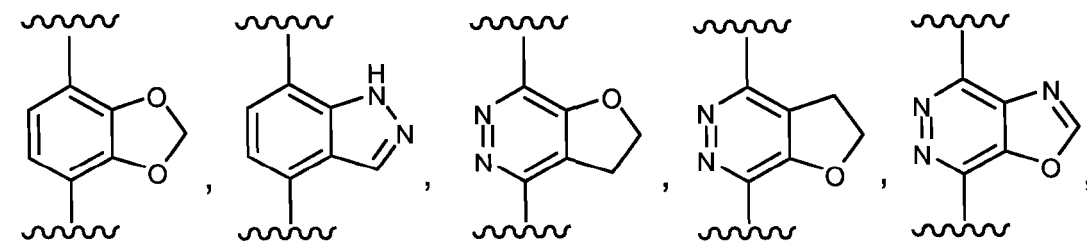
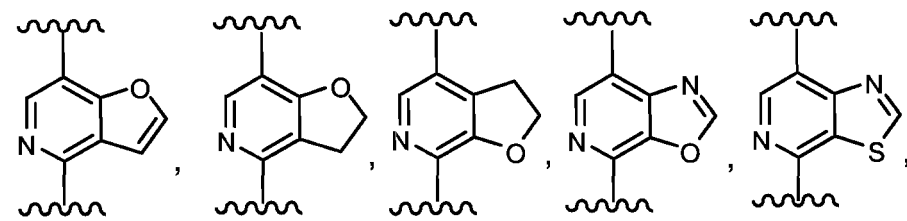
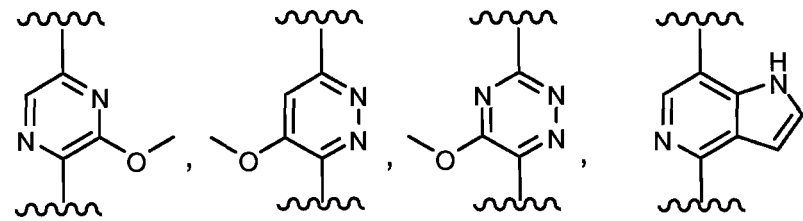
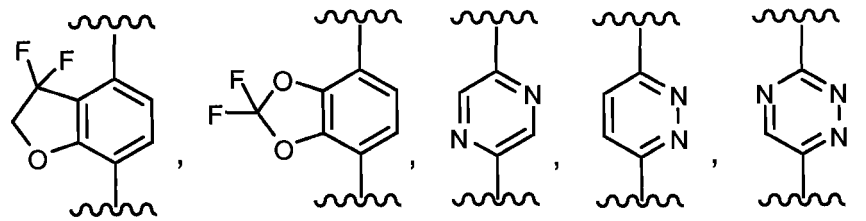
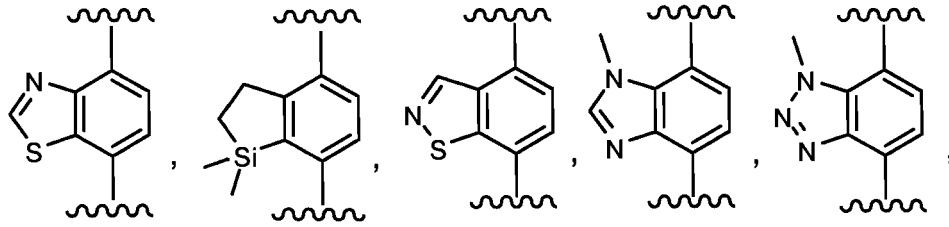
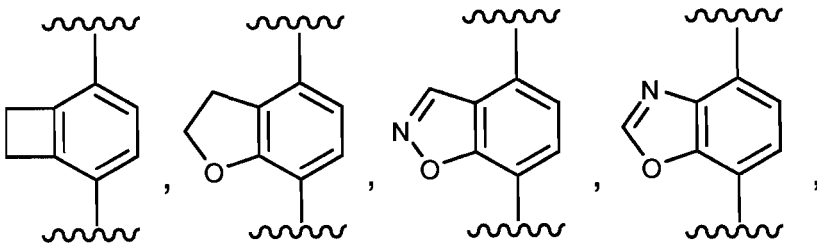
(d) 前記スピロ環状複素環部分はアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環と縮合して縮合環部分を形成していても良く、前記縮合環部分の各環は 1 から 4 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 置換基で置換されていても良く；

