(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2024-523313
(P2024-523313A)
(43)公表日　令和6年6月28日(2024.6.28)

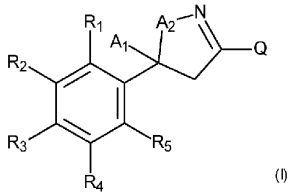
(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 261/04	*(2006.01)*	C07D	261/04	4C086
C07D 413/12	*(2006.01)*	C07D	413/12	CSP 4H011
A61K 31/422	*(2006.01)*	A61K	31/422	
A61K 31/42	*(2006.01)*	A61K	31/42	
A61P 33/14	*(2006.01)*	A61P	33/14	

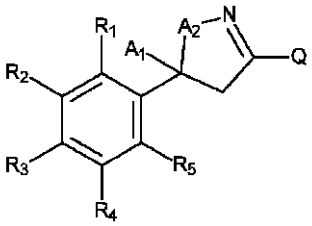
審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全103頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2023-577341(P2023-577341)
(86)(22)出願日　令和4年6月15日(2022.6.15)
(85)翻訳文提出日　令和6年2月6日(2024.2.6)
(86)国際出願番号　PCT/EP2022/066422
(87)国際公開番号　WO2022/263573
(87)国際公開日　令和4年12月22日(2022.12.22)
(31)優先権主張番号　63/211,478
(32)優先日　令和3年6月16日(2021.6.16)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)
(81)指定国・地域　AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,
最終頁に続く

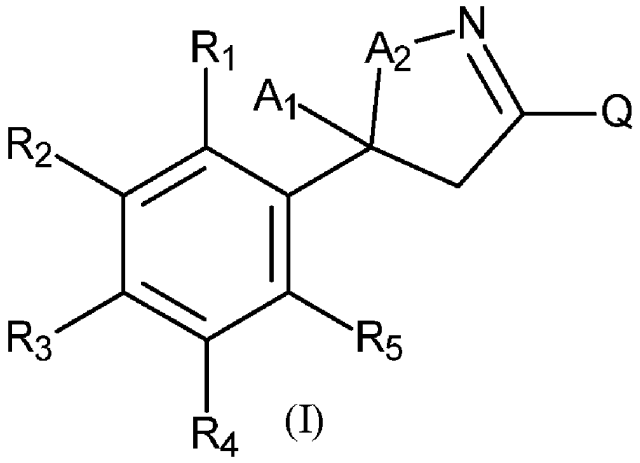
(71)出願人　521263308
エランコ・ティアゲゾンタイト・アーゲー
スイス国、４０５８・バーゼル、マッテンシュトラーセ・２４アー
(71)出願人　508270727
エランコ アニマル ヘルス ゲー・エム・ベー・ハー
Ｅｌａｎｃｏ Ａｎｉｍａｌ Ｈｅａｌｔｈ ＧｍｂＨ
ドイツ連邦共和国 ４０７８９ モンハイム・アム・ライン アルフレート－ノーベル－シュトラーセ ５０
(74)代理人　100114188
弁理士　小野 誠
最終頁に続く

(54)【発明の名称】　イソオキサゾリン殺害虫剤

(57)【要約】
本発明は、伴侶動物及び家畜における害虫（例えば、ノミ及びマダニ）の長期間持続する処置及び防除に有用な式（Ｉ）で表される化合物、及び、薬学的組成物、及び、それらを使用する方法を提供する。
【化１】

(I)

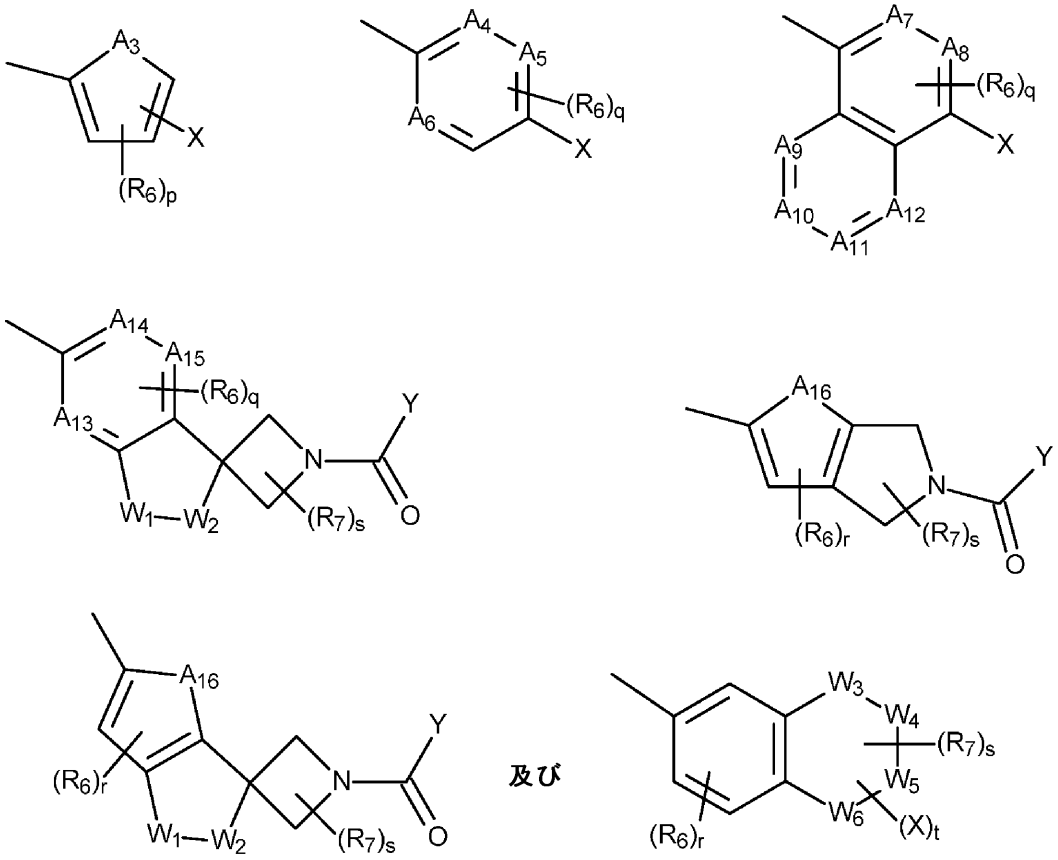

(I)

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】



〔式中、
Ａ１は、ＣＦ３、ＣＨＦ２、ＣＨ２Ｆ及びＣＦ２ＣＦ３からなる群から選択され；
Ａ２は、Ｏ又はＳであり；
Ｒ１は、水素及びハロゲンからなる群から選択され；
Ｒ２は、水素、ハロゲン、ジフルオロメチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ３は、水素、ハロゲン及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ４は、水素、ハロゲン、ジフルオロメチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ５は、水素及びハロゲンからなる群から選択され；
但し、
Ｒ１は、Ｒ２がトリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はブロモである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ５は、Ｒ４がトリフルオロメチル又はブロモである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ３は、Ｒ２又はＲ４のうちの１つが、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はブロモのいずれかである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ１、Ｒ３及びＲ５は、Ｒ２及びＲ４がトリフルオロメチルである場合、全てが水素ではあることはできず；
及び、
Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４及びＲ５のうちの多くとも３が水素であり；
Ｑは、以下の

【化２】



からなる群から選択され；
ここで、
　ｐは、０、１又は２であり；
　ｑは、０、１、２又は３であり；
　ｒは、０又は１であり；
　ｓは、０、１又は２であり；
　ｔは、０又は１であり；
　R_6は、各存在において、以下のものからなる群から独立して選択され：
ハロゲン；シアノ；ニトロ；ヒドロキシル；－NH_2；－NH（C_1－C_4アルキル）；－N（C_1－C_4アルキル）$_2$；C_2－C_5－アルコキシカルボニル；C_1－C_6－アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；C_1－C_6－アルコキシ（ここで、該アルコキシは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；－NR_8C（O）（C_1－C_4アルキル）（ここで、これは、C_1－C_4アルキル上で、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）及び－N（C_1－C_4アルキル）$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよく、ここで、R_8は、水素及びC_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される）；－C（O）NR_8（C_1

－Ｃ４アルキル）（ここで、これは、そのＣ１－Ｃ４アルキル上で、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよく、ここで、Ｒ８は、水素及びＣ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される）；－ＳＣ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；及び、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；

Ｒ７は、各存在において、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルキル及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

Ａ３は、Ｏ又はＳであり；

Ａ４は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ５は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ６は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ７は、ＣＨ　Ｏ、Ｓ、結合又はＮであり；

Ａ８は、ＣＨ　Ｏ、Ｓ、結合又はＮであり；

Ａ９は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１０は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１１は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１２は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１３は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１４は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１５は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１６は、ＮＲ、Ｏ又はＳであり、ここで、Ｒは、水素、Ｃ１－Ｃ４アルキル及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から選択され；

Ｗ１は、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－、－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ２は、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－、－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

但し、

Ｗ１が、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－又は－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－である場合、Ｗ２は、－ＣＨ２－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；

Ｗ２が、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－又は－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－である場合、Ｗ１は、－ＣＨ２－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；

Ｗ３は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ４は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

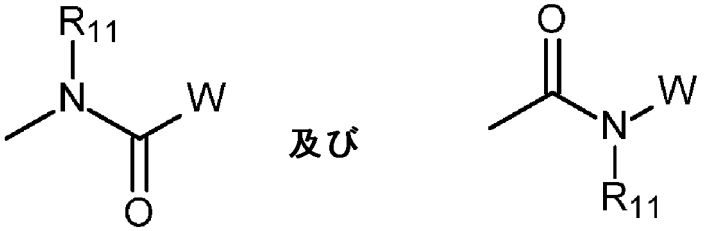
Ｗ５は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ６は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

ここで、Ｗ１、Ｗ２、Ｗ３及びＷ４の間の結合は、単結合又は二重結合であることができ；

但し、

（ｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つ以下は、存在せず；
（ｉｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つ以下は、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＮＲ$_9$－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；
（ｉｉｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つが－Ｏ－及び／又は－Ｓ－である場合、それらの間に少なくとも１個の炭素原子が存在し；
（ｉｖ）W_1、W_2、W_3又はW_4が－ＣＨ－及び／又は－ＮＲ$_9$－である場合、W_1、W_2、W_3及びW_4によって形成される環の中に二重結合が形成され；
R_9は、各存在において、水素及びC_1－C_6－アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル及び－ＳO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択され；
R_{10}は、各存在において、オキソ、C_1－C_4アルキル及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択され；
Ｘは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１又は２個のヘテロ原子を有する５～１０員のヘテロアリールであり；
ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－ＳO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4ハロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、
ここで、該ヘテロアリール内の任意のＮは、原子価が許す限り、水素、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－ＳO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく；
又は、
Ｘは、
【化３】



からなる群から選択され；
ここで、

R_{11}は、水素、C_1-C_4アルキル、C_1-C_4ハロアルキル、C_3-C_6シクロアルキル、C_4-C_7アルキシクロアルキル（ａｌｋｙｃｙｃｌｏａｌｋｙｌ）、C_2-C_7アルキルカルボニル、C_2-C_5アルコキシカルボニル、C_2-C_6アルケニル及びC_2-C_6アルキニルからなる群から選択され；

Ｗは、以下のものからなる群から選択され：

（ｉ）　水素、

（ｉｉ）　C_1-C_6アルキル［ここで、該アルキルは、ハロゲン；シアノ；ヒドロキシル；オキソ；C_1-C_4アルコキシ；C_3-C_6シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン及びシアノの群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；アセチレニル；$-NH_2$；C_1-C_7アミノカルボニル；$-NH(C_1-C_4$アルキル）；$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$；$-SC_1-C_4$アルキル；$-S(O)C_1-C_4$アルキル；$-SO_2C_1-C_4$アルキル；$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びC_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルコキシ、C_3-C_6シクロアルキル及び$-NH_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルコキシ、C_3-C_6シクロアルキル及び$-NH_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$シアノアルキル（ここで、これは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキル；$-C(O)-$４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、これは、窒素によって結合しており、そして、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個の他のヘテロ原子を有していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3-C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択された１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意の他のＮは、原子価が許す限り、水素、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$ハロアルキル及びC_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されている）；５～１０員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4ハロアルキル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1$

－Ｃ４アルキル）２及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリール任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい）；フェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル及びＣ２－Ｃ６アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；及び、４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｂ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ及びＣ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＢは、原子価が許す限り、ヒドロキシルで置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の
酸素原子で置換されていてもよい）；からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；

（ｉｉｉ）　Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル［ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、カルボキシ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル（ここで、該アルケニルは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）及びＣ２－Ｃ６アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；

（ｉｖ）　６員のアリール又は５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個、２個又は３個のヘテロ原子を有しており、ここで、該６員のアリール及び該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素及びＣ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］；

（ｖ）　４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、－ＳＯ２ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－ＳＯ２Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－

C_6シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、C_1－C_4アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］；及び、

（ｖｉ）　－$NR_{12}R_{13}$；

ここで、

R_{12}は、水素、C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル、C_2－C_6アルキニル、C_3－C_6シクロアルキル、C_4－C_7アルキルシクロアルキル、C_1－C_7アルキルカルボニル、C_1－C_7アミノカルボニル及びC_2－C_5アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

R_{13}は、水素、C_1－C_6アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_6アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、C_1－C_4アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］及び５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒ

ドロキシル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4アルキル)$、$-N(C_1-C_4アルキル)_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4ハロアルキル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、$-NH(C_1-C_4アルキル)$、$-N(C_1-C_4アルキル)_2$、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4アルキル)$、$-N(C_1-C_4アルキル)_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3-C_6シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］からなる群から選択され；

又は、

R_{11}とＷは、それらが結合している窒素と一緒になって、Ｎ、Ｓ及びＯからなる群から選択される１～２個のヘテロ原子を含んでいてもよい４～７員の環を形成し、ここで、該環の炭素は、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、ハロゲン、C_1-C_2アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－C_1-C_4－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－C_1-C_4－アルキルアミノカルボキシル、C_1-C_7アミノカルボキシル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4アルキル)$、$-N(C_1-C_4アルキル)_2$及び$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3-C_6シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル及びC_1-C_4アルコキシからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、C_1-C_4アルキル、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_2アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－C_1-C_4－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－C_1-C_4－アルキルアミノカルボキシル及びC_1-C_7アミノカルボキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員の環の任意のＮは、水素、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4アルキル)$、$-N(C_1-C_4アルキル)_2$及び$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3-C_6シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルコキシ、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、C_1-C_4アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員の環の任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよく；

Ｙは、C_1-C_6アルキルであり、ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4アルコキシ、アセチレニル、－

ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－ＳＯ$_2$Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＯ$_2$ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル）、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ及び－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$シアノアルキル［ここで、これは、１～３個のハロゲンで置換されていてもよい］、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、フェニル［ここで、該フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル及びＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよい］、５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されている］及び４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$

－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び５～６員のヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい〕
で表される化合物又はその塩。

【請求項２】

Ｗは、以下のものからなる群から選択され：

（ｉ）　水素、

（ｉｉ）　Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル［ここで、該アルキルは、ハロゲン；シアノ；ヒドロキシル；オキソ；Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ；Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン及びシアノの群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；アセチレニル；－ＮＨ$_2$；Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル；－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）；－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$；－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$シアノアルキル（ここで、これは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）；－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル；－Ｃ（Ｏ）－４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、これは、窒素によって結合しており、そして、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個の他のヘテロ原子を有していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択された１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意の他のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロ

アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されている）；５～１０員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリール任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい）；フェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル及びＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；及び、４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｂ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＢは、原子価が許す限り、ヒドロキシルで置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ

$_4$アルキル、－SO_2C_1－C_4ハロアルキル、－C（O）－NH_2、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、C_1－C_4アルコキシ、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、C_1－C_4アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のSは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい）；からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；

（ｉｉｉ）　C_3－C_6シクロアルキル［ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、カルボキシ、C_1－C_4アルコキシ、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、C_1－C_4ハロアルキル、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル、－C（O）NH－C_1－C_6アルキル、－C（O）NH－C_1－C_6ハロアルキル、C_2－C_6アルケニル（ここで、該アルケニルは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）及びC_2－C_6アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；

（ｉｖ）　５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、O、S及びNの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4ハロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$及び－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のNは、原子価が許す限り、水素及びC_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］；

（ｖ）　４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、O、S及びNの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、C_3－C_6シクロアルキル、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1

－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］；及び、

（ｖｉ）　－ＮＲ１２Ｒ１３；

ここで、

Ｒ１２は、水素、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ４－Ｃ７アルキルシクロアルキル、Ｃ１－Ｃ７アルキルカルボニル、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル及びＣ２－Ｃ５アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

Ｒ１３は、水素、Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル及び－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル及び－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、

－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］及び５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］からなる群から選択され；

又は、

Ｒ$_{11}$とＷは、それらが結合している窒素と一緒になって、Ｎ、Ｓ及びＯからなる群から選択される１～２個のヘテロ原子を含んでいてもよい４～７員の環を形成し、ここで、該環の炭素は、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル及びＣ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員の環の任意のＮは、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル

からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員の環の任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよく；

Ｙは、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、アセチレニル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ及び－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$シアノアルキル［ここで、これは、１～３個のハロゲンで置換されていてもよい］、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、フェニル［ここで、該フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル及びＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよい］、５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置

換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されている］及び４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル及び５～６員のヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい；
請求項１に記載の化合物又はその塩。

【請求項３】

A_1は、トリフルオロメチルであり、A_2は、Ｏであり、R_1は、水素であり、R_2は、トリフルオロメチルであり、R_3は、水素であり、R_4は、トリフルオロメチル又はハロゲンであり、及び、R_5は、ハロゲンである、請求項１に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項４】

R_4は、ハロゲンである、請求項３に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項５】

R_4は、トリフルオロメチルである、請求項３に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項６】

R_4は、クロロ又はブロモである、請求項４に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項７】

R_4は、ブロモである、請求項４に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項８】

R_4は、クロロである、請求項４に記載の化合物；又は、その塩。

【請求項９】

R_5は、フルオロである、請求項１～８のいずれかに記載の化合物；又は、その塩。

【請求項１０】

以下の

【表１】

4-(rel-(*S*)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-N-((*S*)-1-ｴﾁﾙ-5-ｵｷｿﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-(rel-(*S*)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(*S*)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-(rel-(*S*)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(*R*)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
ｼｽ-3-(4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ)ｼｸﾛﾌﾞﾀﾝ-1-ｶﾙﾎﾞﾝ酸
ﾄﾗﾝｽ-3-(4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ)ｼｸﾛﾌﾞﾀﾝ-1-ｶﾙﾎﾞﾝ酸
4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(ｼｽ-3-(ﾒﾁﾙｶﾙﾊﾞﾓｲﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ

4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(ﾄﾗﾝｽ-3-(ﾒﾁﾙｶﾙﾊﾞﾓｲﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-(S)-4-(5-(2-ﾌﾙｵﾛ-3,5-ﾋﾞｽ(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(2-ｵｷｿ-2-((2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ)ｴﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((ﾄﾗﾝｽ)-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-(rel-(R)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(S)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-(rel-(R)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(R)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((ｼｽ)-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ

rel-4-((R)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-4-((R)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-2-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ
rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S3)-2-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ

からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物、又は、上記のもののいずれかの塩。

【請求項１１】

請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物又はその塩及び少なくとも１の許容される担体を含んでいる、組成物。

【請求項１２】

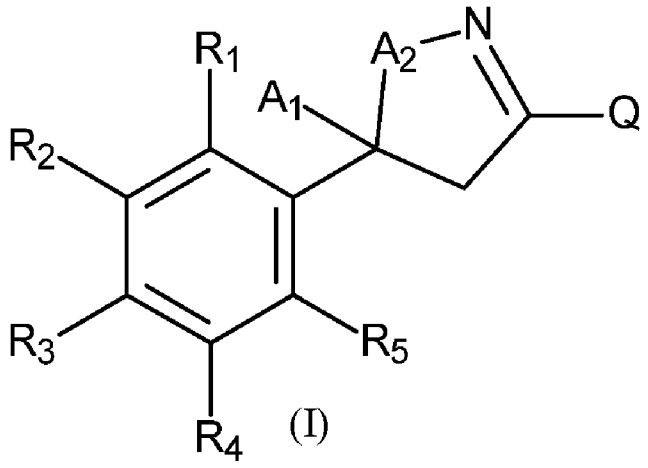
医薬としての、請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物又はその塩の使用。

【請求項１３】

害虫を処置するための医薬の製造における、請求項１～１０のいずれか１項に記載の化

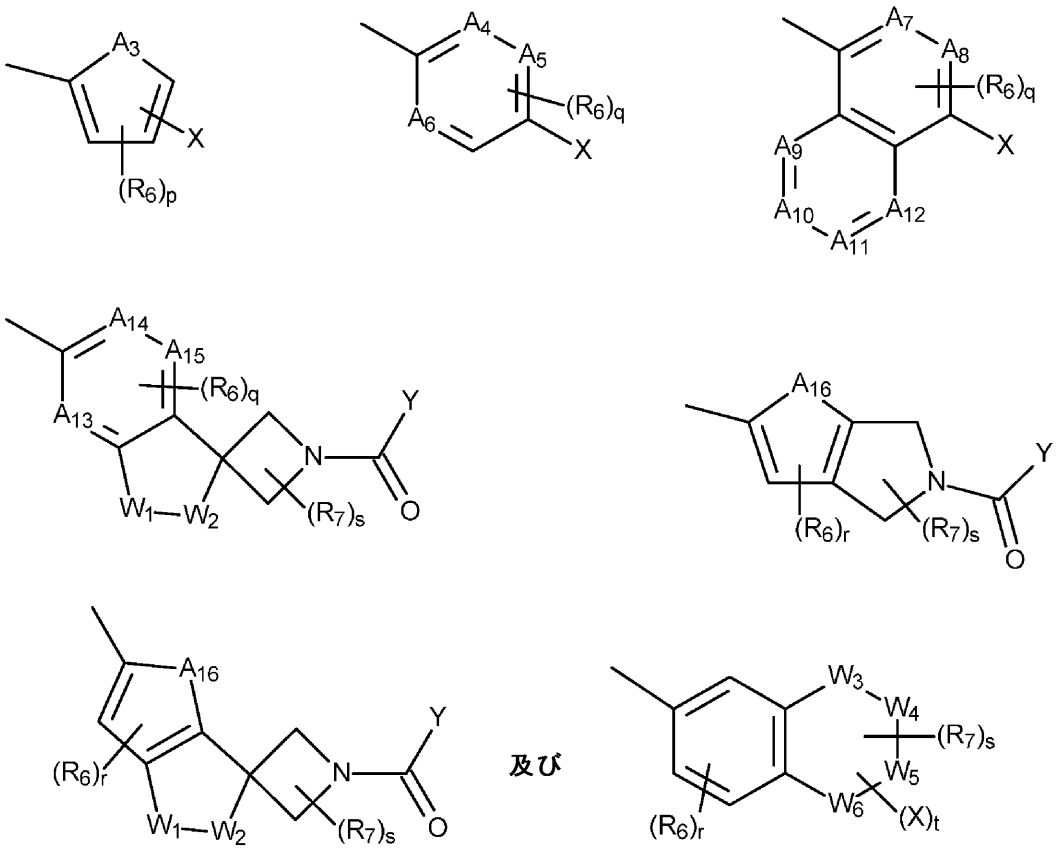
合物又はその塩の使用。
【請求項１４】
ノミを処置するための医薬の製造における、請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物又はその塩の使用。
【請求項１５】
マダニを防除するための医薬の製造における、請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物又はその塩の使用。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、医薬化学、薬理学、並びに、獣医学及びヒト医学に関する。
【背景技術】
【０００２】
アリールイソオキサゾリン類は、農業、林業、芝生、家庭、木材製品、苗畑作物保護及び獣医学分野で使用されている。獣医学分野は、伴侶動物及び家畜（これは、魚を包含する）を包含する。例えば、そのような阻害薬は、ＷＯ２００５／０８５２１６、ＷＯ２００７／０７９１６２、ＵＳ２００７／０６６６１７、ＵＳ２０１３０１３１０１７、ＷＯ２００９／００２８０９、ＷＯ２００９／１１２２７５、ＷＯ２０１０／００３９２３、ＷＯ２０１０／０７００６８、ＷＯ２０１２／１２０３９９、ＷＯ２０１３／０７９４０７及びＷＯ２０２１／１２７１８８に開示されている。
【０００３】
多くの用途において、害虫（ｐｅｓｔ）に対して長期間持続する効力が望ましい。長期間持続する保護は、伴侶動物（例えば、イヌ及びネコ、さらに、マウス、モルモット、フェレット、ウサギ）及び牧場で飼育される動物（例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ）及び魚（特に、サケ及びシーバス）で特に重要である。
【先行技術文献】
【特許文献】
【０００４】
【特許文献１】ＷＯ２００５／０８５２１６
【特許文献２】ＷＯ２００７／０７９１６２
【特許文献３】ＵＳ２００７／０６６６１７
【特許文献４】ＵＳ２０１３０１３１０１７
【特許文献５】ＷＯ２００９／００２８０９
【特許文献６】ＷＯ２００９／１１２２７５
【特許文献７】ＷＯ２０１０／００３９２３
【特許文献８】ＷＯ２０１０／０７００６８
【特許文献９】ＷＯ２０１２／１２０３９９
【特許文献１０】ＷＯ２０１３／０７９４０７
【特許文献１１】ＷＯ２０２１／１２７１８８
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００５】
本発明は、伴侶動物及び家畜、特に、温血動物、特に、イヌ、ネコ及びウシにおける、長い半減期を有する式（Ｉ）で表される化合物、及び、外部寄生虫の防除におけるそれらの使用に関する。多くの場合、式（Ｉ）で表される化合物は、単回経口投与又は注射の後で、数ヶ月間の長い作用持続期間を提供する。
【０００６】
本発明は、さらに、伴侶動物及び家畜における外部寄生虫を効果的に処置及び／又は防除する式（Ｉ）で表される化合物も提供する。
【課題を解決するための手段】

【０００７】
一実施形態では、本発明は、式（Ｉ）：
【化１】



〔式中、
Ａ$_1$は、ＣＦ$_3$、ＣＨＦ$_2$、ＣＨ$_2$Ｆ及びＣＦ$_2$ＣＦ$_3$からなる群から選択され；
Ａ$_2$は、Ｏ又はＳであり；
Ｒ$_1$は、水素及びハロゲンからなる群から選択され；
Ｒ$_2$は、水素、ハロゲン、ジフルオロメチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ$_3$は、水素、ハロゲン及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ$_4$は、水素、ハロゲン、ジフルオロメチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択され；
Ｒ$_5$は、水素及びハロゲンからなる群から選択され；
但し、
Ｒ$_1$は、Ｒ$_2$がトリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はブロモである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ$_5$は、Ｒ$_4$がトリフルオロメチル又はブロモである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ$_3$は、Ｒ$_2$又はＲ$_4$のうちの１つが、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はブロモのいずれかである場合にのみ、水素であることができ；
Ｒ$_1$、Ｒ$_3$及びＲ$_5$は、Ｒ$_2$及びＲ$_4$がトリフルオロメチルである場合、全てが水素ではあることはできず；
及び、
Ｒ$_1$、Ｒ$_2$、Ｒ$_3$、Ｒ$_4$及びＲ$_5$のうちの多くとも３が水素であり；
Ｑは、以下の

