(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-517514
(P2025-517514A)
(43)公表日　令和7年6月5日(2025.6.5)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 333/68 (2006.01)		C07D	333/68	CSP　4C086
A61K 31/381 (2006.01)		A61K	31/381	
C07D 409/12 (2006.01)		C07D	409/12	
A61K 31/4436(2006.01)		A61K	31/4436	
C07D 417/12 (2006.01)		C07D	417/12	

審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全178頁）　最終頁に続く

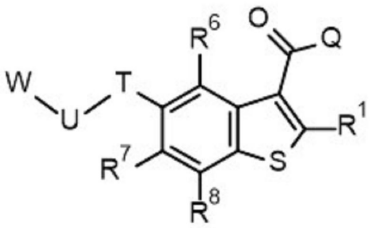
(21)出願番号　特願2024-569519(P2024-569519)
(86)(22)出願日　令和5年5月25日(2023.5.25)
(85)翻訳文提出日　令和7年1月16日(2025.1.16)
(86)国際出願番号　PCT/EP2023/063996
(87)国際公開番号　WO2023/227697
(87)国際公開日　令和5年11月30日(2023.11.30)
(31)優先権主張番号　22175516.8
(32)優先日　令和4年5月25日(2022.5.25)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,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
最終頁に続く

(71)出願人　599098493
カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン
Ｋａｔｈｏｌｉｅｋｅ Ｕｎｉｖｅｒｓｉｔｅｉｔ Ｌｅｕｖｅｎ
ベルギー、ベー－３０００ルーヴァン、ワーイストラート６番、ボックス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ
(71)出願人　524430862
バイオヘイブン・セラピューティクス・リミテッド
Ｂｉｏｈａｖｅｎ Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃｓ Ｌｔｄ．
英国領バージン諸島ブイジー１１１０ト
最終頁に続く

(54)【発明の名称】　ＴＲＰＭ３媒介性障害を治療するための新たな誘導体

(57)【要約】
本発明は、ＴＲＰＭ３媒介性障害、より具体的には、疼痛、てんかん及び炎症性過敏症から選択される障害の予防又は治療に有用な化合物に関する。本発明はまた、当該ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための方法に関する。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体であって、
【化１】



（Ｉ）

式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、
R^2が、$-R^{Y5}$を表し、
R^3が、－ＯＨ又は$-R^{Y1}$を表し、
R^4が、$-R^{Y2}$又は$-S(=O)_2R^{Y3}$を表し、
あるいは、R^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表すか、又はＴが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^{Y4}$を表し、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-NO_2$、$-SF_5$、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、$-C_1-C_6-$アルキル、$-C_2-C_6-$アルケニル、$-C_2-C_6-$アルキニル、を表し、
式中、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の$-C_1-C_6-$アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の$-C_1-C_6-$ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキ

ルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、

Ｒ^{Ｙ１}、Ｒ^{Ｙ２}、Ｒ^{Ｙ３}、Ｒ^{Ｙ４}、及びＲ^{Ｙ５}が、互いに独立して、各場合において、独立して、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、前記６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、前記５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、

「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（

＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（

＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、

前記化合物が、

５－ベンジルオキシベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸ではない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

【請求項２】

Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－を表す、請求項１又は２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表す、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－フェニル、
非置換の、一置換若しくは多置換の－フェニル、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、前記５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

Ｒ^{4}が、
－Ｈ、
飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）、
飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、前記３～１４員シクロアルキルが、飽和、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、ア

ゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換である、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、

５～１４員ヘテロアリール又は－C_{1-6}－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換であり、前記５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、５～１４員ヘテロアリール又は－C_{1-6}－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項７】

Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝

Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$

－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、を表す、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項８】

Ｒ^{1}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキレン）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換－シクロプロピル、非置換シクロブチル、非置換シクロペンチル、又は非置換シクロヘキシル、を表す、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項９】

Ｒ^{5}及びＲ^5’が、互いに独立して、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、請求項１～８のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１０】

Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_{5}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、
－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、
－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１１】

化合物００１－（２Ｒ）－２－｛［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物００２－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００３－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００４－（２Ｒ）－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物００５－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００６－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００７－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００８－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００９－（２Ｓ）－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、

化合物０１０－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１１－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１２－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１３－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０１４－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０１５－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－４－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１６－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１７－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１８－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１９－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０２０－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキソラン－３－カルボキサミド、
化合物０２１－４－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０２２－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２３－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２５－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２６－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０２７－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル

－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０２８－Ｎ－［（３Ｒ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２９－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０３０－Ｎ－［（３Ｓ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３１－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０３２－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３３－４－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０３４－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３５－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３６－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３７－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３８－３－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０３９－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４０－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４１－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４３－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４４－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メ

トキシ］－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４５－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４６－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４７－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４８－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４９－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物０５０－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５１－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５２－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５３－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０５４－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５５－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［（３Ｒ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０５６－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５７－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５８－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０５９－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［（３Ｓ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０６０－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［（３Ｓ）－２－オキソピロリジン－３－イル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０６１－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６２－２－｛［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン

－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６３－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６４－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６５－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０６６－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキサン－４－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６８－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキセタン－３－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６９－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７０－４－｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０７１－４－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０７２－４－｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボン酸、
化合物０７３－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７４－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７５－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７６－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７７－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７８－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７９－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８０－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８１－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８２－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、

化合物０８３－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８５－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８６－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８７－３－｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０８８－３－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０８９－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９０－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９１－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９２－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９３－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９４－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９５－Ｅｎ１－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９５－Ｅｎ２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９６－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９７－２－メチル－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９８－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９９－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１００－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０１－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－５－｛［

２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０２－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０３－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０５－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０６－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０７－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０８－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１０９－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１１１－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１２－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１３－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１４－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１５－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１６－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１７－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１８－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１９－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２０－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２１－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベ

ンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２２－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２３－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２４－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２５－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２６－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２７－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２８－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２９－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３０－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３１－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３２－３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１３３－Ｎ－メチル－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキソラン－３－カルボキサミド、
化合物１３４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ，２－ジメチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３５－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３６－Ｎ，２－ジメチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３７－Ｎ，２－ジメチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３８－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１３９－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミ、
化合物１４０－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１４１－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物１４２－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－５－［（２－メト

キシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４３－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４５－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４６－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４７－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４８－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４９－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１５０－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１５１－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１５２－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
及びそれらの生理学的に許容される塩、からなる群から選択される、請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物を含む、薬学的組成物。
【請求項１３】
医薬としての使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。
【請求項１４】
疼痛又はてんかんの治療における使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。
【請求項１５】
前記疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択され、好ましくは術後疼痛である、請求項１４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、ＴＲＰＭ３媒介性障害、より具体的には、疼痛、てんかん及び炎症性過敏症から選択される障害の予防又は治療に有用な化合物に関する。本発明はまた、当該ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための方法に関する。
【背景技術】
【０００２】
ＴＲＰスーパーファミリーは、ホモ又はヘテロ四量体として組み立ててカチオン透過性イオンチャネルを形成する６つの膜貫通ドメイン（６ＴＭ）を有するタンパク質からなる。ＴＲＰという名称は、持続光への応答におけるハエ光受容体における一過性受容体電位

を特徴とするＤｒｏｓｏｐｈｉｌａ　ｔｒｐ（一過性受容体電位）変異体に由来する。過去１５年間で、ｔｒｐ関連チャネルが、ヒトにおける２７個のＴＲＰを含む、酵母、寄生虫、昆虫、魚類、及び哺乳動物において確認されている。配列相同性に基づいて、ＴＲＰチャネルは、７つのサブファミリー：ＴＲＰＣ、ＴＲＰＶ、ＴＲＰＭ、ＴＲＰＡ、ＴＲＰＰ、ＴＲＰＭＬ、及びＴＲＰＮに分けることができる。

【０００３】

ＴＲＰスーパーファミリーのメンバーは、おそらく全ての哺乳動物の臓器や細胞型で発現しており、近年、その生理学的役割の理解において大きな進歩があった。ある特定のＴＲＰチャネルのカスタマイズされた選択性は、Ca^{2+}、Mg^{2+}、及び微量金属イオンの細胞取り込み及び／又は経上皮輸送において重要な役割を果たすことを可能にする。更に、幅広い化学的及び物理的刺激に対するＴＲＰチャネルの感度は、視覚から味覚、触覚までのプロセスに関与する専用の生物学的センサーとして機能することを可能にする。具体的には、ＴＲＰスーパーファミリーのいくつかのメンバーは、温度に対して非常に高い感度を示す。これらのいわゆるサーモＴＲＰは、感覚ニューロン及び／又は皮膚ケラチノサイトで高度に発現され、無害及び有害な（痛みを伴う）温度の検出のための主要なサーモセンサーとして機能する。

【０００４】

ＴＲＰチャネルの機能不全が、様々な遺伝性及び後天性疾患の病因に直接関与していることがますます明らかになりつつある。実際、ＴＲＰチャネル遺伝子の機能喪失及び機能獲得の両方の変異が、ブラキオール血症、二次性低カルシウム血症を伴う低マグネシウム血症、多嚢胞性腎臓病、ＩＶ型ムコリピドーシス、及び家族性巣状分節性糸球体硬化症を含む遺伝性疾患の直接的原因として特定されている。更に、ＴＲＰチャネルの機能／機能不全は、慢性疼痛、高血圧、がん、てんかん、及び神経変性障害を含む広範囲の病理学的状態に直接関連している。

【０００５】

ＴＲＰＭ３（一過性受容体電位メラスタチン３）は、有望な薬理学的標的を表す。ＴＲＰＭ３は、後根及び三叉神経節からの小径感覚ニューロンの大きなサブセットで発現し、熱感知に関与している。神経ステロイドである硫酸プレグネノロンは、ＴＲＰＭ３の強力な既知の活性化因子である（Ｗａｇｎｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，２００８）。神経ステロイドである硫酸プレグネノロンは、野生型マウスでは痛みを引き起こしたが、ノックアウトＴＲＰＭ３マウスでは痛みを引き起こさなかった。また、最近、ＴＲＰＭ３ノックアウトマウスにおいて、ＣＦＡ誘発炎症及び炎症性疼痛が排除されることも示された。したがって、ＴＲＰＭ３アンタゴニストは、炎症性疼痛などの疼痛に対抗するための鎮痛剤として使用され得る（ＶｒｉｅｎｓＪ．ｅｔ　ａｌ．Ｎｅｕｒｏｎ，Ｍａｙ　２０１１）。ＴＲＰＭ３はまた、脳を含むいくつかの他の組織で発現される；報告は、ＴＲＰＭ３における２つの変異が発達性及びてんかん性脳症と関連することを示している（Ｚｈａｏ，ｓ．，ｅｔ　ａｌ．Ｃｈａｎｎｅｌｓ（Ａｕｓｔｉｎ）．２０２１）。

【０００６】

いくつかのＴＲＰＭ３アンタゴニストが知られているが、それらのいずれも、本発明の化合物を指すものではない（Ｓｔｒａｕｂ　Ｉ　ｅｔ　ａｌ．Ｍｏｌ　Ｐｈａｒｍａｃｏｌ，Ｎｏｖｅｍｂｅｒ　２０１３）。例えば、想定されたＴＲＰＭ３遮断薬であるリキリチゲニンは、ラット疼痛モデルにおける機械的及び寒冷痛覚過敏症を減少させることが記載されている（Ｃｈｅｎ　Ｌ　ｅｔ　ａｌ．Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ　ｒｅｐｏｒｔｓ，Ｊｕｌｙ　２０１４）。疼痛及びてんかんなどのＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための、より具体的にはてんかん性脳症などの炎症性疼痛又はてんかんなどの疼痛のための新規の、代替の、及び／又はより良好な治療法に対する大きな医学的必要性が依然として存在する。ある特定の種類の疼痛に対する良好な効力、低レベル又は無副作用（オピエートと同様に中毒の可能性がなく、毒性がないなど）及び／又は良好若しくはより良好な薬物動態又は－動的特性が非常に必要である。

【０００７】

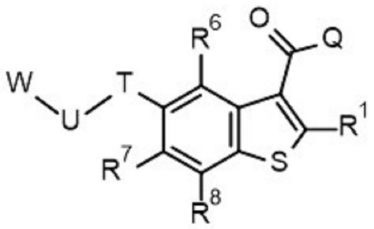
本発明は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニストであり、ＴＲＰＭ３媒介性障害のモジュレーターとして使用することができる新規の化合物類を提供する。

【発明の概要】

【０００８】

本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体であって、

【化１】



（Ｉ）

式中、

R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、

Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、

R^2が、$-R^{Y5}$を表し、

R^3が、－ＯＨ又は$-R^{Y1}$を表し、

R^4が、$-R^{Y2}$又は$-S(=O)_2R^{Y3}$を表し、

あるいは、R^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、

Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表すか、又はＴが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、

ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、

R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^{Y4}$を表し、

R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-NO_2$、$-SF_5$、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、

Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、

一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、$-C_1-C_6-$アルキル、$-C_2-C_6-$アルケニル、$-C_2-C_6-$アルキニル、を表し、

式中、

R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の$-C_1-C_6-$アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の$-C_1-C_6-$ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルで

あって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Ｙ１}、Ｒ^{Ｙ２}、Ｒ^{Ｙ３}、Ｒ^{Ｙ４}、及びＲ^{Ｙ５}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキ

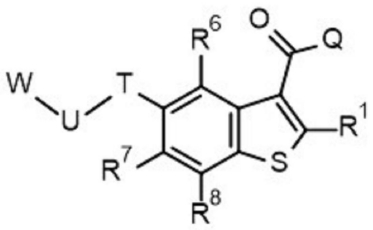
ル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（

＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、

又は化合物が、エチル５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレートである、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体を提供する。

特に、本発明は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体であって、

【化２】



（Ｉ）

式中、

Ｒ^{1}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｒ^W、－ＯＲ^W、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^W、－ＮＲ^{W}Ｒ^X、－ＮＲ^{W}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^X、－ＳＲ^W、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^W、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{W}Ｒ^{X}を表し、

Ｑが、－ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、

Ｒ^{2}が、－Ｒ^{Y5}を表し、

Ｒ^{3}が、－ＯＨ又は－Ｒ^{Y1}を表し、

Ｒ^{4}が、－Ｒ^{Y2}又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^{Y3}を表し、

あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、

Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、

ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、

Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｒ^{Y4}を表し、

Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^W、－ＯＲ^W、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^W、－ＮＲ^{W}Ｒ^X、－ＮＲ^{W}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^X、－ＳＲ^W、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^W、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{W}Ｒ^{X}を表し、

Wが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－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、を表し、
式中、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
R^{Y1}、R^{Y2}、R^{Y3}、R^{Y4}、及びR^{Y5}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル

、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アル

キル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、

当該化合物が、

５－ベンジルオキシベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸ではない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体を提供する。

【０００９】

本発明の第２の態様は、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物を含む薬学的組成物を包含する。

【００１０】
第３の態様によると、本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物又は医薬としての使用のための第２の態様に記載の薬学的組成物を提供する。
【００１１】
第４の態様によると、本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物、あるいはＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／若しくは治療における使用のための、特に、疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症の予防及び／若しくは治療における使用のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するための、第２の態様に記載の薬学的組成物を包含する。特に、疼痛、てんかん性脳症及び／若しくは炎症性過敏症の予防及び／若しくは治療における使用のため、並びに／又は疼痛、てんかん性脳症及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するためである。
【００１２】
本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物をそれを必要としている対象に投与することによって、ＴＲＰＭ３媒介性障害を予防又は治療するための方法を提供する。より具体的には、本発明は、疼痛、てんかん及び／又は炎症性過敏症の予防及び／又は治療のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／又は炎症性過敏症に対抗するためのそのような方法に関する。より具体的には、本発明は、疼痛、てんかん性脳症及び／又は炎症性過敏症の予防及び／又は治療のための、並びに／又は疼痛、てんかん性脳症及び／又は炎症性過敏症に対抗するためのそのような方法に関する。
【００１３】
本発明は更に、以下のステップを含む、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物を調製するための方法を提供する：
－ベンゾチオフェンを５－ヒドロキシベンゾチオフェン－３－カルボキシレートエステル誘導体に変換するステップ、
－以前に得られた５－ヒドロキシベンゾチオフェン－３－カルボキシレートエステル誘導体を、アルキル化又はミツノブ条件下で、離脱基を有する好適な誘導体又はアルコール誘導体で置換して、５－Ｏ－置換ベンゾチオフェン－３－カルボキシレートエステル誘導体を得るステップ、
－以前に得られた５－Ｏ－置換ベンゾチオフェン－３－カルボキシレートエステル誘導体をカルボン酸に変換して、５－Ｏ－置換ベンゾチオフェン－３－カルボン酸誘導体を得るステップ、及び
－以前に得られた５－Ｏ－置換ベンゾチオフェン－３－カルボン酸導体を好適なアミンと結合して、本発明の所望の誘導体を得るステップ。
【発明を実施するための形態】
【００１４】
本発明を説明する前に、本発明は、説明される特定のプロセス、方法及び化合物に限定されず、そのようなプロセス、方法及び化合物は、当然のことながら変動し得ることが理解されるべきである。また、本発明の範囲は添付の特許請求の範囲によってのみ限定されるため、本明細書で使用される用語は、限定することを意図していないことも理解されたい。
【００１５】
本発明の化合物及びプロセスを説明するとき、使用される用語は、文脈から別途指示されない限り、以下の定義に従って解釈されるべきである。
【００１６】
本明細書及び添付の特許請求の範囲で使用される場合、単数形の「ａ」、「ａｎ」、及び「ｔｈｅ」は、文脈上別段明らかに指示されない限り、単数形及び複数形の両方の指示対象を含む。例えば、「化合物」は、１つの化合物又は１つより多くの化合物を意味する。
【００１７】
本明細書で使用される「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅ

ｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「含む（ｉｎｃｌｕｄｉｎｇ）」、「含む（ｉｎｃｌｕｄｅｓ）」、又は「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｉｎｇ）」、「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｓ）」と同義であり、包括的又は非限定的であり、列挙されていない追加の部材、要素、又は方法ステップを除外しない。「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「からなる（ｃｏｎｓｉｓｔｉｎｇ　ｏｆ）」という用語を含む。

【００１８】

本明細書で使用される「約」という用語は、パラメータ、量、時間の長さ等の測定可能な値に言及する場合、指定された値の及び該値からの＋／－１０％以下、好ましくは＋／－５％以下、より好ましくは＋／－１％以下、更により好ましくは＋／－０．１％以下の変動を包含することを意味するが、ただし、開示される発明においてそのような変動を行うことが適切であるものとする。修飾語「約」が指す値は、それ自体も具体的にかつ好ましく開示されることを理解されたい。

【００１９】

本明細書で使用される場合、「及び／又は」という用語は、２つ以上の項目のリストにおいて使用されるとき、列記された項目のうちのいずれか１つを単独で採用することができること、又は列記された項目のうちの２つ以上の任意の組み合わせを採用することができることを意味する。例えば、リストが、群Ａ、Ｂ及び／又はＣを含むと説明されている場合、リストは、Ａのみ、Ｂのみ、Ｃのみ、Ａ及びＢの組み合わせ、Ａ及びＣの組み合わせ、Ｂ及びＣの組み合わせ、又はＡ、Ｂ及びＣの組み合わせを含み得る。

【００２０】

端点による数値範囲の列挙は、全ての整数、及び必要に応じて、その範囲内に含まれる分数を含む（例えば、１～５は、例えば、いくつかの要素を参照する場合、１、２、３、４を含み得、また、例えば、測定値を参照する場合、１．５、２、２．７５、及び３．８０を含み得る）。端点の列挙はまた、端点値自体を含む（例えば、１．０～５．０は、１．０及び５．０の両方を含む）。本明細書に記載される任意の数値範囲は、その中に含まれる全ての部分的な範囲を含むことが意図される。

【００２１】

本明細書を通して「一実施形態」又は「ある実施形態」への言及は、その実施形態に関連して記載される特定の特性、構造、又は特徴が本発明の少なくとも１つの実施形態に含まれることを意味する。したがって、本明細書の様々な箇所に出てくる「一実施形態において」又は「ある実施形態において」という語句は、必ずしも全て同じ実施形態を指しているわけではないが、そうである場合もある。更に、特定の特徴、構造、又は特性は、１つ以上の実施形態において、本開示から当業者に明らかなように、任意の好適な様式で組み合わされ得る。更に、本明細書に記載のいくつかの実施形態は、他の実施形態に含まれるいくつかの特徴を含むが他の特徴は含まず、異なる実施形態の特徴の組み合わせは、当業者に理解されるように、本発明の範囲内にあることを意味し、異なる実施形態を形成する。例えば、以下の特許請求の範囲では、特許請求された実施形態のいずれも、任意の組み合わせで使用することができる。

【００２２】

同様に、本発明の例示的な実施形態の説明では、本開示を簡素化し、かつ様々な発明態様のうちの１つ以上の理解を支援するために、本発明の様々な特性が、単一の実施形態、図、又はそれらの説明にまとめられることもあることを理解されたい。