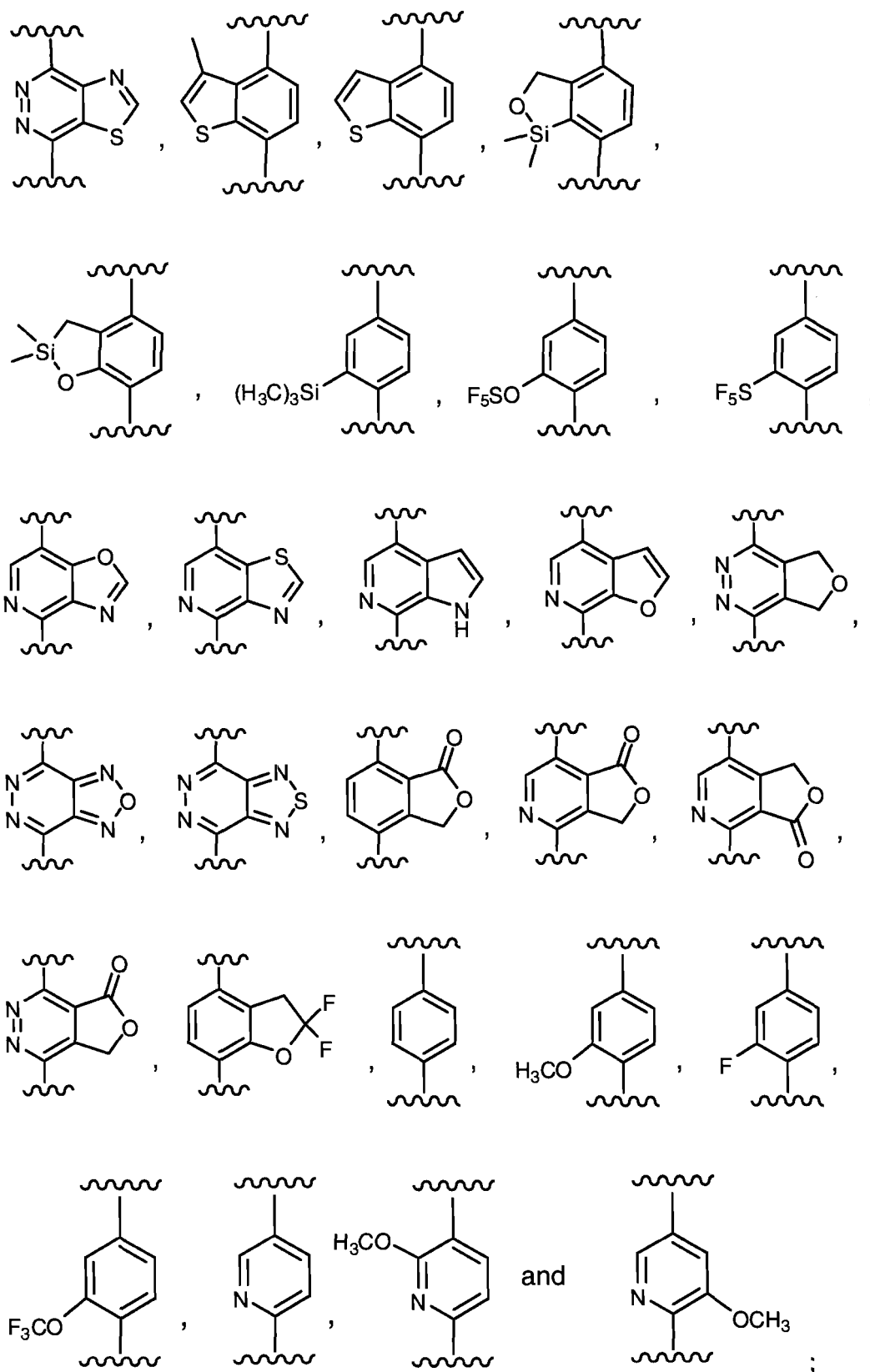
R^9 は、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選択され、各 R^9 基は 1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されていても良く；

R^{10} は、結合、アルキル -、アルケニル -、アルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 -、複素環アルキル -、

【化 2】







からなる群から選択され；

Xは、O、N (R^{14}) またはSからなる群から選択され；前記 R^{10} 基のそれぞれは1から3個の独立に選択される R^{21} 置換基で置換されていても良く；

R^9 は、アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - からなる群から選

扱われ；前記アルキル -、アルケニル - およびアルキニル -、アリール -、アリールアルキル -、アルキルアリール -、シクロアルキル -、シクロアルキルアルキル -、ヘテロアリール -、ヘテロアリールアルキル -、複素環 - および複素環アルキル - 基のそれぞれは置換されていないか、同一もしくは異なることができる 1 から 3 個の置換基で独立に置換されていることができ、各置換基は独立に下記に示す部分からなる群から選択され；

R^{14} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、アリール、アリールアルキル -、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、-CN、-C(O) R^{15} 、-C(O)OR 15 、-C(O)N(R^{15})(R^{16})、-S(O)N(R^{15})(R^{16})、-S(O)₂N(R^{15})(R^{16})、-C(=NOR 15) R^{16} および -P(O)(OR 15)(OR 16) からなる群から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロシクレニル、複素環アルキル、複素環アルケニル -、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキル基のそれぞれは独立に置換されていないか 1 から 5 個の R^{21} 基で置換されており；

各 R^{15A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル -、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅ - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアルキル -、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})₁₋₅ - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

各 R^{16A} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅ - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアルキル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})₁₋₅ - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

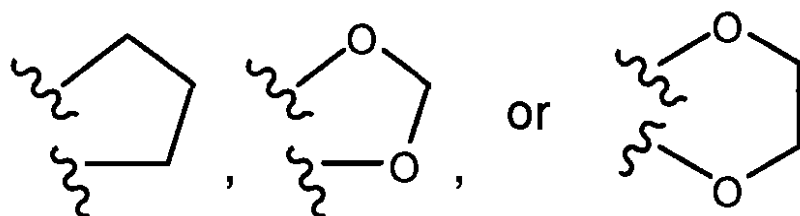
R^{15} 、 R^{16} および R^{17} は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリール複素環、(R^{18})₁₋₅ - アルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキル、(R^{18})₁₋₅ - シクロアルキルアルキル、(R^{18})₁₋₅ - 複素環、(R^{18})₁₋₅ - 複素環アルキル、(R^{18})₁₋₅ - アリール、(R^{18})₁₋₅ - アリールアルキル、(R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールおよび (R^{18})₁₋₅ - ヘテロアリールアルキルからなる群から独立に選択され；各基における各 R^{18} は、いずれか置換可能な原子上にあることができ；

各 R^{18} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、-NO₂、ハロ、ヘテロアリール、HO - アルキル、CF₃、-CN、アルキル - CN、-C(O) R^{19} 、-C(O)OH、-C(O)OR 19 、-C(O)NHR 20 、-C(O)NH₂、-C(O)NH₂ - C(O)N(アルキル)₂、-C(O)N(アルキル)(アリール)、-C(O)N(アルキル)(ヘテロアリール)、-SR 19 、-S(O)₂R 20 、-S(O)NH₂、-S(O)NH(アルキル)、-S(O)N(アルキル)(アルキル)、-S(O)NH(アリール)、-S(O)₂NH₂、-S(O)₂NHR 19 、-S(O)₂NH(複素環)、-S(O)₂N(アルキル)₂、-S(O)₂N(アルキル)(アリール)、-OCF₃、-OH、-OR 20 、-O - 複素環、-O - シクロアルキルアルキル、-O - 複