【化２】



からなる群から選択され；
ここで、
　ｐは、０、１又は２であり；
　ｑは、０、１、２又は３であり；
　ｒは、０又は１であり；
　ｓは、０、１又は２であり；
　ｔは、０又は１であり；
　R_6は、各存在において、以下のものからなる群から独立して選択され：
ハロゲン；シアノ；ニトロ；ヒドロキシル；－NH_2；－NH（C_1－C_4アルキル）；－N（C_1－C_4アルキル）$_2$；C_2－C_5－アルコキシカルボニル；C_1－C_6－アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；C_1－C_6－アルコキシ（ここで、該アルコキシは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル及び－SO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；－NR_8C（O）（C_1－C_4アルキル）（ここで、これは、C_1－C_4アルキル上で、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）及び－N（C_1－C_4アルキル）$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよく、ここで、R_8は、水素及びC_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される）；－C（O）NR_8（C_1

－Ｃ４アルキル）（ここで、これは、そのＣ１－Ｃ４アルキル上で、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよく、ここで、Ｒ８は、水素及びＣ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される）；－ＳＣ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；及び、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；

Ｒ７は、各存在において、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルキル及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

Ａ３は、Ｏ又はＳであり；

Ａ４は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ５は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ６は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ７は、ＣＨ　Ｏ、Ｓ、結合又はＮであり；

Ａ８は、ＣＨ　Ｏ、Ｓ、結合又はＮであり；

Ａ９は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１０は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１１は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１２は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１３は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１４は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１５は、ＣＨ又はＮであり；

Ａ１６は、ＮＲ、Ｏ又はＳであり、ここで、Ｒは、水素、Ｃ１－Ｃ４アルキル及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から選択され；

Ｗ１は、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－、－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ２は、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－、－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

但し、

Ｗ１が、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－又は－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－である場合、Ｗ２は、－ＣＨ２－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；

Ｗ２が、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＮＲ９－又は－ＮＣ（Ｏ）Ｒ１０－である場合、Ｗ１は、－ＣＨ２－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；

Ｗ３は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ４は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ５は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｗ６は、非存在、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）２－、－ＮＲ９－、－ＣＨ－、－Ｎ－、－ＣＨ２－及び－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

ここで、Ｗ１、Ｗ２、Ｗ３及びＷ４の間の結合は、単結合又は二重結合であることができ；

但し、

（ｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つ以下は、存在せず；
（ｉｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つ以下は、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＮＲ$_9$－又は－Ｃ（Ｏ）－であり；
（ｉｉｉ）W_1、W_2、W_3及びW_4のうちの２つが－Ｏ－及び／又は－Ｓ－である場合、それらの間に少なくとも１個の炭素原子が存在し；
（ｉｖ）W_1、W_2、W_3又はW_4が－ＣＨ－及び／又は－ＮＲ$_9$－である場合、W_1、W_2、W_3及びW_4によって形成される環の中に二重結合が形成され；
R_9は、各存在において、水素及びC_1－C_6－アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル及び－ＳO_2C_1－C_4アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択され；
R_{10}は、各存在において、オキソ、C_1－C_4アルキル及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択され；
Ｘは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１又は２個のヘテロ原子を有する５～１０員のヘテロアリールであり；
ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－ＳO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4ハロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、
ここで、該ヘテロアリール内の任意のＮは、原子価が許す限り、水素、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、－ＳC_1－C_4アルキル、－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、－ＳO_2C_1－C_4アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく；
又は、
Ｘは、
【化３】



からなる群から選択され；

ここで、
R_{11}は、水素、C_1-C_4アルキル、C_1-C_4ハロアルキル、C_3-C_6シクロアルキル、C_4-C_7アルキシクロアルキル（ａｌｋｙｃｙｃｌｏａｌｋｙｌ）、C_2-C_7アルキルカルボニル、C_2-C_5アルコキシカルボニル、C_2-C_6アルケニル及びC_2-C_6アルキニルからなる群から選択され；
Ｗは、以下のものからなる群から選択され：
（ｉ）　水素、
（ｉｉ）　C_1-C_6アルキル［ここで、該アルキルは、ハロゲン；シアノ；ヒドロキシル；オキソ；C_1-C_4アルコキシ；C_3-C_6シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン及びシアノの群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；アセチレニル；$-NH_2$；C_1-C_7アミノカルボニル；$-NH(C_1-C_4$アルキル）；$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$；$-SC_1-C_4$アルキル；$-S(O)C_1-C_4$アルキル；$-SO_2C_1-C_4$アルキル；$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びC_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルコキシ、C_3-C_6シクロアルキル及び$-NH_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルコキシ、C_3-C_6シクロアルキル及び$-NH_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$シアノアルキル（ここで、これは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）；$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキル；$-C(O)-$４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、これは、窒素によって結合しており、そして、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個の他のヘテロ原子を有していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3-C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択された１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意の他のＮは、原子価が許す限り、水素、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$ハロアルキル及びC_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、C_1-C_4アルコキシ、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されている）；５～１０員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1-C_4アルコキシ、$-NH_2$、C_1-C_7アミノカルボニル、$-NH(C_1-C_4$アルキル）、$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、$-SC_1-C_4$アルキル、$-S(O)C_1-C_4$アルキル、$-SO_2C_1-C_4$アルキル、$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル及び$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3-C_6シクロアルキル、C_1-C_4ハロアルキル、C_1-C_4アルコキシ

、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリール任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい）；フェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）；Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル及びＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）；及び、４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｂ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＢは、原子価が許す限り、ヒドロキシルで置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の
酸素原子で置換されていてもよい）；からなる群から独立して選択される１～５の置換基

で置換されていてもよい］；
（ｉｉｉ）　Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、カルボキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３の基で置換されていてもよい）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル（ここで、該アルケニルは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）及びＣ$_2$－Ｃ$_6$アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；
（ｉｖ）　６員のアリール又は５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個、２個又は３個のヘテロ原子を有しており、ここで、該６員のアリール及び該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］；
（ｖ）　４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$ＮＨ（

Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－ＳＯ２Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］；及び、

（ｖｉ）　－ＮＲ１２Ｒ１３；

ここで、

Ｒ１２は、水素、Ｃ１－Ｃ６アルキル、Ｃ２－Ｃ６アルケニル、Ｃ２－Ｃ６アルキニル、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ４－Ｃ７アルキルシクロアルキル、Ｃ１－Ｃ７アルキルカルボニル、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル及びＣ２－Ｃ５アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

Ｒ１３は、水素、Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル及び－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ６アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル及び－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］及び５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有して

おり、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていてもよい］からなる群から選択され；

又は、

Ｒ$_{11}$とＷは、それらが結合している窒素と一緒になって、Ｎ、Ｓ及びＯからなる群から選択される１～２個のヘテロ原子を含んでいてもよい４～７員の環を形成し、ここで、該環の炭素は、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルコキシ、Ｎ，Ｎ－ジ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル、Ｎ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル及びＣ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員の環の任意のＮは、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、５～６員のヘテロアリール及びフェニル（ここで、該フェニルは、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員の環の任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよく；

Ｙは、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロ

キシル、オキソ、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、アセチレニル、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－SO_2NH（C_1－C_4アルキル）、－SO_2N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SO_2NH（C_1－C_4ハロアルキル）、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル［ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びC_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルコキシ及び－NH_2からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］、－C（O）NH－C_1－C_6アルキル、－C（O）NH－C_1－C_6シアノアルキル［ここで、これは、１～３個のハロゲンで置換されていてもよい］、－C（O）NH－C_1－C_6ハロアルキル、フェニル［ここで、該フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4ハロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$及び－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル、－C（O）NH－C_1－C_6アルキル、C_2－C_6アルケニル及びC_2－C_6アルキニルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよい］、５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、O、S及びNの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、C_3－C_6シクロアルキル、C_1－C_4ハロアルキル、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリールの任意のNは、原子価が許す限り、水素、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル、－S（O）C_1－C_4アルキル、－SO_2C_1－C_4アルキル、－C（O）NH－C_3－C_6シクロアルキル及び－C（O）NH－C_1－C_6アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びC_3－C_6シクロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されている］及び４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、O、S及びNの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、オキソ、C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、C_1－C_4アルコキシ、－NH_2、C_1－C_7アミノカルボニル、－NH（C_1－C_4アルキル）、－N（C_1－C_4アルキル）$_2$、－SC_1－C_4アルキル

、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）及びＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び５～６員のヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されており、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されていてもよい］からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい〕
で表される化合物又はその塩を提供する。

【０００８】

一実施形態では、本発明は、さらに、式（Ｉ）で表される化合物又はその塩と少なくとも１の許容される賦形剤を含んでいる組成物も提供し、ここで、該組成物は、さらに、少なくとも１の付加的な活性化合物を含んでいてもよい。

【０００９】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を処理する方法も提供し、ここで、該方法は、それを必要とする対象者に有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を投与することを含み、ここで、該方法は、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでもよい。

【００１０】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を防除する方法も提供し、ここで、該方法は、それを必要とする対象者に有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を投与することを含み、ここで、該方法は、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでもよい。

【００１１】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を処理又は防除する方法も提供し、ここで、該方法は、対象者の環境を有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩と接触させることを含み、ここで、該方法は、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでもよい。

【００１２】

従って、本発明は、本発明の化合物の医薬としての使用を提供し、ここで、これは、医薬の製造のための使用を包含する。一実施形態では、本発明は、寄生虫を処理するための式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を含んでいる医薬の製造を提供する。一実施形態では、本発明は、害虫を防除するための式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を含んでいる医薬の製造を提供する。

【００１３】

本発明は、さらに、本発明の化合物を製造する方法及びその中間体を提供する。

【発明を実施するための形態】

【００１４】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルキル」は、１～２個の炭素原子を有するアルキル鎖を示しており、そして、メチル及びエチルを包含する。

【００１５】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル」は、１～４個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキ

ル鎖を示しており、そして、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル及びブチルなどを包含する。

【００１６】

同様に、用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル」は、１～６個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキル鎖を示しており、そして、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ペンチル及びヘキシルなどを包含する。

【００１７】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル」及び「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロゲノアルキル」は、１～４個の炭素原子及び１～５個のハロゲンを有する直鎖又は分枝鎖のアルキル鎖を示しており、そして、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、２，２，２－トリフルオロエチル、１，２，２－トリフルオロエチル及び３，３，３－トリフルオロプロピルなどを包含する。

【００１８】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル」及び「Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロゲノアルキル」は、１～６個の炭素原子及び１～５個のハロゲンを有する直鎖又は分枝鎖のアルキル鎖を示しており、そして、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、２，２，２－トリフルオロエチル、１，２，２－トリフルオロエチル、３，３，３－トリフルオロプロピル及び４，４，４－トリフルオロブチルなどを包含する。

【００１９】

用語「Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル」は、２～４個の炭素原子及び１つの炭素－炭素二重結合を有する直鎖又は分枝鎖のアルケニル鎖を示しており、そして、エチレン、プロピレン、イソ－プロピレン、ブチレン、イソ－ブチレン及びｓｅｃ－ブチレンなどを包含する。

【００２０】

用語「Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル」は、２～４個の炭素原子及び１つの炭素－炭素三重結合を有する直鎖又は分枝鎖のアルキニル鎖を示しており、そして、アセチレン及びプロパルギルなどを包含する。

【００２１】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_2$アルコキシ」は、酸素原子を介して結合したＣ$_1$－Ｃ$_2$アルキルを示しており、そして、メトキシ及びエトキシを包含する。

【００２２】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ」は、酸素原子を介して結合したＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルを示しており、そして、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ及びブトキシなどを包含する。

【００２３】

用語「Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルコキシ」は、酸素原子を介して結合したＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキルを示しており、そして、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ及びブトキシなどを包含する。

【００２４】

用語「Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル」は、３～６個の炭素原子のアルキル環を示しており、そして、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを包含する。シクロアルキル環は、縮合、架橋又はスピロ縮合し得ることは理解される。

【００２５】

用語「Ｃ$_4$－Ｃ$_7$アルキルシクロアルキル」は、炭素の総数が４～７個であるように、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルを示しており、そして、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル及びシクロプロピルエチルなどを包含する。

【００２６】

用語「ハロ」、「ハロゲン」及び「ハロ」は、クロロ原子、フルオロ原子、ブロモ原子又はヨード原子を示している。

【００２７】

用語「４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｎの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよい）」及び「４～７員のヘテロシクロアルキル（ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｂ、Ｎの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよい」は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される１個若しくは２個のヘテロ原子を有しているか、又は、窒素、酸素、ホウ素及び硫黄からなる群から選択される１個若しくは２個のヘテロ原子を有している、４～７員の飽和又は部分的に（しかし、完全ではない）不飽和の環を示しており、ここで、該環は、ラクタム又はラクトンを形成するためのカルボニルを含んでいてもよい。硫黄が含まれている場合、その硫黄は、－Ｓ－、－ＳＯ－又は－SO_2－のいずれかであり得ることは理解される。該ヘテロ環式環は、単環式又は二環式であることができ、そして、任意の二環式環は、縮合、架橋又はスピロ縮合することができる。定義された４～７員は、場合によりベンゾ縮合された環を除く。また、当業者には完全に理解されるように、飽和又は部分的に（しかし、完全ではない）不飽和の４～７員のヘテロシクロアルキル環は、該ヘテロシクロアルキル環に適用され、そして、その性質上完全に不飽和となる任意のベンゾ縮合された環には適用されない。基は、該環ヘテロ原子（原子価が許す限り）、該ヘテロシクロアルキルの炭素原子又は任意のベンゾ縮合された環の炭素原子による置換基として、結合することができることは、さらに理解される。場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルが炭素上で置換されていてもよい場合、その置換基は、該ヘテロ環及び／又はベンゾ縮合された環の炭素原子上に存在し得ることも理解される。例えば、限定するものではないが、この用語は、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、オキセタニル、チオキセタニル、ジオキソラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフリル、ヘキサヒドロピリミジニル、テトラヒドロピリミジニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、イソオキサゾリジン、ジヒドロイミダゾリル、インドリル及びイソインドリルなどを包含する。

【００２８】

用語「５～６員のヘテロアリール」は、１～５個の炭素原子と、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される１個以上（典型的には、１～４個）のヘテロ原子を有している６員の完全に不飽和な単環式環を示している。例えば、限定するものではないが、この用語は、ピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、オキサゾイル、イソオキサゾイル、チアゾリル、トリアゾリル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジル及びピリミジルなどを包含する。６員のヘテロアリールは、そのような結合形態が利用可能である場合、環炭素原子又は環窒素原子を介して置換基として結合することが可能であることは理解される。

【００２９】

R_{11}とＷがそれらが結合している窒素と一緒になる場合、用語「Ｎ、Ｓ及びＯからなる群から選択される１～２個のヘテロ原子を含んでいてもよい４～７員の環」は、R_{11}とＷが結合している窒素を含む４～７の環員を有する完全に飽和又は部分的に不飽和（しかし、完全にではない）の環を示しており、そして、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、オキセタニル、ジオキソラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフリル、ヘキサヒドロピリミジニル、テトラヒドロピリミジニル及びジヒドロイミダゾリルなどを包含する。

【００３０】

用語「５～１０員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有している）」は、１～９個の炭素原子と、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有している、５～１０員の単環式又は多環式の完全に不飽和の環又は環系を示している。例えば、限定されないが、この用語は、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、イソチアゾリル

、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジル、アゼピニル、ジアゼピニル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル、インドリル、イソインドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾピラジニル、ベンゾピラゾリル、キナゾリル、チエノピリジル、キノリル、イソキノリル及びベンゾチアゾリルなどを包含する。５～１０員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有している）は、そのような結合形態が利用可能である場合、環炭素原子又は環窒素原子を介して置換基として結合することが可能であることは理解される。

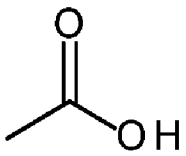
【００３１】

用語「オキソ」は、それが結合してアミド、ケトン又はアルデヒドのカルボニルを形成する、炭素に二重結合した酸素原子を示している。例えば、プリドン（ｐｒｙｉｄｏｎｅ）ラジカルは、オキソ置換された６員のヘテロアリールとして企図されている。

【００３２】

用語「カルボキシル」は、以下の基

【化４】

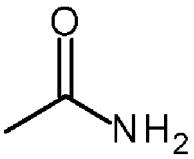


を示している。

【００３３】

用語「Ｎ，Ｎ－ジ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル」は、すぐ下の基

【化５】



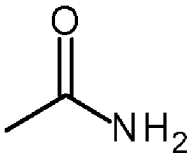
〔ここで、窒素上の水素は、２つの独立して選択されるＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル基で置換されている〕

を示している。

【００３４】

同様に、用語「Ｎ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルアミノカルボキシル」は、すぐ下の基

【化６】



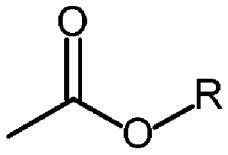
〔ここで、窒素上の水素のうちの１つは、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル基で置換されている〕

を示している。

【００３５】

用語「Ｃ$_2$－Ｃ$_5$アルコキシカルボニル」は、以下の基

【化７】

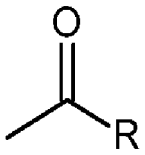


〔ここで、Ｒは、Ｃ１－Ｃ４アルキルである〕
を示している。

【００３６】

用語「Ｃ２－Ｃ７アルキルカルボニル」は、以下の基

【化８】



〔ここで、Ｒは、Ｃ１－Ｃ６アルキルである〕
を示している。

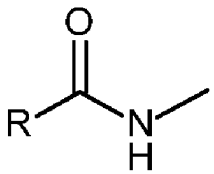
【００３７】

同様に、用語「Ｃ２－Ｃ７ハロアルキルカルボニル」は、ＲがＣ１－Ｃ６ハロアルキルである、すぐ上の基を示している。

【００３８】

用語「Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル」は、以下の基

【化９】



〔ここで、Ｒは、水素又はＣ１－Ｃ４アルキルである〕
を示している。

【００３９】

本明細書で、基、置換基又は部分などに関して使用されている用語「非存在（ｎｉｌ）」は、その基、置換基又は部分が存在していないことを示している。ある基、置換基又は部分が通常２つ以上の他の基、置換基又は部分に結合している場合、存在しない基、置換基又は部分の代わりに他の基、置換基又は部分が一緒に結合する。例えば、構造Ａ－Ｂ－Ｃを有する化合物において、Ｂが存在しない場合、ＡはＣに直接結合して、その化合物はＡ－Ｃである。別の例として、構造Ａ－Ｂ－Ｃを有する化合物において、Ｃが存在しない場合、その化合物はＡ－Ｂである。

【００４０】

用語「塩（単数）」及び「塩（複数）」は、獣医学的又は薬学的に許容される有機酸及び有機塩基又は無機酸及び無機塩基の塩を示している。そのような塩は、当技術分野においてよく知られており、そして、「Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅ，６６，２－１９（１９７７）」に記載されているものを包含する。その一例は、塩酸塩である。

【００４１】

「置換されていてもよい（ｏｐｔｉｏｎａｌｌｙ　ｓｕｂｓｔｉｔｕｔｅｄ）」において使用されている場合を包含する用語「置換されている（ｓｕｂｓｔｉｔｕｔｅｄ）」は、基の１つ以上の水素ラジカルにおいて、非水素ラジカル（置換基）で置き換えられている水素ラジカルを示している。該置換基は、置換位置ごとに同じであっても又は異なっていてもよいことは、理解される。本発明によって想定される基及び置換基の組み合わせは、安定であるか又は化学的に実現可能なものである。本明細書中に記載されている化合物の場合、その基及び置換基は、当該原子及び当該置換基の許容される原子価に従って選択されることができ、その結果、その選択及び置換は、安定な化合物（例えば、変換（例えば、転位、環化、脱離などによる変換）を自発的には受けない安定な化合物）をもたらす。

【００４２】

用語「安定な」は、それらの製造を可能にするための条件に付されたときに実質的に変化しない化合物を示している。非限定的な例において、安定な化合物又は化学的に実現可能な化合物は、水分又は他の化学的に反応性の条件の非存在下で、４０℃以下の温度に約１週間保たれたときに実質的に変化しない化合物である。

【００４３】

本明細書中で定義されている用語が炭素原子の数について言及している場合、その言及された数は言及された基を示しており、そして、その基における場合による置換基内に存在し得る炭素又はベンゾ縮合環を包含する縮合環の一部として存在し得る炭素は含まない、ことは理解される。

【００４４】

当業者は、本発明の化合物の一部が異性体として存在することを理解するであろう。本発明の化合物の任意の比率における全ての立体異性体（これは、幾何異性体、エナンチオマー及びジアステレオマーを包含する）は、本発明の範囲内にあることが意図されている。

【００４５】

本明細書中で使用されている場合、化学命名法の中の用語「（ＲＳ）」は、示されている立体中心におけるラセミ混合物を示している。

【００４６】

本明細書中で使用されている場合、化学命名法の中の用語「（Ｒ又はＳ）」又は「（Ｓ又はＲ）」は、示されている立体中心における２つの可能な立体配置のうちの１つを示している。

【００４７】

当業者は、さらに、本発明の化合物の一部が互変異性体として存在することも理解するであろう。本発明の化合物の全ての互変異性体形態は、本発明の範囲内にあることが意図されている。

【００４８】

本発明の化合物は、さらに、主要な原子質量を有する少なくとも１の原子が、同じ原子番号を有するが主要な原子質量とは異なる原子質量を有する原子で置き換えられている、全ての同位体変異体も包含する。同位体変異体（例えば、重水素、^{2}Ｈ）を使用することで、代謝の安定性が向上する可能性がある。さらに、本発明の化合物の特定の同位体変異体は、放射性同位体（例えば、トリチウム、^{3}Ｈ、又は、^{14}Ｃ）を組み込むことが可能であり、これは、薬物及び／又は基質の組織分布研究において有用であり得る。陽電子を放射する同位体（例えば、^{11}Ｃ、^{18}Ｆ、^{15}Ｏ及び^{13}Ｎ）による置換は、陽電子放射断層撮影（ＰＥＴ）研究において有用であり得る。

【００４９】

用語「本発明の化合物（ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ　ｏｆ　ｔｈｅ　ｉｎｖｅｎｔｉｏｎ）」及び「本発明の化合物（ａ　ｃｏｍｐｏｕｎｄ　ｏｆ　ｔｈｅ　ｉｎｖｅｎｔｉｏｎ）」及び「本発明の化合物（ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ　ｏｆ　ｔｈｅ　ｐｒｅｓｅｎｔ　ｉｎｖｅｎｔｉｏｎ）」などには、式（Ｉ）の実施形態及び本明細書中に記載されている式（Ｉ）

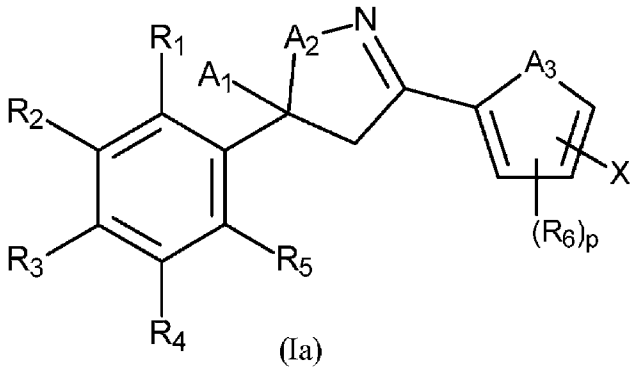
に包含される別のより特定的な実施形態及び本明細書中に記載されている例示的な化合物及びこれらの実施形態のそれぞれの塩が包含されている。

【００５０】

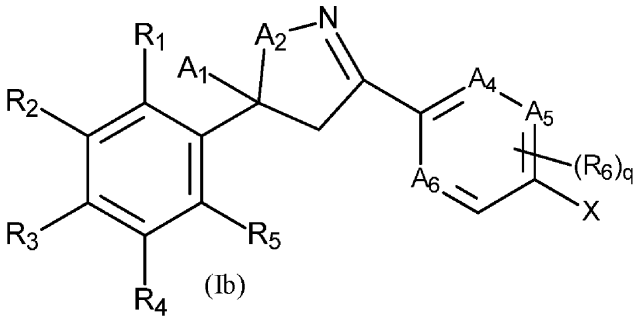
以下のような、様々な実施形態を有する式（Ｉ）で表される化合物：

式（Ｉ）

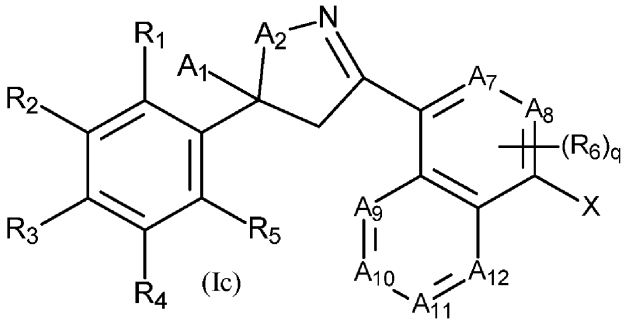
【化１０】



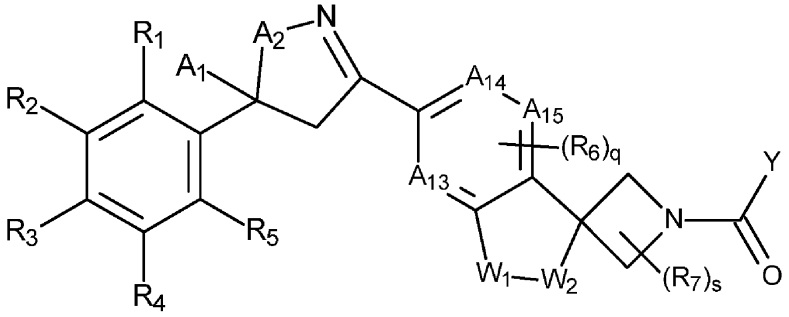
(Ia)



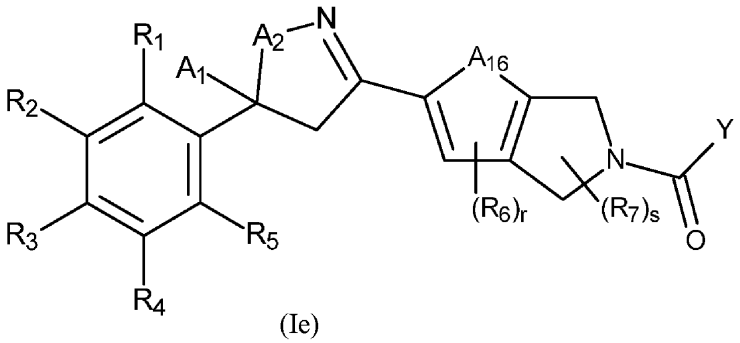
(Ib)