【００２３】

別段の定義がない限り、技術的及び科学的用語を含む、本発明を開示する上で使用される全ての用語は、本発明が属する当業者によって一般的に理解される意味を有する。更なる指針として、本発明の教示をより良好に理解するために、説明で使用される用語の定義が含まれる。

【００２４】

本発明を説明するとき、使用される用語は、文脈から別途指示されない限り、以下の定義に従って解釈されるべきである。

【００２５】

上記の用語及び本明細書で使用される他の用語は、当業者には十分に理解されている。

【００２６】

「置換された」という用語が本明細書で使用されるときはいつでも、「置換された」を使用する表現で示される原子上の１個以上の水素原子が、示された基からの選択によって置き換えられることを示すことを意味するが、ただし、示された原子の通常の価数は上回らず、その置換によって、化学的に安定した化合物、すなわち、反応混合物からの単離に耐えるのに十分に堅牢である化合物がもたらされる。

【００２７】

以下の各定義において、炭素原子の数は、置換基又はリンカーに一般的に最適に存在する炭素原子の最大数を表す。本出願において別段に示される場合、炭素原子の数は、その特定の置換基又はリンカーに対する炭素原子の最適な最大数を表すと理解される。

【００２８】

本明細書で使用される「離脱基」又は「ＬＧ」という用語は、求核試薬によって置換されやすいか、又は塩基性条件若しくは酸性条件で切断若しくは加水分解されやすい化学基を意味する。特定の実施形態において、離脱基は、ハロゲン原子（例えば、Ｃｌ、Ｂｒ、Ｉ）又はスルホネート（例えば、メシラート、トシレート、トリフレート）から選択される。

【００２９】

「保護基」という用語は、官能基の特性又は化合物全体の特性をマスク又は変更する化合物の部分を指す。保護基の化学的基礎構造は、大きく異なる。保護基のある機能は、親薬物物質の合成における中間体として役立つことにある。化学的保護基及び保護／脱保護のための戦略は、当該技術分野において周知である。”Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９９１を参照されたい。保護基は、所望の化学反応の効率、例えば、規則正しく計画された様式で化学結合を形成及び破壊することを補助するために、ある特定の官能基の反応性をマスクするためにしばしば利用されている。化合物の官能基の保護は、極性、親油性（疎水性）、及び一般的な分析ツールによって測定することができる他の特性などの、保護された官能基の反応性以外の他の物理的特性を変える。化学的に保護された中間体は、それ自体が、生物学的に活性又は不活性であり得る。

【００３０】

保護された化合物はまた、変更された特性を示し得、いくつかの場合において、インビトロ及びインビボで最適化された特性（細胞膜の通過及び酵素的分解若しくは捕捉への耐性）を示し得る。この役割において、意図された治療効果を有する保護された化合物は、プロドラッグと称され得る。保護基の別の機能は、親薬物をプロドラッグへ変換することであり、それによって、この親薬物は、インビボでのプロドラッグの変換の際に放出される。活性プロドラッグは、親薬物よりも効果的に吸収され得るので、プロドラッグは、親薬物よりもインビボでの大きな潜在能力を有し得る。保護基は、化学的中間体の例においてはインビトロで、又はプロドラッグの場合にはインビボでのいずれかにおいて除去される。化学中間体に関して、脱保護後に結果として生じる生成物（例えば、アルコール）が、生理学的に許容されることは特に重要ではないが、概して、この生成物が薬理学的に無害である場合がより望ましい。

【００３１】

本明細書で使用される「ヘテロ原子（複数可）」という用語は、四級化され得る窒素、酸素、並びにスルホキシド及びスルホンを含む硫黄から選択される原子を意味する。

【００３２】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のアルキル」という用語は、飽和アルキル、並

びにアルケニル、アルキニルなどの不飽和のアルキルを含む。飽和又は不飽和のアルキルの好適な例としては、メチル、エチル、１－プロピル（ｎ－プロピル）、２－プロピル（ｉＰｒ）、１－ブチル、２－メチル－１－プロピル（ｉ－Ｂｕ）、２－ブチル（ｓ－Ｂｕ）、２－ジメチル－２－プロピル（ｔ－Ｂｕ）、１－ペンチル（ｎ－ペンチル）、２－ペンチル、３－ペンチル、２－メチル－２－ブチル、３－メチル－２－ブチル、３－メチル－１－ブチル、２－メチル－１－ブチル、１－ヘキシル、２－ヘキシル、３－ヘキシル、２－メチル－２－ペンチル、３－メチル－２－ペンチル、４－メチル－２－ペンチル、３－メチル－３－ペンチル、２－メチル－３－ペンチル、２，３－ジメチル－２－ブチル、及び３，３－ジメチル－２－ブチルが挙げられるが、これらに限定されない。「C_{1-6}アルキル」は、１～６個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、ヘキシル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-5}アルキル」は、１～５個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含む全てを含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、エチレン又はビニル（－ＣＨ＝CH_2）、アリル（－CH_2ＣＨ＝CH_2）、５－ヘキセニル（－$CH_2CH_2CH_2CH_2$ＣＨ＝CH_2）、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル、エチニル、２－プロピニル、２－ブチニル、３－ブチニル、２－ペンチニル及びその鎖異性体、２－ヘキシニル及びその鎖異性体を含む。

【００３３】

本明細書で使用される「アルキル」という用語は、不飽和部位を有しない、正常な、二次又は三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例は、メチル、エチル、１－プロピル（ｎ－プロピル）、２－プロピル（ｉＰｒ）、１－ブチル、２－メチル－１－プロピル（ｉ－Ｂｕ）、２－ブチル（ｓ－Ｂｕ）、２－ジメチル－２－プロピル（ｔ－Ｂｕ）、１－ペンチル（ｎ－ペンチル）、２－ペンチル、３－ペンチル、２－メチル－２－ブチル、３－メチル－２－ブチル、３－メチル－１－ブチル、２－メチル－１－ブチル、１－ヘキシル、２－ヘキシル、３－ヘキシル、２－メチル－２－ペンチル、３－メチル－２－ペンチル、４－メチル－２－ペンチル、３－メチル－３－ペンチル、２－メチル－３－ペンチル、２，３－ジメチル－２－ブチル、及び３，３－ジメチル－２－ブチルである。「C_{1-6}アルキル」は、１～６個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、ヘキシル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-5}アルキル」は、１～５個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含む全てを含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-4}アルキル」は、１～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）を含む。例えば、「C_{1-3}アルキル」は、１～３個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピルを含む。「置換されたC_{1-6}アルキル」は、任意の利用可能な結合点で１つ以上の置換基（例えば、１～３つの置換基、例えば、１、２、又は３つの置換基）で置換されたC_{1-6}アルキル基を指す。

【００３４】

本明細書で使用される「アルケニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、正常な、二次又は三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例としては、エチレン又はビニル（－ＣＨ＝CH_2）、アリル（－CH_2ＣＨ＝CH_2）、及び５－ヘキセニル（－

$CH_2CH_2CH_2CH_2CH=CH_2$）が挙げられるが、これらに限定されない。二重結合は、シス又はトランス配置であり得る。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「C_{2-6}アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、C_{2-4}アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を含む。C_{2-6}アルケニル基の例は、エテニル、２－プロペニル、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル等である。

【００３５】

本明細書で使用される「アルキニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ三重結合を有する、正常な、二次、三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例としては、エチニル（－C≡CH）及び１－プロピニル（プロパルギル、$-CH_2C\equiv CH$）が挙げられるが、これらに限定されない。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「C_{2-6}アルキニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素三重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、C_{2-4}アルキニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を含む。C_{2-6}アルキニル基の非限定的な例としては、エチニル、２－プロピニル、２－ブチニル、３－ブチニル、２－ペンチニル及びその鎖異性体、２－ヘキシニル及びその鎖異性体などが挙げられる。

【００３６】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のアルキレン」という用語は、飽和アルキレン、並びにアルケニレン、アルキニレンなどの不飽和アルキレンを包含する。本明細書で使用される「アルキレン」という用語は、親アルカンの同じ又は２個の異なる炭素原子からの２個の水素原子の除去によって得られる２つの一価のラジカル中心を有する飽和、直鎖、又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。典型的なアルキレンラジカルとしては、メチレン（$-CH_2-$）、エチレン（$-CH_2-CH_2-$）、メチルメチレン（$-CH(CH_3)-$）、１－メチル－エチレン（$-CH(CH_3)-CH_2-$）、ｎ－プロピレン（$-CH_2-CH_2-CH_2-$）、２－メチルプロピレン（$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$）、３－メチルプロピレン（$-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$）、ｎ－ブチレン（$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$）、２－メチルブチレン（$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_2-$）、４－メチルブチレン（$-CH_2-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-$）、ペンチレン及びその鎖異性体、ヘキシレン及びその鎖異性体が挙げられるが、これらに限定されない。

【００３７】

本明細書で使用される「アルケニレン」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、親アルケンの同じ又は２個の異なる炭素原子から２個の水素原子を除去することによって得られる２つの一価ラジカル中心を有する、直鎖又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。「C_{2-6}アルケニレン」は、それ自体で又は別の置換基の一部として、二価である、すなわち、２つの他の基への結合のための２つの単結合を有するC_{2-6}アルケニル基を指す。

【００３８】

本明細書で使用される「アルキニレン」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ三重結合を有する、親アルケンの同じ又は２個の異なる炭素原子から２個の水素原子を除去することによって得られる２つの一価ラジカル中心を有する、直鎖又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。本明細書で使用される場合、「C_{2-6}アルキニレン」という用語は、それ自体で又は

別の置換基の一部として、二価である、すなわち、２つの他の基への結合のための２つの単結合を有するＣ$_{2-6}$アルキニル基を指す。

【００３９】

基又は基の一部としての「アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「Ｃ$_{2-6}$アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、Ｃ$_{2-4}$アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を含む。Ｃ$_{2-6}$アルケニル基の例は、エテニル、２－プロペニル、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル等である。

【００４０】

「アルキニル」という用語は、それ自体で又は別の置換基の一部として、１つ以上の炭素－炭素三重結合を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「Ｃ$_{2-6}$アルキニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素三重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、Ｃ$_{2-4}$アルキニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を含む。Ｃ$_{2-6}$アルキニル基の非限定的な例としては、エチニル、２－プロピニル、２－ブチニル、３－ブチニル、２－ペンチニル及びその鎖異性体、２－ヘキシニル及びその鎖異性体などが挙げられる。

【００４１】

基又は基の一部としての「ハロＣ$_{1-6}$アルキル」という用語は、１個、２個又は３個の水素原子が本明細書で定義されるハロゲンで各々置き換えられる、先に定義される意味を有するＣ$_{1-6}$アルキル基を指す。そのようなハロＣ$_{1-6}$アルキル基の非限定的な例としては、クロロメチル、１－ブロモエチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、１，１，１－トリフルオロエチルなどが挙げられる。

【００４２】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和ヘテロアルキル」という用語は、飽和ヘテロアルキル、並びにヘテロアルケニル、ヘテロアルキニルなどの不飽和ヘテロアルキルを包含する。本明細書で使用される「ヘテロアルキル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、ヘテロ原子、すなわち、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。これは、当該アルキルのうちの１つ以上の－ＣＨ$_3$が－ＮＨ$_2$によって置き換えられ得ること、及び／又は当該アルキルのうちの１つ以上の－ＣＨ$_2$－が、－ＮＨ－、－Ｏ－、若しくは－Ｓ－によって置き換えられ得ることを意味する。当該鎖中のＳ原子は、任意に、１個又は２個の酸素原子で酸化されて、スルホキシド及びスルホンをそれぞれ得ることができる。更に、本発明の化合物中のヘテロアルキル基は、安定な化合物をもたらす任意の炭素又はヘテロ原子にオキソ又はチオ基を含有することができる。例示的なヘテロアルキル基には、アルコール、アルキルエーテル（例えば、－メトキシ、－エトキシ、－ブトキシなど）、一級、二級、及び三級アルキルアミン、アミド、ケトン、エステル、アルキルスルフィド、及びアルキルスルホンが含まれるが、これらに限定されない。「ヘテロアルケニル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルケニルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。したがって、ヘテロアルケニルという用語は、イミン、－Ｏ－アルケニル、－ＮＨ－アルケニル、－Ｎ（アルケニル）$_2$、－Ｎ（アルキル）（アルケニル）、及び－Ｓ－アルケニルを含む。本明細書で使用される「ヘテロアルキニル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキニ

ルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。したがって、ヘテロアルキニルという用語は、－シアノ、－Ｏ－アルキニル、－ＮＨ－アルキニル、－Ｎ（アルキニル）$_2$、－Ｎ（アルキル）（アルキニル）、－Ｎ（アルケニル）（アルキニル）、及び－Ｓ－アルキニルを含む。

【００４３】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和ヘテロアルキレン」という用語は、飽和ヘテロアルキレン、並びにヘテロアルケニレン、ヘテロアルキニレンなどの不飽和ヘテロアルキレンを包含する。本明細書で使用される「ヘテロアルキレン」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキレンを意味し、１つ以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、ヘテロ原子、すなわち、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロアルケニレン」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルケニレンを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロアルキニレン」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキニレンを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。

【００４４】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和シクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、シクロアルキニルなどの不飽和シクロアルキルを含む。特に、本明細書で使用される「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、及びシクロアルキニルなどの不飽和非芳香族シクロアルキルを包含する。特に、「飽和又は不飽和のシクロアルキル」及び「飽和又は非芳香族不飽和のシクロアルキル」という用語は、同義語である。「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語はまた、単環式又は二環式基を含む、１個以上の環を含有する全ての飽和及び不飽和炭化水素基を含む。多環シクロアルキルの更なる環は、１個以上のスピロ原子を介して、融合、架橋、及び／又は接合され得る。飽和又は不飽和のシクロアルキルの好適な例としては、シクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニルが挙げられるが、これらに限定されない「シクロアルキル」という用語は、本明細書で使用される場合、特に明記されていない限り、単環式又は二環式基を含む飽和環式炭化水素ラジカルを意味し、多環シクロアルキルの更なる環は、１個以上のスピロ原子を介して、融合、架橋、及び／又は接合され得る。シクロアルキルの例としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ノルボルニル、フェンチル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニルなどが挙げられる。本明細書で使用される「シクロアルケニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、非芳香族環状炭化水素ラジカルを意味する。「シクロアルケニル」という用語はまた、単環式又は二環式基を含み、多環式シクロアルケニルの更なる環は、１個以上のスピロ原子を介して、縮合、架橋、及び／又は接合さ

れ得る。例としては、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルが挙げられるが、これらに限定されない。二重結合は、シス又はトランス配置であり得る。本明細書で使用される「シクロアルキニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ三重を有する、非芳香族環状炭化水素ラジカルを意味する。例は、シクロヘプト－１－エンである。ヘテロシクロアルキル環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。アリール環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、アリールとみなされる。ヘテロアリール環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロアリールとみなされる。

【００４５】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、飽和ヘテロシクロアルキル、並びに少なくとも１個のヘテロ原子、すなわち、環員としてＮ、Ｏ、又はＳを含む不飽和非芳香族ヘテロシクロアルキルを含む。特に、「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」及び「飽和又は非芳香族不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、同義語である。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルケニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルケニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。飽和及び不飽和のヘテロシクロアルキルの例としては、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、が挙げられるが、これらに限定されない。本発明の意味における更なるヘテロシクロアルキルは、Ｐａｑｕｅｔｔｅ，Ｌｅｏ Ａ．”Ｐｒｉｎｃｉｐｌｅｓ ｏｆ Ｍｏｄｅｒｎ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｗ．Ａ．Ｂｅｎｊａｍｉｎ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９６８）、特に、１、３、４、６、７、及び９章、”Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０年から現在）、特に、１３、１４、１６、１９、及び２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ．”Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）；並びにＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．（１９６０）８２：５５６６に記載されている。ヘテロシクロアルキルが環員として窒素を含有しない場合、それは、典型的には炭素を通して結合される。ヘテロシクロアルキルが環員として窒素を含有する場合、それは、窒素又は炭素を通して結合され得る。シク

ロアルキル環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。アリール環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。ヘテロアリール環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロアリールとみなされる。

【００４６】

本明細書で使用される「アリール」という用語は、芳香族炭化水素を意味する。典型的なアリール基としては、一緒になって縮合される、１員、又は２員若しくは３員の、ベンゼン、ナフタレン、アントラセン、ビフェニルなどに由来するラジカルが含まれるが、これらに限定されない。シクロアルキル環を有するアリール環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、アリールとみなされる。ヘテロシクロアルキル環を有するアリール環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。したがって、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェンなどは、本発明によるヘテロシクロアルキルとみなされる。ヘテロアリール環を有するアリール環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロアリールとみなされる。

【００４７】

本明細書で使用される「ヘテロアリール」という用語は、少なくとも１個のヘテロ原子、すなわち、芳香族環系の環員として、Ｎ、Ｏ、又はＳを含む芳香族環系を意味する。ヘテロアリールの例としては、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンが挙げられるが、これらに限定されない。

【００４８】

更なる例として、炭素結合複素環は、ピリジンの２位、３位、４位、５位若しくは６位、ピリダジンの３位、４位、５位、若しくは６位、ピリミジンの２位、４位、５位、若しくは６位、ピラジンの２位、３位、５位、若しくは６位、フラン、テトラヒドロフラン、チオフェン、ピロール、若しくはテトラヒドロピロールの２位、３位、４位、若しくは５位、オキサゾール、イミダゾール、若しくはチアゾールの２位、４位、若しくは５位、イソオキサゾール、プラゾール、若しくはイソチアゾールの３位、４位、若しくは５位、アジリジンの２位若しくは３位、アゼチジンの２位、３位、若しくは４位、キノリンの２位、３位、４位、５位、６位、７位、若しくは８位、又はイソキノリンの１位、３位、４位、５位、６位、７位、若しくは８位で結合される。

【００４９】

好ましい炭素結合複素環としては、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、５－ピリジル、６－ピリジル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、５－ピリダジニル、６－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、６－ピリミジニル、２－ピラジニル、３－ピラジニル、５－ピラジニル、６－ピラジニル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、又は５－チアゾリルが挙げられる。例として、窒素結合複素環は、アジリジン、アゼチジン、ピロール、ピロリジン、２－ピロリン、３－ピロリン、イミダゾール、イミダゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、ピラゾール、ピラゾリン、２－ピラゾリン、３－ピラゾリン、ピペリジン、ピペラジン、インドール、インドリン、１Ｈ－インダゾール、の１位、イソインドール又はイソインドリンの２位、モルホリンの４位、及びカルバゾール又はβ－カルボリンの９位に結合される。好ましい窒素結合複素環としては、１－アジリジル、１－アゼチジル、１－ピロリル、１－イミダゾリ

ル、１－ピラゾリル、及び１－ピペリジニルが挙げられる。本発明の意味における更なるヘテロアリールは、Ｐａｑｕｅｔｔｅ，Ｌｅｏ Ａ．”Ｐｒｉｎｃｉｐｌｅｓ ｏｆ Ｍｏｄｅｒｎ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｗ．Ａ．Ｂｅｎｊａｍｉｎ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９６８）、特に、１、３、４、６、７、及び９章、”Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０年から現在）、特に、１３、１４、１６、１９、及び２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ．”Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）；並びにＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．（１９６０）８２：５５６６に記載されている。

【００５０】

置換基に関して本明細書で使用される場合、特に明記されていない限り、「一置換」、「二置換」、「三置換」、「多置換」などの用語は、本明細書で定義される化学構造を意味し、それぞれの部分は、１つ以上の置換基で置換され、当該部分の１個以上の水素原子は、各々独立して、置換基で置き換えられることを意味する。例えば、－Ｆで多置換され得る－Ｃ$_{1-6}$－アルキルが、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_2$ＣＦ$_3$、ＣＦ$_2$ＣＦ$_3$などに及ぶ。同様に、互いに独立して、－Ｆ及び－Ｃｌから選択される置換基で多置換され得る－Ｃ$_{1-6}$－アルキルは、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_2$ＣＦ$_3$、ＣＦ$_2$ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_2$Ｃｌ、－ＣＨＣｌ$_2$、－ＣＣｌ$_3$、－ＣＨ$_2$ＣＣｌ$_3$、ＣＣｌ$_2$ＣＣｌ$_3$、－ＣＨＣｌＦ、－ＣＣｌＦ$_2$、－ＣＣｌ$_2$ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$ＣＣｌ$_3$、－ＣＣｌＦＣＣｌ$_2$Ｆなどに及ぶ。本発明の化合物中の１つを超える部位に見出される任意の置換基の指定は、独立して、選択されるものとする。