素環アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{20}$ 、 $-N(\text{アルキル})_2$ 、 $-N(\text{アリーールアルキル})_2$ 、 $-N(\text{アリーールアルキル})-(\text{ヘテロアリーールアルキル})$ 、 $-NHC(O)R^{20}$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NH(\text{アルキル})$ 、 $-NHC(O)N(\text{アルキル})(\text{アルキル})$ 、 $-N(\text{アルキル})C(O)MH(\text{アルキル})$ 、 $-N(\text{アルキル})C(O)N(\text{アルキル})(\text{アルキル})$ 、 $-NHS(O)_2R^{20}$ 、 $-NHS(O)_2NH(\text{アルキル})$ 、 $-MHS(O)_2N(\text{アルキル})(\text{アルキル})$ 、 $-N(\text{アルキル})S(O)_2NH(\text{アルキル})$ および $-N(\text{アルキル})S(O)_2N(\text{アルキル})(\text{アルキル})$ からなる群から独立に選択され；

または、隣接する炭素上の二つの R^{18} 部分が、それらが結合している原子と一体となつて、

【化 3】



を形成していることができ；

R^{19} は、アルキル、シクロアルキル、アリーール、アリーールアルキルおよびヘテロアリーールアルキルからなる群から選択され；

R^{20} は、アルキル、シクロアルキル、アリーール、八口置換されたアリーール、アリーールアルキル、ヘテロアリーールおよびヘテロアリーールアルキルからなる群から選択され；

各 R^{21} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリーール、アリーールアルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーールアルキル、八口、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ 、 $-Si(R^{15A})_3$ (各 R^{15A} は独立に選択される。)、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-アルキル-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16A}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16A}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16A}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15A}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ および $-S(O)_2R^{15A}$ からなる群から独立に選択され；前記アルキル、シクロアルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリーール、アリーールアルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーールアルキル、アルケニルおよびアルキニル R^{21} 基のそれぞれが 1 から 5 個の独立に選択される R^{22} 基で置換されていても良く；

各 R^{22} は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、八口、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-アルキル-C(O)OR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SF_5$ 、 $-OSF_5$ 、 $-Si(R^{15A})_3$ (各 R^{15A} は独立に選択される。)、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-アルキル-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、-

CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R^{16A}、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、=NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R^{15A}および-S(O)₂R^{15A}からなる群から独立に選択される。]

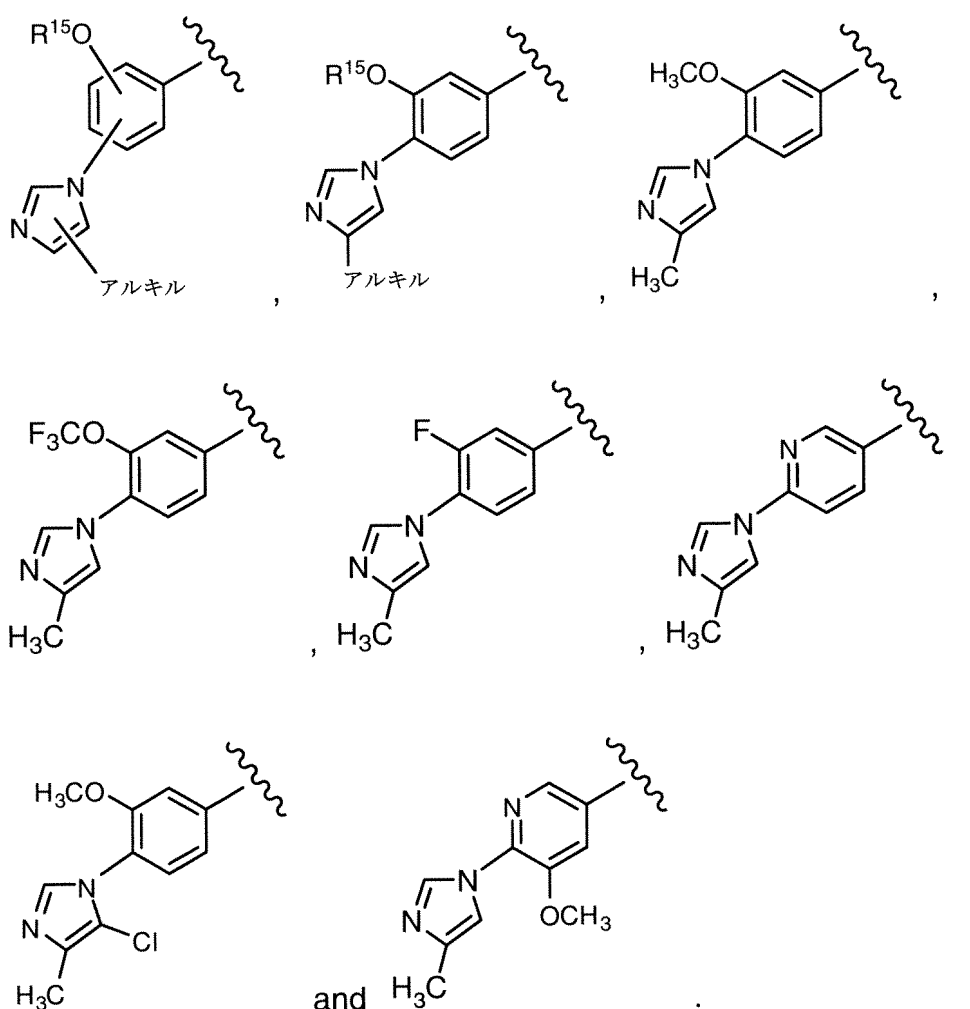
【請求項2】

前記R¹⁰が1個のR²¹基で置換されたフェニルであり、前記R⁹が1個のR²¹基で置換されたイミダゾリルであり、各R²¹が独立に選択される請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記R⁹-R¹⁰-部分が下記のものからなる群から選択される請求項1に記載の化合物。

【化4】



【請求項4】

R⁶がアルキルであり、R⁷が置換されたアリール基である請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R⁷が、

フェニル、または

1以上の独立に選択されるR²¹基で置換されたフェニル、または

1から3個の独立に選択されるR²¹基で置換されたフェニル、または

1 から 3 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、各 $R^{2,1}$ 基は同一もしくは異なるハロゲンであるフェニル、または

1 から 3 個の F で置換されたフェニル、または

1 個の -CN 基で置換されたフェニル、または

1 もしくは 2 個の -CF₃ 基で置換されたフェニル、または

$R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1,5}A)₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5}A が独立に選択されるフェニル、または

$R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1,5}A)₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5}A が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