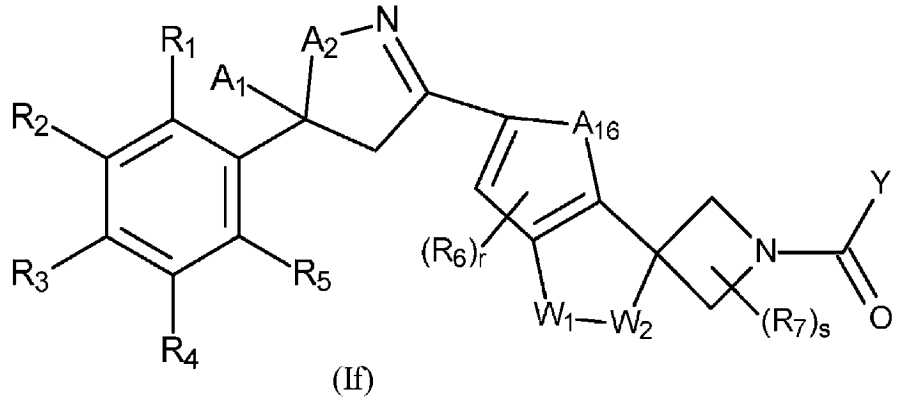
(Ic)



(Id)

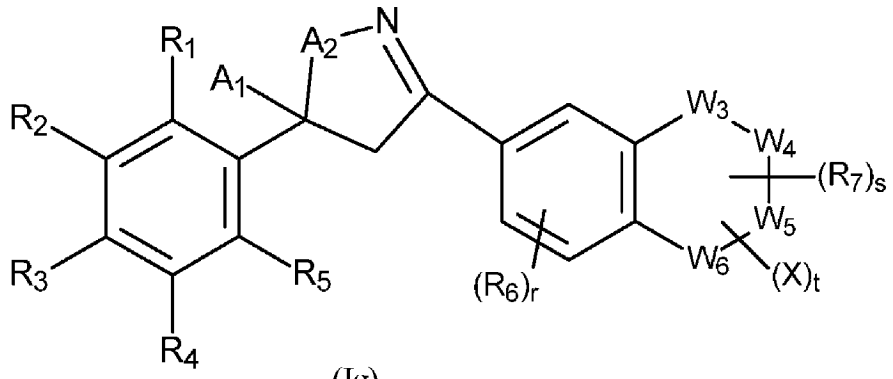


(Ie)



(If)

及び



(Ig)

Ａ４、Ａ５、Ａ６、Ａ７、Ａ９、Ａ１０、Ａ１１、Ａ１２、Ａ１４及び／又はＡ１５に関し、Ｒ６置換基は、存在する場合、ＣＨの水素に取って代わることは理解される。

【００５１】

さらに、式（Ｉｇ）で表される化合物に関し、Ｘ基は、存在する場合、Ｗ３、Ｗ４、Ｗ５又はＷ６において、－ＣＨ２－基若しくは－ＣＨ－基の水素又は－ＮＲ－基のＲと置き換わることによって結合することも理解される。

【００５２】

本発明の化合物のさらなる実施形態を、以下に記載する。

【００５３】

（１）一実施形態は、式（Ｉ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５４】

（ａ）一実施形態は、式（Ｉａ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５５】

（ｂ）一実施形態は、式（Ｉｂ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５６】

（ｃ）一実施形態は、式（Ｉｃ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５７】

（ｄ）一実施形態は、式（Ｉｄ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５８】

（ｅ）一実施形態は、式（Ｉｅ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００５９】

（ｆ）一実施形態は、式（Ｉｆ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００６０】

（ｇ）一実施形態は、式（Ｉｇ）で表される化合物又はその塩に関する。

【００６１】

（ｈ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がトリフルオロメチルであり、及び、R_5がハロゲンである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６２】

（ｉ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がハロゲンであり、及び、R_5がハロゲンである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６３】

（ｊ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がクロロであり、及び、R_5がハロゲンである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６４】

（ｋ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がハロゲンであり、及び、R_5がクロロである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６５】

（ｌ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がハロゲンであり、及び、R_5がフルオロである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６６】

（ｍ）一実施形態は、R_1が水素であり、R_2がトリフルオロメチルであり、R_3が水素であり、R_4がクロロであり、及び、R_5がフルオロである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）及び（ｇ）又はその塩に関する。

【００６７】

（ｎ）一実施形態は、A_2がＯである、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）、（ｇ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）及び（ｍ）又はその塩に関する。

【００６８】

（ｏ）一実施形態は、A_1がCF_3である、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）、（ｇ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）及び（ｎ）又はその塩に関する。

【００６９】

（ｐ）一実施形態は、A_1がCHF_2である、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）、（ｇ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）及び（ｎ）又はその塩に関する。

【００７０】

（ｑ）一実施形態は、A_3がＳである、実施形態（１）、（ａ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）及び（ｐ）又はその塩に関する。

【００７１】

（ｒ）一実施形態は、ｐが１であり、及び、R_5がC_1－C_6アルキルである、実施形態（ｑ）又はその塩に関する。

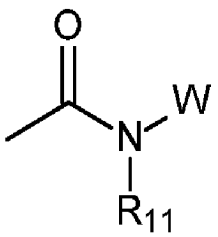
【００７２】

（ｓ）一実施形態は、R_6がメチルである、実施形態（ｒ）又はその塩に関する。

【００７３】

（ｔ）一実施形態は、A_4、A_5及びA_6がＣＨである、実施形態（１）、（ｂ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）及び（ｐ）又はその塩に関する。

【００７４】
（ｕ）一実施形態は、ｐが１であり、及び、Ｒ$_6$がＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキルである、実施形態（ｔ）又はその塩に関する。
【００７５】
（ｖ）一実施形態は、Ｒ$_6$がメチルである、実施形態（ｕ）又はその塩に関する。
【００７６】
（ｗ）一実施形態は、Ａ$_7$、Ａ$_8$、Ａ$_9$、Ａ$_{10}$、Ａ$_{11}$及びＡ$_{12}$がＣＨである、実施形態（１）、（ｃ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）及び（ｐ）又はその塩に関する。
【００７７】
（ｘ）一実施形態は、Ａ$_{13}$、Ａ$_{14}$及びＡ$_{15}$がＣＨである、実施形態（１）、（ｄ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）及び（ｐ）又はその塩に関する。
【００７８】
（ｙ）一実施形態は、Ｗ$_1$が、－ＣＨ$_2$－であり、及び、Ｗ$_2$がＯである、実施形態（ｘ）又はその塩に関する。
【００７９】
（ｚ）一実施形態は、Ｘが
【化１１】



であり、ここで、Ｒ$_{11}$が水素である、実施形態（１）、（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、（ｇ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）、（ｐ）、（ｑ）、（ｒ）、（ｓ）、（ｔ）、（ｕ）、（ｖ）、（ｗ）及び（ｘ）又はその塩に関する。
【００８０】
（ａａ）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、
ハロゲン；
シアノ；
ヒドロキシル；
オキソ；
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ；
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン及びシアノの群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］；
アセチレニル；
－ＮＨ$_2$；
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル；
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）；
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$；
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル；
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、これは、
ハロゲン、

ヒドロキシル、
シアノ、及び、
C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
C_1-C_4アルコキシ、
C_3-C_6シクロアルキル、及び、
$-NH_2$
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］；
$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル［ここで、これは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
C_1-C_4アルコキシ、
C_3-C_6シクロアルキル、及び、
$-NH_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］、
$-C(O)NH-C_1-C_6$シアノアルキル［ここで、これは、１～３個のハロゲンで置換されていてもよい］；
$-C(O)NH-C_1-C_6$ハロアルキル；
$-C(O)-$４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、これは、窒素によって結合しており、そして、Ｏ、Ｓ、Ｎの群から選択される１個又は２個の他のヘテロ原子を有していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、
ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
オキソ、
$-NH_2$、
C_1-C_7アミノカルボニル、
C_1-C_4アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
アセチレニル、
オキソ、
C_1-C_4アルコキシ、
$-NH_2$、
C_1-C_7アミノカルボニル、
$-NH(C_1-C_4$アルキル）、
$-N(C_1-C_4$アルキル）$_2$、
$-SC_1-C_4$アルキル、
$-S(O)C_1-C_4$アルキル、
$-SO_2C_1-C_4$アルキル、
$-C(O)NH-C_3-C_6$シクロアルキル、及び、
$-C(O)NH-C_1-C_6$アルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、及び、
C_3-C_6シクロアルキル

からなる群から独立して選択された１～４の置換基で置換されていてもよく、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意の他のＮは、原子価が許す限り、
水素、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
アセチレニル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）
からなる群から選択される置換基で置換されている］；
５～１０員のヘテロアリール［ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、
ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
オキソ、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、

－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル
からなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、
及び、ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、
水素、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
アセチレニル、
オキソ、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、及び、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル
からなる群から選択される置換基で置換されていてもよく、
及び、該ヘテロアリール任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されている］；
フェニル［ここで、該フェニルは、
ハロゲン、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
シアノ、又は、
ヒドロキシルからなる群から選択される１～３の置換基で置換されていてもよい］；
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル［ここで、該シクロアルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
オキソ、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３個の基で置換されていてもよい）
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、

－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、
Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、及び、
Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；
及び、
４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、Ｏ、Ｓ、Ｂ、Ｎの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、及び、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、
ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
オキソ、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、ヒドロキシル、
アセチレニル、
オキソ、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）
からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＢは、原子価が許す限り、ヒドロキシルで置換されており、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、
水素、
－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、

アセチレニル、
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルコキシ、
－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル）$_{2}$、
－ＳＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル、
－ＳＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$シクロアルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、
Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$シクロアルキル、
５～６員のヘテロアリール、及び、
フェニル（ここで、該フェニルは、
ハロゲン、
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル、
シアノ、及び、
ヒドロキシル
からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）
からなる群から選択される置換基で置換されており、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されている］；
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００８１】

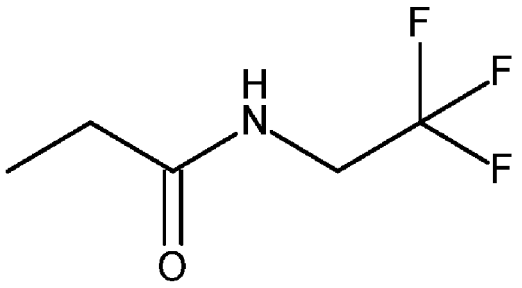
（ａｂ）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルであり、ここで、該アルキルが、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル［ここで、これは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルコキシ、
Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$シクロアルキル、及び、
－ＮＨ$_{2}$
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい］；
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$シアノアルキル［ここで、これは、１～３個のハロゲンで置換されていてもよい］；
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$ハロアルキル；及び、
－Ｃ（Ｏ）－４～７員のヘテロシクロアルキル［ここで、該ヘテロシクロアルキルは、窒素によって結合しており、及び、Ｏ、Ｓ、Ｎの群から選択される１個又は２個の他のヘテロ原子を有していてもよく、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、
ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
オキソ、
－ＮＨ$_{2}$、
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{7}$アミノカルボニル、
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、

アセチレニル、
オキソ、
Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、
－ＮＨ２、
Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、
－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、
－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、及び、
Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル
からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、
及び、４～７員のヘテロシクロアルキルの任意の他のＮは、原子価が許す限り、
水素、
－ＮＨ２、
Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、
Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
アセチレニル、
Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、
－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、
－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、
－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）
からなる群から選択される置換基で置換されている、実施形態（ａａ）又はその塩に関する。

【００８２】

（ａｃ）一実施形態は、Ｗが

【化１２】



である、実施形態（ａｂ）又はその塩に関する。

【００８３】

（ａｄ）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル〔ここで、これは、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ及び－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい〕で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００８４】

（ａｅ）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル〔ここで、これは、

ハロゲン、

シアノ、

ヒドロキシル、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、

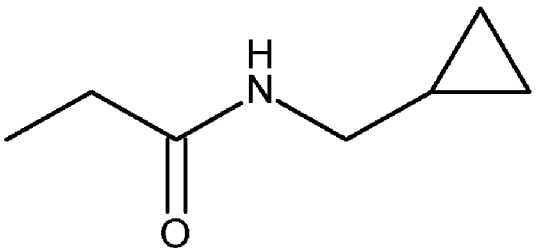
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、及び、

－ＮＨ$_2$からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい〕で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００８５】

（ａｅ１）一実施形態は、Ｗが

【化１３】

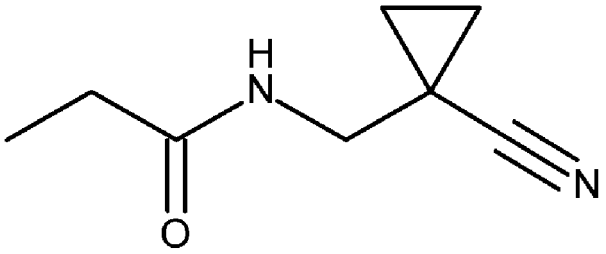


である、実施形態（ａｅ）又はその塩に関する。

【００８６】

（ａｅ２）一実施形態は、Ｗが

【化１４】



である、実施形態（ａｅ）又はその塩に関する。

【００８７】

（ａｆ）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、５～１０員のヘテロアリー〔ここで、該ヘテロアリールは、Ｏ、Ｓ、Ｂ及びＮの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有しており、ここで、該５～１０員のヘテロアリールの炭素は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよく、及び、該ヘテロアリールの任意のＢは、ヒドロキシルで置換されており、及び、該ヘテロアリールの任意のＮは、原子価が許す限り、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アセチレニル、オキソ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されていてもよく、及び、該ヘテロアリールの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されている〕で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００８８】

（ａｆ１）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、ピリジン〔ここで、該ピリジンは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよい〕で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００８９】

（ａｆ２）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルが、チアゾール〔ここで、該チアゾールは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、Ｃ$_1$

－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキルからなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２及び－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキルからなる群から独立して選択される１、２又は３の置換基で置換されていてもよい〕で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００９０】

（ａｇ）一実施形態は、Ｗが、Ｏ、Ｓ、Ｎの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有している４～７員のヘテロシクロアルキルであり、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ベンゾ縮合していてもよく、及び、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、

ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
オキソ、
Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、ヒドロキシル、
アセチレニル、
オキソ、
Ｃ１－Ｃ４アルコキシ、
Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、
－ＮＨ２、
Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、
－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）、
－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４アルキル）２、
－ＳＣ１－Ｃ４アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６アルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ１－Ｃ６ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、
水素、
－ＮＨ２、
Ｃ１－Ｃ７アミノカルボニル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４アルキル、
－ＳＯ２Ｃ１－Ｃ４ハロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、
Ｃ１－Ｃ４アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、

ヒドロキシル、
アセチレニル、
C_1－C_4アルコキシ、
C_3－C_6シクロアルキル、
－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、
－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、
－ＳC_1－C_4アルキル、
－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、
－SO_2C_1－C_4アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_1－C_6ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、
C_3－C_6シクロアルキル、
５～６員のヘテロアリール、及び、
フェニル（ここで、該フェニルは、
ハロゲン、
C_1－C_4アルキル、
シアノ、及び、
ヒドロキシル
からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）からなる群から選択される置換基で置換されており、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキル又は場合によりベンゾ縮合された４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＳは、１個又は２個の酸素原子で置換されている、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【００９１】

（ａｇ１）一実施形態は、Ｗが、Ｏ、Ｓ、Ｎの群から選択される１個又は２個のヘテロ原子を有している４～７員のヘテロシクロアルキルであり、ここで、該ヘテロシクロアルキルは、ピロリル、アゼチジニル、２－オキソアゼチジニル、イソオキサゾリジニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル及び１，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニルからなる群から選択され、ここで、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素は、
ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
ヒドロキシル、
オキソ、
C_1－C_4アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、ヒドロキシル、
アセチレニル、
オキソ、
C_1－C_4アルコキシ、
C_3－C_6シクロアルキル、
－NH_2、
C_1－C_7アミノカルボニル、
－ＮＨ（C_1－C_4アルキル）、
－Ｎ（C_1－C_4アルキル）$_2$、
－ＳC_1－C_4アルキル、
－Ｓ（Ｏ）C_1－C_4アルキル、
－SO_2C_1－C_4アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－C_3－C_6シクロアルキル、

－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～４の置換基で置換されていてもよく、
及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮは、原子価が許す限り、
水素、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、
－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
アセチレニル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、
－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、
－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、
－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、及び、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）、及び、
Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル
からなる群から選択される置換基で置換されている、実施形態（ａｇ）又はその塩に関する。

【００９２】

（ａｈ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素が、オキソ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルからなる群から独立して選択される１又は２の置換基で置換されていてもよく、及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、１～３個のハロゲン、シアノ、アセチレニル又はＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルで置換されていてもよい）で置換されている、実施形態（ａｇ）及び（ａｇ１）又はその塩に関する。

【００９３】

（ａｉ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素が、１つのオキソで置換されており、及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１つのシアノで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９４】

（ａｊ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素が、１つのオキソで置換されており、及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１～３のハロゲンで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９５】

（ａｋ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの炭素が、１つのオキソで置換されており、及び、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１つのＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９６】

（ａｌ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１つのシアノで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９７】

（ａｍ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１～３のハロゲンで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９８】

（ａｎ）一実施形態は、該４～７員のヘテロシクロアルキルの任意のＮが、原子価が許す限り、１つのＣ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されている、実施形態（ａｇ）、（ａｇ１）及び（ａｈ）又はその塩に関する。

【００９９】

（ａｎ１）一実施形態は、Ｗが、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキルであり、ここで、該シクロアルキルは、

ハロゲン、

シアノ、

ヒドロキシル、

オキソ、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン及びシアノからなる群から選択される１～３個の基で置換されていてもよい）、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$ハロアルキル、

－ＮＨ$_2$、

Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、

－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、

－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、

－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、

－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、

－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、

－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、

－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、

－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル、

Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル（ここで、該アルケニルは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）、及び、

Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル

からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい、実施形態（ｚ）又はその塩に関する。

【０１００】

（ａｏ）一実施形態は、Ｙが、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルであり、ここで、該アルキルは、

ハロゲン、

シアノ、

ヒドロキシル、

オキソ、

Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、

アセチレニル、

－ＮＨ$_2$、

Ｃ$_1$－Ｃ$_7$アミノカルボニル、

－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）、

－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル）$_2$、

－ＳＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$シクロアルキル（ここで、これは、
ハロゲン、
ヒドロキシル、
シアノ、及び、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキル（ここで、該アルキルは、
ハロゲン、
シアノ、
ヒドロキシル、
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルコキシ、及び、
－ＮＨ$_2$
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される１～３の置換基で置換されていてもよい）、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$シアノアルキル（ここで、これは、１～３のハロゲンで置換されていてもよい）、
－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$ハロアルキル
からなる群から独立して選択される１～５の置換基で置換されていてもよい、実施形態（１）、（ｄ）、（ｅ）、（ｆ）、（ｈ）、（ｉ）、（ｊ）、（ｋ）、（ｌ）、（ｍ）、（ｎ）、（ｏ）、（ｐ）、（ｔ）、（ｘ）及び（ｙ）又はその塩に関する。

【０１０１】

（ａｐ）一実施形態は、Ｙが、１つの－ＳＯ$_2$Ｃ$_1$－Ｃ$_4$アルキルで置換されたＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキルである、実施形態（ａｑ）又はその塩に関する。

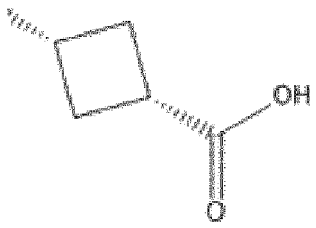
【０１０２】

（ａｑ）一実施形態は、Ｙが、１つの－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$で置換されたＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキルである、実施形態（ａｏ）又は（ａｐ）又はその塩に関する。

【０１０３】

（ａｒ）一実施形態は、Ｗが、

【化１５】

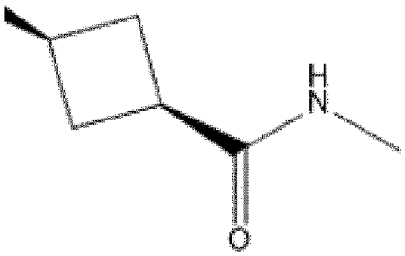


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０４】

（ａｓ）一実施形態は、Ｗが、

【化１６】

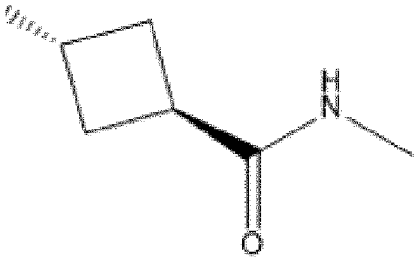


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０５】

（ａｔ）一実施形態は、Ｗが、

【化１７】

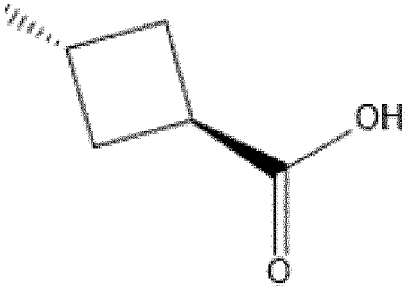


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０６】

（ａｕ）一実施形態は、Ｗが、

【化１８】

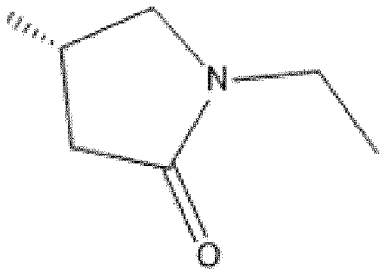


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０７】

（ａｓ）一実施形態は、Ｗが、

【化１９】

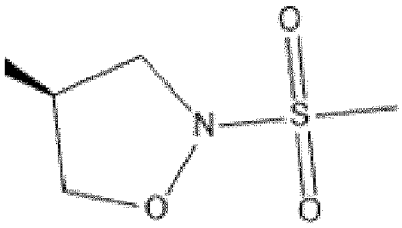


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０８】

（ａｔ）一実施形態は、Ｗが、

【化２０】

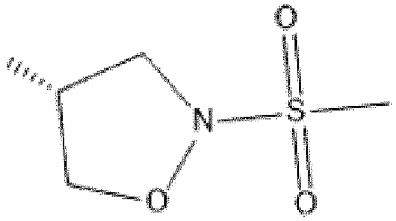


である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１０９】

（ａｕ）一実施形態は、Ｗが、

【化２１】



である、実施形態（ｚ）に関する。

【０１１０】

（ｘａ）別の実施形態は、例示されている化合物の各々又はその塩に関する。

【０１１１】

（ｘｂ）別の実施形態は、例示されている、描かれている又は命名される各化合物の各立体異性体又はその塩に関する。

【０１１２】

（ｘｃ）別の実施形態は、例示されている化合物の各々の塩に関する。

【０１１３】

本発明の化合物は、様々な方法によって調製することが可能であり、ここで、それら方法の多くは、当該技術分野において既に記載されている。例えば、ＷＯ２００５／０８５２１６、ＷＯ２００７／０７９１６２、ＵＳ２００７／０６６６１７、ＵＳ２０１３０１３１０１７、ＷＯ２００９／００２８０９、ＷＯ２００９／１１２２７５、ＷＯ２０１０

／００３９２３、ＷＯ２０１０／０７００６８、ＷＯ２０１２／１２０３９９及びＷＯ２０１３／０７９４０７を参照されたい。

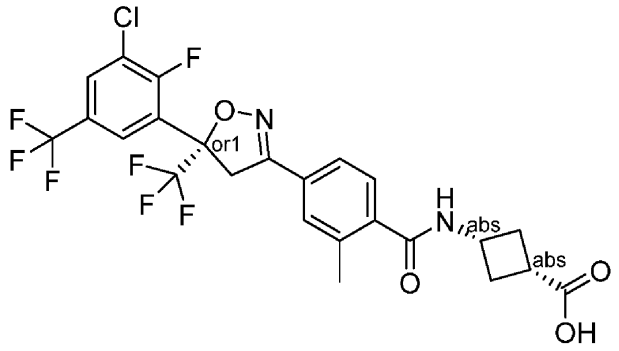
【０１１４】

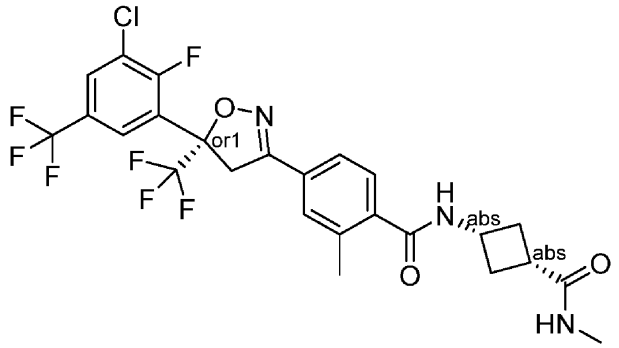
本開示は、半減期が延長された式（Ｉ）で表される化合物に関する。式（Ｉ）で表される化合物は、メタ位にトリフルオロメチル基を有するか又はパラ位及び／若しくはオルト位にハロゲンを有するかのいずれかである。従って、式（Ｉ）で表される化合物は、以下の特徴を含んでいる：片方又は両方のメタ位置にあるトリフルオロメチル基；オルト位置にあるハロゲン；オルト位置及びパラ位置の各々にあるハロゲン；又は、オルト位置の各々にあるハロゲン及びパラ位置にあるトリフルオロメチル。式（Ｉ）で表される化合物は、他の置換基を有し得るが、上述の基が含まれることが理解される。いかなる特定の理論にも束縛されるものではないが、本出願人は、オルト位置及びパラ位置の両方での代謝の阻害が、経口投与又は注射の後の持続時間を向上させると考えている。

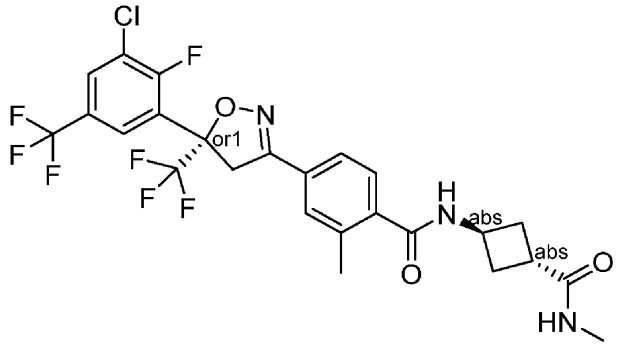
【０１１５】

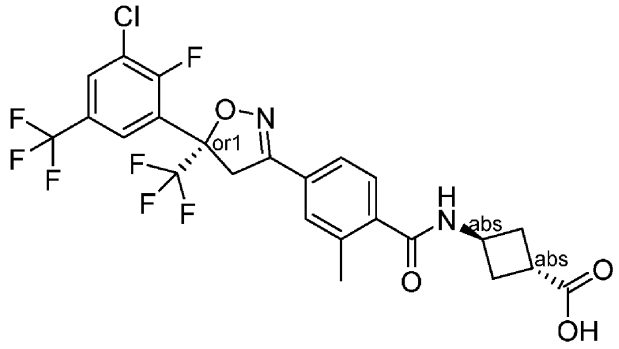
以下の例は、例示的且つ非限定的であることを意図しており、そして、本発明の特定の実施形態を表している。