【００５１】

本明細書で使用される場合、及び特に明記されていない限り、「溶媒和物」という用語は、アルコール、ケトン、エステル、エーテル、ニトリルなどであるが、これらに限定されない、好適な無機溶媒（例えば、水和物）又は有機溶媒を有する、本発明の誘導体によって形成され得る任意の組み合わせを含む。

【００５２】

本明細書で使用される「対象」という用語は、治療、観察、又は実験の対象である、ヒトを含む動物、好ましくは哺乳動物、最も好ましくはヒトを指す。

【００５３】

本明細書で使用される「治療有効量」という用語は、治療される疾患又は障害の症状の緩和又は部分的緩和を含む、研究者、獣医師、医師、又は他の臨床医によって求められている、組織系、動物、又はヒトにおける生物学的又は医薬応答を誘発する、活性化合物又は医薬品の量を指す。

【００５４】

本明細書で使用される「組成物」とは、治療有効量の指定された成分を含む生成物、並びに指定された量の指定された成分の組み合わせから直接的又は間接的に得られる任意の生成物を包含することが意図される。

【００５５】

本明細書で使用される「アンタゴニスト」又は「阻害剤」という用語は、状況に応じて、競合アンタゴニスト、非競合アンタゴニスト、脱感作アゴニスト、及び部分アゴニストを含む、ＴＲＰＭ３イオンチャネルの機能的アンタゴニストを産生することができる化合物を指す。

【００５６】

本発明の目的のために、「ＴＲＰＭ３変調された」という用語は、ＴＲＰＭ３イオンチャネルによって媒介される状態を含む、ＴＲＰＭ３イオンチャネルの変調によって影響を受ける状態を指すために使用される。

【００５７】

本明細書で使用される「ＴＲＰＭ３媒介性障害」という用語は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニストの使用が症状を予防、治療、（部分的に）緩和又は改善し、疼痛及び炎症性過敏症状態からなる障害又は疾患を指す。国際疼痛学会によれば、本発明の目的のために、疼痛は、実際の又は潜在的な組織損傷に関連する、又はそのような損傷の観点から説明される不快な感覚的及び感情的経験である。好ましくは、ＴＲＰＭ３媒介性障害は、疼痛又はてんかんである。好ましくは、ＴＲＰＭ３媒介性障害は、好ましくはてんかん性脳症から選択されるてんかんである。本発明の目的のために、「てんかん性脳症」という用語は、発作及び脳症の両方によって特徴付けられる重度のてんかんの群を指す。好ましくは、ＴＲＰＭ３媒介性障害は、好ましくは、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される疼痛である。より好ましくは、疼痛は、術後疼痛である。本発明の目的のために、「炎症性過敏症」という用語は、浮腫、紅斑、異常高熱及び疼痛を含む炎症の１つ以上の特徴によって、及び／又は熱的、機械的、及び／又は化学的刺激を含む１つ以上のタイプの刺激に対する過剰な生理学的又は病理生理学的応答によって特徴付けられる状態を指すために使用される。

【００５８】

本発明は、特定の実施形態に関して、場合によっては、更に説明されるが、本発明は、それらに限定されるものではない。

【００５９】

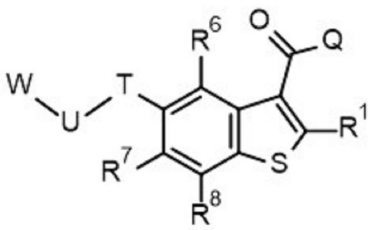
これより、本発明の化合物及び方法の好ましい陳述（特徴）及び実施形態を記載する。そのように定義された本発明の各陳述及び実施形態は、反対のことが明確に示されない限り、任意の他の陳述及び／又は実施形態と組み合わされ得る。特に、好ましい又は有利であると示される任意の特徴は、好ましい又は有利であると示される任意の他の１つ以上の特徴と組み合わせてもよい。

【００６０】

この発明の番号付けした陳述は、以下の通りである：

１．式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体であって、

【化３】



（Ｉ）

式中、

R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、

Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、

R^2が、$-R^{Y5}$を表し、

R^3が、－ＯＨ又は$-R^{Y1}$を表し、

R^4が、$-R^{Y2}$又は$-S(=O)_2R^{Y3}$を表し、

あるいは、R^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、

Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{5}Ｒ

^{5}’)$_{n}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
R^{5}及びR^{5}’が、互いに独立して、－R^{Y4}を表し、
R^{6}、R^{7}、及びR^{8}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－NO_{2}、－SF_{5}、－R^{W}、－OR^{W}、－ＯＣ（＝Ｏ）R^{W}、－$NR^{W}R^{X}$、－NR^{W}Ｃ（＝Ｏ）R^{X}、－SR^{W}、－Ｓ（＝Ｏ）R^{W}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}R^{W}$、－Ｃ（＝Ｏ）R^{W}、－Ｃ（＝Ｏ）OR^{W}、又は－Ｃ（＝Ｏ）$NR^{W}R^{X}$を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－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、を表し、
式中、
R^{W}及びR^{X}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
R^{Y1}、R^{Y2}、R^{Y3}、R^{Y4}、及びR^{Y5}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキ

レン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、

「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）

、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、

又は化合物が、エチル５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレートであり、
特に、当該化合物が、
５－ベンジルオキシベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸ではない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。
２．Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す、陳述１に記載の化合物。
３．Ｑが、－ＯＲ^{2}を表す、陳述１に記載の化合物。
４．Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’）$_{n}$－を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
５．Ｒ^{1}が、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
６．Ｒ^{1}が、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$

－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルであって、当該３～１４員シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルの各々が、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
７．Ｒ^{1}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキレン）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
８．Ｒ^{1}が、－Ｈ、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、又は－シクロペンチル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
９．Ｒ^{2}が、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキ

ル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１０．Ｒ^{2}が、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１１．Ｒ^{2}が、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１２．Ｒ^{2}が、－Ｈ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１３．Ｒ^{2}が、－Ｈを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１４．Ｒ^{3}が、
－Ｈ、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任

意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１５．Ｒ^{3}が、
－Ｈ、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１６．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１７．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１８．Ｒ^{3}が、－Ｈを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１９．Ｒ^{4}が、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリ

ールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２０．Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1}$－$_{6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、

非置換の、一置換若しくは多置換の－フェニル、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２１．Ｒ^{4}が、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ

（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール

からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
　３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
　３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）

、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－フェニル、
５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ

$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２２．Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、

３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリ

ン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換である、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、

５～１４員ヘテロアリール又は－C_{1-6}－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換であり、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、５～１４員ヘテロアリール又は－C_{1-6}－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２３．R^4が、

－Ｈ、

飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、

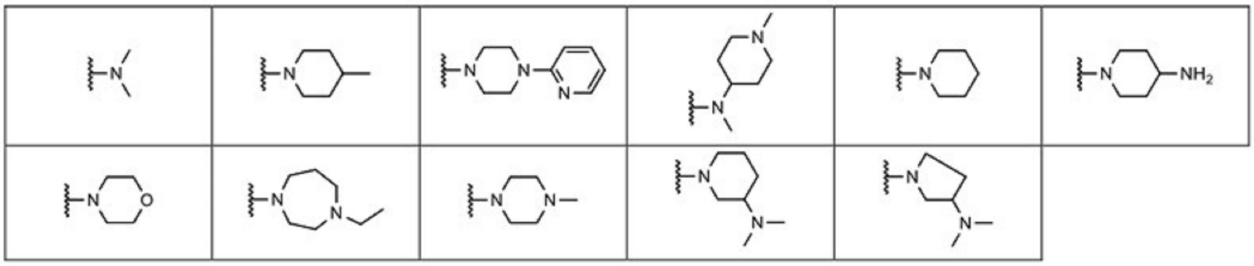
飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和の、非置換の、－ＯＨ、－OC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル

、非置換の－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
　３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
　３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、オキセタニル、ピリミジニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、
　非置換－フェニル、
　５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２４．Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
　Ｒ^{4}が、
　－Ｈ、
　飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
　飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、
　飽和の、非置換の、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は非置換－フェ

ニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、オキセタニル、ピリミジニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、
非置換－フェニル、
５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２５．Ｒ^{3}及びＲ^{4}が、一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５員又は６員の複素環を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２６．Ｒ^{3}及びＲ^{4}が、一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、各場合において、非置換の、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換－ピリジル、及び非置換若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換されている１，２，４－オキサジアゾールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、先行陳述のいずれか

１つに記載の化合物。
２７．R^3及びR^4が、一緒になって、
非置換、又は－Ｎ（CH_3）$_2$で一置換されている、ピロリジン環、
非置換、又は－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－Ｎ（CH_3）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、及び非置換若しくは－C_{1-6}－アルキルで一置換されている１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換されている、ピペリジン環、
非置換のモルホリン環、あるいは
非置換、又は－C_{1-6}－アルキル及び非置換の－ピリジルからなる群から選択される置換基でＮ置換されている、ピペリジン環、を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２８．R^3及びR^4が、これらが結合している窒素原子と一緒になって、
【表１】



からなる群から選択される残基を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２９．Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは二置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは二置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは二置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－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、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３０．Ｗが、
非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル基、
非置換の、一置換若しくは二置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは二置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－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、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３１．Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換のフェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換のフェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換のフェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝

Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３２．Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－ア

ルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－OH、－C_{1-6}－アルキレン－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NH_2、－C（＝O）－NH－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－S（＝O）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－S（＝O）$_2$－$NH_2$、－S（＝O）$_2$－NH（$C_{1-6}$－アルキル）、－S（＝O）$_2$－N（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは芳香族不飽和の、非置換の、－F、－Cl、－Br、－I、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C（＝O）－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）OH、－C（＝O）－OC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－OH、＝O、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－OH、－C_{1-6}－アルキレン－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NH_2、－C（＝O）－NH－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－S（＝O）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－S（＝O）$_2$－$NH_2$、－S（＝O）$_2$－NH（$C_{1-6}$－アルキル）、－S（＝O）$_2$－N（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１０員シクロアルキル、又は

非置換の、－F、－Cl、－Br、－I、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C（＝O）－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）OH、－C（＝O）－OC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－OH、＝O、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－OH、－C_{1-6}－アルキレン－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NH_2、－C（＝O）－NH－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－S（＝O）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－S（＝O）$_2$－$NH_2$、－S（＝O）$_2$－NH（$C_{1-6}$－アルキル）、－S（＝O）$_2$－N（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１２員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－F、－Cl、－Br、－I、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C（＝O）－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）OH、－C（＝O）－OC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－OH、＝O、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－OH、－C_{1-6}－アルキレン－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NH_2、

－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３３．Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝

Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３４．Ｗが、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、３～１０員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは二置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは二置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、－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、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３５．R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３６．ｎが、１、２、又は３から選択される整数であり、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３７．R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－C_1－C_6－アルキル、又は－C_1－C_6－アルキレン－Ｎ（C_1－C_6－アルキル）$_2$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３８．R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}－アルキル、

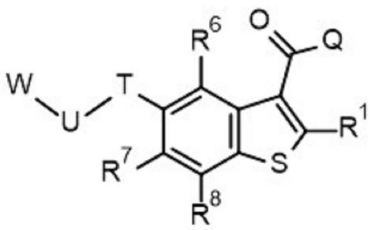
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３９．Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_{5}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、
－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、
－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４０．Ｒ^{6}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４１．Ｒ^{6}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４２．Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４３．Ｒ^{7}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４４．Ｒ^{8}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４５．Ｒ^{8}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４６．（ｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が各々、－Ｈを表すか、又は
（ｉｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの２つが、－Ｈを表し、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの他方は、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_{3}$を表すか、又は
（ｉｉｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの１つが、－Ｈを表し、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの他方が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_{3}$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４７．本明細書で述べられている化合物００１～化合物１５２及びそれらの生理学的に許容される塩からなる群から選択される、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４８．Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、又は－ＣＦ$_{3}$を表し、
Ｒ２が、Ｈを表し、
Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
Ｒ^{4}が、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５又は６員の複素環を形成し、
Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表し、
Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
４９．Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、又は－ＣＦ$_3$を表し、
Ｒ２が、Ｈを表し、
Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルであって、当該３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルの各々が、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員飽和シ

クロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５又は６員の複素環を形成し、
Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表し、
Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、
Ｗが、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
５０．Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、又は－ＣＦ$_3$を表し、
Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任

意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５又は６員の複素環を形成し、
Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表し、
Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
５１．Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、又は－ＣＦ$_3$を表し、
Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルであって、当該３～１４員シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルの各々が、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５又は６員の複素環を形成し、
Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表し、

R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表し、
Ｗが、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
５２．先行陳述のいずれか１つに記載の化合物を含む、薬学的組成物又は医薬。
５３．医薬としての使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述５２に記載の薬学的組成物。
５４．疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛及びてんかん性脳症の治療における使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述５２に記載の薬学的組成物。
５５．当該疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述５４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。
５６．当該疼痛が、術後疼痛である、陳述５５に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。
５７．有効量の先行陳述１～５１のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項５２に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／又は治療の方法。
５８．有効量の先行陳述１～５１のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項５２に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、疼痛、又はてんかん性脳症などのてんかんの予防及び／又は治療の方法。
５９．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述５８に記載の方法。
【００６１】
本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体を提供し、
【化４】



（Ｉ）

式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－R^W、－OR^W、－ＯＣ（＝Ｏ）R^W、－NR^WR^X、－NR^WC（＝Ｏ）R^X、－SR^W、－Ｓ（＝Ｏ）R^W、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^W$、－Ｃ（＝Ｏ）R^W、－Ｃ（＝Ｏ）OR^W、又は－Ｃ（＝Ｏ）NR^WR^Xを表し、
Ｑが、－OR^2又は－NR^3R^4を表し、
R^3が、－ＯＨ又は－R^{Y1}を表し、
R^4が、－R^{Y2}又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^{Y3}$を表し、
あるいは、R^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５

、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’）$_{n}$－を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’）$_{n}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
Ｒ^{5}及びＲ^{5}’が、互いに独立して、－Ｒ^{Y4}を表し、
Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＳＦ$_{5}$、－Ｒ^{W}、－ＯＲ^{W}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{W}、－ＮＲ^{W}Ｒ^{X}、－ＮＲ^{W}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{X}、－ＳＲ^{W}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{W}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{W}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{W}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{W}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{W}Ｒ^{X}を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－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、を表し、
式中、
Ｒ^{W}及びＲ^{X}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Y1}、Ｒ^{Y2}、Ｒ^{Y3}、Ｒ^{Y4}、及びＲ^{Y5}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、

非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（

＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（

＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、
又は化合物が、エチル５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレートであり、
当該化合物が、
５－ベンジルオキシベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸ではない。
【００６２】
いくつかの実施形態において、Ｑは、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す。
【００６３】
いくつかの実施形態において、Ｑは、－ＯＲ^{2}を表す。
【００６４】
いくつかの実施形態において、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－を表し、ｎは、１、２、又は３から選択される整数である。
【００６５】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＮＨ$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_1$－$_6$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換

若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す。

【００６６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アル

キレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｏ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、
－ＮＨ$_2$、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$

－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｓ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ

$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$

－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若

しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す。

【００６７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、－ＯＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の３～１４員シクロアルキル、又は非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、－ＯＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。

【００６８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、－Ｈ、ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－ＣＮ、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－ＣＨＦ$_{2}$、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシク

ロヘキシルを表す。
【００６９】
好ましくは、R^1は、－Ｈ、－ＣＮ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、又は－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、より好ましくは、－Ｈ、－CH_3、又は－CF_2Hを表す。
【００７０】
いくつかの実施形態において、R^2は、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。
【００７１】
いくつかの実施形態において、R^2は、
－Ｈ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2

Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から選択される置換基で互いに独立して一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃ

ｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールあって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００７２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}は、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又

は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、を表す。
【００７３】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す。好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す。好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｈ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換されている－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す。好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｈを表す。
【００７４】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す。
【００７５】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}は、－Ｈ又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す。
【００７６】
いくつかの実施形態において、Ｑは、－ＯＲ^{2}を表し、Ｒ^{1}は、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、又は－ＣＦ$_{3}$を表す。
【００７７】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、
－Ｈ、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換

の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００７８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、
－Ｈ、
－ＯＨ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換、－Ｆ、

－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から選択される置換基で互いに独立して一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールあって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－

ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００７９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、
－Ｈ、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、を表す。

【００８０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表す。好ましくは、Ｒ^{3}は、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$

－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表す。好ましくは、Ｒ^{3}は、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換されている－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す。好ましくは、Ｒ^{3}は、－Ｈを表す。

【００８１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}及びＲ^{4}は、両方とも－Ｈを表さない。いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、－Ｈを表さない。

【００８２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００８３】

好ましくは、Ｒ^{4}は、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ

$_{1-6}$－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、C_{1-6}－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、
３～１４員シクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ$_2$、－C_{1-}

$_{6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１

４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－フェニル、
５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す。

【００８４】

好ましくは、Ｒ^{4}は、
－Ｈ、
－Ｆで一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、
－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は非置換－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、
３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一

置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、オキセタニル、ピリミジニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、

非置換－フェニル、

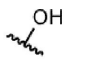
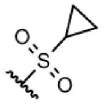
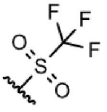
５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す。

【００８５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、

以下のもの：

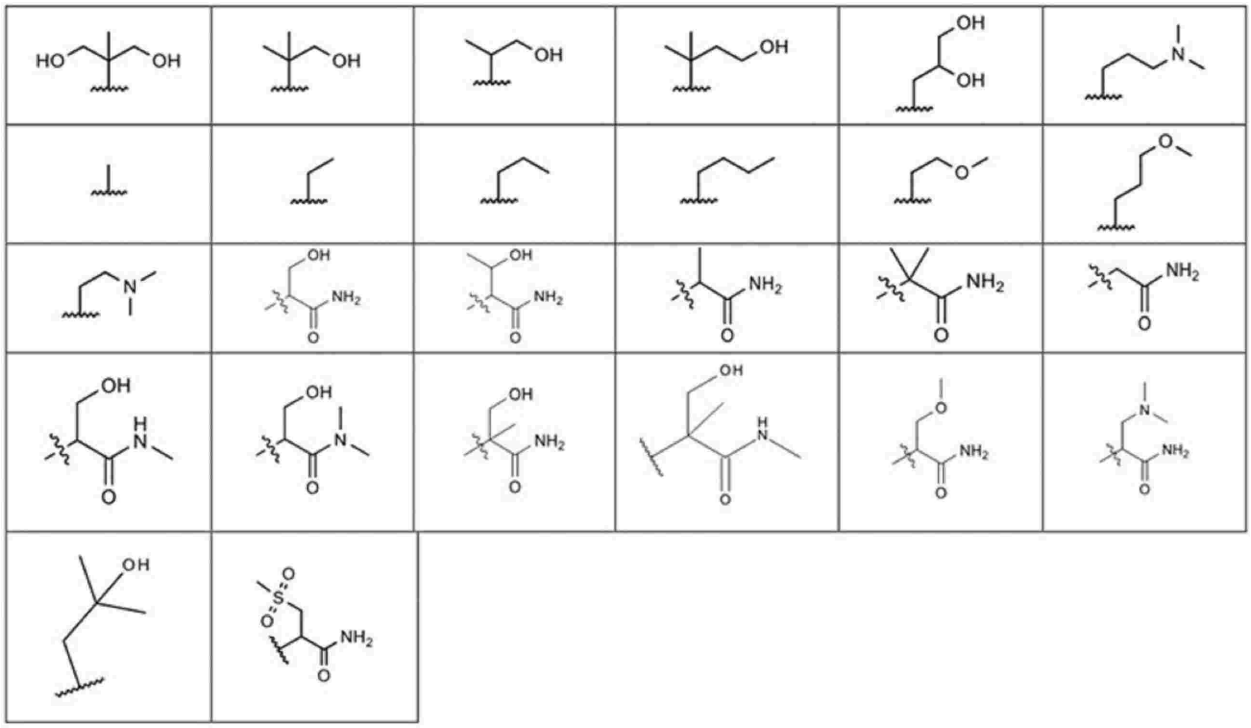
【表２】

からなる群から選択される残基、又は

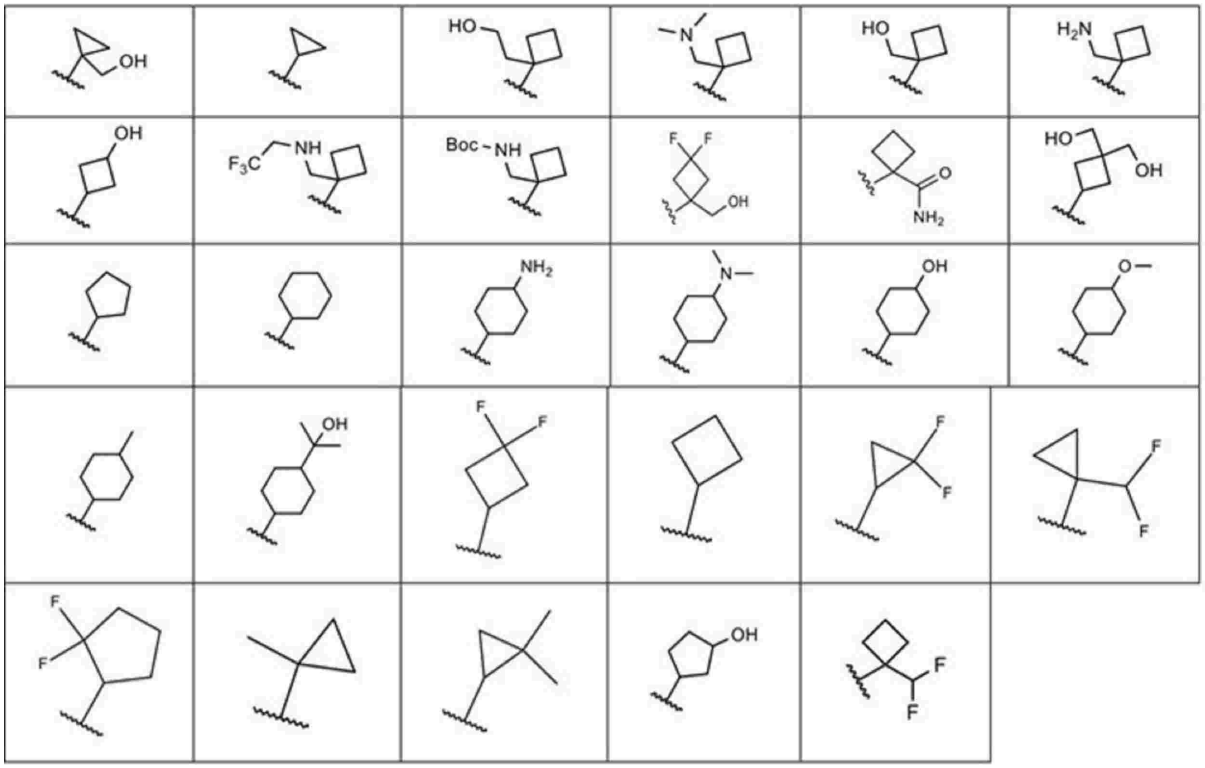
非置換の、一置換若しくは多置換のＣ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、好ましくは、残基－ＣＲ’Ｒ”－（ＣＨ$_2$）$_m$－ＯＨを表し、ｍが、１、２、３、４、５、又は６から選択される、好ましくは、１、２、又は３から選択される整数であり、Ｒ’及びＲ”が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、好ましくは、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$を表し、好ましくは、少なくともＲ’又はＲ”が、－Ｈを表さず、好ましくは、Ｒ’又はＲ”のいずれも－Ｈを表さず、好ましくは、以下のもの