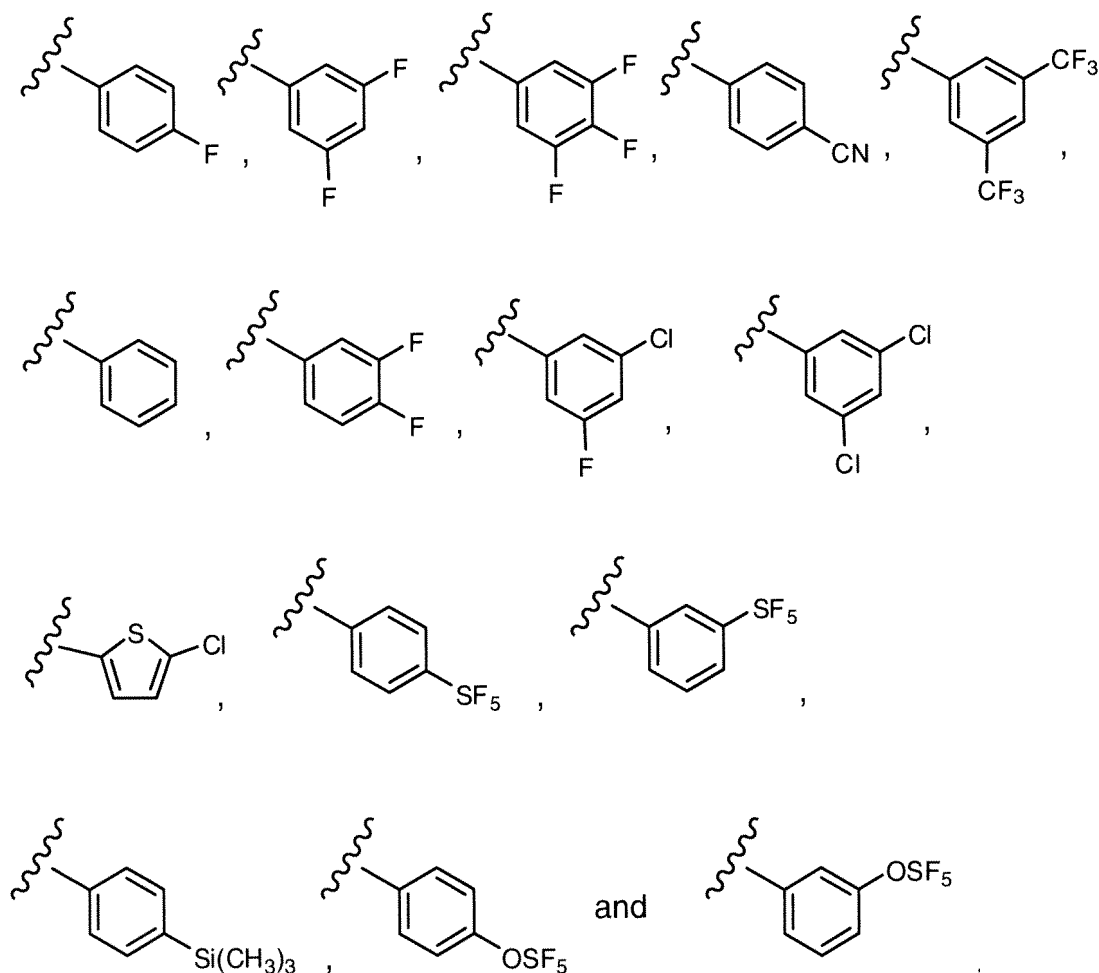
$R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1,5}A)₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5}A が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

$R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(CH₃)₃ からなる群から選択されるフェニルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R⁷ が

【化 5】



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 7】

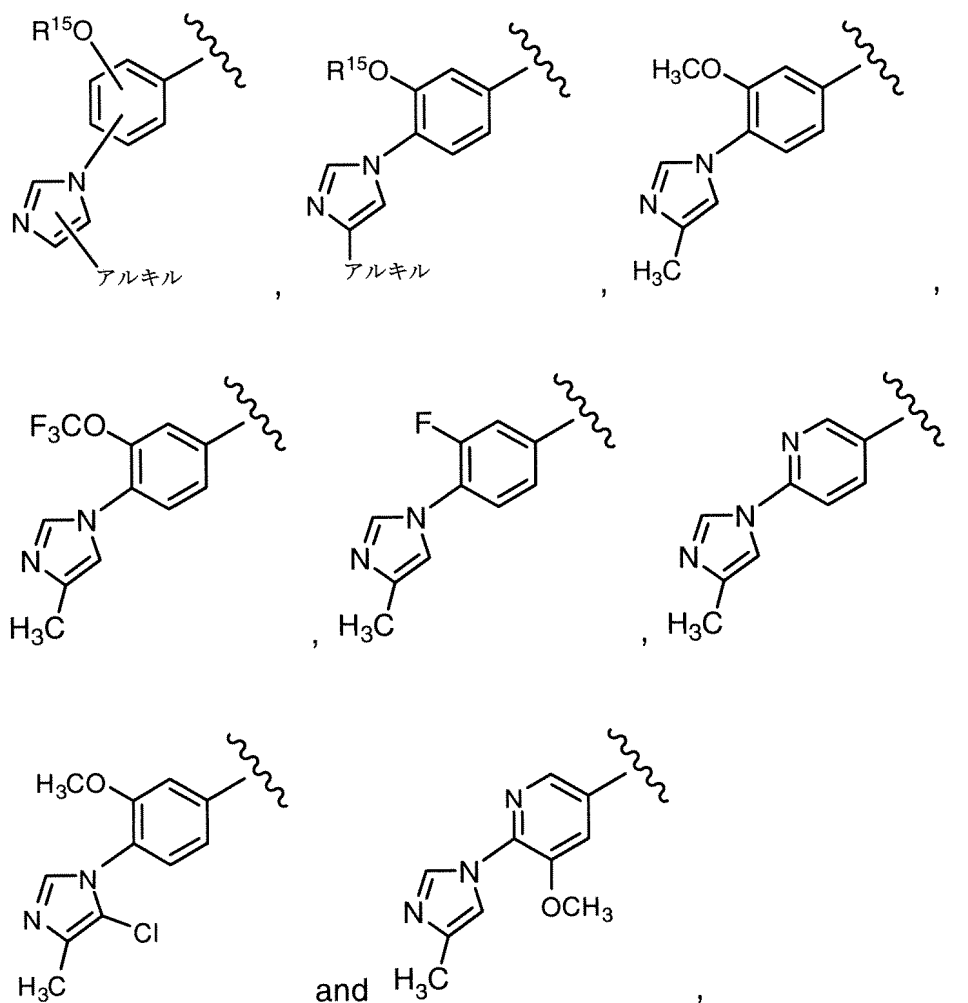
- (a) G が O であり、U が C R ⁵ であり、
- (b) G が O であり、U が N であり、
- (c) G が S であり、U が C R ⁵ であり、
- (d) G が S であり、U が N であり、
- (e) G が C (O) であり、U が C R ⁵ であり、
- (f) G が C (O) であり、U が N であり、
- (g) G が N (R ^{1 4}) であり、U が C R ⁵ であり、または
- (h) G が N (R ^{1 4}) であり、U が N である