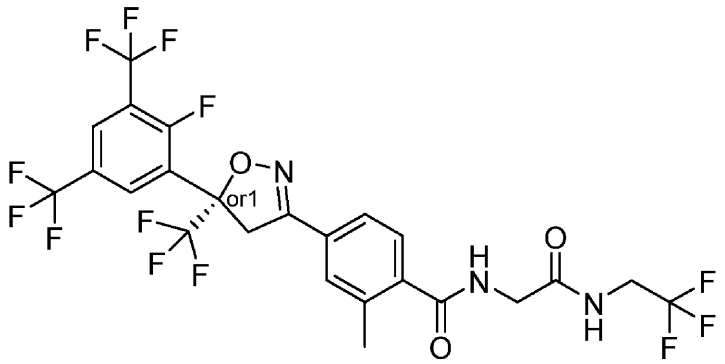
【化２２】

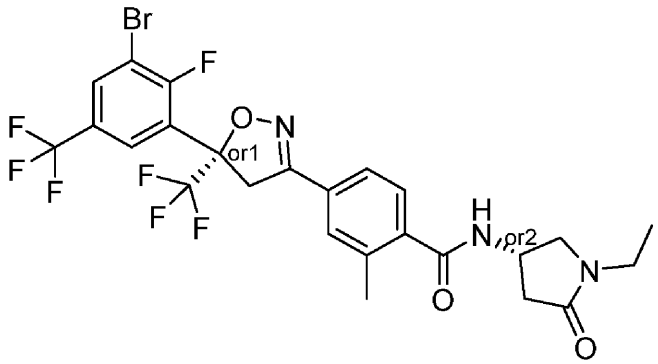


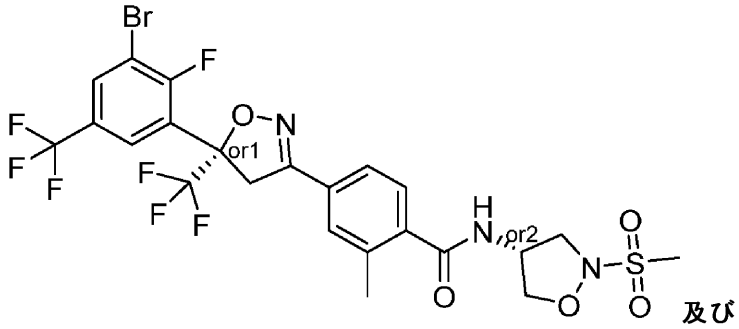




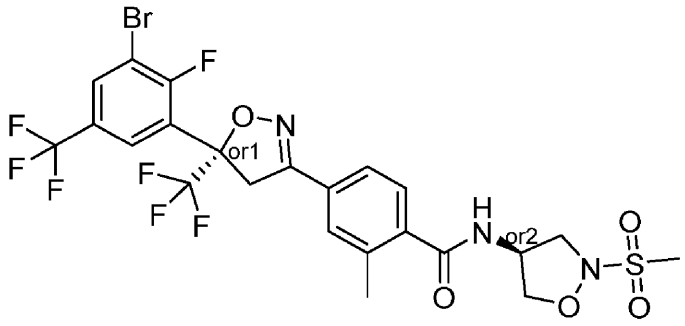








及び

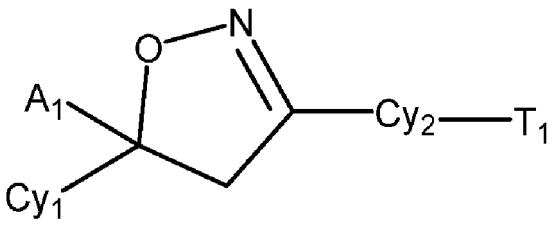


及び、上記化合物の各立体異性体。

【０１１６】

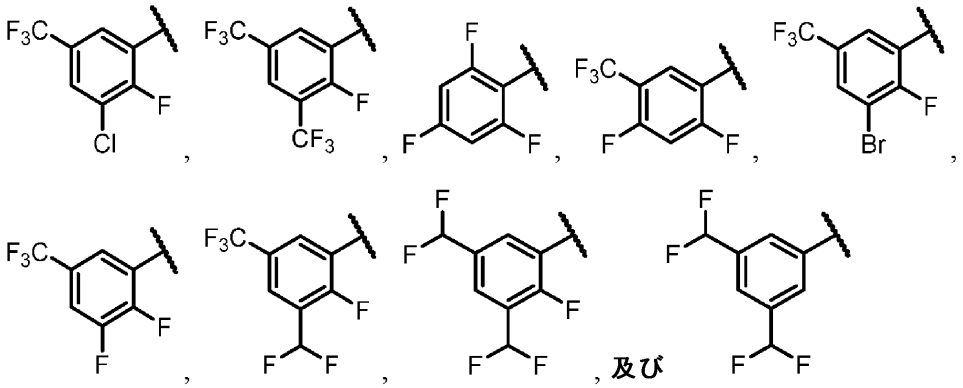
別の態様において、開示されているのは、式（ＩＩ）

【化２３】

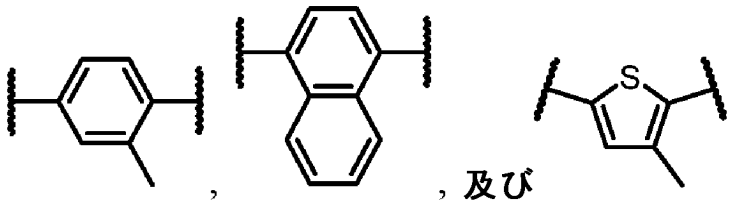


(II)

〔式中、
Ａ$_1$は、－ＣＦ$_3$又は－ＣＨＦ$_2$であり；
Ｃｙ$_1$は、
【化２４】

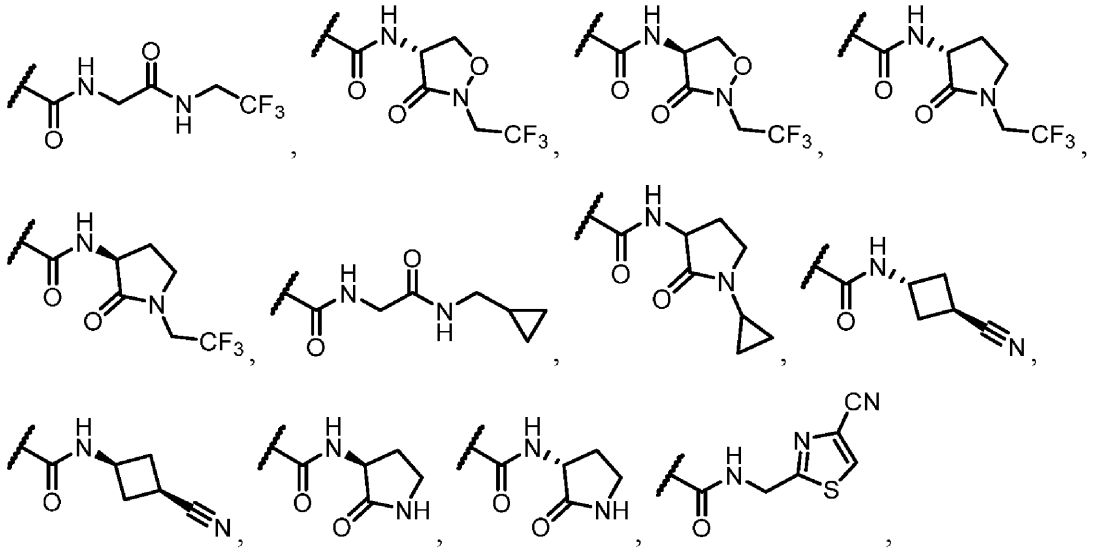


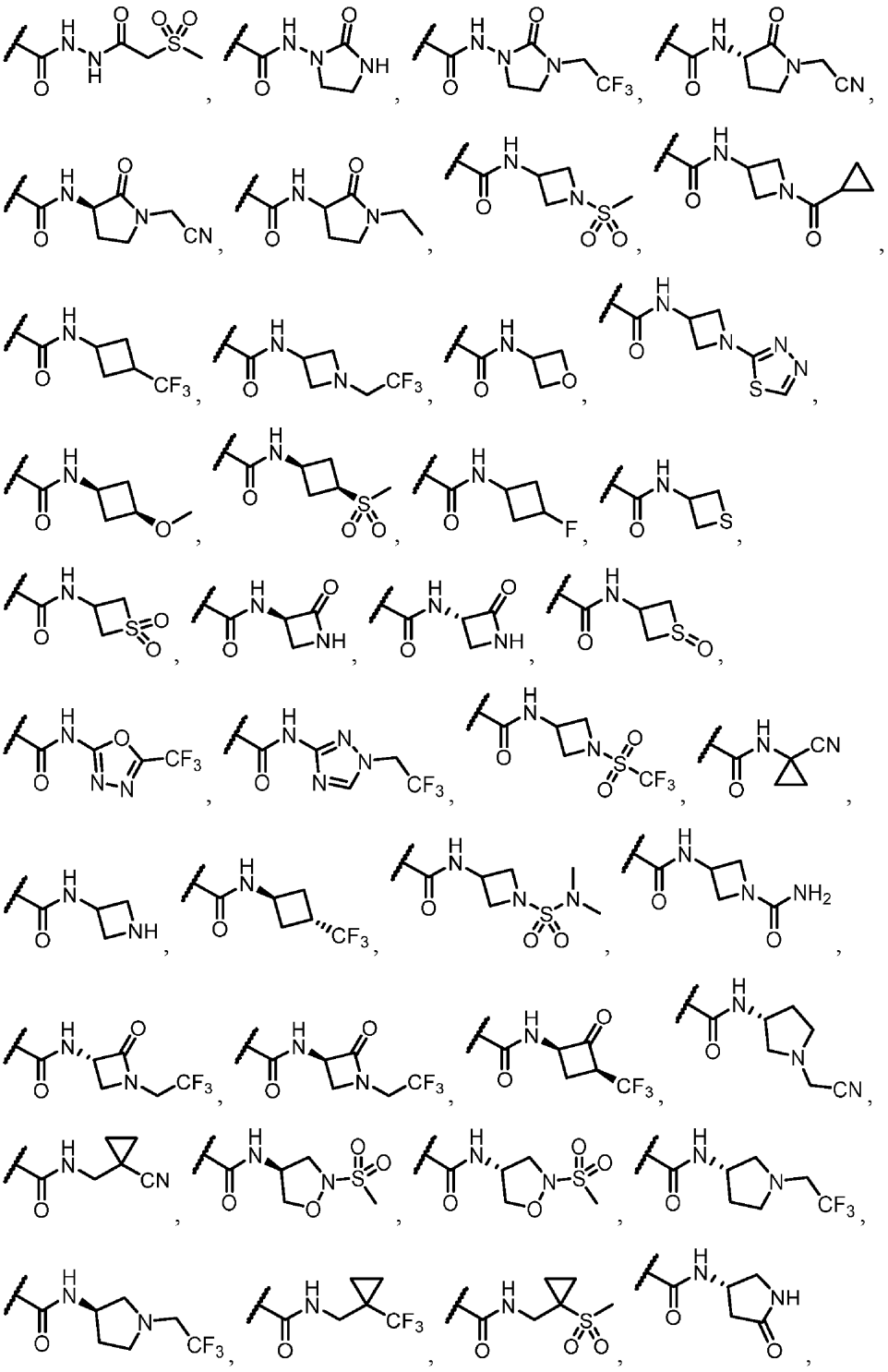
から選択され；
Ｃｙ$_2$は、
【化２５】

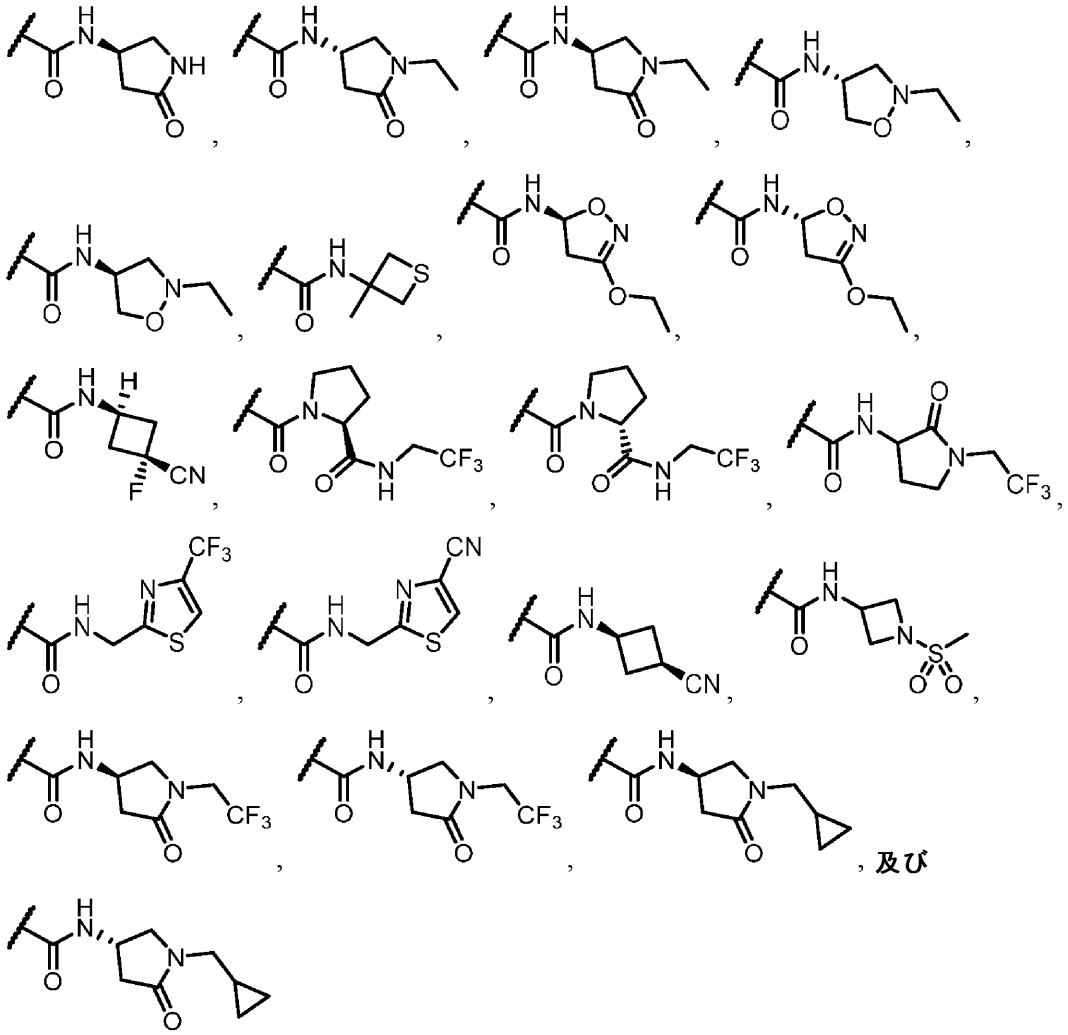


から選択され；及び、
Ｔ$_1$は、

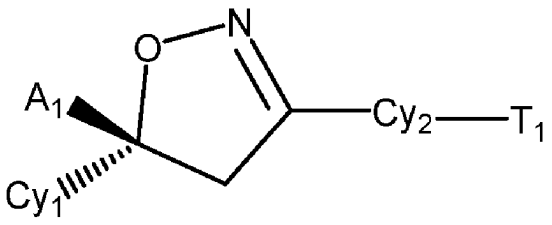
【化２６】







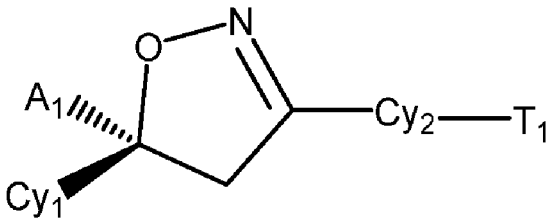
から選択される〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１１７】
一実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩａ）
【化２７】



(IIa)

〔式中、A_1、Cy_1、Cy_2及びT_1は、上記で定義されているとおりである〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１１８】
別の実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩｂ）

【化２８】



(IIb)

〔式中、A_1、Cy_1、Cy_2及びT_1は、上記で定義されているとおりである〕
で表される化合物又はその塩である。

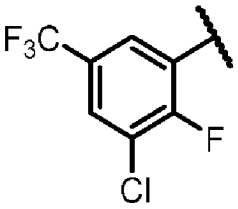
【０１１９】

特定の実施形態では、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）のA_1は、$-CF_3$である。

【０１２０】

特定の実施形態では、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）のCy_1は、

【化２９】

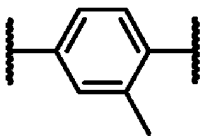


である。

【０１２１】

特定の実施形態では、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）のCy_2は、

【化３０】

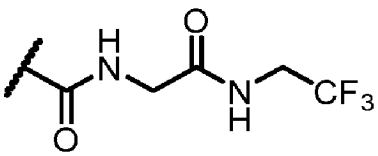


である。

【０１２２】

特定の実施形態では、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）のT_1は、

【化３１】

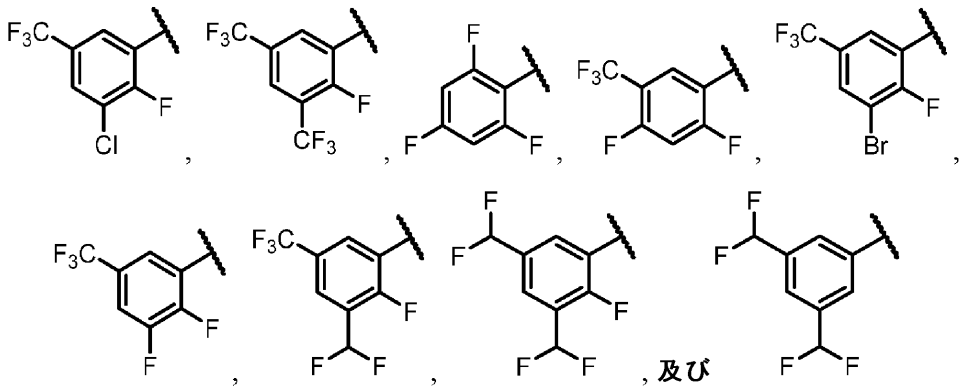


である。

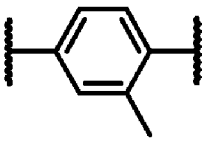
【０１２３】

特定の実施形態では、開示されているのは、式式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）〔式中、

Ａ１は、－ＣＦ３であり；
Ｃｙ１は、
【化３２】

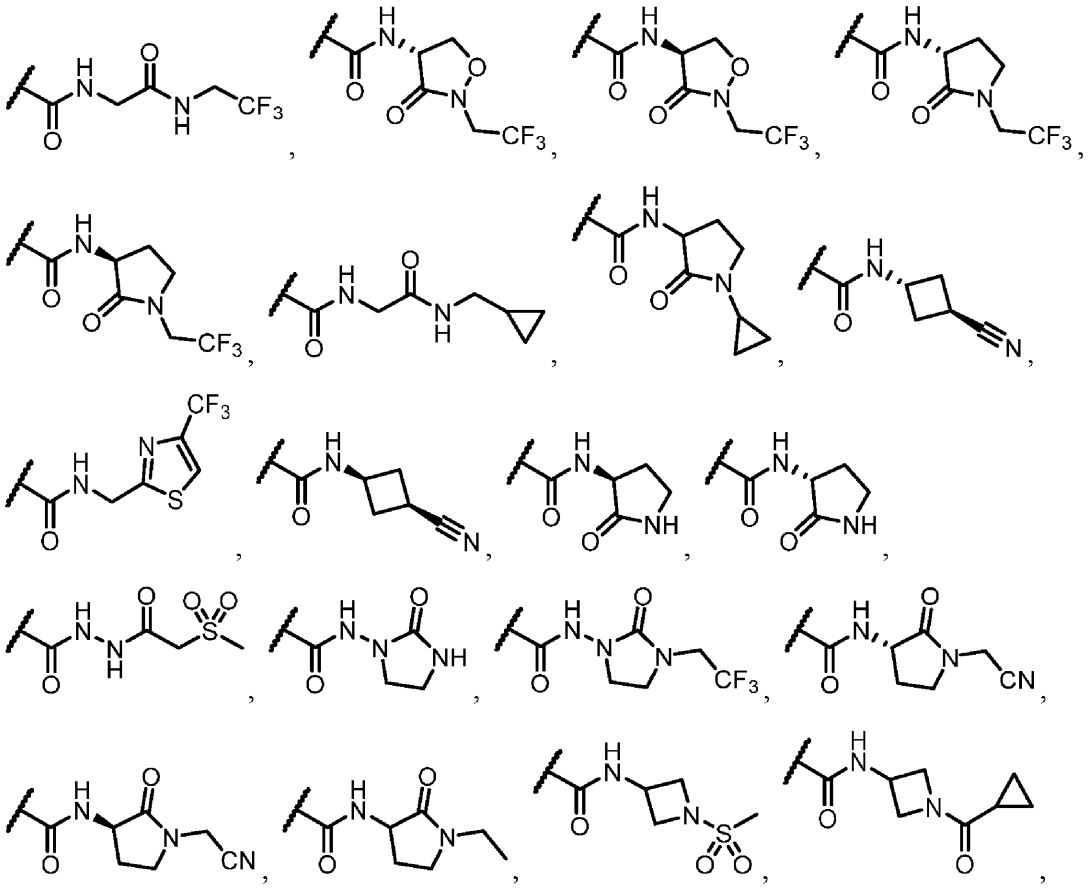


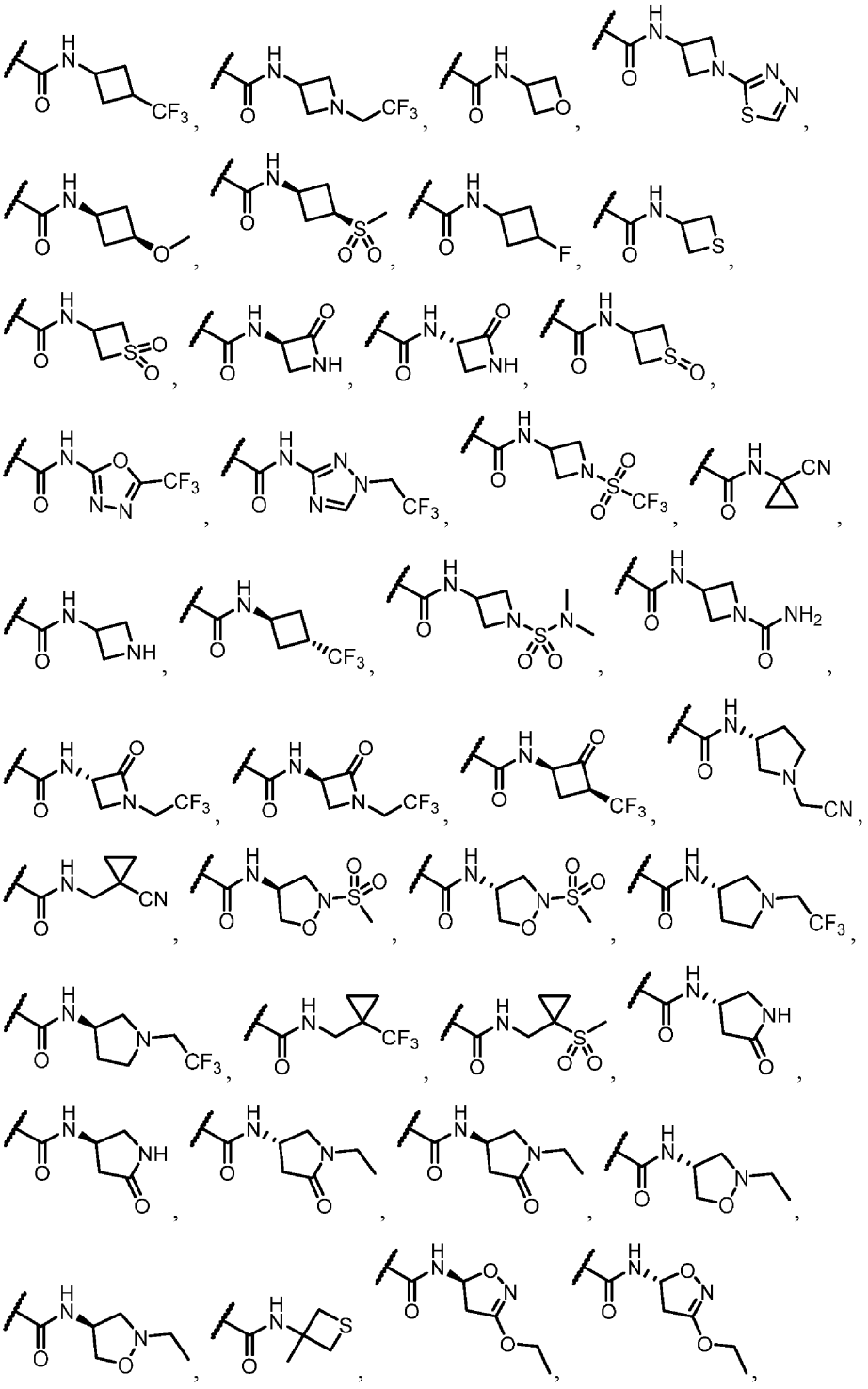
から選択され；
Ｃｙ２は、
【化３３】

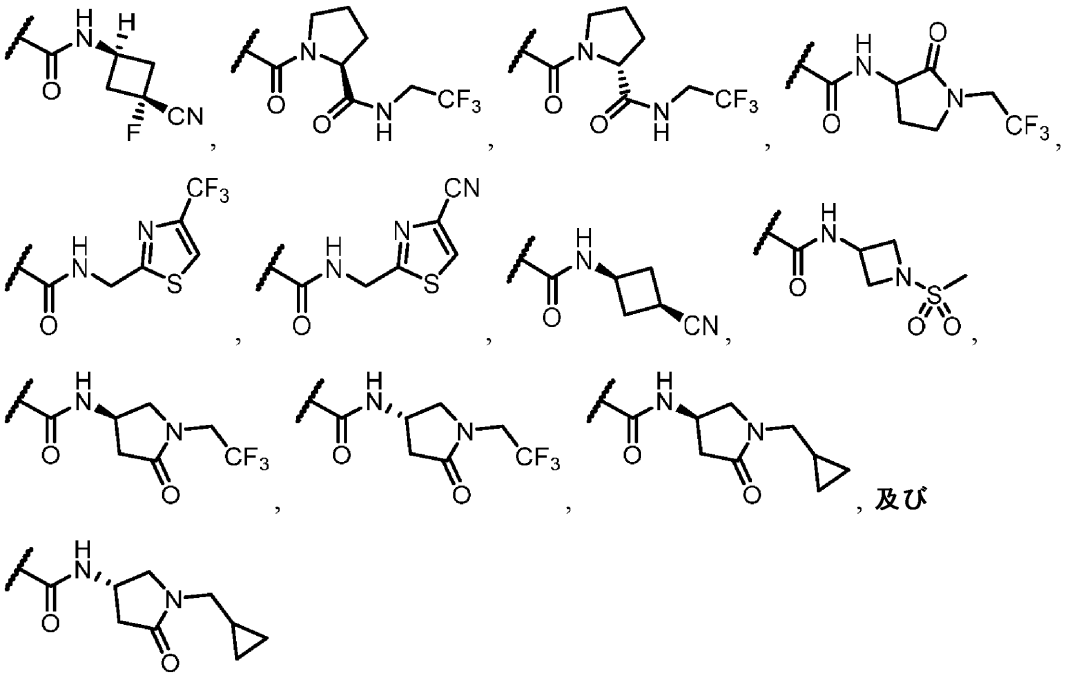


であり；
Ｔ１は、

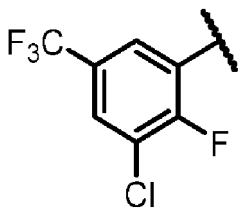
【化３４】



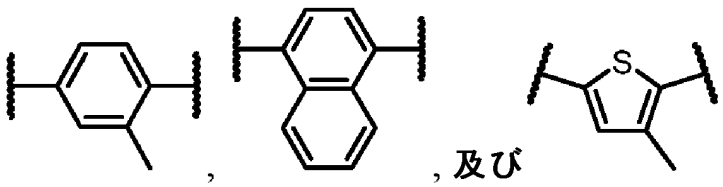




である〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１２４】
特定の実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）〔式中、
A_1は、－CF_3であり；
Cy_1は、
【化３５】