【表３】

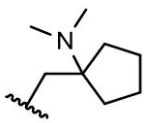


からなる群から選択される残基、又は
飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【表４】

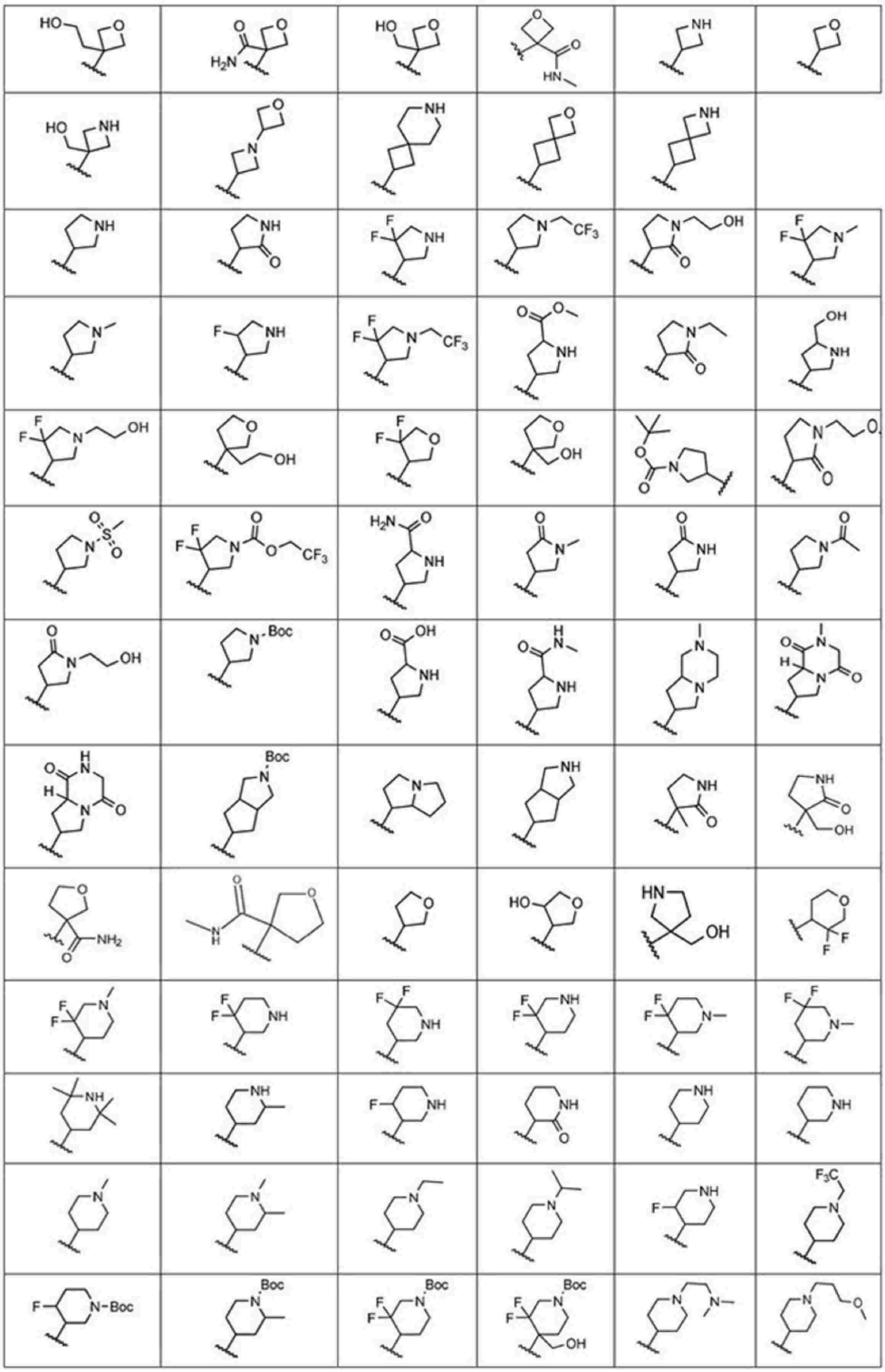


からなる群から選択されるシクロアルキル残基、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキルであって、当該３～１２員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルであって、当該３～１０員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキルであって、当該３～８員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～８員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキルであって、当該３～１２員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルであって、当該３～１０員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキルであって、当該３～８員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～８員シクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：
【化５】

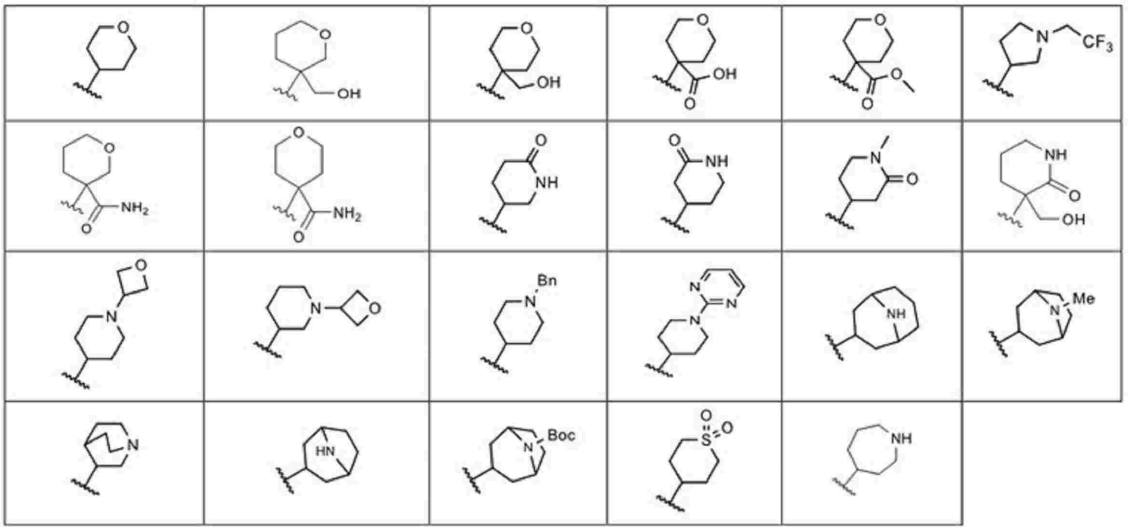


からなる群から選択される残基、又は
飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【表５－１】

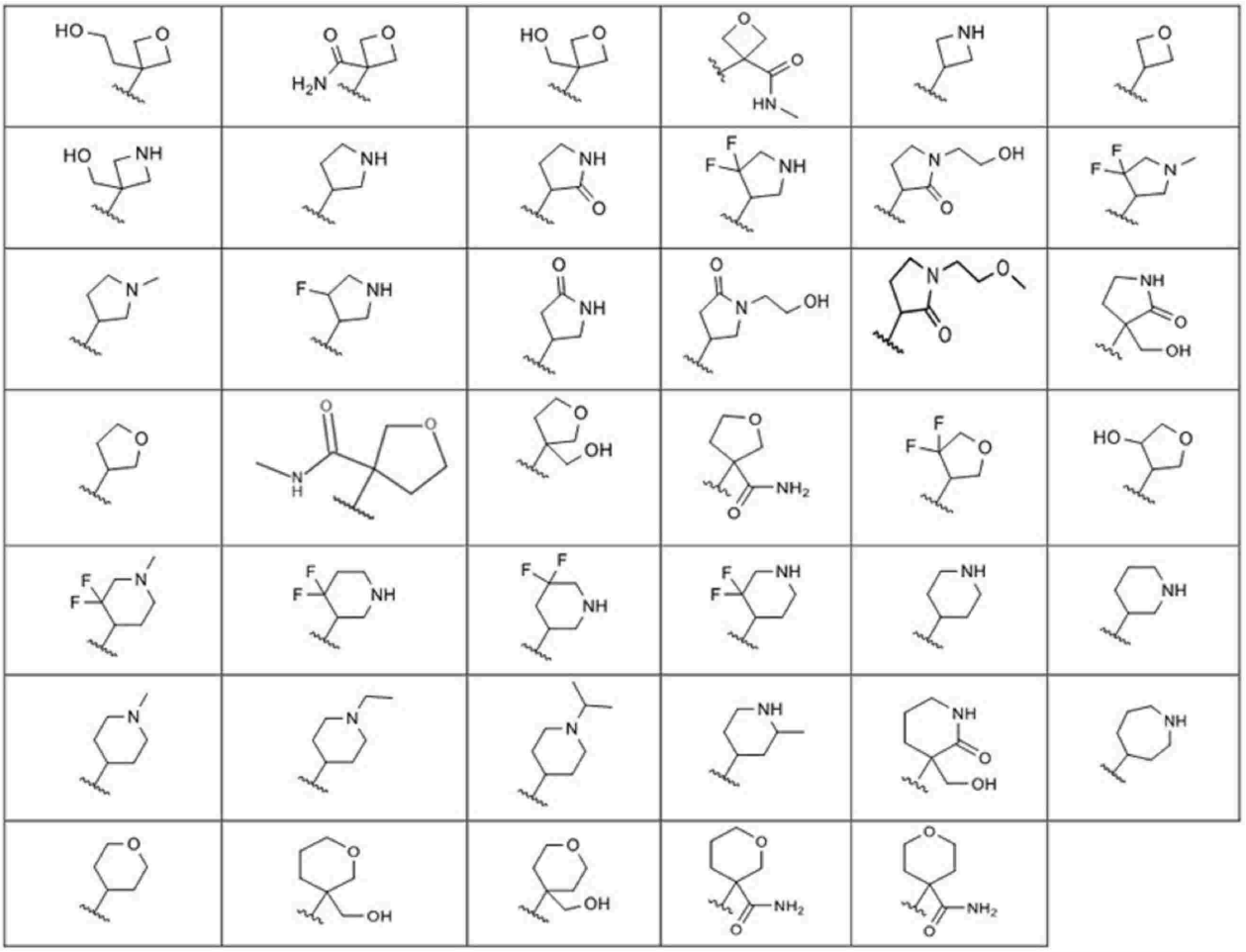


【表５－２】



からなる群から選択される、より好ましくは、以下のもの：

【表６】

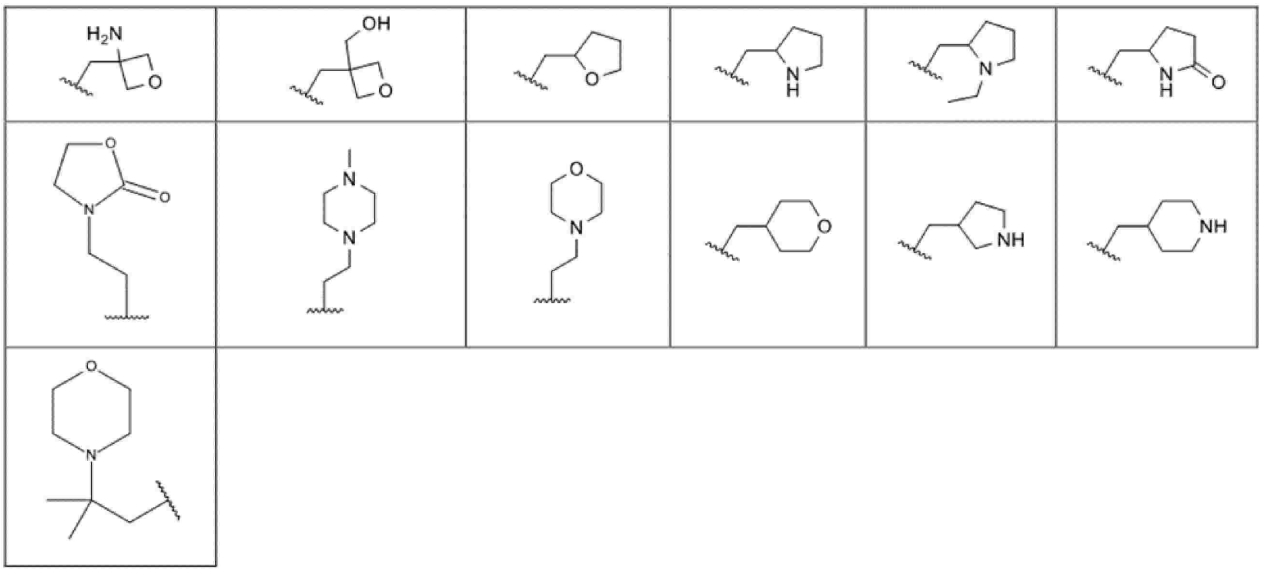


、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１２員ヘテロシクロアル

キルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１０員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～８員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～８員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【表７】

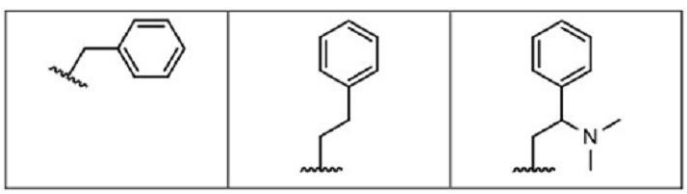


からなる群から選択される残基、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～８員アリール、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリールであって、当該６～１２員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該６～１０員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、６～１０員アリールを表し、好ましくは、以下のもの：

【表８】

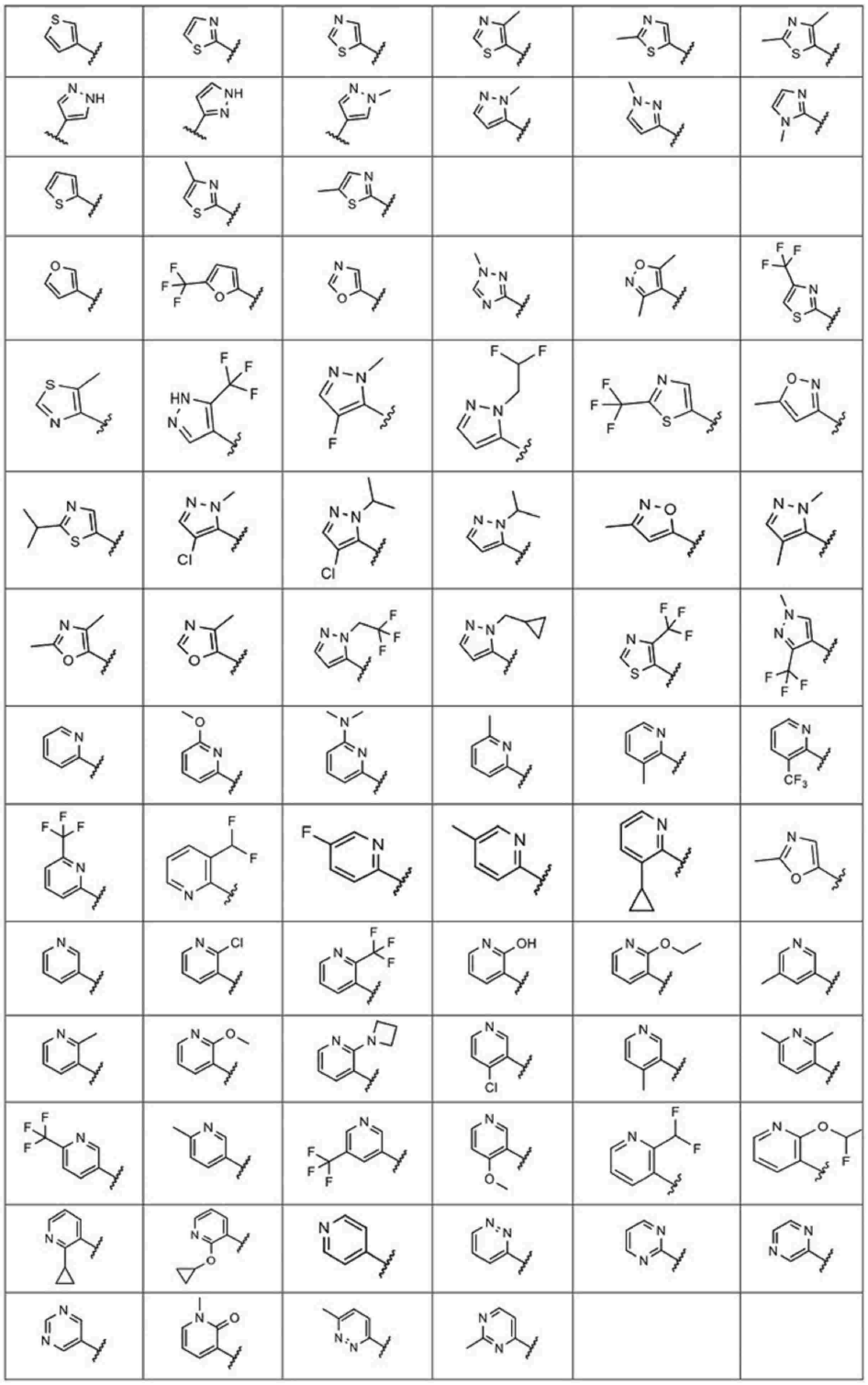


からなる群から選択される残基、又は

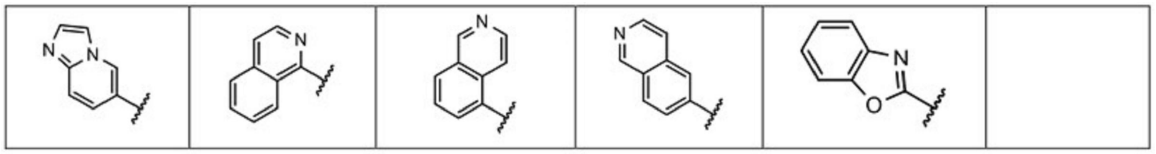
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若し