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

- (a) 前記 R ⁹ - R ¹⁰ - 部分が

【化 8】



からなる群から選択され、(b) R ⁶ がアルキルであり、(c) R ⁷ が置換されたアリー
 ル基であり、(d) G および U が、(i) G が O であり、U が C R ⁵ である、(i i) G
 が O であり、U が N である、(i i i) G が S であり、U が C R ⁵ である、(i v) G が
 S であり、U が N である、(v) G が C (O) であり、U が C R ⁵ である、(v i) G が
 C (O) であり、U が N である、(v i i) G が N (R ^{1 4}) であり、U が C R ⁵ である
 、(v i i i) G が N (R ^{1 4}) であり、U が N である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 9】

R ⁷ が、

フェニル、または

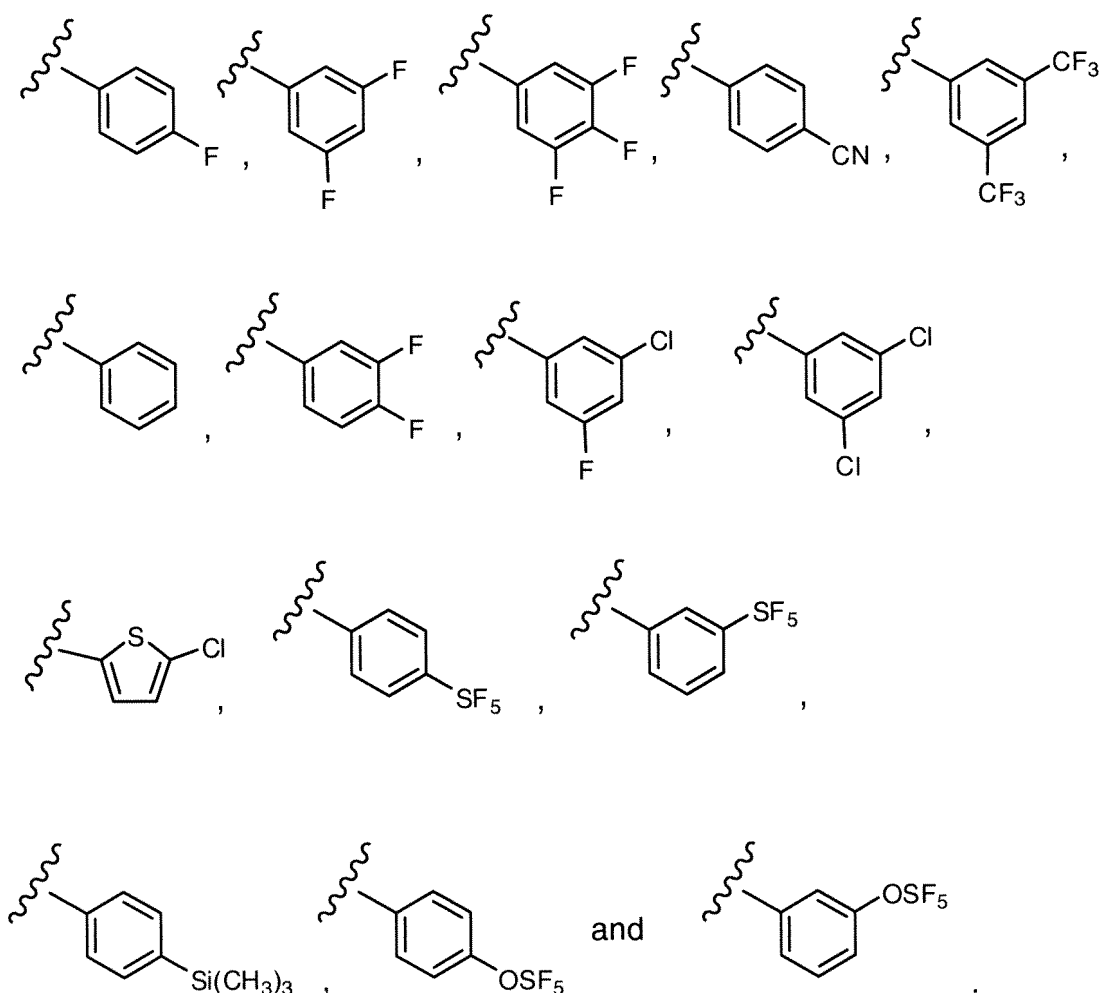
1 以上の独立に選択される R ^{2 1} 基で置換されたフェニル、または

1 から 3 個の独立に選択される $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニル、または
 1 から 3 個の $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、各 $R^{2,1}$ 基は同一もしくは異なる
 八口であるフェニル、または
 1 から 3 個の F で置換されたフェニル、または
 1 個の -CN 基で置換されたフェニル、または
 1 もしくは 2 個の -CF₃ 基で置換されたフェニル、または
 $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅
 および -Si(R^{1,5A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5A} が独立に選択される
 フェニル、または
 $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅
 および -Si(R^{1,5A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5A} が同一もしくは異なる
 アルキル基であるフェニル、または
 $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅
 および -Si(R^{1,5A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1,5A} が同一もしくは異なる
 アルキル基であるフェニル、または
 $R^{2,1}$ 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の $R^{2,1}$ 基が -SF₅、-OSF₅
 および -Si(CH₃)₃ からなる群から選択されるフェニル
 である請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R⁷ が