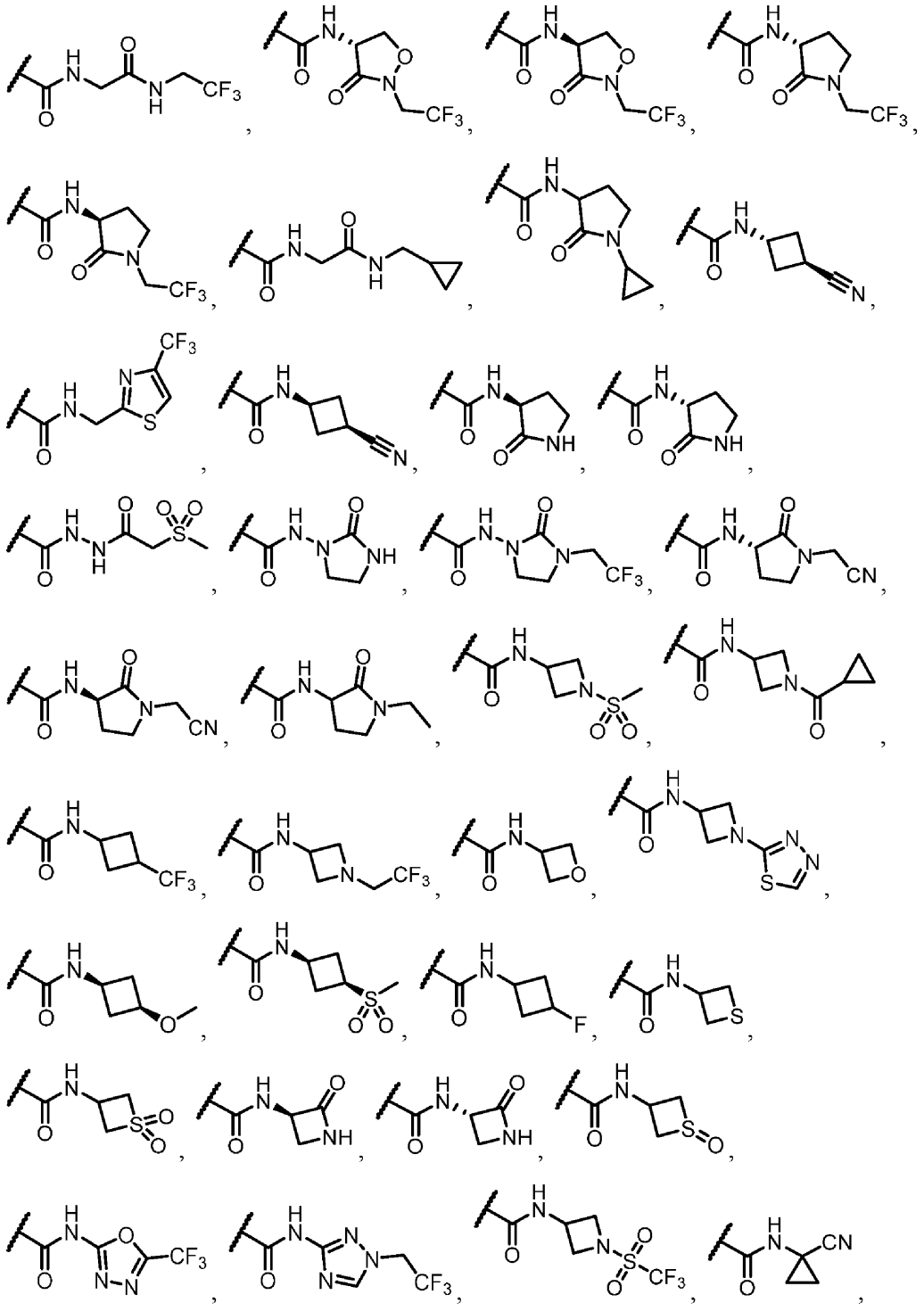


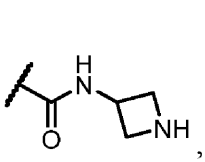
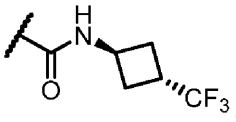
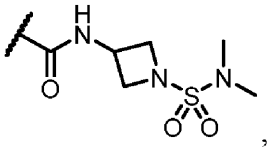
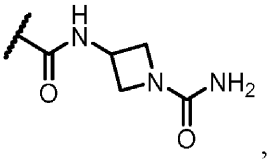
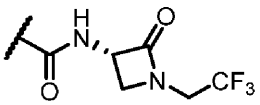
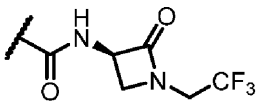
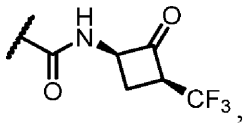
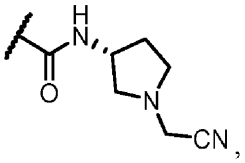
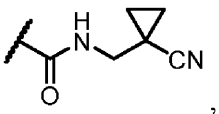
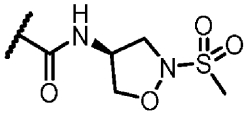
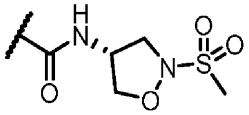
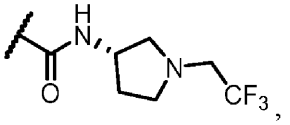
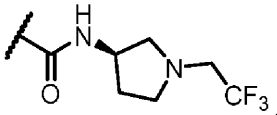
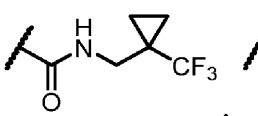
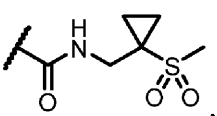
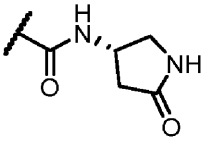
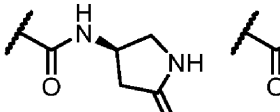
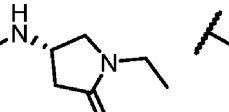
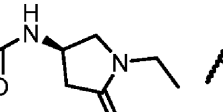
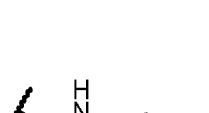
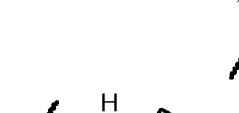
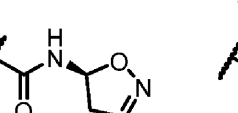
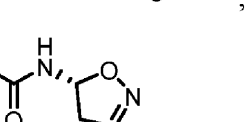
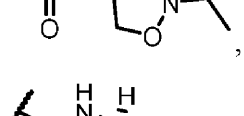
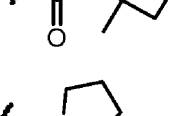
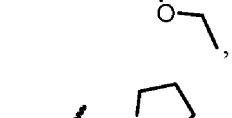
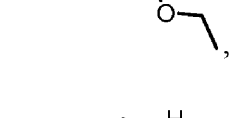
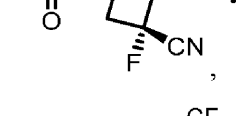
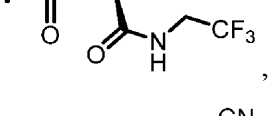
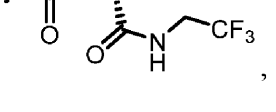
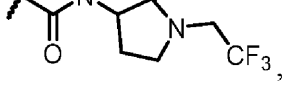
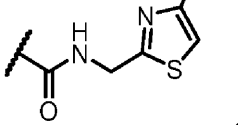
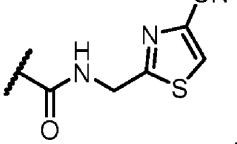
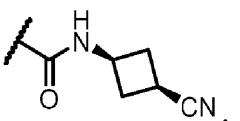
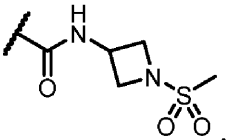
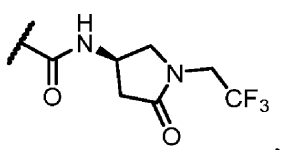
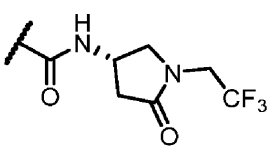
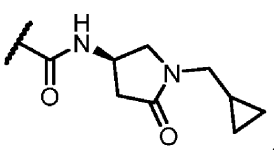
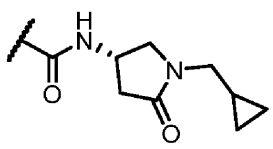
であり；
Cy_2は、
【化３６】



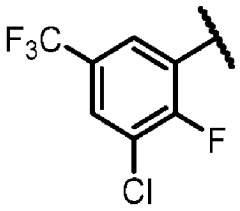
から選択され；
T_1は、

【化３７】

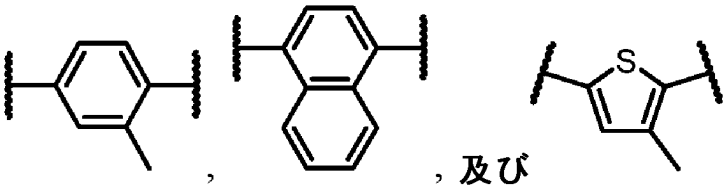


,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
,
, 及び


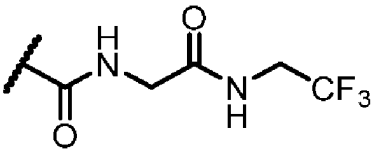
である〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１２５】
特定の実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩ）、式（ＩＩａ）又は式（ＩＩｂ）〔式中、
A_1は、－CF_3であり；
Cy_1は、
【化３８】



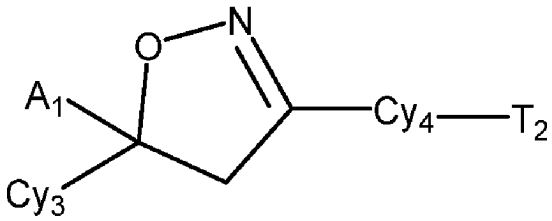
であり；
Cy_2は、
【化３９】



から選択され；
T_1は、
【化４０】



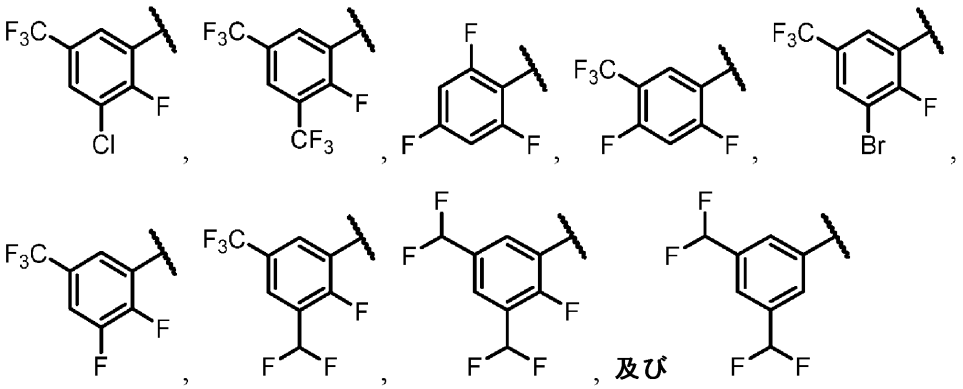
である〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１２６】
別の態様において、開示されているのは、式（ＩＩＩ）
【化４１】



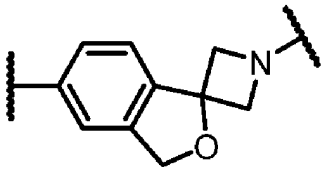
(III)

〔式中、

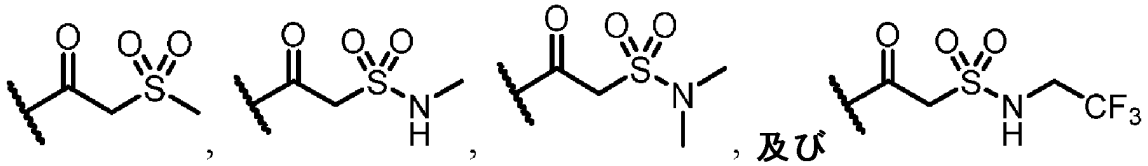
Ａ１は、－ＣＦ３又は－ＣＨＦ２であり；
Ｃｙ３は、
【化４２】



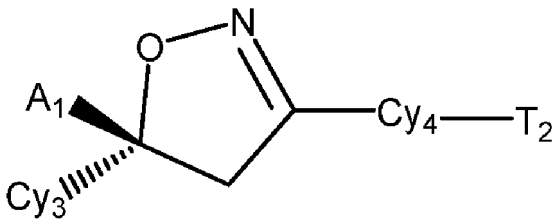
から選択され；
Ｃｙ４は、
【化４３】



であり；
Ｔ２は、
【化４４】



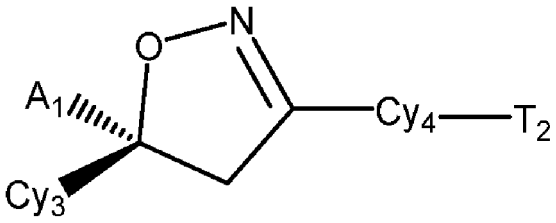
から選択される〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１２７】
一実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩＩａ）
【化４５】



(IIIa)

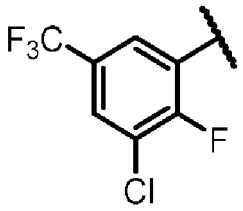
〔式中、Ａ１、Ｃｙ３、Ｃｙ４及びＴ２は、上記で定義されているとおりである〕

で表される化合物又はその塩である。
【０１２８】
別の実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩＩｂ）
【化４６】

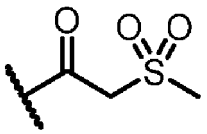


(IIIb)

〔式中、Ａ$_1$、Ｃｙ$_3$、Ｃｙ$_4$及びＴ$_2$は、上記で定義されているとおりである〕
で表される化合物又はその塩である。
【０１２９】
特定の実施形態では、式（ＩＩＩ）、式（ＩＩＩａ）又は式（ＩＩＩｂ）のＡ$_1$は、－ＣＦ$_3$である。
【０１３０】
特定の実施形態では、式（ＩＩＩ）、式（ＩＩＩａ）又は式（ＩＩＩｂ）のＣｙ$_3$は、
【化４７】

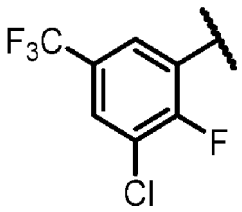


である。
【０１３１】
特定の実施形態では、式（ＩＩＩ）、式（ＩＩＩａ）又は式（ＩＩＩｂ）のＴ$_2$は、
【化４８】



である。
【０１３２】
特定の実施形態では、開示されているのは、式（ＩＩＩ）、式（ＩＩＩａ）又は式（ＩＩＩｂ）〔式中、
Ａ$_1$は、－ＣＦ$_3$であり；
Ｃｙ$_3$は、

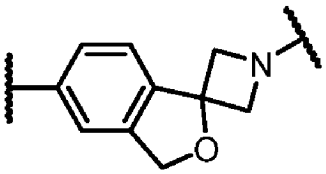
【化４９】



であり；

Ｃｙ$_4$は、

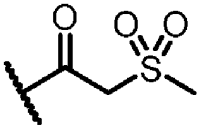
【化５０】



から選択され；

Ｔ$_3$は、

【化５１】



である〕

で表される化合物又はその塩である。

【０１３３】

以下の例は、例示的且つ非限定的であることを意図しており、そして、本発明の特定の実施形態を表している。

【０１３４】

分析は、Ｗａｔｅｒｓ　ＳＱ　Ｄｅｔｅｃｔｏｒ　２シングル四重極質量分析計（ＭＳ）検出器に連結されたＷａｔｅｒｓ　Ａｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｌｉｑｕｉｄ　Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ（ＬＣ）システムを使用して、実施した。ＵＶ（ＤＡＤ）の収集は、２００－４００ｎｍ（分解能１．２ｎｍ）のスキャン範囲で実施した。ＭＳは、陽イオンモード及び陰イオンモードの両方でエレクトロスプレーイオン化源（ＥＳＩ）を用いて作動させた。キャピラリー電圧３．５０（ｋＶ）、コーン電圧３５（Ｖ）、及び、脱溶媒温度５５０℃。脱溶媒気体流量１０００（Ｌ／時間）、コーン気体流量５０（Ｌ／時間）。ＭＳ収集範囲は、１００－１５００ｍ／ｚに設定した。ＭＳスキャンサイクル時間は、０．５秒であった。データ収集は、Ｗａｔｅｒｓ　Ｍａｓｓｌｙｎｘソフトウェアを使用して行った。

【０１３５】

方法Ａ：　分析は、長さ５０ｍｍ、内径２．１ｍｍ及び粒径１．７μｍのＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　ＢＥＨ　Ｃ１８カラムで実施した。使用した移動相は、以下のとおりであった：Ａ＝水（０．１％ギ酸含有）／Ｂ＝ＣＨ$_3$ＣＮ（０．１％ギ酸含有）。

【０１３６】

方法Ｂ：　分析は、長さ５０ｍｍ、内径２．１ｍｍ及び粒径１．７μｍのＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　ＢＥＨ　Ｃ１８カラムで実施した。使用した移動相は、以下のとおりであった：Ａ＝水（０．１％ギ酸含有）／Ｂ＝ＣＨ$_3$ＣＮ。

【０１３７】
方法Ｃ：　分析は、長さ５０ｍｍ、内径２．１ｍｍ及び粒径１．７μｍのＡｃｑｕｉｔｙ ＵＰＬＣ ＢＥＨ Ｃ１８カラムで実施した。使用した移動相は、以下のとおりであった：Ａ＝水（１０ｍＭ 酢酸アンモニウム含有）／Ｂ＝CH_3CN。
【０１３８】
分析は、イオントラップ質量分析器と連結したＵｌｔｒａ Ｈｉｇｈ Ｐｅｒｆｏｒｍａｎｃｅ Ｌｉｑｕｉｄ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ（ＵＨＰＬＣ）システム（Ｍａｋｅ－Ｔｈｅｒｍｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ）を使用して実施した。ＵＶの収集は、２００－４００ｎｍ（分解能１ｎｍ）のスキャン範囲で実施した。ＭＳは、陽イオンモード及び陰イオンモードの両方で、シース気体流量（ａｒｂ）：４０、補助気体流量（ａｒｂ）：２０、スイープ気体流量（ａｒｂ）：１、スプレー電圧（ｋｖ）：５、キャピラリー温度（℃）：３５０、キャピラリー電圧（Ｖ）：３０、チューブレンズ（Ｖ）：陽モード３０及び陰モード－３０を使用して、エレクトロスプレーイオン化源（ＥＳＩ）を用いて、作動させた。ＭＳ収集範囲は、１００－２０００ｍ／ｚに設定した。ＭＳスキャンサイクル時間は、３マイクロスキャンであった。データ収集は、Ｘｃａｌｉｂｕｒソフトウェアを使用して行った。
【０１３９】
方法Ｄ：　分析は、長さ５ｃｍ、内径２．１ｍｍ及び粒径２．７μｍのＡｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８で実施した。使用した移動相は、以下のとおりであった：Ａ＝水（０．１％ギ酸含有）／Ｂ＝１００％CH_3CN。
【０１４０】
分析は、四重極質量分析（ＭＳ）検出器に連結されたＬｉｑｕｉｄ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ（ＬＣ）システムを使用して実施した。ＵＶ（ＤＡＤ）収集は、２００－４００ｎｍのスキャン範囲で実施した。
【０１４１】
ＬＣ－ＭＳ、分析方法Ｅ：
機器：ＳＨＩＭＡＤＺＵ ＬＣＭＳ － ＵＦＬＣ ２０－ＡＤ － ＬＣＭＳ ２０２０ ＭＳ検出器； カラム：Ａｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８ ２．７μｍ、５０×３．０ｍｍ； 溶離液Ａ：水＋０．０５体積％トリフルオロ酢酸、溶離液Ｂ：CH_3CN＋０．０５体積％トリフルオロ酢酸。
【０１４２】
ＬＣ－ＭＳ、分析方法Ｆ：
機器：ＳＨＩＭＡＤＺＵ ＬＣＭＳ － ＵＦＬＣ ２０－ＡＤ － ＬＣＭＳ ２０２０ ＭＳ検出器； カラム：Ｋｉｎｅｔｅｘ ＥＶＯ Ｃ１８ ２．６μｍ、５０×３．０ｍｍ； 溶離液Ａ：水＋０．０５体積％炭酸水素アンモニウム、溶離液Ｂ：CH_3CN。
【０１４３】
本明細書中で使用されている場合：ａｑは水性を示しており、ｂｒは広幅線を示しており、CH_3CNはアセトニトリルを示しており、ｄは二重線を示しており、ｄｄは二重線の二重線を示しており、ＤＣＭはジクロロメタンを示しており、ＤＣＥはジクロロエタンを示しており、ＤＩＰＥＡはＮ－ジイソプロピルエチルアミンを示しており、ＤＭＦはＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドを示しており、ＤＭＳＯはジメチルスルホキシドを示しており、ｅｅはエナンチオマー過剰率を示しており、ＥＳはエレクトロスプレーイオン化を示しており、ＥｔＯＡｃは酢酸エチルを示しており、ｈは時間（ｓ）を示しており、ＨＡＴＵは１－［ビス（ジメチルアミノ）メチレン］－１Ｈ－１，２，３－トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニウム ３－オキシド ヘキサフルオロホスフェートを示しており、ＨＰＬＣは高性能液体クロマトグラフィーを示しており、ｉＰｒＯＨはイソプロパノールを示しており、Ｊはカップリング定数を示しており、ＬＣＭＳは液体クロマトグラフィー－質量分析を示しており、ｍ／ｚは質量電荷比を示しており、Ｍはモル濃度を示しており、ｍは多重線を示しており、ＭｅＯＨはメタノールを示しており、ｍｉｎ．は分を示しており、$NaHCO_3$は重炭酸ナトリウムを示しており、Na_2CO_3は炭酸ナトリウムを示して

おり、NEt_3はトリエチルアミンを示しており、ＮＭＲは核磁気共鳴を示しており、ｑは四重線を示しており、ｑｕｉｎｔは五重線を示しており、ｒｔは室温を示しており、R_tは保持時間を示しており、ｓは一重線を示しており、ｓａｔ．は飽和を示しており、Ｔは温度を示しており、ｔは三重線を示しており、ｔｄは二重線の三重線を示しており、ＴＨＦはテトラヒドロフランを示しており、ｗｔは重量を示しており、及び、δは化学シフトを示している。

【実施例】

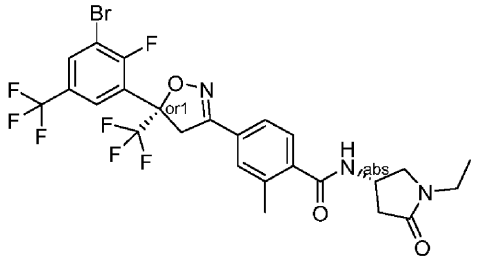
【０１４４】

４－（（Ｒ*）－５－（３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（トリフルオロメチル）－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－３－イル）－Ｎ－（（Ｓ）－１－エチル－５－オキソピロリジン－３－イル）－２－メチルベンズアミド（実施例１．１）

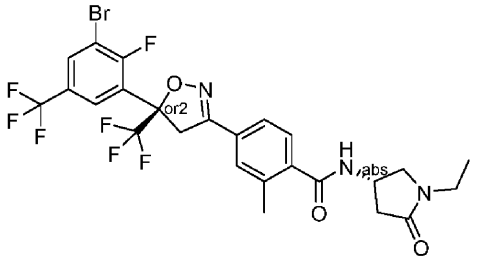
及び、

４－（（Ｓ*）－５－（３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（トリフルオロメチル）－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－３－イル）－Ｎ－（（Ｓ）－１－エチル－５－オキソピロリジン－３－イル）－２－メチルベンズアミド（実施例１．２）

【化５２】



及び



２－［３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル］－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン（１．３ｇ、３．５ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（１５ｍＬ）と水（７．５ｍＬ）に溶解させた溶液を撹拌しながら、それに、炭酸二カリウム（１．０２ｇ、７．３８ｍｍｏｌ）を添加し、その混合物をN_2－ガスで１０分間脱ガスした。２－ブロモ－３，３，３－トリフルオロ－プロパ－１－エン（０．７６ｇ、４．３ｍｍｏｌ）及びビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリド（０．２５ｇ、０．３６ｍｍｏｌ）を添加し、その反応混合物を８０℃で３時間加熱した。次いで、その混合物を室温まで冷却し、ジエチルエーテル（２×１０ｍＬ）で抽出した。その有機層を合してブライン（１０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で脱水し、減圧下で濃縮して、１－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）－３－［１－（トリフルオロメチル）ビニル］ベンゼンが褐色の液体として得られた。これは、それ以上精製することなく次の段階で直ぐに使用した。

【０１４５】

メチル　４－（ヒドロキシイミノメチル）－２－メチル－ベンゾエート（５００ｍｇ、２．５９ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（５ｍＬ）に溶解させた溶液を撹拌しながら、それに、Ｎ－クロロスクシンイミド（０．４５ｇ、３．４ｍｍｏｌ）を室温で添加し、その混合物を４０℃で１０分間加熱した。次いで、その混合物を０℃まで冷却し、１－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）－３－［１－（トリフルオロメチル）ビニル］ベンゼン（１．０５ｇ、３．１２ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、NEt_3（０．４０ｍＬ、２．８５ｍｍｏｌ）を添加し、その反応物を室温で３時間撹拌した。その反応混合物を水（１０ｍＬ）を添加することでクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３０ｍＬ）で抽出した。その有機層をブライン（３×１５ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で脱水し、減圧下で濃縮した。その粗製生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（石油エーテル中の０－２０％Ｅ

ｔＯＡｃ）で精製して、メチル　４－［５－［３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル］－５－（トリフルオロメチル）－４Ｈ－イソオキサゾール－３－イル］－２－メチル－ベンゾエートがベージュ色の半固体として得られた。

【０１４６】

LC-MS（方法 A）R_t= 2.78 分, m/z= 528.1 $[M+H]^+$.