くは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下のもの：

【表９－１】

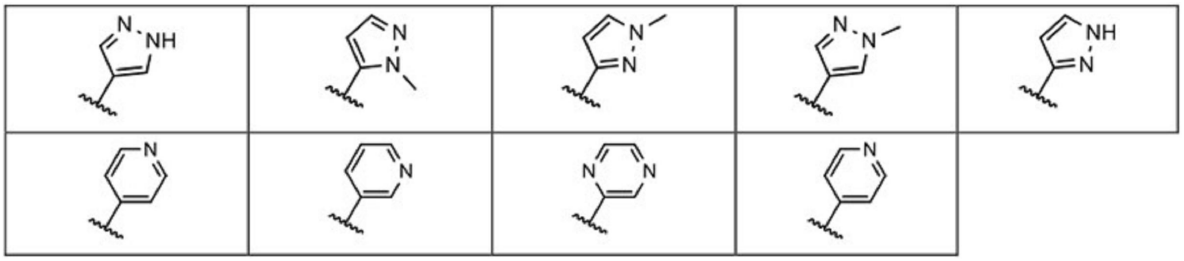


【表９－２】



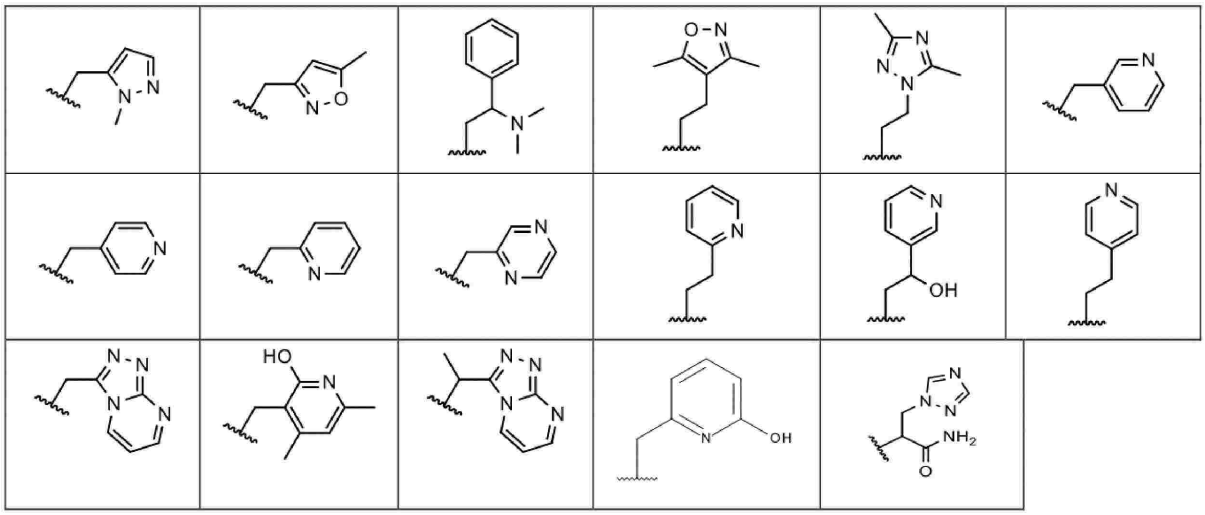
からなる群から選択される残基を表し、より好ましくは、以下のもの：

【表１０】



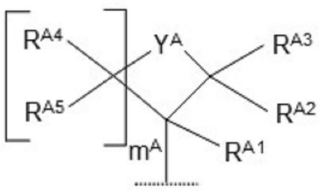
からなる群から選択される残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリールであって、当該５～１２員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、５～１２員ヘテロアリール、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリールであって、当該５～１０員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、５～１０員ヘテロアリール、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該５～８員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、５～８員ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択される残基を表す：

【表１１】



【００８６】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ａ）による残基を表し、

【化６】



（Ａ）

式中、
m^Aが、０又は１であり、
Y^Aが、－Ｏ－、－ＮＲ^{A6}－、及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、
Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A6}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－ＮＨ（C_{1-3}－アルキル）、－C_{1-3}－アルキレン－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、－C_{1-3}－アルキレン－ＮＨ（C_{1-3}－アルキレン－CF_3）、－C_{1-3}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-4}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-3}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、又は－３－オキセタニルを表すか、又はＲ^{A7}及びＲ^{A8}は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、環を形成し、－CH_2OCH_2－、－$CH_2OCH_2CH_2$－又は－$CH_2CH_2OCH_2CH_2$－、－CH_2NHCH_2－、－$CH_2NHCH_2CH_2$－又は－$CH_2CH_2NHCH_2CH_2$－を表す。

【００８７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、先に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、
m^Aが、０又は１であり、
Y^Aが、－Ｏ－及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、
Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}は、互いに独立して、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、又は－Ｃ（＝Ｏ）NH_2を表し、好ましくは、Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

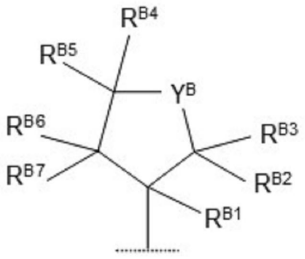
【００８８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、先に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、
m^Aが、０又は１であり、
Y^Aが、－Ｏ－及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、
Ｒ^{A1}が、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、又は－Ｃ（＝Ｏ）NH_2を表し、
Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}が、－Ｈを表す。

【００８９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ｂ）による残基を表し、

【化７】



（Ｂ）

式中、
Y^Bが、－Ｏ－、－ＮＲ^{B8}－、及び－ＣＲ^{B9}Ｒ^{B10}－から選択され、
Ｒ^{B1}、Ｒ^{B2}、Ｒ^{B3}、Ｒ^{B4}、Ｒ^{B5}、Ｒ^{B6}、Ｒ^{B7}、Ｒ^{B8}、Ｒ^{B9}、及びＲ^{B10}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-3}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－Ｏ－C_{1-3}－アルキル、

－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＯ$_2$Ｈ、若しくは－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキルを表すか、又はＲ^{Ｂ2}及びＲ^{Ｂ3}が、一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｂ4}及びＲ^{Ｂ5}が、一緒になって、＝Ｏを表す。

【００９０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、先に定義される一般式（Ｂ）による残基を表し、

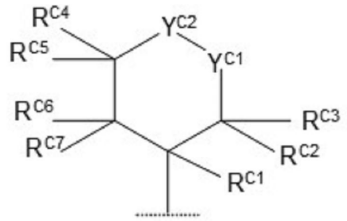
Ｙ^{Ｂ}が、－Ｏ－及び－ＮＲ^{Ｂ8}－から選択され、

Ｒ^{Ｂ1}、Ｒ^{Ｂ2}、Ｒ^{Ｂ3}、Ｒ^{Ｂ4}、Ｒ^{Ｂ5}、Ｒ^{Ｂ6}、Ｒ^{Ｂ7}、Ｒ^{Ｂ8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$を表すか、又はＲ^{Ｂ2}及びＲ^{Ｂ3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｂ4}及びＲ^{Ｂ5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、好ましくは、Ｒ^{Ａ1}、Ｒ^{Ａ2}、Ｒ^{Ａ3}、Ｒ^{Ａ4}、Ｒ^{Ａ5}、Ｒ^{Ａ7}、及びＲ^{Ａ8}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とし、好ましくは、Ｒ^{Ａ1}、Ｒ^{Ａ2}、Ｒ^{Ａ3}、Ｒ^{Ａ4}、Ｒ^{Ａ5}、Ｒ^{Ａ7}、及びＲ^{Ａ8}のうちの少なくとも１つが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【００９１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ｃ）による残基を表し、

【化８】



（Ｃ）

式中、

Ｙ^{Ｃ1}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、－ＮＲ^{Ｃ8}－、及び－ＣＲ^{Ｃ9}Ｒ^{Ｃ10}－から選択されるか、又はＹ^{Ｃ2}が、－ＣＲ^{Ｃ11}Ｒ^{Ｃ12}－を表すか、又はＹ^{Ｃ1}が、－ＣＲ^{Ｃ9}Ｒ^{Ｃ10}－を表し、Ｙ^{Ｃ2}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、及び－ＮＲ^{Ｃ8}－から選択され、

Ｒ^{Ｃ1}、Ｒ^{Ｃ2}、Ｒ^{Ｃ3}、Ｒ^{Ｃ4}、Ｒ^{Ｃ5}、Ｒ^{Ｃ6}、Ｒ^{Ｃ7}、Ｒ^{Ｃ8}、Ｒ^{Ｃ9}、Ｒ^{Ｃ10}、Ｒ^{Ｃ11}、及びＲ^{Ｃ12}が、互いに独立して、

－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-3}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ－（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$を表すか、又はＲ^{Ｃ2}及びＲ^{Ｃ3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｃ4}及びＲ^{Ｃ5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｃ9}及びＲ^{Ｃ10}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｃ11}及びＲ^{Ｃ12}が一緒になって、＝Ｏを表す。

【００９２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、先に定義される一般式（Ｃ）による残基を表し、

Ｙ^{Ｃ1}が、－Ｏ－若しくは－ＮＲ^{Ｃ8}－から選択され、Ｙ^{Ｃ2}が、－ＣＲ^{Ｃ11}Ｒ^{Ｃ12}－を表すか、又はＹ^{Ｃ1}が、－ＣＲ^{Ｃ9}Ｒ^{Ｃ10}－を表し、Ｙ^{Ｃ2}が、－Ｏ－及び－ＮＲ^{Ｃ8}－から選択され、

Ｒ^{Ｃ1}、Ｒ^{Ｃ2}、Ｒ^{Ｃ3}、Ｒ^{Ｃ4}、Ｒ^{Ｃ5}、Ｒ^{Ｃ6}、Ｒ^{Ｃ7}、Ｒ^{Ｃ8}、Ｒ^{Ｃ9}、Ｒ^{Ｃ10}、Ｒ^{Ｃ11}、及びＲ^{Ｃ12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$を表すか、好ましくは、Ｒ^{Ｃ1}、

R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}、及びR^{C12}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とし、好ましくは、R^{C1}、R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}、及びR^{C12}のうちの少なくとも１つが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

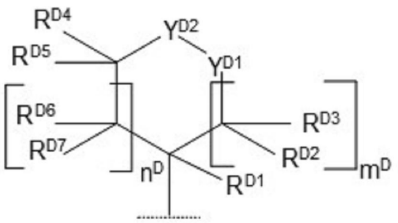
【００９３】

いくつかの実施形態において、R^4は、

（ｉ）残基－ＣＲ’Ｒ”－（CH_2）$_m$－ＯＨであって、式中、ｍが、１～６の整数であり、好ましくは１～３の整数であり、Ｒ’及びＲ”が、互いに独立して、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－Ｏ－C_{1-3}－アルキル、又は－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨを表し、好ましくは、－Ｈ、－CH_3、又は－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨを表す、残基－ＣＲ’Ｒ”－（CH_2）$_m$－ＯＨを表す。好ましい実施形態において、少なくともＲ’又はＲ”は、－Ｈを表さない。好ましい実施形態において、Ｒ’又はＲ”のいずれも、－Ｈを表さず、又は

（ｉｉ）一般式（Ｄ）による残基、

【化９】



（Ｄ）

式中、

m^D及びn^Dが、互いに独立して、０、１、２、又は３であるが、好ましくは、$m^D+n^D \leqq 3$であることを条件とし、

Y^{D1}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、－NR^{D8}－、及び－$CR^{D9}R^{D10}$－から選択され、Y^{D2}が、－$CR^{D11}R^{D12}$－を表すか、又はY^{D1}が、－$CR^{D9}R^{D10}$－を表し、Y^{D2}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、及び－NR^{D8}－から選択され、

R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}、及びR^{D12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-3}－アルキル、－NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－NH_2、－ＮＨ（C_{1-3}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、－ＮＨ（C_{1-3}－アルキレン－CF_3）、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＣＨ$_3$、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3を表すか、又はR^{D2}及びR^{D3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D4}及びR^{D5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D9}及びR^{D10}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D11}及びR^{D12}が一緒になって、＝Ｏを表し、

好ましくは、

m^D及びn^Dが、互いに独立して、０、１、２、又は３であるが、好ましくは、$m^D+n^D \leqq 3$であることを条件とし、

Y^{D1}が、－Ｏ－、－NR^{D8}－、及び－$CR^{D9}R^{D10}$－から選択され、Y^{D2}が、－$CR^{D11}R^{D12}$－を表すか、又はY^{D1}が、－$CR^{D9}R^{D10}$－を表し、Y^{D2}が、－Ｏ－及び－NR^{D8}－から選択され、

R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}、及びR^{D12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレ

ン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－ＣＨ$_2$ＮＨ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－ＮＨＣＨ$_2$ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、若しくは－ＣＨ$_2$ＣＦ$_3$を表すか、又はＲ^{Ｄ２}及びＲ^{Ｄ３}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｄ４}及びＲ^{Ｄ５}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｄ９}及びＲ^{Ｄ１０}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｄ１１}及びＲ^{Ｄ１２}が一緒になって、＝Ｏを表し、好ましくは、Ｒ^{Ｄ１}、Ｒ^{Ｄ２}、Ｒ^{Ｄ３}、Ｒ^{Ｄ４}、Ｒ^{Ｄ５}、Ｒ^{Ｄ６}、Ｒ^{Ｄ７}、Ｒ^{Ｄ８}、Ｒ^{Ｄ９}、Ｒ^{Ｄ１０}、Ｒ^{Ｄ１１}、及びＲ^{Ｄ１２}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とし、好ましくは、Ｒ^{Ｄ１}、Ｒ^{Ｄ２}、Ｒ^{Ｄ３}、Ｒ^{Ｄ４}、Ｒ^{Ｄ５}、Ｒ^{Ｄ６}、Ｒ^{Ｄ７}、Ｒ^{Ｄ８}、Ｒ^{Ｄ９}、Ｒ^{Ｄ１０}、Ｒ^{Ｄ１１}、及びＲ^{Ｄ１２}のうちの少なくとも１つが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

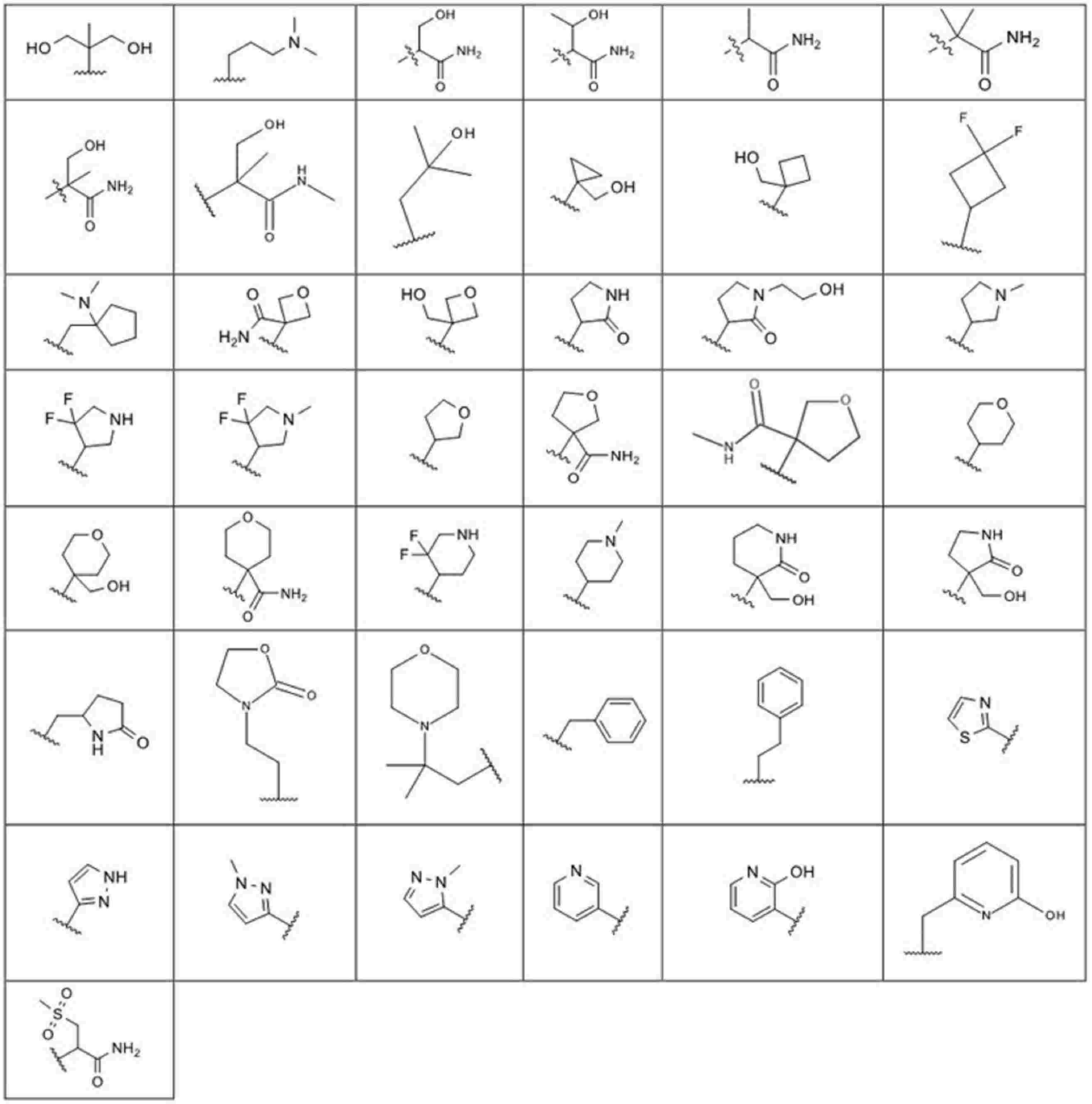
【００９４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ａ）、（Ｂ）、（Ｃ）、（Ｄ）による残基、又は本明細書に記載の式－ＣＲ’Ｒ”－（ＣＨ$_2$）$_m$－ＯＨの残基を表す。

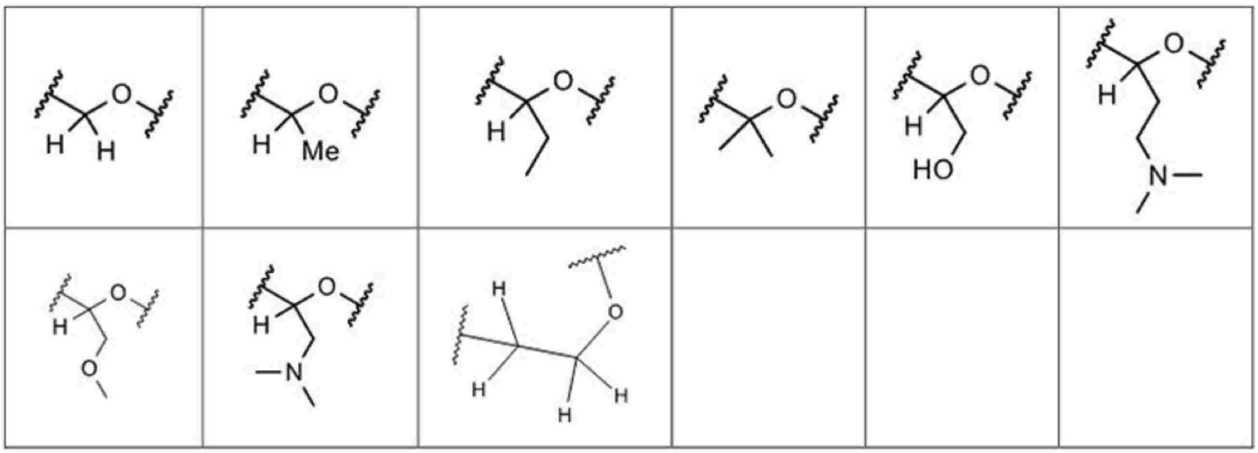
【００９５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、以下のものからなる群から選択される残基を表す：－ＣＨ$_3$、

【表１２】



【００９６】
いくつかの実施形態において、R^3は、Ｈであり、R^4は、本明細書で先に記載の実施形態のいずれかである。
【００９７】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$は、互いに独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す。
【００９８】
好ましくは、R^5及び$R^{5'}$は、互いに独立して、－Ｈ、－C_1－C_6－アルキル、又は－C_1－C_6－アルキレン－Ｎ（C_1－C_6－アルキル）$_2$を示す。
【００９９】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$のうちの少なくとも１つは、－Ｈではない。
【０１００】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$は、両方とも－Ｈである。
【０１０１】
好ましい実施形態において、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－（$CR^5R^{5'})_n$を表し、得られる部分－Ｏ－（$CR^5R^{5'})_n$－は、以下からのものなる群から選択される残基を表す：
【表１３】



【０１０２】
いくつかの実施形態において、R^5は、－Ｈを表し、$R^{5'}$は、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、及び－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｈ又はC_{1-3}－アルキルからなる群から選択される残基を表

す。
【０１０３】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－ヘテロアルキル、を表す。
【０１０４】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－C_{1-6}－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリール

からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－

アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す。

【０１０５】

好ましくは、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は、互いに独立して、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、

－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、

－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、及び－Ｃ（＝Ｏ）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－C_{1-6}－ヘテロアルキル、を表す。

【０１０６】

いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、及び－CFH_2、好ましくは－Ｈ又は－Ｆからなる群から選択される残基を表す。

【０１０７】

いくつかの実施形態において、R^6は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表す。

【０１０８】

いくつかの実施形態において、R^6は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－CH_3、好ましくは、－Ｈ、－Ｆ、－ＣＮ、又は－CH_3からなる群から選択される残基を表す。