【化 9】



からなる群から選択される請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

前記式 (I) の化合物が、2 A、3 A、4 A、5 A、6 A、7 A、8 A、2 B、3 B、4 B、5 B、6 B、7 B、8 B、2 C、3 C、4 C、5 C、6 C、7 C、8 C、2 D、3 D、4 D、5 D、6 D、7 D、8 D、2 E、3 E、4 E、5 E、2 F、3 F、4 F、5 F、2 G、3 G、4 G、5 G、2 H、3 H、4 H、5 H、2 I、3 I、4 I、5 I、2 J、3 J、4 J、5 J、2 K、3 K、4 K、5 K、2 L、3 L、4 L H、5 L、2 M、3 M、4 M、5 M、2 N、3 N、4 N、5 N、2 O、3 O、4 O、5 O、2 P、3 P、4 P および 5 P 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 1 2】

R⁶ がアルキルであり；

R⁷ が、

フェニル、または

1 以上の独立に選択される R^{2 1} 基で置換されたフェニル、または

1 から 3 個の独立に選択される R^{2 1} 基で置換されたフェニル、または

1 から 3 個の R^{2 1} 基で置換されたフェニルであって、各 R^{2 1} 基は同一もしくは異なるハロゲンであるフェニル、または

1 から 3 個の F で置換されたフェニル、または

1 個の -CN 基で置換されたフェニル、または

1 もしくは 2 個の -CF₃ 基で置換されたフェニル、または

R^{2 1} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{2 1} 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1 5 A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1 5 A} が独立に選択されるフェニル、または

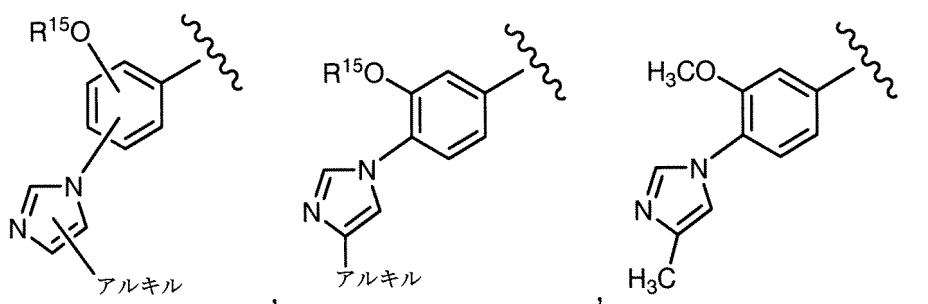
R^{2 1} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{2 1} 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1 5 A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1 5 A} が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

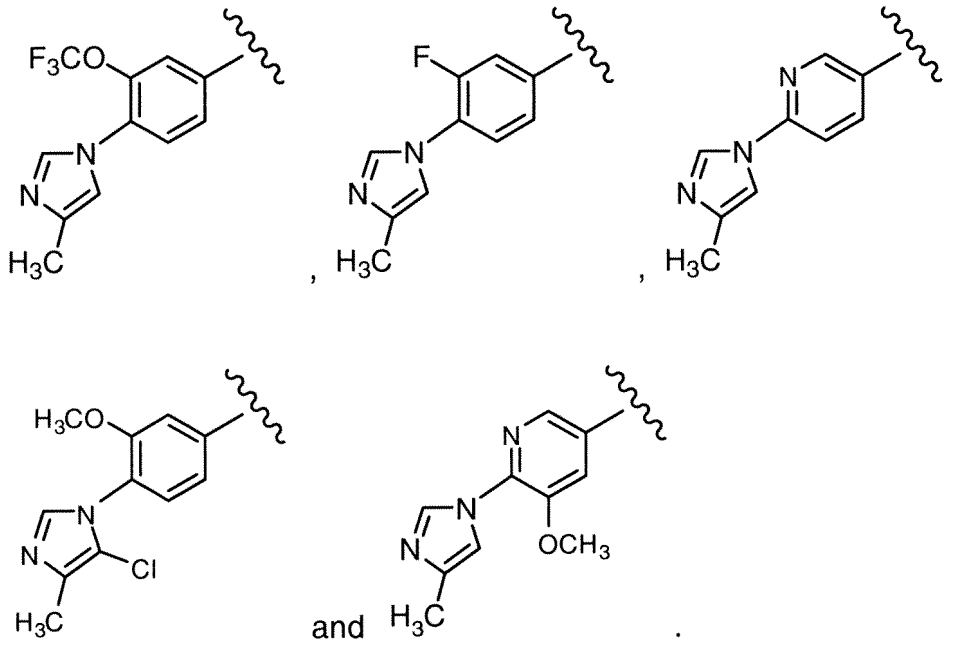
R^{2 1} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{2 1} 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(R^{1 5 A})₃ からなる群から選択され、各 R^{1 5 A} が同一もしくは異なるアルキル基であるフェニル、または

R^{2 1} 基で置換されたフェニルであって、少なくとも 1 個の R^{2 1} 基が -SF₅、-OSF₅ および -Si(CH₃)₃ からなる群から選択されるフェニルであり；