メチル　４－［５－［３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル］－５－（トリフルオロメチル）－４Ｈ－イソオキサゾール－３－イル］－２－メチル－ベンゾエート（５００ｍｇ、０．９ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（５ｍＬ）と水（５ｍＬ）に溶解させた溶液を撹拌しながら、それに、水酸化リチウム一水和物（０．１２ｇ、２．９ｍｍｏｌ）を室温で添加し、その混合物を６０℃で１６時間加熱した。次いで、その混合物を室温まで冷却し、溶媒を減圧下で蒸発させた。その残渣を水（５ｍＬ）に溶解させ、ＨＣｌ溶液（１Ｍ）を用いて酸性化してｐＨ約２～３とし、ＥｔＯＡｃ（２×２５ｍＬ）で抽出した。その有機層を合してブライン（１０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で脱水し、減圧下で濃縮して、４－［５－［３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル］－５－（トリフルオロメチル）－４Ｈ－イソオキサゾール－３－イル］－２－メチル－安息香酸がベージュ色の固体として得られた。

【０１４７】

LC-MS（方法 D）R_t= 2.74 分, m/z= 514.3 $[M+H]^+$.

４－［５－［３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル］－５－（トリフルオロメチル）－４Ｈ－イソオキサゾール－３－イル］－２－メチル－安息香酸（０．３１ｇ、０．６０ｍｍｏｌ）と（Ｓ）－４－アミノ－１－エチルピロリジン－２－オン・ＨＣｌ（１２１ｍｇ、０．７３ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（５ｍＬ）に溶解させた溶液を撹拌しながら、それに、ＨＡＴＵ（０．２８ｇ、０．７４ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、ＤＩＰＥＡ（０．３２ｍＬ、１．８ｍｍｏｌ）を室温で添加し、その混合物を２時間撹拌した。その反応混合物を水（５ｍＬ）を添加することでクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×１５ｍＬ）で抽出した。その有機層を合してブラインで洗浄し、無水Na_2SO_4で脱水し、減圧下で濃縮した。その粗製生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（石油エーテル中の０－５０％ＥｔＯＡｃ）で精製して、標題化合物が得られた。

【０１４８】

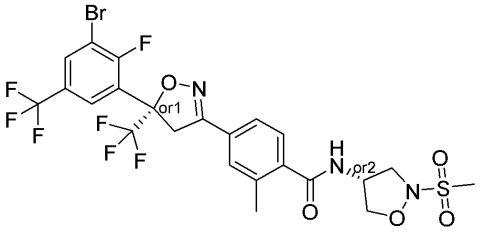
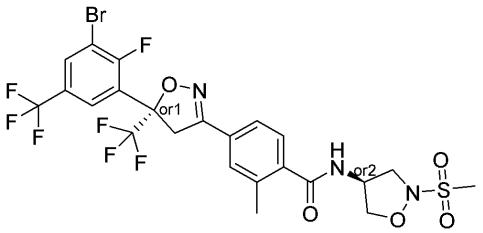
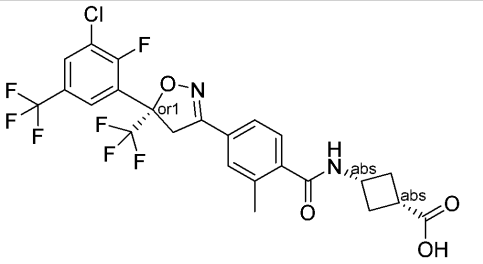
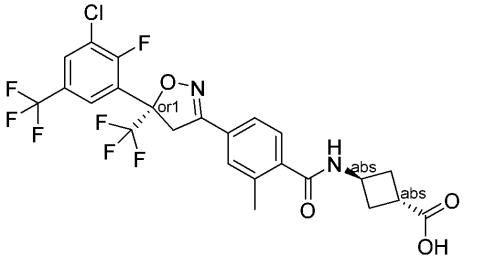
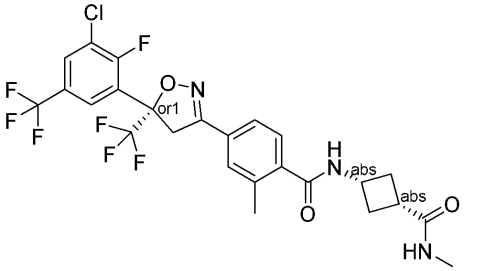
LC-MS（方法 B）R_t= 2.26 分, m/z= 624.1 $[M+H]^+$. ^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.77 (d, J = 6.8 Hz, 1 H), 8.45-8.40 (m, 1 H), 7.96-7.91 (m, 1 H), 7.68-7.61 (m, 2 H), 7.42 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.55 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.53-4.47 (m, 1 H), 4.38 (d, J = 18 Hz, 1 H), 3.72 (dd, J = 10, 7.2 Hz, 1 H), 3.29-3.17 (m, 3 H), 2.68-2.61 (m, 1 H), 2.37 (s, 3 H), 2.34-2.25 (m, 1 H), 1.03 (t, J = 7.2 Hz, 3 H).

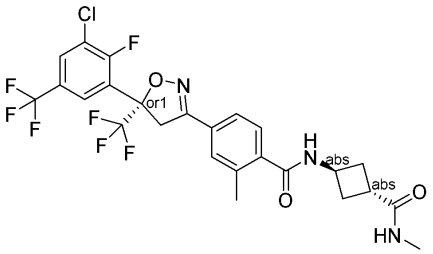
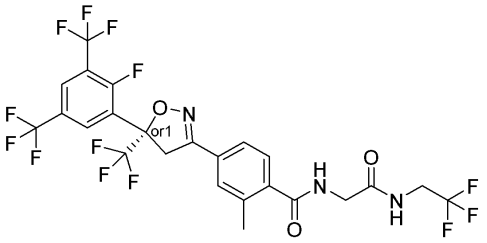
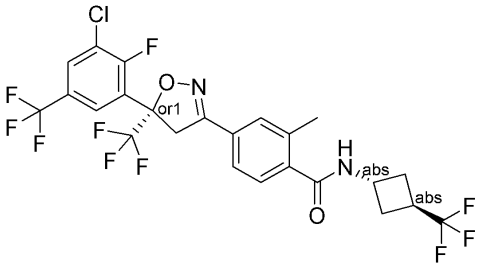
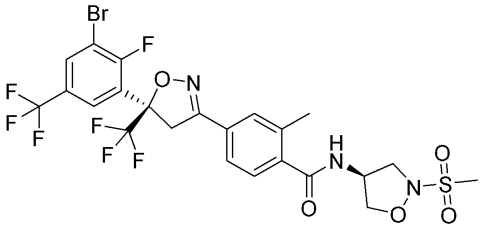
２つのエナンチオマーをＳＦＣで分離させた。その分離は、Ｃｈｉｒａｌｃｅｌ－ＯＪ－Ｈ（カラム寸法：２５０ｍｍ×３０ｍｍ（５μｍ）、流量：９５．０ｇ／分、及び、０．２％Ｎ，Ｎ－イソプロピルアミンを添加剤として含んでいる１０％ｉＰｒＯＨを有するCO_2系移動相）で実施して、実施例１．１：「４－（（Ｒ＊）－５－（３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（トリフルオロメチル）－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－３－イル）－Ｎ－（（Ｓ）－１－エチル－５－オキソピロリジン－３－イル）－２－メチルベンズアミド」及び実施例１．２：「４－（（Ｓ＊）－５－（３－ブロモ－２－フルオロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル）－５－（トリフルオロメチル）－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－３－イル）－Ｎ－（（Ｓ）－１－エチル－５－オキソピロリジン－３－イル）－２－メチルベンズアミド」が得られた。

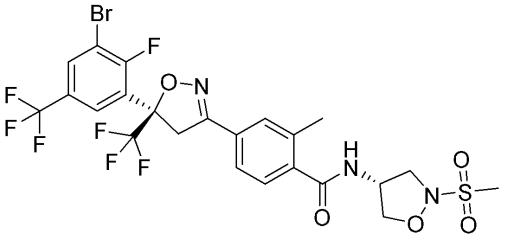
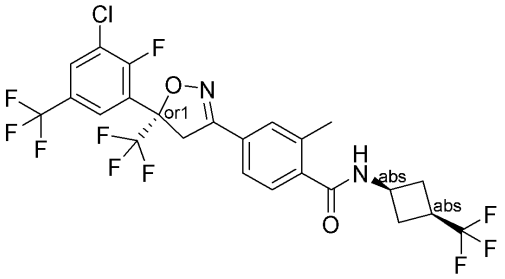
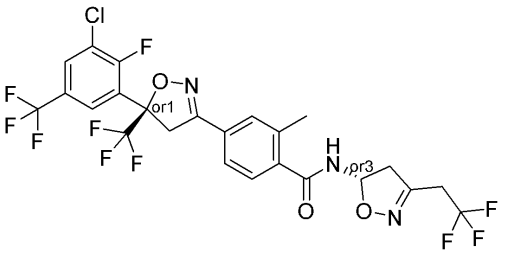
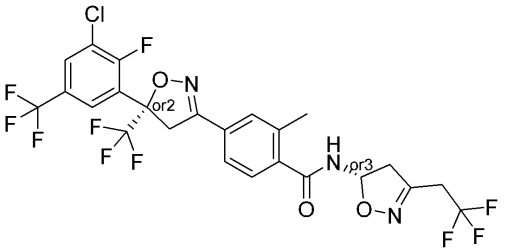
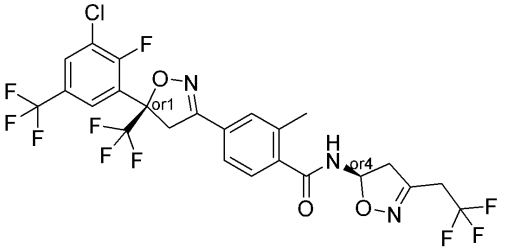
【０１４９】

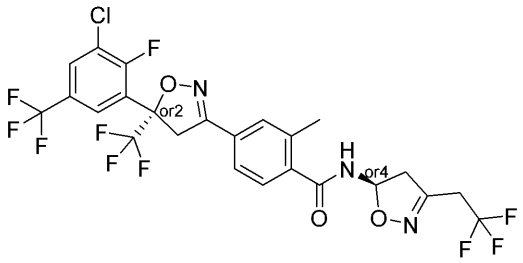
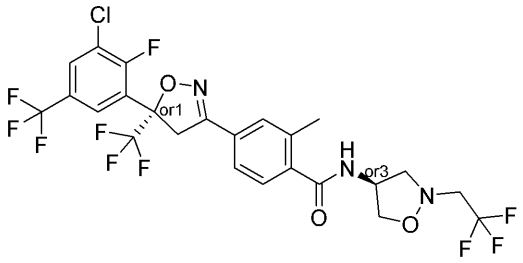
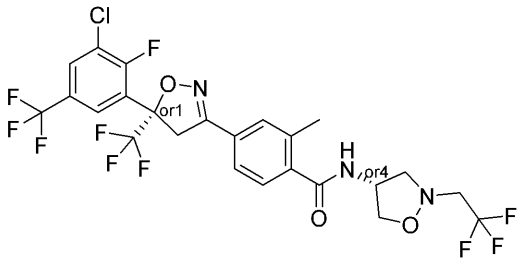
以下の化合物は、実施例１．１及び実施例１．２の方法によって、同様に調製した。

【表１】

Ex.	名　称	構　造
1.3	4-(rel-(*S*)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(*S*)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.4	4-(rel-(*S*)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(*R*)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
2.1	ｼｽ-3-(4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ)ｼｸﾛﾌﾞﾀﾝ-1-ｶﾙﾎﾞﾝ酸	
2.2	ﾄﾗﾝｽ-3-(4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ)ｼｸﾛﾌﾞﾀﾝ-1-ｶﾙﾎﾞﾝ酸	
2.3	4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(ｼｽ-3-(ﾒﾁﾙｶﾙﾊﾞﾓｲﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	

2.4	4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(ﾄﾗﾝｽ-3-(ﾒﾁﾙｶﾙﾊﾞﾓｲﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
3.1	rel-(S)-4-(5-(2-ﾌﾙｵﾛ-3,5-ﾋﾞｽ(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(2-ｵｷｿ-2-((2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ)ｴﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.5	4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((ﾄﾗﾝｽ)-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.6	4-(rel-(R)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(S)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	

1.7	4-(rel-(R)-5-(3-ﾌﾞﾛﾓ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-(rel-(R)-2-(ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.8	4-((S*)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((ｼｽ)-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.9	rel-4-((R)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.10	rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.11	rel-4-((R)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	

1.12	rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-3-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.13	rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((R*)-2-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	
1.14	rel-4-((S)-5-(3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ)-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-4,5-ｼﾞﾋﾄﾞﾛｲｿｵｷｻｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)-2-ﾒﾁﾙ-N-((S3)-2-(2,2,2-ﾄﾘﾌﾙｵﾛｴﾁﾙ)ｲｿｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ)ﾍﾞﾝｽﾞｱﾐﾄﾞ	

【表２】

上記表中の化合物に関する実験の詳細：

Ex.	LC-MS	^{1}H NMR
1.3	LC-MS (方法 B) R_t= 2.37 分, *m/z*= 662.3 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.90 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 8.45-8.41 (m, 1 H), 7.96-7.91 (m, 1 H), 7.69-7.62 (m, 2 H), 7.46 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.95-4.86 (m, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.42-4.30 (m, 2 H), 4.08-4.00 (m, 2 H), 3.46 (dd, J = 12, 4.8 Hz, 1 H), 3.20 (s, 3 H), 2.38 (s, 3 H).
1.4	LC-MS (方法 B) R_t= 2.37 分, *m/z*= 662.3 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.90 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 8.45-8.41 (m, 1 H), 7.95-7.91 (m, 1 H), 7.69-7.62 (m, 2 H), 7.46 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.94-4.86 (m, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.42-4.30 (m, 2 H), 4.08-4.00 (m, 2 H), 3.46 (dd, J = 12, 4.8 Hz, 1 H), 3.20 (s, 3 H), 2.38 (s, 3 H).
1.5	LC-MS (方法 C) R_t= 2.63 分, *m/z*= 591.1 $[M+H]^+$	1H NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ 8.78 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 8.37-8.33 (d, 1 H), 7.92-7.88 (d, 1 H), 7.67-7.63 (m, 2 H), 7.44 (d, J = 7.6 Hz, 1 H), 4.61-4.35 (m, 3 H), 3.16-3.06 (m, 1 H), 2.47-2.35 (m, 7 H).
1.6	LC-MS (方法 B) R_t= 2.37 分, *m/z*= 662 $[M+H]^+$	1H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.90 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 8.45-8.41 (m, 1 H), 7.96-7.91 (m, 1 H), 7.69-7.62 (m, 2 H), 7.46 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.95-4.86 (m, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.42-4.30 (m, 2 H), 4.08-4.00 (m, 2 H), 3.46 (dd, J = 12, 4.8 Hz, 1 H), 3.20 (s, 3 H), 2.38 (s, 3 H).
1.7	LC-MS (方法 B) R_t= 2.37 分, *m/z*= 662 $[M+H]^+$	1H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.90 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 8.45-8.41 (m, 1 H), 7.95-7.91 (m, 1 H), 7.69-7.62 (m, 2 H), 7.46 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.94-4.86 (m, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.42-4.30 (m, 2 H), 4.08-4.00 (m, 2 H), 3.46 (dd, J = 12, 4.8 Hz, 1 H), 3.20 (s, 3 H), 2.38 (s, 3 H).
1.8	LC-MS (方法 C) R_t= 2.57 分, *m/z*= 591.0 $[M+H]^+$	1H NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ 8.74 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 8.37-8.34 (d, 1 H), 7.92-7.88 (d, 1 H), 7.67-7.62 (m, 2 H), 7.43 (d, J = 7.6 Hz, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.43-4.34 (m, 2 H), 3.01-2.87 (m, 1 H), 2.47-2.42 (m, 2 H), 2.36 (s, 3 H), 2.17-2.10 (m, 2 H).

1.9	LC-MS (方法 F) R_t = 1.35 分; *m/z*= 620 $(M+H)^+$	1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) δ 9.45-9.42 (d, 1H), 8.38-8.36 (m, 1H), 7.91-7.90 (m, 1H), 7.69-7.66 (m, 2H), 7.46-7.43 (d, 1H), 6.34-6.27 (m, 1H), 4.61-4.60 (m, 1H), 4.43-4.37 (d, 1H), 3.64-3.48 (m, 2H), 3.41-3.38 (m, 1H), 2.97-4.90 (dd, 1H), 2.38 (s, 3H).
1.10	LC-MS (方法 F) R_t= 1.34 分; *m/z*= 620 $(M+H)^+$	1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) δ 9.45-9.42 (d, 1H), 8.38-8.36 (m, 1H), 7.91-7.89 (m, 1H), 7.69-7.66 (m, 2H), 7.46-7.43 (d, 1H), 6.34-6.27 (m, 1H), 4.61-4.60 (m, 1H), 4.43-4.37 (d, 1H), 3.64-3.48 (m, 2H), 3.41-3.38 (m, 1H), 2.98-2.90 (m, 1H), 2.38 (s, 3H).
1.11	LC-MS (方法 F) R_t= 1.35 分; *m/z*= 620 $(M+H)^+$	1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) δ 9.45-9.42 (d, 1H), 8.38-8.36 (m, 1H), 7.91-7.90 (m, 1H), 7.69-7.66 (m, 2H), 7.46-7.43 (d, 1H), 6.34-6.27 (m, 1H), 4.61-4.60 (m, 1H), 4.43-4.37 (d, 1H), 3.64-3.48 (m, 2H), 3.41-3.38 (m, 1H), 2.98-2.90 (m, 1H), 2.38 (s, 3H).
1.12	LC-MS (方法 F) R_t= 1.35 分; *m/z*= 620 $(M+H)^+$	1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) δ 9.45-9.42 (d, 1H), 8.38-8.36 (m, 1H), 7.91-7.90 (m, 1H), 7.69-7.66 (m, 2H), 7.46-7.43 (d, 1H), 6.34-6.27 (m, 1H), 4.61-4.60 (d, 1H), 4.43-4.37 (d, 1H), 3.64-3.47 (m, 2H), 3.41-3.38 (m, 1H), 2.97-2.90 (m, 1H), 2.38 (s, 3H).
1.13	LC-MS (方法 E) R_t= 1.21 分; *m/z*= 622 $(M+H)^+$	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.67-8.65 (d, 1H), 8.38-8.37 (d, 1H), 7.91-7.90 (d, 1H), 7.70-7.68 (d, 2H), 7.49-7.46 (d, 1H), 4.85-4.77 (m, 1H), 4.61-4.60 (d, 1H), 4.54-4.37 (d, 1H), 4.22-4.12 (m, 1H), 4.10-4.00 (m, 1H), 3.73-3.72 (d, 1H), 3.28-3.23 (m, 2H), 3.19-3.04 (d, 1H), 2.49 (s, 3H).
1.14	LC-MS (方法 E) R_t= 1.21 分; *m/z*= 622 $(M+H)^+$	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.37-8.36 (d, 1H), 8.29-8.26 (d, 1H), 7.91-7.90 (d, 1H), 7.66-7.63 (d, 2H), 7.41-7.39 (d, 1H), 4.70-4.59 (m, 2H),4.53-4.36 (d, 1H), 4.16-4.11 (m, 1H), 4.07-3.98 (m, 1H), 3.54-3.47 (m, 1H), 3.41-3.37 (m, 1H),3.20-3.16 (d, 1H), 2.76-2.65 (m, 1H), 2.29-2.27 (s, 3H).

2.1	LC-MS (方法 C) R_t= 2.51 分, *m/z*= 567.1 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.64 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 8.48 (br s, 1 H), 8.37-8.34 (m, 1 H), 7.92-7.89 (m, 1 H), 7.65-7.60 (m, 2 H), 7.40 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.39 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.30-4.20 (m, 1 H), 2.69-2.61 (m, 1 H), 2.48-2.30 (m, 5 H), 2.19-2.08 (m, 2 H).
2.2	LC-MS (方法 B) R_t= 2.24 分, *m/z*= 567.2 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 12.2 (br s, 1 H), 8.68 (d, J = 7.6 Hz, 1 H), 8.38-8.34 (m, 1 H), 7.93-7.88 (m, 1 H), 7.68-7.61 (m, 2 H), 7.42 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.56 (d, J = 19 Hz, 1 H), 4.53-4.45 (m, 1 H), 4.40 (d, J = 18 Hz, 1 H), 3.00-2.90 (m, 1 H), 2.50-2.41 (m, 2 H), 2.36 (s, 3 H), 2.34-2.19 (m, 2 H).
2.3	LC-MS (方法 B) R_t= 2.20 分, *m/z*= 580.2 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.63 (d, J = 7.6 Hz, 1 H), 8.38-8.34 (m, 1 H), 7.93-7.89 (m, 1 H), 7.72-7.67 (m, 1 H), 7.66-7.59 (m, 2 H), 7.39 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.56 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.39 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.31-4.21 (m, 1 H), 2.69-2.61 (m, 1 H), 2,56 (d, J = 4.8 Hz, 3 H), 2.39-2.29 (m, 5 H), 2.19-2.08 (m, 2 H).
2.4	LC-MS (方法 B) R_t= 2.49 分, *m/z*= 580.1 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.62 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 8.38-8.33 (m, 1 H), 7.93-7.88 (m, 1 H), 7.74-7.61 (m, 3 H), 7.41 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 5.00-4.45 (m, 2 H), 4.40 (d, J = 18 Hz, 1 H), 2.92-2.84 (m, 1 H), 2.59 (d, J = 4,4 Hz, 3 H), 2.43-2.30 (m, 5 H), 2.24-2.14 (m, 2 H).
3.1	LC-MS (方法 B) R_t= 2.22 分, *m/z*= 642.4 $[M+H]^+$	^{1}H NMR (DMSO-d6, 400 MHz) δ 8.65-8.57 (m, 2 H), 8.43-8.39 (m, 1 H), 8.29-8.24 (m, 1 H), 7.69-7.64 (m, 2 H), 7.49 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 4.61 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.45 (d, J = 18 Hz, 1 H), 4.02-3.89 (m, 4 H), 2.40 (s, 3 H).