【０１０９】

いくつかの実施形態において、R^6は、－Ｈを表さない。

【０１１０】

いくつかの実施形態において、R^7は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表す。

【０１１１】

いくつかの実施形態において、R^7は、－Ｈを表さない。

【０１１２】

いくつかの実施形態において、R^7は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－CH_3、好ましくは、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、又は－CH_3からなる群から選択される残基を表す。

【０１１３】

いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、－Ｈ、又は以下のものからなる群から選択される残基を表す：

【表１４】



【０１１４】

いくつかの実施形態において、R^8は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表す。

【０１１５】

いくつかの実施形態において、R^8は、－Ｈを表さない。

【０１１６】

いくつかの実施形態において、R^8は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又はCH_3、好ましくは、－Ｆからなる群から選択される残基を表す。

【０１１７】

いくつかの実施形態において、

（ｉ）R^6、R^7、及びR^8は各々、－Ｈを表すか、又は

（ｉｉ）R^6、R^7、及びR^8のうちの２つは、－Ｈを表し、R^6、R^7、及びR^8のうちの他方は、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－CH_3を表すか、又は

（ｉｉｉ）R^6、R^7、及びR^8のうちの１つは、－Ｈを表し、R^6、R^7、及びR^8のうちの他方は、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－CH_3を表す。

【０１１８】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換であり、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであり、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～６員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換

の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、
－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルであって、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは二置換である、－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、を表す。

【０１１９】

いくつかの実施形態において、Ｗは、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換、一置換若しくは多置換の３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員飽和シクロアルキル、５～６員シクロアルケニルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換、一置換若しくは多置換の３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員飽和シクロアルキル、５～６員シクロアルケニル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若し

くは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、

－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルであって、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは二置換である、－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、を表す。

【０１２０】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、

一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、

各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－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、を表し、

置換基は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される。

【０１２１】

いくつかの実施形態において、Ｗは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルを表し、好ましくは、Ｗは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換若しくは二置換の５～１２員ヘテロアリール、又は各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルを表し、好ましくは、Ｗは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは二置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和、一置換若しくは二置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換又は二置換の５～１２員ヘテロアリール、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル及びｔ－ブチル、ペンチル、ヘキシル－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－ＣＣｌ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＣｌ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す。

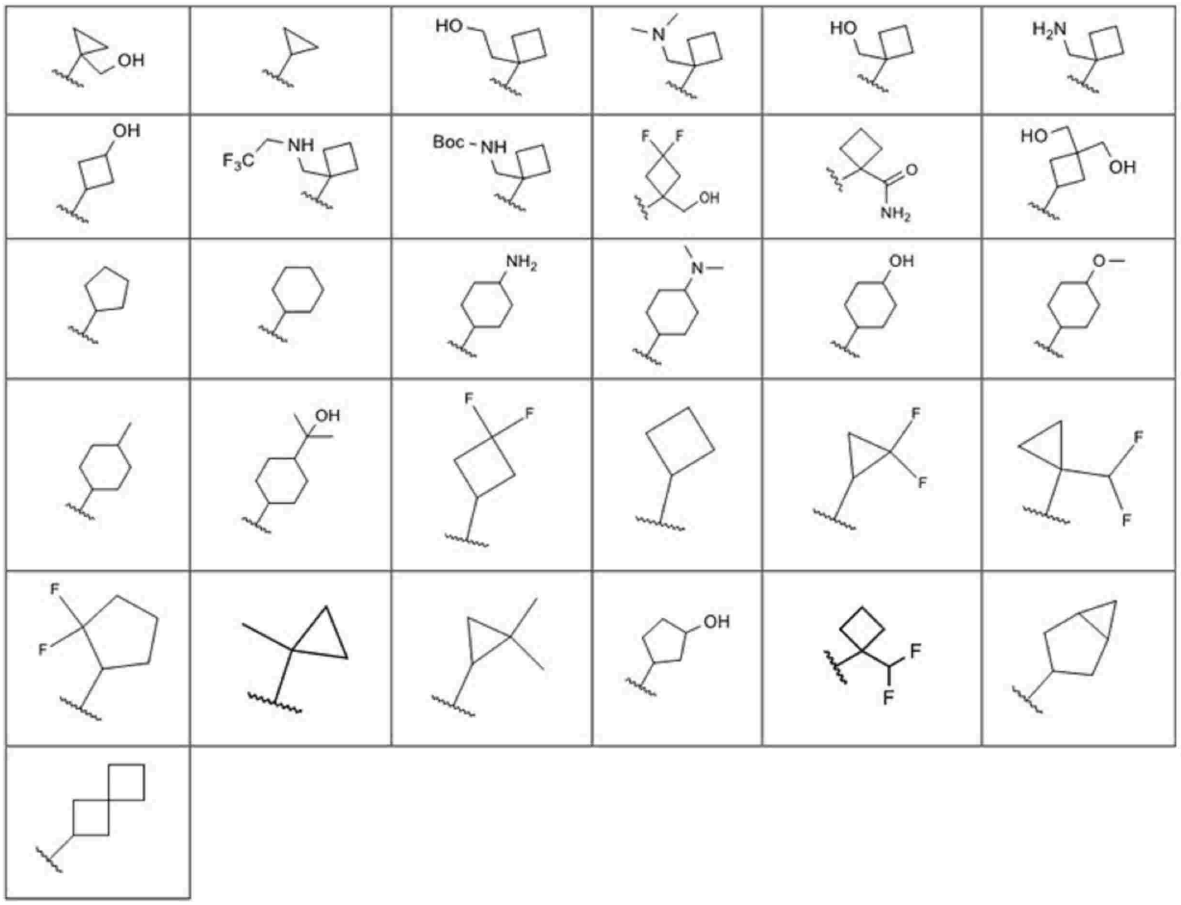
【０１２２】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、以下

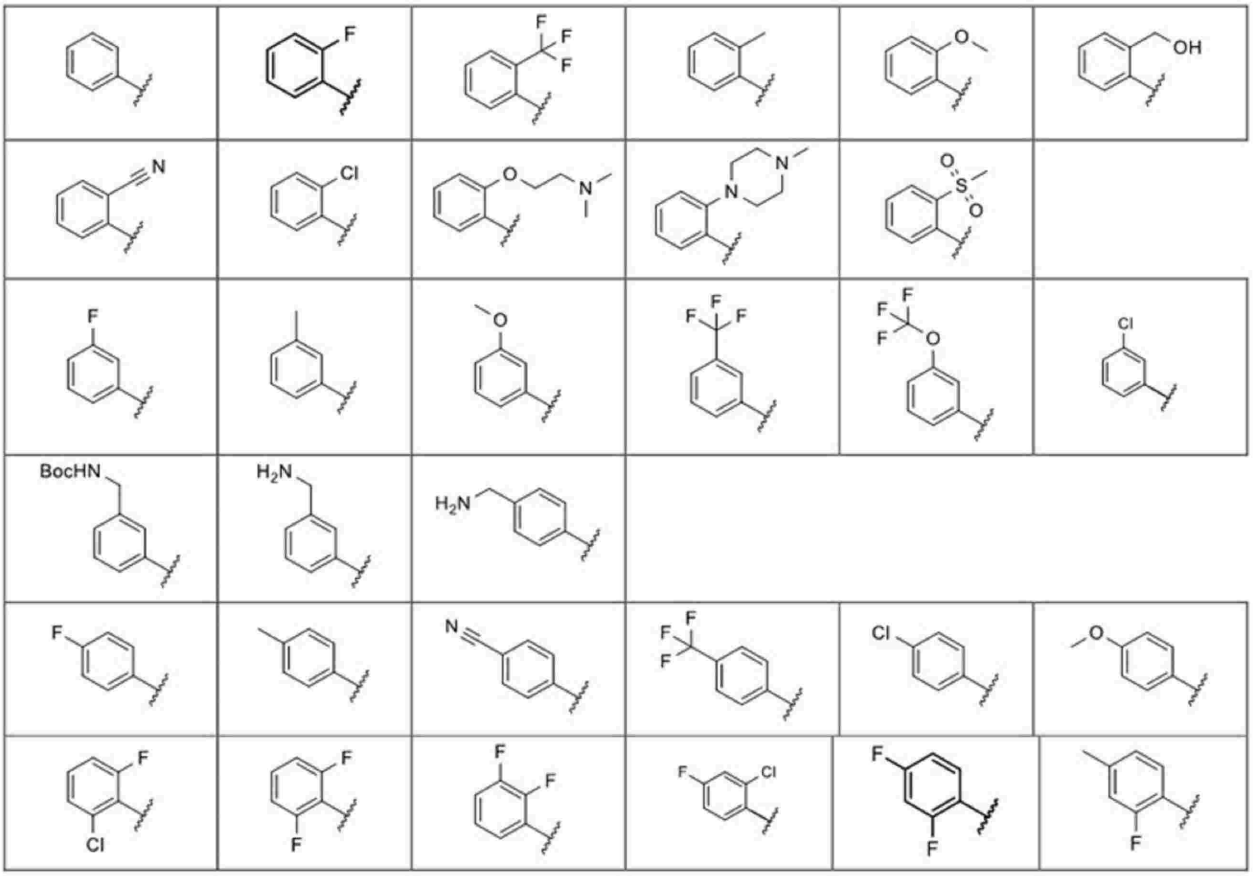
のものからなる群から選択されるシクロアルキル残基：

【表１５】



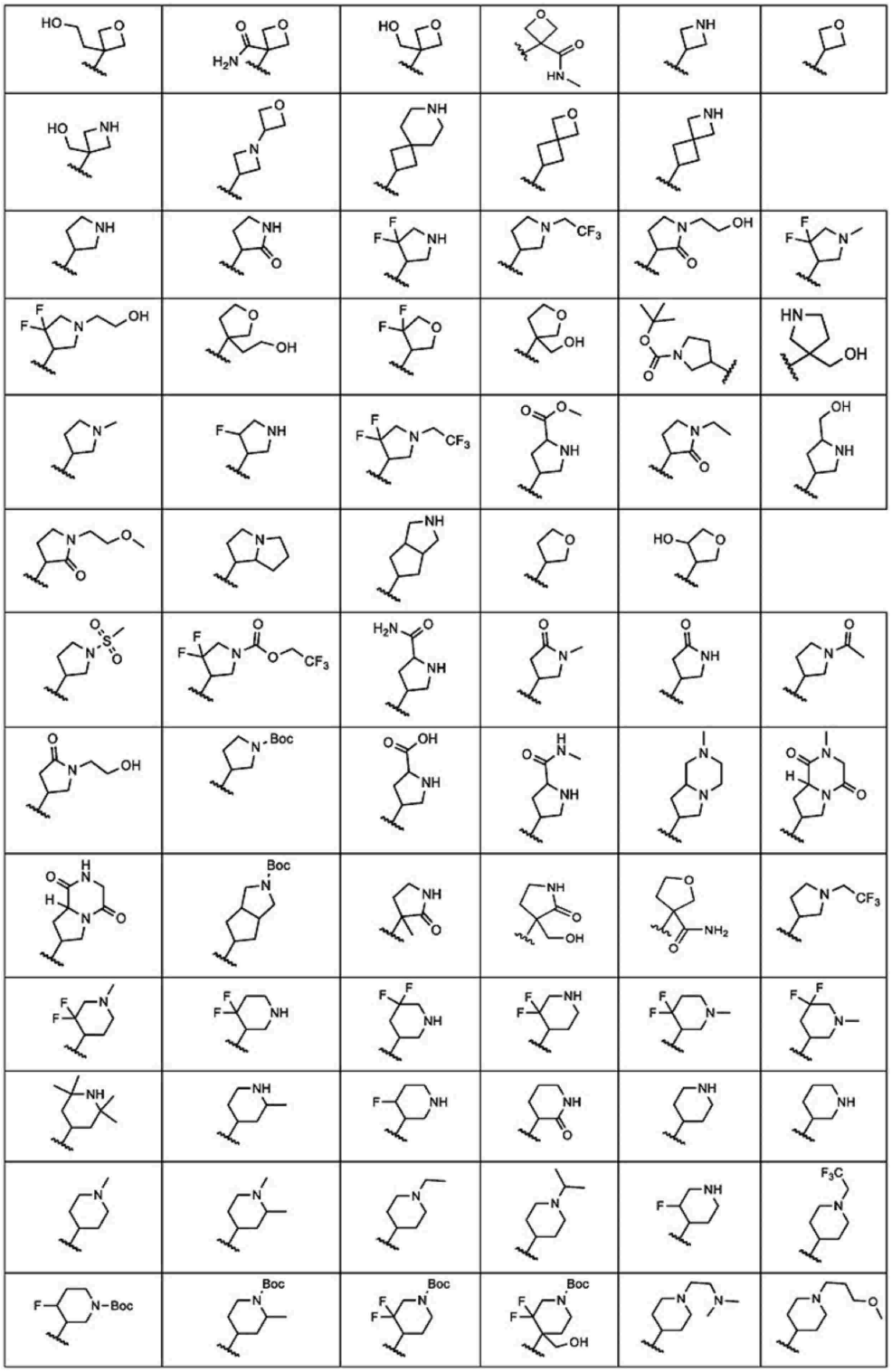
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～８員アリールを表し、好ましくは、以下のもの：

【表１６】

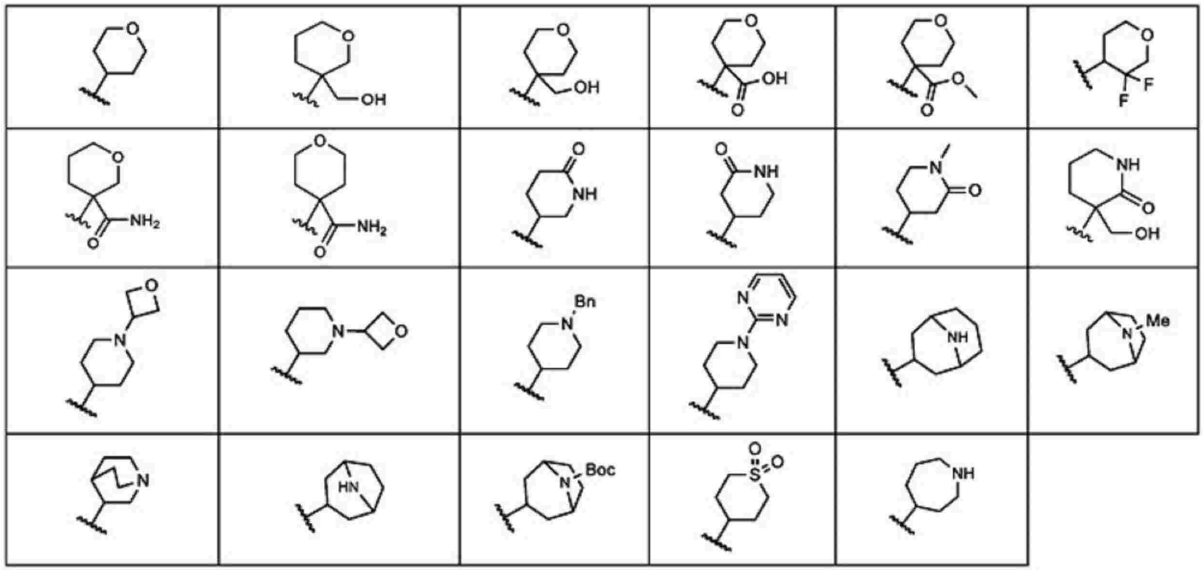


からなる群から選択されるフェニル残基、又は
飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【表１７－１】

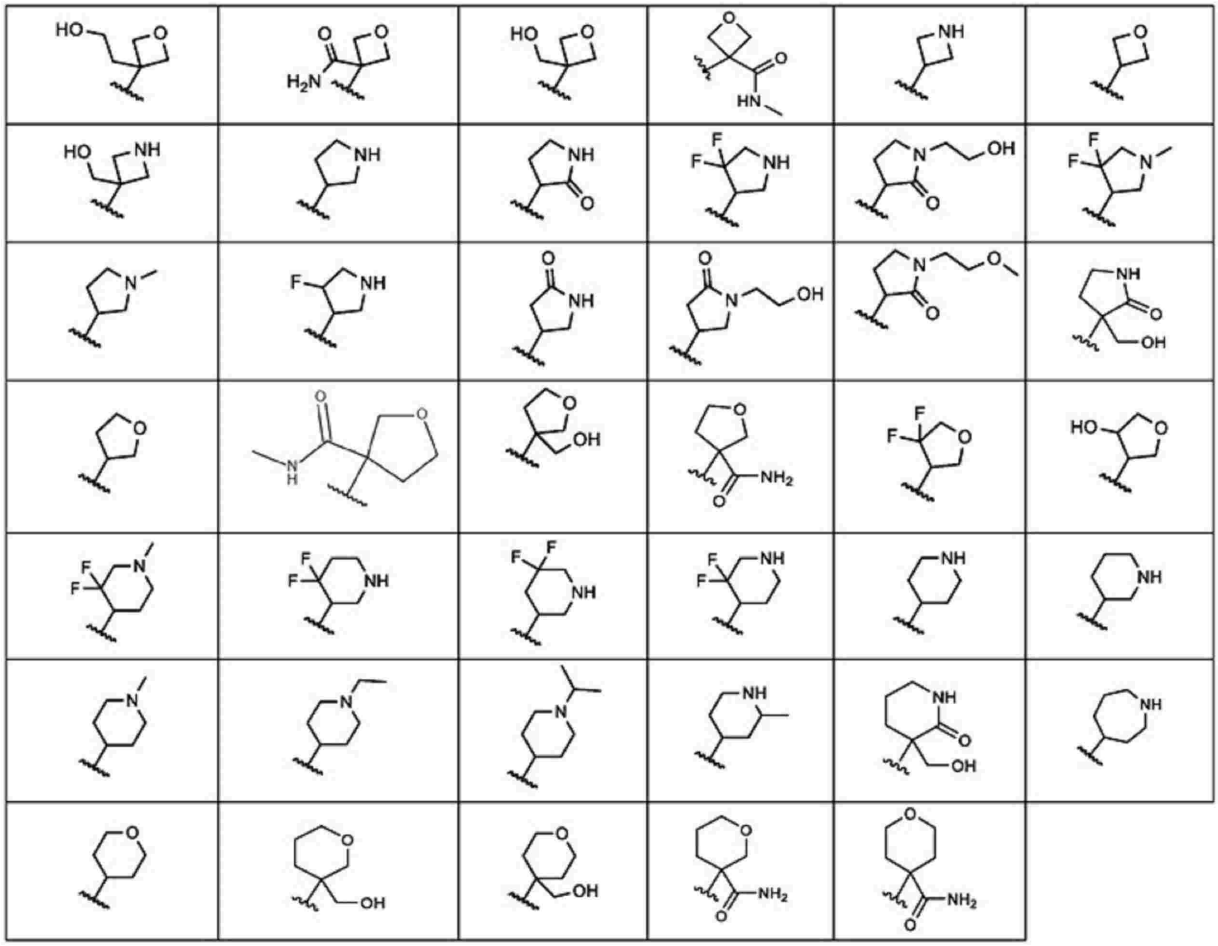


【表１７－２】



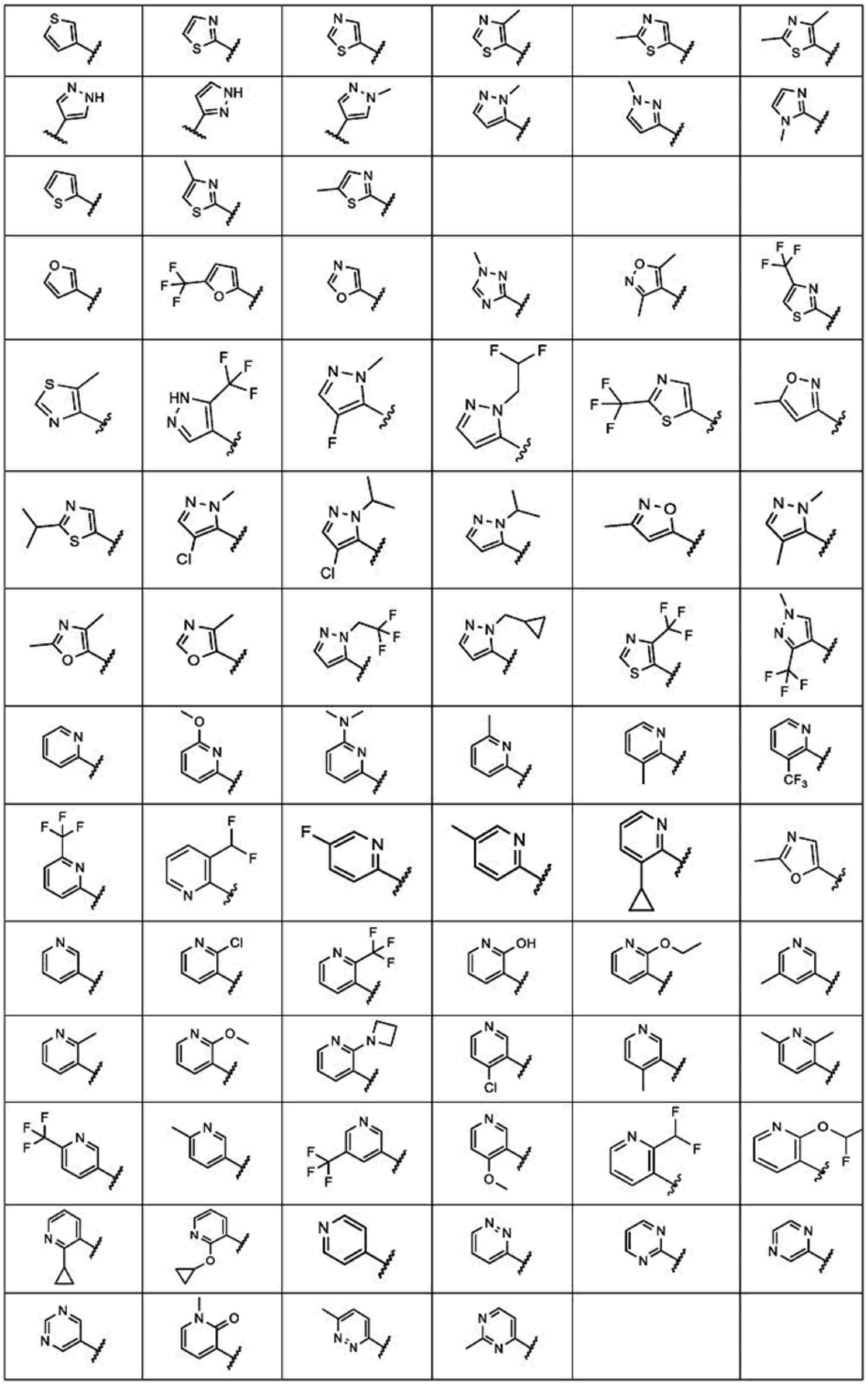
からなる群から選択される、より好ましくは、以下のもの：

【表１８】

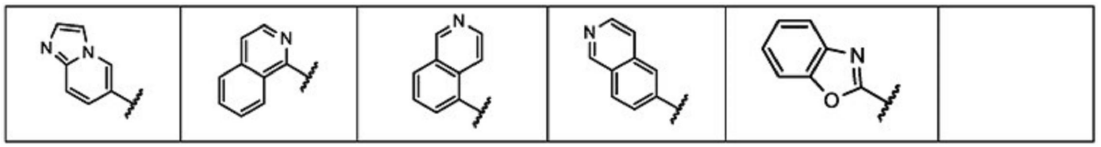


からなる群から選択されるヘテロシクロアルキル残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリールを表し、より好ましくは、以下のもの：