前記 R⁹ - R^{1 0} - 部分が

【化 1 3】



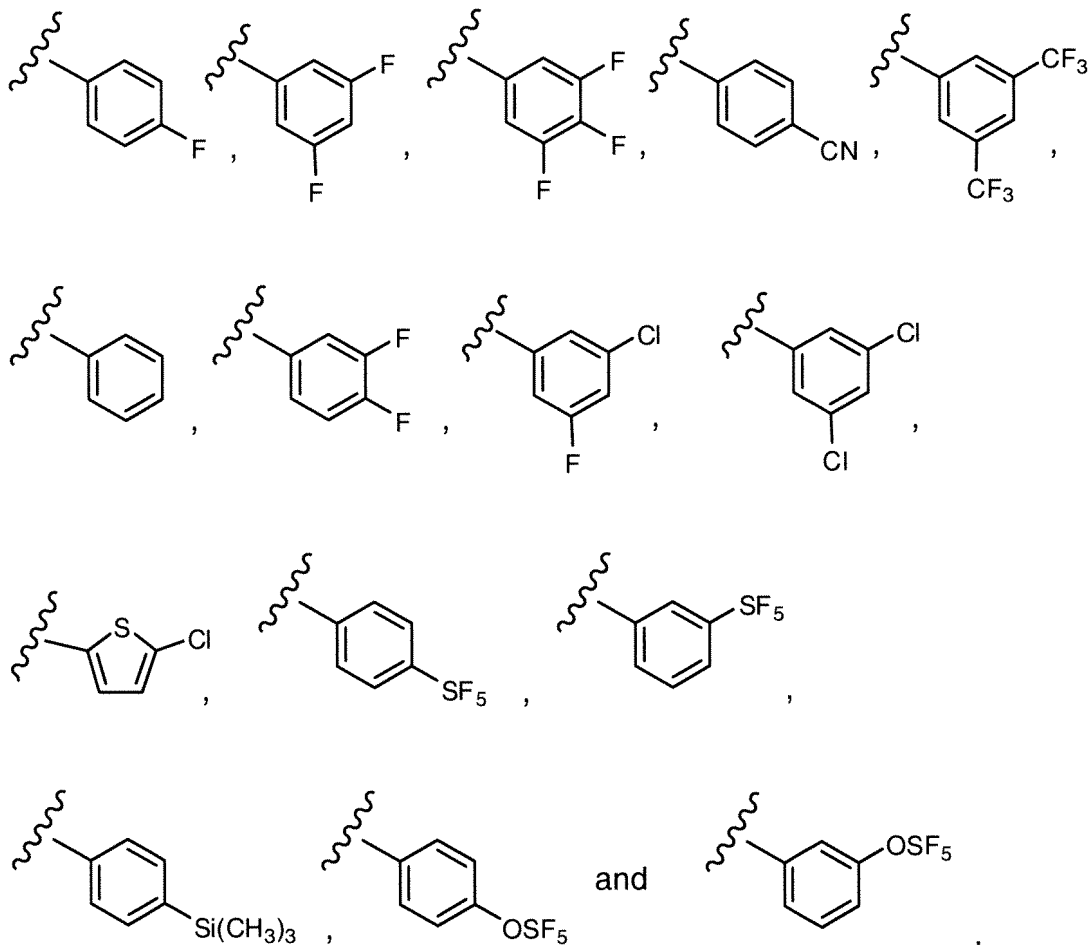


からなる群から選択される請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R⁷ が

【化 1 4】



からなる群から選択される請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

化合物 9 および 15 から 26 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 15】

(a) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、および少なくとも一つの製薬上許容される担体；または

(b) 治療上有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩、および少なくとも一つの製薬上許容される担体ならびに治療上有効量の BACE 阻害薬；ムスカリン性拮抗薬；コリンエステラーゼ阻害薬； α -セクレターゼ阻害薬； α -セクレターゼ調節剤；HMG-CoA レダクターゼ阻害薬；非ステロイド系抗炎症剤；N-メチル-D-アスパラギン酸受容体拮抗薬；抗アミロイド抗体；ビタミン E；ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬；CB1 受容体逆作動薬または CB1 受容体拮抗薬；抗生物質；成長ホルモン分泌促進物質；ヒスタミン H3 拮抗薬；AMPA 作動薬；PDE4 阻害薬；GABA_A 逆作動薬；アミロイド凝集阻害薬；グリコーゲンシンターゼキナーゼ阻害薬； α -セクレターゼ活性促進剤；PDE-10 阻害薬；エクセロン（リバステイグミン）；コグネックス（タクリン）；タウキナーゼ阻害薬（例えば、GSK3 阻害薬、cdk5 阻害薬または ERK 阻害薬）；抗 A β ワクチン；APP リガンド；インシュリンを上昇させる薬剤、コレステロール降下剤（例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチンなどのスタチン類）；コレステロール吸収阻害薬（エゼチミブなど）；フィブラート類（例えばクロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラートおよびアルミニウムクロフィブラートなど）；LXR 作動薬；LRP 模倣薬；ニコチン性受容体作動薬；H3 受容体拮抗薬；ヒストンデアセチラーゼ阻害薬；hsp90 阻害薬；m1 ムスカリン性受容体作動薬；5-HT6 受容体拮抗薬；mGluR1；mGluR5；陽性アロステリック調節剤または作動薬；mGluR2/3 拮抗薬；神経炎症を軽減することができる抗炎症剤；プロスタグランジン EP2 受容体拮抗薬；PAI-1 阻害薬；およびゲルソリンなどの A β 流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される 1 以上の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 16】

アルツハイマー病を治療するための、場合により BACE 阻害剤と組み合わせられる少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物又は該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項 17】

以下に使用されるための少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物又は該化合物の製薬上許容される塩。

(1) アルツハイマー病の治療（ここで、当該化合物は、有効量の 1 以上の BACE 阻害薬、ムスカリン性拮抗薬、コリンエステラーゼ阻害薬； α -セクレターゼ阻害薬； α -セクレターゼ調節剤；HMG-CoA レダクターゼ阻害薬；非ステロイド系抗炎症剤；N-メチル-D-アスパラギン酸受容体拮抗薬；抗アミロイド抗体；ビタミン E；ニコチン性アセチルコリン受容体作動薬；CB1 受容体逆作動薬または CB1 受容体拮抗薬；抗生物質；成長ホルモン分泌促進物質；ヒスタミン H3 拮抗薬；AMPA 作動薬；PDE4 阻害薬；GABA_A 逆作動薬；アミロイド凝集阻害薬；グリコーゲンシンターゼキナーゼ阻害薬； α -セクレターゼ活性促進剤；PDE-10 阻害薬；エクセロン；コグネックス；タウキナーゼ阻害薬；抗 A β ワクチン；APP リガンド；インシュリンを上昇させる薬剤、コレステロール降下剤；コレステロール吸収阻害薬；フィブラート類；LXR 作動薬；LRP 模倣薬；ニコチン性受容体作動薬；H3 受容体拮抗薬；ヒストンデアセチラーゼ阻害薬；hsp90 阻害薬；m1 ムスカリン性受容体作動薬；5-HT6 受容体拮抗薬；mGluR1；mGluR5；陽性アロステリック調節剤または作動薬；mGluR2/3 拮抗薬；神経炎症を軽減することができる抗炎症剤；プロスタグランジン EP2 受容体拮抗薬；PAI-1 阻害薬；およびゲルソリンなどの A β 流出を誘発することができる薬剤からなる群から選択される他の医薬有効成分と組み合わせて使用される。）；または