本発明の化合物は、害虫の防除において使用するための貴重な活性成分である。用語「害虫（ｐｅｓｔ）」には、動物の体表面及び内部並びに衛生分野における外部寄生虫及び内部寄生虫が包含される。特に、害虫は、ノミ、マダニ、ダニ、ハエ、蠕虫（ｗｏｒｍ）及びシラミである。さらに一層特定的には、害虫は、ノミ及びマダニである。

【０１５０】

本発明との関連における動物は、脊椎動物を包含すると理解される。これに関連して、用語「脊椎動物」は、例えば、魚類、両生類、爬虫類、鳥類及び哺乳動物（これは、ヒトを包含する）を包含すると理解される。本発明による脊椎動物の１つの好ましい群は、温血動物を包含し、これは、家畜（例えば、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ及びヤギ）、家禽類（例えば、ニワトリ、シチメンチョウ、ホロホロチョウ及びガチョウ）、毛皮動物（例えば、ミンク、キツネ、チンチラ及びウサギなど）及び伴侶動物（例えば、フェレット、モ

ルモット、ラット、ハムスター、ネコ及びイヌ）を包含し、及び、さらにヒトも包含する。本発明による好ましい脊椎動物のさらなる群は、魚類（これは、サケを包含する）を包含する。

【０１５１】

本発明に関連して、外部寄生虫は、特に、昆虫類、ダニ類（ａｃａｒｉ）（ダニ及びマダニ）及び甲殻類（フナムシ）であると理解される。これらには、以下の目の昆虫が包含される：チョウ目（Ｌｅｐｉｄｏｐｔｅｒａ）、コウチュウ目（Ｃｏｌｅｏｐｔｅｒａ）、ヨコバイ亜目（Ｈｏｍｏｐｔｅｒａ）、カメムシ目（Ｈｅｍｉｐｔｅｒａ）、カメムシ亜目（Ｈｅｔｅｒｏｐｔｅｒａ）、ハエ目（Ｄｉｐｔｅｒａ）、網翅上目（Ｄｉｃｔｙｏｐｔｅｒａ）、アザミウマ目（Ｔｈｙｓａｎｏｐｔｅｒａ）、バッタ目（Ｏｒｔｈｏｐｔｅｒａ）、シラミ目（Ａｎｏｐｌｕｒａ）、ノミ目（Ｓｉｐｈｏｎａｐｔｅｒａ）、ハジラミ目（Ｍａｌｌｏｐｈａｇａ）、シミ目（Ｔｈｙｓａｎｕｒａ）、シロアリ目（Ｉｓｏｐｔｅｒａ）、チャタテムシ目（Ｐｓｏｃｏｐｔｅｒａ）、及び、ハチ目（Ｈｙｍｅｎｏｐｔｅｒａ）。しかしながら、特に挙げることができる外部寄生虫は、ヒト又は動物に障害を与え、病原体を運ぶもの、例えば、以下のものである：ハエ類、例えば、イエバエ（Ｍｕｓｃａ ｄｏｍｅｓｔｉｃａ）、ムスカ・ヴェツスチシマ（Ｍｕｓｃａ ｖｅｔｕｓｔｉｓｓｉｍａ）、ムスカ・アウツムナリス（Ｍｕｓｃａ ａｕｔｕｍｎａｌｉｓ）、ヒメイエバエ（Ｆａｎｎｉａ ｃａｎｉｃｕｌａｒｉｓ）、ミバエ（Ｓａｒｃｏｐｈａｇａ ｃａｒｎａｒｉａ）、ヒツジキンバエ（Ｌｕｃｉｌｉａ ｃｕｐｒｉｎａ）、ヒロズキンバエ（Ｌｕｃｉｌｉａ ｓｅｒｉｃａｔａ）、ウシバエ（Ｈｙｐｏｄｅｒｍａ ｂｏｖｉｓ）、キスジウシバエ（Ｈｙｐｏｄｅｒｍａ ｌｉｎｅａｔｕｍ）、クリソミイア・クロロピガ（Ｃｈｒｙｓｏｍｙｉａ ｃｈｌｏｒｏｐｙｇａ）、ヒトヒフバエ（Ｄｅｒｍａｔｏｂｉａ ｈｏｍｉｎｉｓ）、ラセンウジバエ（Ｃｏｃｈｌｉｏｍｙｉａ ｈｏｍｉｎｉｖｏｒａｘ）、ウマバエ（Ｇａｓｔｅｒｏｐｈｉｌｕｓ ｉｎｔｅｓｔｉｎａｌｉｓ）、ヒツジバエ（Ｏｅｓｔｒｕｓ ｏｖｉｓ）、サシバエ類（ｂｉｔｉｎｇ ｆｌｉｅｓ）、例えば、ノサシバエ（Ｈａｅｍａｔｏｂｉａ ｉｒｒｉｔａｎｓ ｉｒｒｉｔａｎｓ）、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア（Ｈａｅｍａｔｏｂｉａ ｉｒｒｉｔａｎｓ ｅｘｉｇｕａ）、サシバエ（Ｓｔｏｍｏｘｙｓ ｃａｌｃｉｔｒａｎｓ）、アブ類（Ｔａｂａｎｉｄｓ）（これは、アブ科（Ｔａｂａｎｉｄａｅ）の亜科を含んでいる）、例えば、ゴマフアブ属種（Ｈａｅｍａｔｏｐｏｔａ ｓｐｐ．）（例えば、ゴマフアブ（Ｈａｅｍａｔｏｐｏｔａ ｐｌｕｖｉａｌｉｓ））及びアブ属種（Ｔａｂａｎｕｓ ｓｐｐ）（例えば、タバヌス・ニグロビタツス（Ｔａｂａｎｕｓ ｎｉｇｒｏｖｉｔｔａｔｕｓ））、並びに、ハネモンアブ亜科（Ｃｈｒｙｓｏｐｓｉｎａｅ）、例えば）、メクラアブ属種（Ｃｈｒｙｓｏｐｓ ｓｐｐ．）（例えば、クリソプス・カエクチエンス（Ｃｈｒｙｓｏｐｓ ｃａｅｃｕｔｉｅｎｓ））； シラミバエ科（Ｈｉｐｐｏｂｏｓｃｉｄｓ）、例えば、ヒツジシラミバエ（Ｍｅｌｏｐｈａｇｕｓ ｏｖｉｎｕｓ）（ｓｈｅｅｐ ｋｅｄ）；ツェツェバエ（ｔｓｅｔｓｅ ｆｌｉｅｓ）、例えば、グロシニア属種（Ｇｌｏｓｓｉｎｉａ ｓｐｐ．）； 他の刺咬性昆虫、例えば、小昆虫類（ｍｉｄｇｅｓ）、例えば、ヌカカ科（Ｃｅｒａｔｏｐｏｇｏｎｉｄａｅ）（ｂｉｔｉｎｇ ｍｉｄｇｅｓ）、ブユ科（Ｓｉｍｕｌｉｉｄａｅ）（Ｂｌａｃｋｆｌｉｅｓ）、チョウバエ科（Ｐｓｙｃｈｏｄｉｄａｅ）（Ｓａｎｄｆｌｉｅｓ）；さらには、吸血性昆虫（ｂｌｏｏｄ－ｓｕｃｋｉｎｇ ｉｎｓｅｃｔｓ）、例えば、蚊類（ｍｏｓｑｕｉｔｏｅｓ）、例えば、ハマダラカ属種（Ａｎｏｐｈｅｌｅｓ ｓｐｐ）、ヤブカ属種（Ａｅｄｅｓ ｓｐｐ）及びイエカ属種（Ｃｕｌｅｘ ｓｐｐ）、ノミ類、例えば、ネコノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ ｆｅｌｉｓ）及びイヌノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ ｃａｎｉｓ）（ｃａｔ ａｎｄ ｄｏｇ ｆｌｅａｓ）、ケオプスネズミノミ（Ｘｅｎｏｐｓｙｌｌａ ｃｈｅｏｐｉｓ）、ヒトノミ（Ｐｕｌｅｘ ｉｒｒｉｔａｎｓ）、ニワトリノミ（Ｃｅｒａｔｏｐｈｙｌｌｕｓ ｇａｌｌｉｎａｅ）、デルマトフィルス・ペネトランス（Ｄｅｒｍａｔｏｐｈｉｌｕｓ ｐｅｎｅｔｒａｎｓ）、吸血性シラミ（ｂｌｏｏｄ－ｓｕｃｋｉｎｇ ｌｉｃｅ）（シラミ目（Ａｎｏｐｌｕｒａ））、例えば、リノグナツス属種（Ｌｉｎｏｇｎａｔｈｕ

ｓ ｓｐｐ）、ハエマトピヌス属種（Ｈａｅｍａｔｏｐｉｎｕｓ ｓｐｐ）、ソレノポテス属種（Ｓｏｌｅｎｏｐｏｔｅｓ ｓｐｐ）、ヒトジラミ（Ｐｅｄｉｃｕｌｕｓ ｈｕｍａｎｉｓ）；さらにまた、刺咬性シラミ（ｃｈｅｗｉｎｇ ｌｉｃｅ）（ハジラミ目（Ｍａｌｌｏｐｈａｇａ））、例えば、ヒツジハジラミ（Ｂｏｖｉｃｏｌａ （Ｄａｍａｌｉｎｉａ） ｏｖｉｓ）、ウシハジラミ（Ｂｏｖｉｃｏｌａ （Ｄａｍａｌｉｎｉａ） ｂｏｖｉｓ）、及び、他のボビコラ属種（Ｂｏｖｉｃｏｌａ ｓｐｐ．）。外部寄生虫には、さらに、以下の目のメンバーも包含される：ダニ目（Ａｃａｒｉｎａ）、例えば、ダニ類、例えば、ショクヒヒゼンダニ（Ｃｈｏｒｉｏｐｔｅｓ ｂｏｖｉｓ）、ツメダニ属種（Ｃｈｅｙｌｅｔｉｅｌｌａ ｓｐｐ．）、ワクモ（Ｄｅｒｍａｎｙｓｓｕｓ ｇａｌｌｉｎａｅ）、イエダニ属種（Ｏｒｔｎｉｔｈｏｎｙｓｓｕｓ ｓｐｐ．）、イヌニキビダニ（Ｄｅｍｏｄｅｘ ｃａｎｉｓ）、ヒゼンダニ（Ｓａｒｃｏｐｔｅｓ ｓｃａｂｉｅｉ）、ヒツジキュウセンヒゼンダニ（Ｐｓｏｒｏｐｔｅｓ ｏｖｉｓ）及びヒツジツメダニ属種（Ｐｓｏｒｅｒｇａｔｅｓ ｓｐｐ．）、並びに、マダニ類。代表的なマダニは、例えば、ウシマダニ属（Ｂｏｏｐｈｉｌｕｓ）、キララマダニ属（Ａｍｂｌｙｏｍｍａ）、アノセントル属（Ａｎｏｃｅｎｔｏｒ）、カクマダニ属（Ｄｅｒｍａｃｅｎｔｏｒ）、チマダニ属（Ｈａｅｍａｐｈｙｓａｌｉｓ）、イボマダニ属（Ｈｙａｌｏｍｍａ）、マダニ属（Ｉｘｏｄｅｓ）、リピセントル属（Ｒｈｉｐｉｃｅｎｔｏｒ）、マルガロプス属（Ｍａｒｇａｒｏｐｕｓ）、コイタマダニ属（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ）、ナガヒメダニ属（Ａｒｇａｓ）、オトビウス属（Ｏｔｏｂｉｕｓ）及びヒメダニ属（Ｏｒｎｉｔｈｏｄｏｒｏｓ）などであり、これらは、好ましくは、脊椎動物、例えば、温血動物、例えば、家畜（例えば、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ及びヤギ）、家禽類（例えば、ニワトリ、シチメンチョウ、ホロホロチョウ及びガチョウ）、毛皮動物（例えば、ミンク、キツネ、チンチラ及びウサギなど）及び伴侶動物（例えば、フェレット、モルモット、ラット、ハムスター、ネコ及びイヌ）を侵襲し、及び、さらに、ヒト及び魚類も侵襲する。

【０１５２】

本発明による本発明の化合物は、正常な感受性を示す動物性害虫の全ての成育段階又は個々の成育段階に対して活性を示し、及び、広く使用される殺寄生虫剤に対して耐性を示すものに対しても活性を示す。このことは、特に、ダニ目（Ａｃａｒｉｎａ）の抵抗性を示す昆虫及びメンバーに当てはまる。本発明の活性物質の殺虫効果、殺卵効果及び／又は殺ダニ効果は、直接的に（即ち、例えば脱皮が起こって直ぐに若しくはある程度の時間が経過した後に害虫を死滅させるか、又は、それらの卵を破壊することによって）、又は、間接的に（例えば、産卵数及び／又は孵化率を低減させることによって）、少なくとも５０～６０％の殺害虫率（死虫率）に相当する良好な効力を発現し得る。

【０１５３】

本発明の化合物は、さらに、衛生害虫に対しても、特に、ハエ目（Ｄｉｐｔｅｒａ）〔イエバエ科（Ｍｕｓｃｉｄａｅ）、ニクバエ科（Ｓａｒｃｏｐｈａｇｉｄａｅ）、アノフィリダエ科（Ａｎｏｐｈｉｌｉｄａｅ）及びカ科（Ｃｕｌｉｃｉｄａｅ）〕；バッタ目（Ｏｒｔｈｏｐｔｅｒａ）；網翅上目（Ｄｉｃｔｙｏｐｔｅｒａ）〔例えば、ゴキブリ科（Ｂｌａｔｔｉｄａｅ）（ゴキブリ類）、例えば、チャバネゴキブリ（Ｂｌａｔｅｌｌａ ｇｅｒｍａｎｉｃａ）、トウヨウゴキブリ（Ｂｌａｔｔａ ｏｒｉｅｎｔａｌｉｓ）、ワモンゴキブリ（Ｐｅｒｉｐｌａｎｅｔａ ａｍｅｒｉｃａｎａ）〕及びハチ目（Ｈｙｍｅｎｏｐｔｅｒａ）〔例えば、アリ科（Ｆｏｒｍｉｃｉｄａｅ）（アリ類）及びスズメバチ科（Ｖｅｓｐｉｄａｅ）（スズメバチ類）〕の衛生害虫に対しても、使用することができる。

【０１５４】

式（Ｉ）で表される化合物は、さらに、魚類の外部寄生虫、特に、カイアシ亜綱（Ｃｏｐｅｐｏｄａ）（例えば、ウオジラミ目（Ｓｉｐｈｏｎｏｓｔｏｍａｔｏｉｄａ）（フナムシ））に対しても有効であり、一方で、魚類は充分な耐性を示す。

【０１５５】

式（Ｉ）で表される化合物は、条虫綱（Ｃｅｓｔｏｄａ）〔これは、真正条虫亜綱（Ｅ

ｕｃｅｓｔｏｄａ）及び単節条虫亜綱（Ｃｅｓｔｏｄａｒｉａ）を包含する〕の蠕虫類（ｗｏｒｍｓ）に対しても使用することができる。

【０１５６】

本発明の化合物は、さらに、植物の寄生性のダニ類及び昆虫類に対しても持続的な効力も有している。ダニ目（Ａｃａｒｉｎａ）のハダニ類の場合、本発明の化合物は、ハダニ科（Ｔｅｔｒａｎｙｃｈｉｄａｅ）（ナミハダニ属種（Ｔｅｔｒａｎｙｃｈｕｓ　ｓｐｐ．）及びパノニクス属種（Ｐａｎｏｎｙｃｈｕｓ　ｓｐｐ．））の卵、若虫及び成体に対して有効である。

【０１５７】

それらは、ヨコバイ亜目（Ｈｏｍｏｐｔｅｒａ）の吸汁性昆虫に対して、特に、アブラムシ科（Ａｐｈｉｄｉｄａｅ）、ウンカ科（Ｄｅｌｐｈａｃｉｄａｅ）、ヨコバイ科（Ｃｉｃａｄｅｌｌｉｄａｅ）、キジラミ科（Ｐｓｙｌｌｉｄａｅ）、ロシダエ科（Ｌｏｃｃｉｄａｅ）、マルカイガラムシ科（Ｄｉａｓｐｉｄｉｄａｅ）及びフシダニ科（Ｅｒｉｏｐｈｙｄｉｄａｅ）の吸汁性昆虫（例えば、柑橘類果実上のサビダニ）に対して；カメムシ目（Ｈｅｍｉｐｔｅｒａ）、カメムシ亜目（Ｈｅｔｅｒｏｐｔｅｒａ）及びアザミウマ目（Ｔｈｙｓａｎｏｐｔｅｒａ）の吸汁性昆虫に対して、並びに、チョウ目（Ｌｅｐｉｄｏｐｔｅｒａ）、コウチュウ目（Ｃｏｌｅｏｐｔｅｒａ）、ハエ目（Ｄｉｐｔｅｒａ）及びバッタ目（Ｏｒｔｈｏｐｔｅｒａ）の植物を食する昆虫類に対して、高い活性を示す。

【０１５８】

それらは、土壌中の害虫に対する土壌殺虫剤としても同様に適している。

【０１５９】

従って、式（Ｉ）で表される化合物は、穀物、ワタ、イネ、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、野菜、果実、タバコ、ホップ、柑橘類、アボカド及び他の作物などの作物上における吸汁性昆虫及び食する昆虫の全ての成育段階に対して有効である。

【０１６０】

式（Ｉ）で表される化合物は、さらに、メロイドギネ種（Ｍｅｌｏｉｄｏｇｙｎｅ）、ヘテロデラ種（Ｈｅｔｅｒｏｄｅｒａ）、プラチレンクス種（Ｐｒａｔｙｌｅｎｃｈｕｓ）、ジチレンクス種（Ｄｉｔｙｌｅｎｃｈｕｓ）、ラドホルス種（Ｒａｄｏｐｈｏｌｕｓ）、リゾグリフス種（Ｒｉｚｏｇｌｙｐｈｕｓ）などの植物線虫類に対しても有効である。

【０１６１】

本発明の化合物は、蠕虫類（ｈｅｌｍｉｎｔｈｓ）に対して有効である。蠕虫類は、哺乳動物及び家禽において、例えば、ヒツジ、ブタ、ヤギ、ウシ、ウマ、ロバ、ラクダ、イヌ、ネコ、ウサギ、モルモット、ハムスター、ニワトリ、シチメンチョウ、ホロホロチョウ及び他の飼育されている鳥類において、並びに、外来鳥類において、深刻な疾患を引き起こすので、商業的に重要である。典型的な線虫は、以下のとおりである：ハエモンクス属（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ）、トリコストロンギルス属（Ｔｒｉｃｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）、オステルタギア属（Ｏｓｔｅｒｔａｇｉａ）、ネマトジルス属（Ｎｅｍａｔｏｄｉｒｕｓ）、クーペリア属（Ｃｏｏｐｅｒｉａ）、アスカリス属（Ａｓｃａｒｉｓ）、ブノストヌム属（Ｂｕｎｏｓｔｏｎｕｍ）、オエソファゴストヌム属（Ｏｅｓｏｐｈａｇｏｓｔｏｎｕｍ）、カルベルチア属（Ｃｈａｒｂｅｒｔｉａ）、トリクリス属（Ｔｒｉｃｈｕｒｉｓ）、ストロンギルス属（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）、トリコネマ属（Ｔｒｉｃｈｏｎｅｍａ）、ジクチオカウルス属（Ｄｉｃｔｙｏｃａｕｌｕｓ）、カピラリア属（Ｃａｐｉｌｌａｒｉａ）、ヘテラキス属（Ｈｅｔｅｒａｋｉｓ）、トキソカラ属（Ｔｏｘｏｃａｒａ）、アスカリジア属（Ａｓｃａｒｉｄｉａ）、オキシウリス属（Ｏｘｙｕｒｉｓ）、アンシロストマ属（Ａｎｃｙｌｏｓｔｏｍａ）、ウンシナリア属（Ｕｎｃｉｎａｒｉａ）、トキサスカリス属（Ｔｏｘａｓｃａｒｉｓ）、及び、パラスカリス属（Ｐａｒａｓｃａｒｉｓ）。上記吸虫類としては、特に、ファスシオリデアエ科（Ｆａｓｃｉｏｌｉｄｅａｅ）、特に、肝蛭（Ｆａｓｃｉｏｌａ　ｈｅｐａｔｉｃａ）などを挙げることができる。

【０１６２】

本発明による式（Ｉ）で表される化合物の殺害虫活性（ｐｅｓｔｉｃｉｄａｌ ａｃｔｉｖｉｔｙ）は、上記害虫の約５０～６０％の死虫率に相当し、さらに好ましくは、９０％を超える死虫率に相当し、最も好ましくは、９５～１００％の死虫率に相当する。好ましくは、式（Ｉ）で表される化合物は、非修飾形態で内用的に若しくは外用的に使用されるか、又は、好ましくは、製剤の技術分野で慣習的に使用されているアジュバント一緒に内用的に若しくは外用的に使用され、従って、例えば、液体製剤（例えば、スポットオン剤、ポアオン剤、スプレーオン剤、エマルション剤、懸濁液剤、溶液剤、乳剤、濃厚溶液剤）、半固体製剤（例えば、クリーム剤、軟膏剤、ペースト剤、ゲル剤、リポソーム調製物）及び固体調製物（例えば、食品添加用の錠剤（これは、カプセル剤を包含する）、粉末剤（これは、可溶性粉末剤を包含する）、顆粒剤、又は、高分子物質中に活性成分を埋め込んだもの（例えば、インプラント及び微粒子））を得るために、既知方法で処理され得る。組成物の場合と同様に、その施用方法は、意図された目的及び一般的な状況に従って選択する。

【０１６３】

本発明の化合物は、単独で又は組成物の形態で投与することができる。実際には、本発明の化合物は、通常、組成物の形態で、即ち、少なくとも１種類の許容される賦形剤と混合された状態で、投与される。任意の許容される賦形剤の割合及び性質は、本発明の選択された化合物の特性、選択された投与経路並びに獣医学及び製薬の分野における標準的技法によって決定される。

【０１６４】

一実施形態では、本発明は、本発明の化合物及び少なくとも１種類の許容される賦形剤を含んでいる組成物を提供する。

【０１６５】

そのような処置及び／又は防除の実施において、本発明の化合物は、該化合物を生物学的に利用可能なものとする任意の形態及び経路で投与することができる。本発明の化合物は、経口経路を包含するさまざまな経路によって、特に、錠剤及びカプセル剤によって、投与することができる。本発明の化合物は、非経口経路によって、より特定的には、吸入、皮下、筋肉内、静脈内、動脈内、経皮、鼻腔内、直腸内、膣内、眼内、局所、舌下及び頬側、腹腔内、脂肪内（ｉｎｔｒａａｄｉｐｏｓａｌｌｙ）、髄腔内によって、並びに、局所送達（例えば、カテーテル又はステントによる）を介して、投与することができる。当業者は、選択された化合物の特定の特徴、治療対象の障害又は状態、その障害又は状態の段階及び他の関連する状況に応じて、適切な投与形態及び投与経路を容易に選択することができる。本発明の医薬組成物は、対象者に、例えば、錠剤（これは、チュアブル錠を包含する）、カプセル剤、カシェ剤、紙剤、トローチ剤、ウエハー剤、エリキシル剤、ボリ剤（ｂｏｌｉ）、軟膏剤、経皮貼付剤、エアロゾル剤、吸入剤、坐剤、ドレンチ剤、溶液剤、注射剤及び懸濁液剤の形態で、投与することができる。

【０１６６】

用語「許容される賦形剤」は、獣医学的組成物及び医薬組成物を調製する際に通常使用される賦形剤を示しており、そして、純粋でなければならず、及び、使用される量において無毒でなければならない。それらは、一般に、全体として活性成分のためのビヒクル又は媒体として機能し得る固体、半固体又は液体の物質である。許容される賦形剤の一部の例は、「Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ’ｓ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ ａｎｄ ｔｈｅ Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｅｘｃｉｐｉｅｎｔｓ」の中に見いだされ、そして、そのような賦形剤としては、希釈剤、ビヒクル、担体、軟膏基剤、結合剤、崩壊剤、潤滑剤、流動促進剤、甘味剤、香味料、ゲル基剤、徐放性マトリックス、安定化剤、防腐剤、溶剤、懸濁化剤、緩衝剤、乳化剤、染料、噴射剤、コーティング剤などがある。

【０１６７】

一実施形態では、該組成物は、経口投与に適合している（例えば、錠剤若しくはカプセル剤、又は、液体製剤、例えば、経口投与に適合させた溶液剤若しくは懸濁液剤）。一実

施形態では、該組成物は、経口投与に適合している（例えば、経口投与に適合させたチュアブル製剤）。さらに別の実施形態では、該組成物は、液体又は半固体の製剤、例えば、非経口投与に適合させた溶液剤又は懸濁液剤又はペースト剤である。

【０１６８】

一実施形態では、該組成物は、注射投与に適合している（例えば、注射投与に適合させた溶液剤又は懸濁液剤）。

【０１６９】

線虫類／蠕虫類の処置及び／又は防除において対象者に使用するための特定の組成物としては、以下のものなどがある：溶液剤；注射剤；エマルション剤、例えば、古典的なエマルション剤、マイクロエマルション剤及び自己乳化組成物（これは、対象者の身体に添加されると体液と一緒にエマルションを形成する、水を含まない有機組成物、好ましくは、油性組成物）；懸濁液剤（ドレンチ剤）；ポアオン製剤；食品添加物；粉末剤；錠剤（これは、発泡錠を包含する）；ボリ剤（ｂｏｌｉ）；カプセル剤（これは、マイクロカプセル剤を包含する）；及び、チュアブルトリート剤（ｃｈｅｗａｂｌｅ　ｔｒｅａｔ）。特に、組成物の形態は、錠剤、カプセル剤、食品添加物又はチュアブルトリートである。

【０１７０】

本発明の組成物は、獣医学及び製薬の技術分野においてよく知られている方法で調製され、そして、活性成分として本発明の化合物の少なくとも１種類を含んでいる。本発明の化合物の量は、その特定の形態に応じて変えることができ、そして、都合の良いことに、単位投与形態の１重量％～約５０重量％であり得る。本発明の医薬組成物は、好ましくは、単位投与形態で製剤され、そして、各用量は、典型的には、約０．５ｍｇ～約１００ｍｇの本発明の化合物を含んでいる。治療用量に変化をもたらすために、１以上の単位投与形態をとることができる。

【０１７１】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を処置する方法も提供し、ここで、該方法は、そのような処置を必要とする対象者に有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を投与することを含み、ここで、該方法は、場合により、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでいる。

【０１７２】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を防除する方法も提供し、ここで、該方法は、そのような防除を必要とする対象者に有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を投与することを含み、ここで、該方法は、場合により、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでいる。

【０１７３】

一実施形態では、本発明は、さらに、害虫を処置又は防除する方法も提供し、ここで、該方法は、対象者の環境を有効量の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩と接触させることを含み、ここで、該方法は、場合により、有効量の少なくとも１種類の付加的な活性化合物をさらに含んでいる。

【０１７４】

従って、本発明は、本発明の化合物の薬剤としての使用も提供し、ここで、これは、薬剤を製造するための使用を包含している。一実施形態では、本発明は、害虫を処置するための式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を含んでいる薬剤の製造を提供する。一実施形態では、本発明は、害虫を防除するための本発明の化合物又はその塩を含んでいる薬剤の製造を提供する。

【０１７５】

用語「治療する（ｔｒｅａｔｉｎｇ）」、「治療する（ｔｏ　ｔｒｅａｔ）」、「治療される（ｔｒｅａｔｅｄ）」又は「治療（ｔｒｅａｔｍｅｎｔ）」は、限定するものではないが、既存の症状の進行若しくは重症度を抑制すること、遅らせること、停止させること、低減させること、改善すること、逆転させること、又は、障害、状態若しくは疾患を予防することを包含する。例えば、成体イヌ糸状虫感染症は、本発明の化合物を投与する

ことによって治療されるであろう。治療は、治療的に適用又は投与され得る。

【０１７６】

用語「防除する（ｃｏｎｔｒｏｌ）」、「防除する（ｃｏｎｔｒｏｌｌｉｎｇ）」又は「防除される（ｃｏｎｔｒｏｌｌｅｄ）」は、限定するものではないが、症状、障害、状態又は疾患のリスクを低下させること、低減させること又は改善すること、及び、症状、障害、状態又は疾患から動物を保護することを包含する。防除は、治療的投与、予防的投与又は防止的投与を示す場合がある。例えば、幼虫又は未成熟の害虫は、無症候性であり得るが、幼虫又は未成熟の害虫に作用させて、感染が、成熟した害虫による症候性又は衰弱性の感染症へと進行するのを防ぐことによって防除される。

【０１７７】

従って、害虫（特に、蠕虫類、特に、内部寄生性の線虫類及び吸虫類）の処置及び／又は防除における本発明の化合物の使用とは、対象者が罹患率又は死亡率を包含する症状を示しているかどうかに関係なく、また、害虫の攻撃の段階に関係なく、そのライフサイクル全体を通してさまざまな形態の害虫に作用するための本発明の化合物の使用のことである。

【０１７８】

本明細書中で使用されている場合、「対象者への投与」には、限定するものではないが、皮膚投与、皮下投与、筋肉内投与、粘膜投与、粘膜下投与、経皮投与、経口投与又は鼻腔内投与が包含される。投与は、注射又は局所投与（例えば、ポアオン投与又はスポットオン投与）を包含し得る。ポアオン法又はスポットオン法は、ウシ、ウマ、ヒツジ又はブタなどの群れる動物（これらは、全ての動物を経口又は注射によって処理することが困難であるか又は時間がかかる）に対する使用に特に有利である。この方法は、その単純さのために、もちろん、個々の家庭内動物又はペットを包含する他の全ての動物にも使用することが可能であり、そして、それは、多くの場合、獣医の専門的な存在なしに実施され得るので、動物の飼育者に非常に好まれている。

【０１７９】

用語「対象者」及び「患者」には、ヒト、並びに、非ヒト哺乳動物及び魚類、本明細書中に記載されている脊椎動物、例えば、イヌ、ネコ、マウス、ラット、モルモット、ウサギ、フェレット、ウシ、ウマ、ヒツジ、ヤギ及びブタなどが包含される。特定的な対象者は、哺乳類のペット又は伴侶動物、例えば、イヌ及びネコ、並びに、さらに、マウス、モルモット、フェレット及びウサギなどである。