【表１９－１】

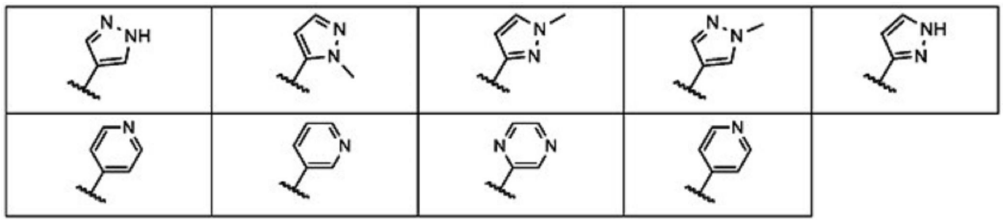


【表１９－２】



からなる群から選択される残基を表し、より好ましくは、以下のもの：

【表２０】



からなる群から選択される残基、又は
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－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、を表す。

【０１２３】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、ノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、非置換、一置換若しくは多置換のベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、チオフェン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インドール、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソオキサゾール、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キノリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のフラン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、トリアゾール、ピリジン、イソキノリン、ベンゾチアゾール、ピリダジン、ピリミジン、イミダゾピリジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のフラン－２－イル、フラン－３－イル、チオフェン－２－イル、チオフェン－３－イル、ピラゾール－５－イル、オキサゾール－５－イル、イソオキサゾール

－４－イル、チアゾール－２－イル、チアゾール－５－イル、１，２，４－トリアゾール－３－イル、１，２，３－トリアゾール－４－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、イソキノリン－１－イル、イソキノリン－５－イル、ベンゾ［ｄ］チアゾール－２－イル、ピリダジン－３－イル、ピリミジン－５－イルイル、及びイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イルから選択される。

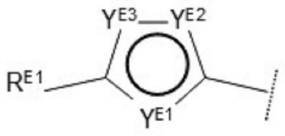
【０１２４】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルは、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のアゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼパン、アゼチジン、アジリジン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、チアゾリジン、チオラン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼパン、アゼチジン、アジリジン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、チアゾリ、ジン、チオラン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼチジン、ジオキサン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－２－イル、テトラヒドロフラン－１－イル、テトラヒドロフラン－２－イル、テトラヒドロピラン－１－イル、テトラヒドロピラン－２－イル、テトラヒドロピラン－３－イル、テトラヒドロピラン－４－イル、チアゾリジン、チオラン、及びインドリンから選択される。

【０１２５】

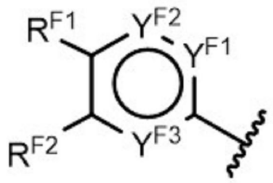
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｅ）による残基を表す：

【化１０】



（E）

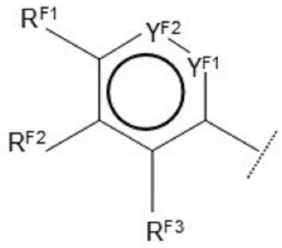
式中、
Y^{E1}は、－Ｎ＝、－NR^{E2}－、Ｓ、Ｏ、又は－CR^{E3}＝を表し、Y^{E2}は、－Ｎ＝、－NR^{E3}－、Ｓ、Ｏ、又は－CR^{E4}＝を表し、Y^{E3}は、－Ｎ＝、－NR^{E4}－、Ｓ、Ｏ、又は－CR^{E5}＝を表すが、Y^{E1}、Y^{E2}、及びY^{E3}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－CR^{E3}＝、－CR^{E4}＝、及び－CR^{E5}＝ではないことを条件とする。
別の好ましい実施形態において、Ｗは、一般式（Ｅ）による残基を表し、
式中、ＹＥ１は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ２－、Ｓ、又は－ＣＲＥ３＝を表し、ＹＥ２は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ３－、Ｓ、又は－ＣＲＥ４＝を表し、ＹＥ３は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ４－、Ｓ、又は－ＣＲＥ５＝を表すが、ＹＥ１、ＹＥ２、及びＹＥ３のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲＥ３＝、－ＣＲＥ４＝、及び－ＣＲＥ５＝ではないことを条件とする。
R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CH_2－シクロプロピル、－CH_2CF_3、－CH_2CHF_2、又は－CF_3を表し、より具体的には、R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、又は－CF_3を表すが、好ましくは、R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。
【０１２６】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｆ’）による残基を表す：
【化１１】



（F’）

式中、
Y^{F1}は、－Ｎ＝又は－CR^{F4}＝を表し、Y^{F2}は、－Ｎ＝又は－CR^{F5}＝を表し、Y^{F3}は、－Ｎ＝又は－CR^{F3}＝を表すが、Y^{F1}及びY^{F2}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－CR^{F4}＝及び－CR^{F5}＝ではないことを条件として、
R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、又は－アゼチジニルを表すが、好ましくは、R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。
【０１２７】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｆ）による残基を表す：

【化１２】



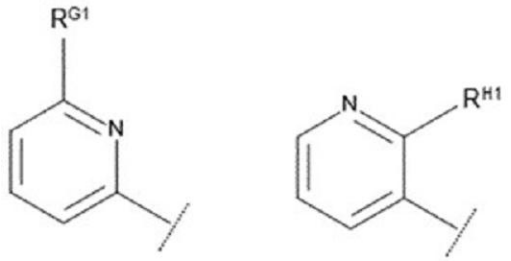
(F)

式中、
Y^{F1}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F4}＝を表し、Y^{F2}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F5}＝を表すが、Y^{F1}及びY^{F2}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲ^{F4}＝及び－ＣＲ^{F5}＝ではないことを条件として、
R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、又は－アゼチジニルを表すが、好ましくは、R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【０１２８】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｇ）又は（Ｈ）による残基を表す：

【化１３】



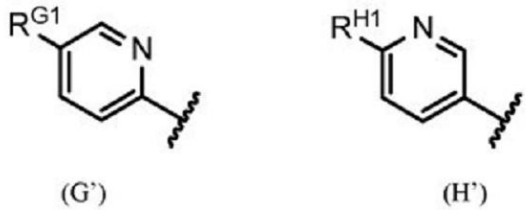
(G) (H)

式中、R^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、アゼチジニル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、及び－CHF_2からなる群から選択されるか、又はR^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、及びアゼチジニルからなる群から選択される。

【０１２９】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｇ’）又は（Ｈ’）による残基を表す：

【化１４】



(G') (H')

式中、R^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2

CH_3、－Ｃｌ、アゼチジニル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、及び－CHF_2からなる群から選択されるか、又はR^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、及びアゼチジニルからなる群から選択される。

【０１３０】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、本明細書で先に定義される一般式（Ｅ）、（Ｆ）、（Ｆ’）、（Ｇ）、（Ｈ）、（Ｇ’）、又は（Ｈ’）による残基を表す。

【０１３１】

いくつかの実施形態において、「一置換若しくは多置換」という用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-6}－アルキレン－CFH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－OCF_3、－OCF_2H、－$OCFH_2$、－OCF_2Cl、－$OCFCl_2$、－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－NH_2、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－NH_2、－ＮＯ、－NO_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2

、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－

Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ２、－ＮＯ、－ＮＯ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ５、－ＳＣＦ３、－ＳＣＦ２Ｈ、－ＳＣＦＨ２、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ１－６－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、

－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アル

キレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基

で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１０員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員シクロアルキル）、３～１０員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－フェニル、５～１０員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（５～１０員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する。

【０１３２】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員シクロアルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、及び－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、及び－ＯＣＨ$_3$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１３３】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の６～１４員アリールは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、及び－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、及び－ＯＣＨ$_3$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１３４】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、及び－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_3$、及び－ＯＣＨ$_3$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換

である。
【０１３５】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、及び－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ$_{3}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{3}$、及び－ＯＣＨ$_{3}$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。
【０１３６】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、及び－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ$_{3}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{3}$、及び－ＯＣＨ$_{3}$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。
【０１３７】
本発明のいくつかの実施形態において、化合物は、以下のものからなる群から選択される：
化合物００１－（２Ｒ）－２－｛［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物００２－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００３－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００４－（２Ｒ）－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物００５－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００６－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００７－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００８－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物００９－（２Ｓ）－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０１０－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１１－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１２－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパン

アミド、
化合物０１３－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０１４－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０１５－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－４－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１６－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１７－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１８－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０１９－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０２０－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキソラン－３－カルボキサミド、
化合物０２１－４－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０２２－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２３－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２５－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２６－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０２７－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０２８－Ｎ－［（３Ｒ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０２９－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０３０－Ｎ－［（３Ｓ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メト

キシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３１－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０３２－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３３－４－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０３４－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３５－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３６－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３７－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０３８－３－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０３９－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４０－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４１－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４３－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４４－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４５－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４６－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４７－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４８－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メト

キシ］－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０４９－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物０５０－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５１－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５２－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５３－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０５４－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５５－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［（３Ｒ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０５６－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０５７－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０５８－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０５９－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［（３Ｓ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０６０－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［（３Ｓ）－２－オキソピロリジン－３－イル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０６１－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６２－２－｛［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６３－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６４－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６５－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０６６－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物０６７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキサン－

４－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６８－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキセタン－３－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０６９－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７０－４－｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０７１－４－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボキサミド、
化合物０７２－４－｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキサン－４－カルボン酸、
化合物０７３－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７４－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７５－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７６－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７７－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７８－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０７９－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８０－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８１－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８２－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８３－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８５－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８６－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０８７－３－｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、

化合物０８８－３－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキセタン－３－カルボキサミド、
化合物０８９－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９０－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９１－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９２－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９３－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９４－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９５－Ｅｎ１－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９５－Ｅｎ２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９６－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９７－２－メチル－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９８－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物０９９－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１００－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０１－Ｎ－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０２－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０３－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０５－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０６－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、

化合物１０７－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１０８－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１０９－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１１０－エチル５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレート、
化合物１１１－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１２－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１３－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１４－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロペンチル］メチル｝－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１５－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１６－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１７－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１８－Ｎ－［２－（ジメチルアミノ）エチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１１９－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２０－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２１－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２２－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２３－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２４－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２５－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２６－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボ

キサミド、
化合物１２７－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２８－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１２９－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３０－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３１－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３２－３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１３３－Ｎ－メチル－３－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－アミド｝オキソラン－３－カルボキサミド、
化合物１３４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ，２－ジメチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３５－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３６－Ｎ，２－ジメチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３７－Ｎ，２－ジメチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１３８－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１３９－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミ、
化合物１４０－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１４１－２－（｛５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド、
化合物１４２－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４３－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－５－［（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４５－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロシクロブチル）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４６－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４７－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－（オキソラン－３－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、

化合物１４８－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１４９－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１５０－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸、
化合物１５１－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
化合物１５２－５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド、
及びそれらの生理学的に許容される塩。

【０１３８】

本発明はまた、本発明の少なくとも１つの化合物を含む薬学的組成物を包含する。本発明はまた、本発明の少なくとも１つの化合物と、薬学的目的で許容される少なくとも１つの担体、賦形剤又は希釈剤と、を含む、薬学的組成物を包含する。

【０１３９】

いくつかの実施形態において、本発明は、疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛又はてんかん性脳症の予防及び／又は治療（のための組成物の調製）における、式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物、又はその任意のサブグループの使用に関する。

【０１４０】

いくつかの実施形態において、本発明は、代謝性疼痛の予防及び／又は治療の方法であって、疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択され、好ましくは術後疼痛である、方法に関する。

【０１４１】

好ましい置換基を含むＱ、Ｔ、Ｕ、Ｗ、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、$R^{5'}$、ｎ、R^6、R^7、R^8の全ての定義、好ましい実施形態、及び好ましい意味は、本発明による化合物にも同様に適用するが、これらは、必ずしも疼痛又はてんかんの治療に使用することに限定されない。したがって、本発明のこの態様は、本発明の化合物それ自体、本発明の化合物を含む組成物、本発明の化合物を含む医薬、並びに疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症などのＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／又は治療における使用のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するための本発明の化合物に関する。好ましくは、疼痛は、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される。より好ましくは、疼痛は、術後疼痛である。

【０１４２】

本発明のいくつかの実施形態において、化合物は、上述の化合物００１～化合物１５２と、それらの生理学的に許容される塩と、からなる群から選択される。

【０１４３】

本発明の別の態様は、上記の本発明による化合物を含む薬学的組成物又は医薬に関する。

【０１４４】

本発明の化合物は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニストであることが示されており、したがって、本発明は、化合物それ自体、医薬として使用するための、より具体的には、治療有効量の本発明の化合物を有する対象におけるＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療における医薬としての使用のための化合物を提供する。

【０１４５】

いくつかの実施形態において、本発明の化合物は、治療のために投与される唯一の薬理学的に活性な化合物である。本発明の別の実施形態において、本発明の化合物は、ＴＲＰＭ３媒介性障害の治療又は予防のために他の治療剤と組み合わせて使用され得る。したがって、本発明はまた、

－本明細書の式及び実施形態のうちの１つ以上の化合物、及び
－ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のために、同時、別個又は連続的使用のための複合調製物の形態で生物学的に活性な薬剤として使用される１つ以上の更なる治療剤又は予防剤、を含む組成物の使用に関する。

【０１４６】

本発明による薬学的組成物又は複合調製物は、企図される使用及び調製物の期待される効果に応じて、広い含有量範囲にわたって本発明の化合物を含有し得る。一般に、複合調製物の本発明の化合物の含有量は、０．１～９９．９重量％、好ましくは１～９９重量％、より好ましくは５～９５重量％の範囲内である。

【０１４７】

いくつかの活性成分が組み合わせて使用される場合、それらが治療される哺乳動物において必ずしも同時にそれらの関節治療効果を直接発揮するとは限らないという事実を考慮して、対応する組成物はまた、別個であるが、隣接する保管庫又は区画内の２つの成分を含有する医療キット又はパッケージの形態であり得る。したがって、後者の文脈では、各活性成分は、他の成分の投与経路とは異なる投与経路に好適な方法で製剤化され得、例えば、それらのうちの一方は、経口又は非経口製剤の形態であり得るのに対して、他方は、静脈内注射用のアンプル又はエアロゾルの形態であり得る。

【０１４８】

当業者はまた、本発明の化合物が、とりわけそれらの環境のｐＨに応じて、多くの異なるプロトン化状態で存在し得ることを認識するであろう。本明細書に提供される構造式は、いくつかの可能なプロトン化状態のうちの１つのみの化合物を示すが、これらの構造は、例示的なものであり、本発明は、任意の特定のプロトン化状態に限定されず、化合物の任意の及び全てのプロトン化形態は、本発明の範囲内に入ることが意図されることが理解されるであろう。

【０１４９】

本明細書で使用される「薬学的に許容される塩」という用語は、本明細書の式の化合物が形成することができる治療活性の非毒性塩形態を意味する。したがって、本発明の化合物は、任意に、本明細書の化合物の塩、特に、例えば、Na^+、Li^+、K^+、Ca^{2+}、及びMg^{2+}を含有する薬学的に許容される非毒性塩を含む。そのような塩は、適切なカチオン、例えば、アルカリ及びアルカリ土類金属イオン、又はアンモニウム及び四級アミノイオンと、酸性アニオン部分、典型的にはカルボン酸との組み合わせによって誘導されるものを含み得る。本発明の化合物は、複数の正電荷又は負電荷を有し得る。本発明の化合物の正味電荷は、正又は負のいずれかであり得る。任意の関連する対イオンは、典型的には、化合物が得られる合成方法及び／又は単離方法によって決定される。典型的な対イオンには、アンモニウム、ナトリウム、カリウム、リチウム、ハロゲン化物、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩など、及びそれらの混合物が含まれるが、これらに限定されない。任意の関連する対イオンの同一性は、本発明の重要な特徴ではなく、本発明は、任意のタイプの対イオンと会合する化合物を含むことが理解されるであろう。更に、化合物は、様々な異なる形態で存在し得るため、本発明は、対イオンと会合する化合物の形態（例えば、乾燥塩）だけでなく、対イオンと会合しない形態（例えば、水溶液又は有機溶液）も含むことが意図される。金属塩は、典型的には、金属水酸化物を本発明の化合物と反応させることによって調製される。このような方法で調製される金属塩の例は、Li^+、Na^+、及びK^+を含有する塩である。より可溶性の低い金属塩は、好適な金属化合物の添加によって、より可溶性の高い塩の溶液から沈殿し得る。加えて、塩は、塩基の中心、典型的にはアミン、又は酸性基へのある特定の有機酸及び無機酸の酸付加から形成され得る。そのような適切な酸の例としては、例えば、ヒドロハロゲン酸、例えば、塩酸若しくは臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸などの無機酸、又は例えば、酢酸、プロパン酸、ヒドロキシ酢酸、２－ヒドロキシプロパン酸、２－オキソプロパン酸、乳酸、ピルビン酸、シュウ酸（すなわち、エタンジオ酸）、マロン酸、コハク酸（すなわち、ブタンジオ酸）、マレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベ

ンゼンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、シクロヘキサンスルファミン酸、サリチル（すなわち、２－ヒドロキシベンゾ）酸、ｐ－アミノサリチル酸などの有機酸が挙げられる。更に、この用語はまた、本明細書の式の化合物並びにそれらの塩が形成することができる溶媒和物、例えば、水和物、アルコラートなども含む。最後に、本明細書の組成物は、それらの非イオン化された本発明の化合物、並びに両性イオン形態、及び水和物の場合には化学量論量の水との組み合わせを含むことを理解されたい。

【０１５０】

１つ以上のアミノ酸、特にタンパク質成分として見出される天然アミノ酸を有する親化合物の塩もまた、本発明の範囲内に含まれる。アミノ酸は、典型的には、塩基性若しくは酸性の基、例えば、リジン、アルギニン若しくはグルタミン酸、又はグリシン、セリン、スレオニン、アラニン、イソロイシン、若しくはロイシンなどの中性基を有する側鎖を有するものである。