(2) 軽度認知障害の治療；または

- (3) 緑内障の治療、または
- (4) 脳アミロイド血管症の治療；または
- (5) 卒中の治療；または
- (6) 認知症の治療；または
- (7) 小膠細胞症の治療；または
- (8) 脳の炎症の治療；または
- (9) 嗅覚機能喪失の治療

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

		International application No PCT/US2009/068684
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D498/04 A61K31/4245 A61P25/00 A61P25/28		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, BIOSIS		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2008/137139 A1 (SCHERING CORP [US]; VOIGT JOHANNES H [US]; ZHU ZHAONING [US]; GREENLEE) 13 November 2008 (2008-11-13) page 1, line 7 - page 3, line 16 page 161 - page 231; examples 1-167 claim 1	1-44
Y	EP 1 953 154 A1 (EISAI R&D MAN CO LTD [JP]) 6 August 2008 (2008-08-06) page 3, paragraph 2 - page 4, paragraph 3 page 42 - page 113; examples 1-111 claim 1	1-44
Y	US 2007/117839 A1 (KIMURA TEIJI [JP] ET AL) 24 May 2007 (2007-05-24) page 1, paragraph 2 - paragraph 6 page 38 - page 139; examples 1-115 claim 1	1-44
	----- -/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 17 February 2010		Date of mailing of the international search report 01/03/2010
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5816 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Bissmire, Stewart

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2009/068684

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 1 992 618 A1 (EISAI R&D MAN CO LTD [JP]) 19 November 2008 (2008-11-19) page 2, column 2 - page 3, column 3 page 77 - page 187; examples 1-180 claim 1 -----	1-44

International Application No. PCT/US2009/068684

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

Continuation of Box II.2

Claims Nos.: 1-21, 35-44(all partially)

Present claims 1-22 relate to an extremely large number of possible compounds. Support and disclosure in the sense of Article 6 and 5 PCT is to be found however for only a very small proportion of the compounds claimed, see pages 184-190 examples 1 and 2. The non-compliance with the substantive provisions is to such an extent, that the search was performed taking into consideration the non-compliance in determining the extent of the search of claims 1-22 (PCT Guidelines 9.19 and 9.23). The search of claim 1-22 was restricted to those claimed compounds which appear to be supported and a generalisation of their structural formulae, i.e. compounds of formula (I) where G is O and U is N.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). The applicant is advised that the EPO policy when acting as an International Preliminary Examining Authority is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report or during any Chapter II procedure. If the application proceeds into the regional phase before the EPO, the applicant is reminded that a search may be carried out during examination before the EPO (see EPO Guideline C-VI, 8.2), should the problems which led to the Article 17(2) declaration be overcome.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2009/068684

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.: 1-21, 35-44(all partially)
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
see FURTHER INFORMATION sheet PCT/ISA/210

3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.

3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2009/068684

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2008137139	A1	13-11-2008	AR 066459 A1 19-08-2009
			AU 2008248129 A1 13-11-2008
			CA 2686589 A1 13-11-2008
			EC SP099720 A 28-12-2009
			PE 07292009 A1 24-06-2009
EP 1953154	A1	06-08-2008	AR 058198 A1 23-01-2008
			AU 2006317457 A1 31-05-2007
			CA 2629745 A1 31-05-2007
			WO 2007060810 A1 31-05-2007
			KR 20080069221 A 25-07-2008
			US 2007117798 A1 24-05-2007
US 2007117839	A1	24-05-2007	NONE
EP 1992618	A1	19-11-2008	AR 059955 A1 14-05-2008
			AU 2007223158 A1 13-09-2007
			CA 2643796 A1 13-09-2007
			EA 200870336 A1 27-02-2009
			WO 2007102580 A1 13-09-2007
			KR 20080108481 A 15-12-2008

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 1 1	
A 6 1 P 27/06 (2006.01)	A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 9/00 (2006.01)	A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 11/02 (2006.01)	A 6 1 P 27/06	
	A 6 1 P 9/00	
	A 6 1 P 11/02	

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(74)代理人 100129713

弁理士 重森 一輝

(74)代理人 230105223

弁護士 城山 康文

(72)発明者 アスベローム, セオドロス

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07052、ウエスト・オレンジ、ストーン・ドライブ・17

(72)発明者 フアン, シーアンハイ

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07059、ワレン、ヘムロック・サークル・16

(72)発明者 ジュー, ジャオニン

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・08536、ブレインズボロ、サイプレス・コート・6

(72)発明者 クレーダー, ジョン・ダブリュー

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07016、クランフォード、ノース・ユニオン・アベニュー・428

(72)発明者 ビサーニツスキ, ドミトリ・エー

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07076、スコッチ・プレーンズ、ブルー・リτζジ・サークル・22

(72)発明者 ジョシオン, ユベール・ビー

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07302、ジャージー・シティー、パボニア・アベニュー・293

(72)発明者 リ, ホンメイ

アメリカ合衆国、ニュー・ジャージー・07059、ワレン、ヘムロック・サークル・16

F ターム(参考) 4C072 AA01 BB02 CC02 CC12 EE02 FF11 GG01 HH02 HH07 UU01
 4C084 AA19 MA02 MA13 MA17 MA22 MA23 MA28 MA31 MA32 MA35
 MA37 MA41 MA43 MA52 MA57 MA59 MA63 MA66 NA05 NA14
 ZA01 ZA15 ZA16 ZA33 ZA34 ZA36 ZC20 ZC75
 4C086 AA01 AA03 CB22 MA01 MA02 MA04 MA13 MA17 MA22 MA23
 MA28 MA31 MA32 MA35 MA37 MA41 MA43 MA52 MA57 MA59
 MA63 MA66 NA05 NA14 ZA01 ZA15 ZA16 ZA33 ZA34 ZA36
 ZC20 ZC75