【０１８０】

用語「有効量」は、対象者に所望の利益を与える量を示しており、そして、治療及び防除の両方のための投与を包含する。該量は、個々の対象者ごとに異なり、そして、多くの要因（例えば、対象者の全体的な健康状態及び治療される状態の根本的な原因の重症度、併用治療、並びに、所望の応答を有益なレベルで維持するために使用される本発明化合物の量）に依存する。

【０１８１】

有効量は、既知の技術を使用することによって、及び、類似の状況下で得られた結果を観察することによって、当業者としての担当の診断医が容易に決定することができる。当該有効量、当該用量の決定においては、多くの要因が担当の診断医によって考慮され、ここで、そのような要因としては、限定するものではないが、以下のものがある：患者の種；そのサイズ、年齢及び一般的な健康状態；関連する特定の状態、障害、感染症又は疾患；状態、障害又は疾患の程度又は関与又は重症度；個々の患者の反応；投与される特定の化合物；投与方法；投与される調製物のバイオアベイラビリティ特性；選択された投与計画；併用薬の使用；及び、他の関連する状況。本発明の有効量、治療投与量は、０．５ｍｇ～１００ｍｇの範囲であると予期される。具体的な量は、当業者が決定することができる。これらの投与量は、体重が約１ｋｇ～約２０ｋｇの対象者に基づいているが、診断医は、体重がこの体重範囲の外にある対象者に関して適切な用量を決定することができる。本発明の有効量、治療用量は、対象者の体重１ｋｇあたり、０．１ｍｇ～１０ｍｇの範囲

であると予期される。投薬計画は、月１回、年４回、年２回又は年１回の投与であると予期される。

【０１８２】

本発明の化合物は、それが適応症である１以上の障害、疾患又は状態の治療（これは、害虫の処置を包含する）のための１以上の別の活性化合物又は治療法と組み合わせることができる。本発明の化合物は、害虫及び他の障害を治療するための１以上の化合物又は治療法と組み合わせて、同時に、順次に、又は、別々に、投与することができる。

【０１８３】

従って、本発明の組成物及び方法が、場合により、有効量の少なくとも１の付加的な活性化合物を含んでいることを包含することは、理解される。本発明において有用な付加的な活性化合物としては、ノミ、マダニ、ハエ及び蚊を処置するために使用されるものなどがあり、そして、大環状ラクトン類、例えば、ミルベマイシンオキシム、イミダクロプリド、スピノサド、ピリプロキシフェン、プレメトリン、Ｓ－メトプレン、プラジカンテル及びモキシデクチンなどを挙げることができる。さらなる例示的な付加的な活性化合物としては、限定するものではないが、以下のものを挙げることができる：アフォキソラネル、ブロフラニリド、フルララネル、フルキサメタミド、イソシクロセラム、ロチラネル、モドフラネル、ニコフルプロール、サロラネル、チゴラネル、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、パラベンダゾール、チアベンダゾール、トリクラベンダゾール、アミトラズ、デミジトラズ、クロルスロン、クロサンテル、オキシクロナジド、ラフォキサニド、シフェノトリン、デルタメトリン、フルメトリン、ペルメトリン、シロマジン、デルカンテル、ジアンフェネチド、ジシクラニル、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアメトキサム、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、モキシデクチン、セラメクチン、ミルベマイシンオキシム、エモデプシド、エプシプランテル、フィプロニル、フルアズロン、フルヘキサホン、インドキサカルブ、レバミゾール、ルフェヌロン、メタフルミゾン、メトプレン、モネパンテル、モランテル、ニクロサミド、ニトロスカネート、ニトロキシニル、ノバルロン、オキサンテル、プラジカンテル、ピランテル、ピリプロール、ピリプロキシフェン、シサプロニル、スピノサド、スピネトラム、及び、トリフルメゾピリム、又は、上記のいずれかの塩。

【０１８４】

本発明の化合物の活性は、インビトロ方法及びインビボ方法を包含する、様々な方法で確認することができる。

【０１８５】

実施例Ａ

成体ネコノミに対する摂食活性のインビトロ評価

ノミに給餌するための試験血液混合物を調製するために、被験物質をジメチルスルホキシドに溶解させ、クエン酸塩が添加されたウシ血液で希釈して所望の濃度とする。試験装置を組み立てるために、約２０匹の餌を与えていない雄及び雌の成体ネコノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ　ｆｅｌｉｓ）を、頂部及び底部がガーゼで閉じられたチャンバーの中に入れる。金属製シリンダーの一端をパラフィルム膜で密封し、密封された底部を前記チャンバー上に配置し、試験血液混合物を入れる。この試験血液混合物は、パラフィルム膜を通してノミが吸うことができる。この組み立てられた試験装置の血液シリンダー部分は、ノミチャンバーを保持する隔離キャリアプレートの上の隔離された空気加熱容器内に約３７℃で収容される。ノミチャンバー部分は、室温に保持する。４８時間経過した後、ノミに対する殺虫活性を測定する。１００％は、全てのノミが死んだか又は瀕死になったことを意味し；０％は、投与した用量で影響を受けノミがなかったことを意味する。用量反応曲線から、それぞれのＥＣ５０を計算した（４パラメーターロジスティック曲線フィッティング）。ＥＣ５０が２０ｐｐｍの施用量を下回る場合、その物質はネコノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ　ｆｅｌｉｓ）に対して良好な殺虫活性を示す。

【０１８６】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜１ｐｐｍを示した：実施例１．５、１．８、１．９、１．１１、１．１３、１．１４、２．３、及び、３．１。

【０１８７】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜５ｐｐｍを示した：実施例１．１、１．５、１．８、１．９、１．１１、１．１３、１．１４、２．３、２．４、及び、３．１。

【０１８８】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜２０ｐｐｍを示した：実施例１．１、１．３、１．４、１．５、１．８、１．９、１．１１、１．１３、１．１４、２．３、２．４、及び、３．１。

【０１８９】

上記データに関し、異性体の絶対配置が分からずに単一の異性体について試験された場合、そのデータは、当該被験物質が一方の異性体又は別の異性体（例えば、実施例１．１又はそのエナンチオマー）であることを示している。

【０１９０】

実施例Ｂ

成体クリイロコイタマダニに対する接触活性のインビトロ評価

マダニとのインビトロ接触試験は、クリイロコイタマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓａｎｇｕｉｎｅｕｓ）の成体雄及び成体雌を用いて実施する。試験バイアルをコーティングするために、被験物質をアセトンｐ．ａ．に溶解させ、アセトンｐ．ａ．で希釈して所望の濃度とする。次いで、溶媒が完全に蒸発するまで、オービタルシェーカー上で回転及び揺動させることにより、当該溶液をガラスバイアルの内壁及び底部に均一に塗布する。例えば、９００ｐｐｍの被験物質溶液では、５μｇ／ｃｍ^{2}の面積基準薬量が達成される。溶媒が完全に蒸発した後、５～１０匹の成体マダニを各コーティングされた試験バイアルに適用し、次いで、そのバイアルを穴の開いたプラスチック製の蓋で密封し、室温及び周囲湿度の暗所で水平位置でインキュベートする。殺ダニ活性は、４８時間後に測定する。この目的のために、試験管を軽くたたいてマダニをその底部に移動させ、次いで、その試験バイアルをホットプレート上で４５～５０℃で５分間以内インキュベートする。試験バイアルの底で動かないままでいるか又は熱を避けるために意図的によじ登ることなく動きがギクシャクとしているマダニは、それぞれ、死んでいるか又は瀕死であると見なす。１００％の殺ダニ活性は、全てのマダニが死んだか又は瀕死になったことを意味する。０％の殺ダニ活性は、死んでいるか又は瀕死であるマダニが見られなかったことを意味する。用量反応曲線から、それぞれのＥＣ５０を計算した（４パラメーターロジスティック曲線フィッティング）。ＥＣ５０が５μｇ／ｃｍ^{2}の施用量を下回る場合、その物質はクリイロコイタマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓａｎｇｕｉｎｅｕｓ）に対して良好な殺ダニ活性を示す。

【０１９１】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．０４μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．３、１．５、１．８、及び、３．１。

【０１９２】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．２５μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．１、１．３、１．４、１．５、１．８、及び、３．１。

【０１９３】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜１μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．１、１．３、１．４、１．５、１．８、２．３、及び、３．１。

【０１９４】

上記データに関し、異性体の絶対配置が分からずに単一の異性体について試験された場合、そのデータは、当該被験物質が一方の異性体又は別の異性体（例えば、実施例１．１又はそのエナンチオマー）であることを示している。

【０１９５】
実施例Ｃ
成体ネコノミに対する接触活性のインビトロ評価
マダニとのインビトロ接触試験は、ネコノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ　ｆｅｌｉｓ）の成体雄及び成体雌を用いて実施する。試験バイアルをコーティングするために、被験物質をアセトンｐ．ａ．に溶解させ、アセトンｐ．ａ．で希釈して所望の濃度とする。次いで、溶媒が完全に蒸発するまで、オービタルシェーカー上で回転及び揺動させることにより、当該溶液をガラスバイアルの内壁及び底部に均一に塗布する。例えば、９００ｐｐｍの被験物質溶液では、５μｇ／ｃｍ^{2}の面積基準薬量が達成される。
【０１９６】
溶媒が完全に蒸発した後、約１０匹の成体ノミを各コーティングされた試験バイアルに適用し、次いで、そのバイアルを穴の開いたプラスチック製の蓋で密封し、室温及び周囲湿度の暗所で水平位置でインキュベートする。殺虫活性は、４８時間後に測定する。試験バイアルの底部で動かないままでいるか又は時折ジャンプしたり真っ直ぐ歩いたりせずに動きがギクシャクとしているノミは、それぞれ、死んでいるか又は瀕死である見なす。１００％の殺虫活性は、全てのノミが死んだか又は瀕死になったことを意味する。０％の殺虫活性は、影響を受けたノミがなかったことを意味する。用量反応曲線から、それぞれのＥＣ５０を計算した（４パラメーターロジスティック曲線フィッティング）。ＥＣ５０が５μｇ／ｃｍ^{2}の施用量を下回る場合、その物質はネコノミ（Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ　ｆｅｌｉｓ）に対して良好な殺虫活性を示す。
【０１９７】
この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．０５μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例３．１。
【０１９８】
この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．１μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．１、１．３、１．４、１．８、及び、３．１。
【０１９９】
上記データに関し、異性体の絶対配置が分からずに単一の異性体について試験された場合、そのデータは、当該被験物質が一方の異性体又は別の異性体（例えば、実施例１．１又はそのエナンチオマー）であることを示している。
【０２００】
実施例Ｄ
充血した雌オウシマダニに対する全身活性のインビトロ評価
マダニに注射するための被験化合物混合物を調製するために、被験物質をジメチルスルホキシドに溶解させ、同じ溶媒で稀釈して所望の濃度とする。１μＬの該試験混合物を、５匹の充血した雌成体オウシマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　（Ｂｏｏｐｈｉｌｕｓ）　ｍｉｃｒｏｐｌｕｓ）の各腹部に注射する。そのマダニを個別に５×５レプリカプレートの単一コンパートメントに移し、人工気象室（２８℃、相対湿度８５％）内で維持する。オウシマダニに対する殺ダニ活性は、７日後に、産卵された有精卵を評価することによって評価する。正常に見えない卵は、４２日後に幼虫が孵化するまで、人工気象室［２８℃、相対湿度８５％］内で保管することができる。１００％の殺ダニ活性は、産卵したマダニがなかったか又は産卵された卵が無精卵であったことを意味し；０％は、全ての卵が有精卵であることを意味する。用量反応曲線から、それぞれのＥＣ５０を計算した（４パラメーターロジスティック曲線フィッティング）。ＥＣ５０が１０μｇ／マダニの施用量を下回る場合、その物質はオウシマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　ｍｉｃｒｏｐｌｕｓ）に対して良好な全身殺ダニ活性を示す。
【０２０１】
この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜１μｇ／マダニを示した：実施例１．５、１．８、２．３、及び、３．１。
【０２０２】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜２μｇ／マダニを示した：実施例１．１、１．３、１．５、１．８、２．３、２．４、及び、３．１。

【０２０３】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜１０μｇ／マダニを示した：実施例１．１、１．３、１．５、１．８、２．１、２．２、２．３、２．４、及び、３．１。

【０２０４】

上記データに関し、異性体の絶対配置が分からずに単一の異性体について試験された場合、そのデータは、当該被験物質が一方の異性体又は別の異性体（例えば、実施例１．１又はそのエナンチオマー）であることを示している。

【０２０５】

実施例Ｅ

幼生オウシマダニに対する接触活性のインビトロ評価

このインビトロ接触試験は、オウシマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　ｍｉｃｒｏｐｌｕｓ）の幼生を用いて実施する。試験バイアルをコーティングするために、被験物質をアセトンｐ．ａ．に溶解させ、アセトンｐ．ａ．で希釈して所望の濃度とする。次いで、溶媒が完全に蒸発するまで、オービタルシェーカー上で回転及び揺動させることにより、当該溶液をガラスバイアルの内壁及び底部に均一に塗布する。例えば、９００ｐｐｍの被験物質溶液では、５μｇ／ｃｍ^{2}の面積基準薬量が達成される。溶媒が完全に蒸発した後、１０～２０匹の幼生マダニを各コーティングされた試験バイアルに適用し、次いで、そのバイアルを穴の開いたプラスチック製の蓋で密封し、人工気象室（２８℃、相対湿度８５％）内に維持されているトレイ内で水平位置でインキュベートする。殺ダニ活性は、４８時間後に測定する。この目的のために、バイアルを垂直に置き、オウシマダニ幼生の自然な負の走地性（ｅｇｅｏｔａｃｔｉｃ）行動を使用して効力を評価する。試験バイアルの底で動かないままでいるか又は意図的によじ登ることなく動きがギクシャクとしているマダニは、それぞれ、死んでいるか又は瀕死である見なす。１００％の殺ダニ活性は、全てのマダニ幼生が死んだか又は瀕死になったことを意味する。０％の殺ダニ活性は、影響を受けたマダニ幼生がなかったことを意味する。用量反応曲線から、それぞれのＥＣ５０を計算した（４パラメーターロジスティック曲線フィッティング）。ＥＣ５０が５μｇ／ｃｍ^{2}の施用量を下回る場合、その物質はクリイロコイタマダニ（Ｒｈｉｐｉｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓａｎｇｕｉｎｅｕｓ）に対して良好な殺ダニ活性を示す。

【０２０６】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．０１μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．３、１．５、及び、３．１。

【０２０７】

この試験において、例えば、調製実施例からの下記化合物は、ＥＣ$_{50}$＜０．１μｇ／ｃｍ^{2}を示した：実施例１．１、１．３、１．４、１．５、２．３、及び、３．１。

【０２０８】

上記データに関し、異性体の絶対配置が分からずに単一の異性体について試験された場合、そのデータは、当該被験物質が一方の異性体又は別の異性体（例えば、実施例１．１又はそのエナンチオマー）であることを示している。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/066422

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D261/04 C07D413/12 A01N43/80
ADD.

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 practicable, search terms used)
EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	WO 2021/127188 A1 (ELANCO TIERGESUNDHEIT AG [CH]; ELANCO US INC [US]) 24 June 2021 (2021-06-24) cited in the application claim 1	1-15
X	EP 1 731 512 A1 (NISSAN CHEMICAL IND LTD [JP]) 13 December 2006 (2006-12-13) cited in the application claims 1,9	1-15
X	WO 2012/120399 A1 (PFIZER [US]; BILLEN DENIS [US] ET AL.) 13 September 2012 (2012-09-13) cited in the application claim 1	1-15

-/--

[x] Further documents are listed in the continuation of Box C.

[x] 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 application or patent 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	Date of mailing of the international search report
18 August 2022	31/08/2022

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Gettins, Marc

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/066422

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2009/112275 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; MURATA TETSUYA [JP] ET AL.) 17 September 2009 (2009-09-17) cited in the application claim 1	1-15
X	WO 2010/070068 A2 (NOVARTIS AG [CH]; NANCHEN STEVE [CH] ET AL.) 24 June 2010 (2010-06-24) cited in the application claim 1	1-15
X	WO 2007/079162 A1 (DU PONT [US]; LAHM GEORGE PHILIP [US] ET AL.) 12 July 2007 (2007-07-12) cited in the application claim 1	1-15
X	WO 2009/002809 A2 (DU PONT [US]; LAHM GEORGE PHILIP [US] ET AL.) 31 December 2008 (2008-12-31) cited in the application claims 1,20	1-15

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/066422

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2021127188 A1	24-06-2021	AR 120804 A1	16-03-2022
		AU 2020408351 A1	11-08-2022
		CA 3164924 A1	24-06-2021
		US 2021188789 A1	24-06-2021
		WO 2021127188 A1	24-06-2021
EP 1731512 A1	13-12-2006	AU 2005219788 A1	15-09-2005
		AU 2010212450 A1	09-09-2010
		BR PI0508140 A	24-07-2007
		CA 2558848 A1	15-09-2005
		CN 1930136 A	14-03-2007
		CN 101768129 A	07-07-2010
		CN 102532048 A	04-07-2012
		CN 102558082 A	11-07-2012
		CY 1115818 T1	14-12-2016
		DK 1731512 T3	05-01-2015
		EA 200601639 A1	27-02-2007
		EA 200900197 A1	30-06-2009
		EP 1731512 A1	13-12-2006
		ES 2526614 T3	13-01-2015
		HR P20141241 T1	13-02-2015
		HU S1500009 I1	28-06-2017
		IL 177949 A	28-02-2013
		JP 4883296 B2	22-02-2012
		JP 5321856 B2	23-10-2013
		JP 2012006944 A	12-01-2012
		JP WO2005085216 A1	17-01-2008
		KR 20070010145 A	22-01-2007
		KR 20110132638 A	08-12-2011
		LU 92672 I2	02-11-2015
		NL 300721 I1	29-12-2015
		PL 1731512 T3	31-03-2015
		PT 1731512 E	24-11-2014
		SI 1731512 T1	30-01-2015
		TW I355896 B	11-01-2012
		US 2007066617 A1	22-03-2007
		US 2009312330 A1	17-12-2009
		US 2011251398 A1	13-10-2011
		US 2012172615 A1	05-07-2012
		US 2013296559 A1	07-11-2013
		US 2015105398 A1	16-04-2015
		US 2017065565 A1	09-03-2017
		US 2018318266 A1	08-11-2018
		US 2020000777 A1	02-01-2020
		US 2020155511 A1	21-05-2020
		WO 2005085216 A1	15-09-2005
		ZA 200607637 B	28-05-2008
WO 2012120399 A1	13-09-2012	AR 085649 A1	16-10-2013
		AU 2012226475 A1	12-09-2013
		BR 112013023068 A2	26-07-2016
		CA 2828397 A1	13-09-2012
		CL 2013002516 A1	13-06-2014
		CN 103517907 A	15-01-2014
		CO 6761337 A2	30-09-2013
		CY 1117987 T1	17-05-2017
		EP 2683723 A1	15-01-2014
		ES 2585555 T3	06-10-2016

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/066422

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		HK 1190393 A1	04-07-2014
		HR P20160601 T1	01-07-2016
		HU E029810 T2	28-03-2017
		JP 5806743 B2	10-11-2015
		JP 2014508773 A	10-04-2014
		KR 20140017590 A	11-02-2014
		ME 02412 B	20-09-2016
		NZ 614547 A	24-12-2014
		PL 2683723 T3	31-07-2017
		PT 2683723 T	05-08-2016
		RU 2013139630 A	20-04-2015
		US 2012232026 A1	13-09-2012
		UY 33943 A	31-10-2012
		WO 2012120399 A1	13-09-2012
		ZA 201306817 B	27-07-2016
WO 2009112275 A1	17-09-2009	AR 070866 A1	12-05-2010
		AU 2009224896 A1	17-09-2009
		BR PI0909504 A2	04-08-2015
		CA 2718199 A1	17-09-2009
		CL 2009000509 A1	13-08-2010
		CN 101970403 A	09-02-2011
		CO 6321194 A2	20-09-2011
		CR 11672 A	24-02-2011
		DO P2010000271 A	15-10-2010
		EP 2254863 A1	01-12-2010
		JP 2009286773 A	10-12-2009
		JP 2011517663 A	16-06-2011
		KR 20100138987 A	31-12-2010
		KR 20130100387 A	10-09-2013
		NI 201000151 A	23-03-2011
		PE 20091619 A1	05-11-2009
		SV 2010003661 A	14-01-2011
		TW 200950703 A	16-12-2009
		US 2011071141 A1	24-03-2011
		UY 31690 A	10-11-2009
		WO 2009112275 A1	17-09-2009
		ZA 201006502 B	30-11-2011
WO 2010070068 A2	24-06-2010	AR 074790 A1	09-02-2011
		AU 2009327079 A1	24-06-2010
		BR PI0923009 A2	11-08-2015
		CA 2747354 A1	24-06-2010
		CL 2011001390 A1	28-10-2011
		CN 102256971 A	23-11-2011
		CO 6341475 A2	21-11-2011
		DK 2379537 T3	17-12-2012
		EP 2379537 A2	26-10-2011
		ES 2395704 T3	14-02-2013
		HU S1700034 I1	28-09-2017
		JP 5608676 B2	15-10-2014
		JP 2012512838 A	07-06-2012
		LU C00030 I1	10-08-2017
		NO 2017048 I1	08-09-2017
		NZ 593135 A	26-04-2013
		PL 2379537 T3	29-03-2013
		PT 2379537 E	27-12-2012
		TW 201024289 A	01-07-2010

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/066422

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		US 2011245239 A1	06-10-2011
		US 2013131053 A1	23-05-2013
		US 2014120147 A1	01-05-2014
		WO 2010070068 A2	24-06-2010
		ZA 201103780 B	25-01-2012
WO 2007079162 A1	12-07-2007	AR 058896 A1	27-02-2008
		AT 496900 T	15-02-2011
		AU 2006332749 A1	12-07-2007
		BR PI0621171 A2	29-11-2011
		CA 2632694 A1	12-07-2007
		CN 101351456 A	21-01-2009
		CY 1111736 T1	07-10-2015
		DK 1973888 T3	16-05-2011
		EP 1973888 A1	01-10-2008
		ES 2358683 T3	12-05-2011
		HR P20110223 T1	30-06-2011
		HU S1400043 I1	28-08-2017
		IL 191512 A	30-07-2015
		JO 2668 B1	17-06-2012
		JP 5242413 B2	24-07-2013
		JP 2009522282 A	11-06-2009
		KR 20080094015 A	22-10-2008
		KR 20120013453 A	14-02-2012
		LU 92512 I2	06-10-2014
		MA 30070 B1	01-12-2008
		MD 20080171 A	31-07-2009
		ME 00496 B	10-10-2011
		MY 149421 A	30-08-2013
		MY 169840 A	16-05-2019
		NZ 568026 A	29-10-2010
		PL 1973888 T3	30-06-2011
		PT 1973888 E	22-02-2011
		RS 51670 B	31-10-2011
		RS 20060699 A	07-08-2008
		SI 1973888 T1	30-06-2011
		TW I412322 B	21-10-2013
		US 2010234219 A1	16-09-2010
		US 2011263641 A1	27-10-2011
		US 2013029845 A1	31-01-2013
		US 2014038821 A1	06-02-2014
		US 2014249314 A1	04-09-2014
		UY 30069 A1	31-07-2007
		WO 2007079162 A1	12-07-2007
		ZA 200804384 B	26-08-2009
WO 2009002809 A2	31-12-2008	AR 067185 A1	30-09-2009
		AR 110434 A2	27-03-2019
		AU 2008268614 A1	31-12-2008
		BR PI0810936 A2	23-12-2014
		BR 122018001898 B1	21-07-2020
		CA 2684632 A1	31-12-2008
		CL 2008001879 A1	22-05-2009
		CN 101765592 A	30-06-2010
		CY 1119101 T1	07-03-2018
		DK 2158188 T3	07-08-2017
		DK 3222618 T3	30-11-2020
		EP 2158188 A2	03-03-2010

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/066422

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		EP 3222618 A1	27-09-2017
		ES 2633448 T3	21-09-2017
		ES 2836269 T3	24-06-2021
		GT 200900321 A	25-03-2011
		HR P20171018 T1	03-11-2017
		HR P20201897 T1	02-04-2021
		HU E035329 T2	02-05-2018
		HU E052554 T2	28-05-2021
		IL 201671 A	28-05-2014
		JP 5467042 B2	09-04-2014
		JP 2010531883 A	30-09-2010
		KR 20100021533 A	24-02-2010
		LT 2158188 T	10-07-2017
		LT 3222618 T	28-12-2020
		MA 31444 B1	01-06-2010
		ME 00967 B	20-06-2012
		MY 156005 A	31-12-2015
		MY 158669 A	31-10-2016
		NO 2017049 I1	14-09-2017
		NZ 580396 A	29-07-2011
		PL 2158188 T3	31-10-2017
		PL 3222618 T3	25-01-2021
		PT 2158188 T	28-07-2017
		PT 3222618 T	30-11-2020
		RU 2010102224 A	10-08-2011
		SI 2158188 T1	31-08-2017
		SI 3222618 T1	26-02-2021
		TN 2009000488 A1	31-03-2011
		TW 200906810 A	16-02-2009
		UA 99822 C2	10-10-2012
		US 2010254959 A1	07-10-2010
		US 2013217736 A1	22-08-2013
		UY 31177 A1	30-01-2009
		WO 2009002809 A2	31-12-2008

フロントページの続き

(51)国際特許分類			FI			テーマコード（参考）
A01P	*7/02*	*(2006.01)*	A01P	7/02		
A01P	*7/04*	*(2006.01)*	A01P	7/04		
A01N	*43/80*	*(2006.01)*	A01N	43/80	101	

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100119253
弁理士 金山 賢教
(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 100137213
弁理士 安藤 健司
(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
(74)代理人 100196483
弁理士 川嵜 洋祐
(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
(72)発明者 デュクレー，ピエール
アメリカ合衆国、インディアナ・４６１４０、グリーンフィールド、イノベーションウェイ・２５００・エランコ・アニマル・ヘルス気付
(72)発明者 ラジョー，デニーズ
アメリカ合衆国、インディアナ・４６１４０、グリーンフィールド、イノベーションウェイ・２５００・エランコ・アニマル・ヘルス気付
(72)発明者 トゥルバーグ，アンドレアス
アメリカ合衆国、インディアナ・４６１４０、グリーンフィールド、イノベーションウェイ・２５００・エランコ・アニマル・ヘルス気付

Ｆターム（参考） 4C086 AA01 AA02 AA03 BC67 GA07 GA09 GA16 MA01 MA04 MA16
MA17 MA23 MA28 MA35 MA37 MA52 MA55 MA66 NA14 ZB37 ZC61
4H011 AC01 AC04 BB10