【０１５１】

本発明の化合物はまた、その生理学的に許容される塩も含む。本発明の化合物の生理学的に許容される塩の例としては、アルカリ金属（例えば、ナトリウム）、アルカリ土類（例えば、マグネシウム）、アンモニウム及び$NX4^+$（式中、Ｘは、－C_{1-6}－アルキルである）などの適切な塩基由来の塩が挙げられる。水素原子又はアミノ基の生理学的に許容される塩としては、酢酸、安息香酸、乳酸、フマル酸、酒石酸、マレイン酸、マロン酸、リンゴ酸、イセチオン酸、ラクトビオン酸、及びコハク酸などの有機カルボン酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、及びｐ－トルエンスルホン酸などの有機スルホン酸、並びに塩酸、硫酸、リン酸、及びスルファミン酸などの無機酸が挙げられる。ヒドロキシ基を含有する化合物の生理学的に許容される塩は、Na^+及び$NX4^+$などの好適なカチオンと組み合わせた当該化合物のアニオンを含む（式中、Ｘは、典型的には、独立して、－Ｈ又は－C_{1-4}－アルキル基から選択される）。しかしながら、生理学的に許容されない酸及び塩基の塩もまた、例えば、生理学的に許容される化合物の調製又は精製における使用が認められ得る。全ての塩は、生理学的に許容される酸又は塩基を形成するか否かにかかわらず、本発明の範囲内である。

【０１５２】

本明細書で使用される場合、及び特に明記されていない限り、「エナンチオマー」という用語は、少なくとも８０％（すなわち、１つのエナンチオマーの少なくとも９０％、及び他のエナンチオマーの最大１０％）、好ましくは少なくとも９０％、より好ましくは少なくとも９８％の光学純度又はエナンチオマー過剰（当該技術分野の標準方法によって決定される）を有する、本発明の化合物の各個々の光学的に活性な形態を意味する。

【０１５３】

本明細書で使用される「異性体」という用語は、本明細書の式の化合物が有することができるが、位置異性体を含まない、互変異性形態及び立体化学形態を含む、全ての可能な異性体形態を意味する。典型的には、本明細書に示される構造は、化合物の１つの互変異性形態又は共鳴形態のみを例示するが、対応する代替構成も同様に企図される。特に明記されていない限り、化合物の化学的名称は、全ての可能な立体化学的異性体形態の混合物を示し、当該混合物は、塩基性分子構造の全てのジアステレオマー及びエナンチオマー（本明細書の式の化合物は、少なくとも１つのキラル中心を有し得るため）、並びに立体化学的に純粋な又は濃縮された化合物を含有する。より具体的には、立体中心は、Ｒ配座又はＳ配座のいずれかを有してもよく、複数の結合は、シス配座又はトランス配座のいずれかを有してもよい。

【０１５４】

当該化合物の純粋な異性体形態は、同じ塩基性分子構造の他のエナンチオマー又はジアステレオマー形態を実質的に含まない異性体として定義される。具体的には、「立体異性的に純粋な」又は「キラル純粋な」という用語は、少なくとも約８０％（すなわち、１つの異性体の少なくとも９０％、及び他の可能な異性体の最大１０％）、好ましくは少なくとも９０％、より好ましくは少なくとも９４％、及び最も好ましくは少なくとも９７％の

立体異性体過剰を有する化合物に関する。「鏡像異性的に純粋な」及び「ジアステレオ選択的に純粋な」という用語は、問題の混合物の鏡像異性体過剰、それぞれジアステレオマー過剰を考慮して、同様の方法で理解されるべきである。

【０１５５】

立体異性体の分離は、当業者に既知の標準的な方法によって達成される。本発明の化合物の１つのエナンチオマーは、光学活性な分解剤を使用したジアステレオマーの形成などの方法により、その反対側のエナンチオマーを実質的に含まないように分離することができる（”Ｓｔｅｒｅｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｃａｒｂｏｎ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，”（１９６２）ｂｙ Ｅ．Ｌ．Ｅｌｉｅｌ，ＭｃＧｒａｗ Ｈｉｌｌ、Ｌｏｃｈｍｕｌｌｅｒ，Ｃ．Ｈ．，（１９７５）Ｊ．Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒ．，１１３：（３）２８３－３０２）。混合物中の異性体の分離は、（１）キラル化合物によるイオン性ジアステレオマー塩の形成及び分別結晶又は他の方法による分離、（２）キラル誘導体化試薬によるジアステレオマー化合物の形成、ジアステレオマーの分離、及び純粋なエナンチオマーへの変換、又は（３）エナンチオマーがキラル条件下で直接を分離され得る、を含む、任意の好適な方法によって達成することができる。方法（１）において、ジアステレオマー塩は、ブルシン、キニン、エフェドリン、ストリキニン、ａ－メチル－ｂ－フェニルエチルアミン（アンフェタミン）などの鏡像異性的に純粋なキラル塩基と、カルボン酸及びスルホン酸などの酸性官能性を有する非対称化合物との反応によって形成することができる。ジアステレオマー塩は、分別結晶又はイオンクロマトグラフィーによって分離するように誘導され得る。アミノ化合物の光学異性体の分離のために、カンファースルホン酸、酒石酸、マンデル酸、又は乳酸などのキラルカルボン酸又はスルホン酸の添加は、ジアステレオマー塩の形成をもたらし得る。代替的に、方法（２）によって、分解される基質をキラル化合物の１つのエナンチオマーと反応させて、ジアステレオマー対を形成し得る（Ｅｌｉｅｌ，Ｅ．ａｎｄ Ｗｉｌｅｎ，Ｓ．（１９９４）Ｓｔｅｒｅｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，ｐ．３２２）。ジアステレオマー化合物は、非対称化合物を、メンチル誘導体などの鏡像異性的に純粋なキラル誘導体化試薬と反応させ、続いてジアステレオマーの分離及び加水分解によって形成して、遊離の鏡像異性的に濃縮された化合物を得ることができる。光学純度を決定する方法は、ラセミ混合物のキラルエステル、例えば、メンチルエステル又はＭｏｓｈｅｒエステル、ａ－メトキシ－ａ－（トリフルオロメチル）フェニルアセテート（Ｊａｃｏｂ ＩＩＩ．（１９８２）Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．４７：４１６５）を作製することと、２つのアトロプ異性ジアステレオマーの存在に関して、ＮＭＲスペクトルを分析することと、を伴う。安定なジアステレオマーは、アトロプ異性ナフチル－イソキノリンの分離のための方法に従って、正相及び逆相クロマトグラフィーによって分離し、単離することができる（Ｈｏｙｅ，Ｔ．，ＷＯ９６／１５１１１）。方法（３）の下で、２つの非対称エナンチオマーのラセミ混合物は、キラル固定相を使用してクロマトグラフィーによって分離される。好適なキラル固定相は、多糖類、特にセルロース又はアミロース誘導体である。市販の多糖類ベースのキラル固定相は、ＣｈｉｒａｌＣｅｌ（登録商標）ＣＡ、ＯＡ、ＯＢ５、ＯＣ５、ＯＤ、ＯＦ、ＯＧ、ＯＪ、及びＯＫ、並びにＣｈｉｒａｌｐａｋ（登録商標）ＡＤ、ＡＳ、ＯＰ（＋）及びＯＴ（＋）である。当該多糖類キラル固定相と組み合わせて使用するための適切な溶離液又は移動相は、ヘキサンなどであり、エタノール、イソプロパノールなどのアルコールで修飾される。（”Ｃｈｉｒａｌ Ｌｉｑｕｉｄ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ”（１９８９）Ｗ．Ｊ．Ｌｏｕｇｈ，Ｅｄ．Ｃｈａｐｍａｎ ａｎｄ Ｈａｌｌ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ、Ｏｋａｍｏｔｏ，（１９９０）”Ｏｐｔｉｃａｌ ｒｅｓｏｌｕｔｉｏｎ ｏｆ ｄｉｈｙｄｒｏｐｙｒｉｄｉｎｅ ｅｎａｎｔｉｏｍｅｒｓ ｂｙ Ｈｉｇｈ－ｐｅｒｆｏｒｍａｎｃｅ ｌｉｑｕｉｄ ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ ｕｓｉｎｇ ｐｈｅｎｙｌｃａｒｂａｍａｔｅｓ ｏｆ ｐｏｌｙｓａｃｃｈａｒｉｄｅｓ ａｓ ａ ｃｈｉｒａｌ ｓｔａｔｉｏｎａｒｙ ｐｈａｓｅ”，Ｊ．ｏｆ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒ．５１３：３７５－３７８）。

【０１５６】

シス及びトランスという用語は、本明細書では、化学情報検索の命名法に従って使用され、環状部分上の置換基の位置への言及を含む。本明細書に記載の式の化合物の絶対立体化学配置は、例えば、Ｘ線回折などの周知の方法を使用しながら、当業者によって容易に決定され得る。

【０１５７】

化合物が溶液又はスラリーから結晶化される場合、これは、異なる空間的格子配置で結晶化され（この特性は「多形性」と呼ばれる）、異なる結晶形態を有する結晶を形成することができ、これらの各々が「多形体」として知られている。したがって、本明細書で使用される「多形体」という用語は、式（Ｉ）の化合物の結晶形態を指し、分子は、三次元格子部位に局在される。式（Ｉ）の化合物の異なる多形体は、溶解度及び溶解速度、真の比重、結晶形態、蓄積モード、流動性、及び／又は固体状態の安定性などの１つ以上の物理的特性において、互いに異なり得る。

【０１５８】

本発明の化合物及びそれらの生理学的に許容される塩（以下、総称して活性成分と称する）は、治療される病態、経口、直腸、鼻腔、局所（眼、口腔、及び舌下を含む）、膣及び非経口（皮下、筋肉内、鼻腔内、静脈内、動脈内、皮内、髄腔内、及び硬膜外を含む）を含む好適な経路に適切な任意の経路によって投与され得る。好ましい投与経路は、例えば、レシピエントの状態によって異なり得る。

【０１５９】

特に、ヒト及び他の哺乳動物、又は動物におけるＴＲＰＭ３媒介性障害の治療のための、化合物（複数可）の調製の治療有効量は、好ましくは、本明細書に定義される化合物のＴＲＰＭ３イオンチャネル阻害量であり、１μｇ／ｍｌ～１００ｍｇ／ｍｌ、任意に１０ｍｇ／ｍｌの血漿レベルを確保する量に対応する。

【０１６０】

本発明の化合物又は組成物の好適な用量は、対象におけるＴＲＰＭ３媒介性障害を治療又は予防するために使用されるべきである。治療される病理学的状態及び患者の状態に応じて、当該有効量は、１日当たりいくつかのサブユニットに分割され得るか、又は１日を超える間隔で投与され得る。

【０１６１】

本発明は更に、本発明の１つ以上の化合物、より具体的には、本明細書に記載の全ての式（Ｉ）及び他の式及び実施形態、並びにそれらのより具体的な態様又は実施形態を含む（薬学的）組成物を提供する。更に、本発明は、本発明の化合物又は（薬学的）組成物、より具体的には、本明細書に記載の全ての式（Ｉ）及び他の式及び実施形態、並びにそれらのより具体的な態様又は実施形態を、薬物として使用するために、より具体的には、疼痛又はてんかんの治療に使用するために提供する。ＴＲＰＭ３媒介性障害は、疼痛、てんかん、及び炎症性過敏症状態から選択される。

【０１６２】

本発明の化合物は、従来の担体及び賦形剤とともに製剤化され得、これらは、通常の慣行に従って選択される。錠剤は、賦形剤、流動剤、充填剤、結合剤などを含有する。水性製剤は、滅菌形態で調製され、経口投与以外による送達を意図する場合、一般に等張的になる。製剤は、任意に、”Ｈａｎｄｂｏｏｋ　ｏｆ　Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　Ｅｘｃｉｐｉｅｎｔｓ”（１９８６）に記載されているような賦形剤を含有する。

【０１６３】

その後、本明細書で使用される「薬学的に許容される担体」という用語は、例えば、当該組成物を溶解、分散、又は拡散することによって、治療されるべき遺伝子座へのその適用又は播種を容易にするために、及び／又はその有効性を損なうことなしに、その保存、輸送、又は取り扱いを容易にするために、活性成分が製剤化される任意の材料又は物質を意味する。薬学的に許容される担体は、固体又は液体、又は液体を形成するために圧縮された気体であり得、すなわち、本発明の組成物は、濃縮物、エマルション、溶液、顆粒、粉塵、スプレー、エアロゾル、懸濁液、軟膏、クリーム、錠剤、ペレット又は粉末として

好適に使用することができる。

【０１６４】

当該薬学的組成物及びその製剤で使用するための好適な薬学的担体は、当業者に周知であり、本発明内でのそれらの選択に、特に制限はない。これらはまた、同様のものが、薬学的実施、すなわち、哺乳動物に対して永続的な損傷をもたらさない担体及び添加剤と一致するという条件で、湿潤剤、分散剤、ステッカー、接着剤、乳化剤、表面活性剤、溶媒、コーティング、抗菌剤及び抗真菌剤、等張剤などの添加剤を含み得る。本発明の薬学的組成物は、任意の既知の方法で、例えば、ワンステップ又はマルチステップの手順で、選択された担体材料、及び必要に応じて、表面活性剤などの他の添加剤と、活性成分を均一に混合、コーティング、及び／又は粉砕することによって調製することができる。また、例えば、活性成分の制御又は持続放出のためのマイクロカプセルの製造のために、通常約１～１０ｇｍの直径を有するマイクロスフィアの形態でそれらを得るために、マイクロナイゼーションによって調製され得る。

【０１６５】

本発明の化合物を単独で投与することが可能であるが、薬学的製剤としてそれらを提示することが好ましい。本発明の獣医用及びヒト用の両方の製剤は、上記のように、少なくとも１つの活性成分を、したがって、１つ以上の薬学的に許容される担体、及び任意に他の治療成分とともに含む。担体（複数可）は、最適には、製剤の他の成分と適合し、そのレシピエントに有害でないという意味で「許容される」。本製剤は、経口、直腸、鼻、局所（口腔及び舌下を含む）、膣又は非経口（皮下、筋肉内、静脈内、皮内、髄腔内、及び硬膜外を含む）投与に好適なものを含む。製剤は、好都合に単位剤形で提示され得、かつ薬学の技術分野で周知の方法のうちのいずれかによって調製され得る。そのような方法は、活性成分を１つ以上の付属成分を構成する担体と会合させるステップを含む。一般に、製剤は、活性成分を液体担体、又は細かく分割された固体担体、又はその両方と均一かつ密接に会合させ、必要に応じて生成物を成形することによって調製される。

【０１６６】

経口投与に好適な本発明の製剤は、各々が、別個の単位として（例えば、所定量の活性成分を含むカプセル、カシェ、又は錠剤）、粉末又は顆粒として、水性液体又は非水性液体中の溶液又は懸濁液、又は水中油液体エマルション若しくは油中水液体エマルションとして提示され得る。活性成分はまた、ボーラス、舐剤、又はペーストとして提示され得る。

【０１６７】

錠剤は、任意に１種以上の副成分とともに、圧縮又は成形によって製造することができる。圧縮錠剤は、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、保存剤、表面活性剤、又は分散剤と任意に混合された、粉末又は顆粒などの自由流動形態で、活性成分を、好適な機械において圧縮することによって調製され得る。成形錠剤は、不活性液体希釈剤で湿らせた粉末化合物の混合物を好適な機械で成形することにより作製することができる。錠剤は、任意に、コーティング又はスコアリングされ得、その中に、活性成分の徐放又は制御放出を提供するように製剤化され得る。眼又は他の外部組織、例えば、口及び皮膚の感染症の場合、製剤は、例えば、０．０７５～２０ｗ／ｗ％（０．６ｗ／ｗ％、０．７ｗ／ｗ％などの０．１ｗ／ｗ％の増分で０．１％～２０％の範囲の活性成分（複数可）を含む）、好ましくは０．２～１５ｗ／ｗ％、最も好ましくは０．５～１０ｗ／ｗ％の量で、活性成分（複数可）を含有する局所軟膏又はクリームとして、任意に適用される。軟膏に製剤化される場合、活性成分は、パラフィン系又は水混和性軟膏基剤のいずれかとともに使用され得る。代替的に、活性成分は、水中油性クリーム基剤を有するクリーム中で製剤化され得る。所望される場合、クリーム基剤の水相は、例えば、少なくとも３０ｗ／ｗ％の多価アルコール、すなわち、プロピレングリコール、ブタン１，３－ジオール、マンニトール、ソルビトール、グリセロール、及びポリエチレングリコール（ＰＥＧ４００を含む）などの２つ以上のヒドロキシル基を有するアルコール、及びこれらの混合物を含み得る。局所製剤は、望ましくは、皮膚又は他の影響を受ける領域を通る活性成分の吸収又は浸透を増強する化

合物を含み得る。そのような皮膚浸透増強剤の例には、ジメチルスルホキシド及び関連する類似体が含まれる。

【０１６８】

本発明のエマルションの油性相は、既知の方法で既知の成分から構成され得る。相は、単に乳化剤（別名、利尿剤として知られている）を含み得るが、望ましくは、少なくとも１つの乳化剤と脂肪若しくは油との混合物、又は脂肪及び油の両方との混合物を含む。任意に、親水性乳化剤は、安定剤として作用する親油性乳化剤と一緒に含まれる。また、油及び脂肪の両方を含むことが好ましい。合わせて、安定剤（複数可）の有無にかかわらず、乳化剤（複数可）は、いわゆる乳化ワックスを構成し、ワックスは、油及び脂肪とともに、クリーム製剤の油性分散相を形成するいわゆる乳化軟膏基剤を構成する。

【０１６９】

製剤に好適な油又は脂肪の選択は、薬学的エマルション製剤に使用される可能性が高いほとんどの油における活性化合物の溶解度が非常に低いため、所望の化粧特性を達成することに基づく。したがって、クリームは、任意に、チューブ又は他の容器からの漏れを避けるために、好適な一貫性を有する非脂肪性、非汚染性及び洗濯可能な生成物であるべきである。ココナツ脂肪酸のジイソアジパート、ステアリン酸イソセチル、プロピレングリコールジエステル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸デシル、パルミチン酸イソプロピル、ステアリン酸ブチル、２－エチルヘキシルパルミテート、又はクロダモル（Ｃｒｏｄａｍｏｌ）ＣＡＰとして知られている分岐鎖エステルのブレンドなどの直鎖又は分岐鎖の、一塩基性又は二塩基性のアルキルエステルが使用され得、最後の３つが好ましいエステルである。これらは、必要とされる性質に応じて、単独で又は組み合わせで使用され得る。代替的に、白色軟質パラフィン及び／又は液体パラフィン又は他の鉱油などの高融点脂質が、使用され得る。

【０１７０】

眼への局所投与に好適な製剤には、活性成分が好適な担体、特に活性成分のための水性溶媒に溶解又は懸濁される点眼剤も含まれる。活性成分は、任意に、そのような製剤中に、０．５～２０％、有利には０．５～１０％、特に約１．５ｗ／ｗ％の濃度で存在する。口腔内の局所投与に好適な製剤としては、香味ベースの通常はスクロース及びアカシア若しくはトラガカント中に活性成分を含むロゼンジ錠、不活性ベースで例えばゼラチン及びグリセリン、又はスクロース及びアカシア中に活性成分を含む香錠、並びに好適な液体担体中に活性成分を含むマウスウォッシュが挙げられる。

【０１７１】

直腸投与のための製剤は、例えば、カカオバター又はサリチレートを含む好適な塩基を有する座薬として提示されてもよい。担体が固体である、経鼻投与のために好適な製剤は、嗅がれる様式で、すなわち、鼻に近づけて維持した粉末の容器からの経鼻経路を介した迅速な吸入によって投与される、例えば、２０～５００ミクロンの範囲の粒子サイズを有する（３０ミクロン、３５ミクロンなどの５ミクロン単位で２０～５００ミクロンの範囲の粒子サイズを有する）粗い粉末を含む。担体が液体である好適な製剤は、例えば、鼻スプレーとして、又は点鼻薬として投与するために、活性成分の水性又は油性溶液を含む。エアロゾル投与に好適な製剤は、従来の方法に従って調製され得、他の治療剤とともに送達され得る。

【０１７２】

膣投与に好適な製剤は、活性成分に加えて、適切であることが当該技術分野で知られているような担体を含有するペッサリー、タンポン、クリーム、ゲル、ペースト、フォーム、又はスプレー製剤として提示され得る。

【０１７３】

非経口投与に好適な製剤には、酸化防止剤、緩衝剤、静菌剤、及び意図するレシピエントの血液と等張性にする溶質を含有し得る水性及び非水性の滅菌注射液、並びに懸濁剤及び増粘剤を含み得る水性及び非水性の滅菌懸濁液が挙げられる。製剤は、単位用量又は複数用量の容器（例えば、密封されたアンプル及びバイアル）で提示され得、使用直前に滅

菌液体担体（例えば、水）の添加のみを必要とするフリーズドライ（すなわち、凍結乾燥）状態で保存され得る。即時注射溶液及び懸濁液は、前述の種類の滅菌粉末、顆粒及び錠剤から調製され得る。

【０１７４】

好ましい単位用量製剤は、本明細書に記載されているように、活性成分の１日用量若しくは１日単位サブ用量、又はその適切な画分を含有するものである。

【０１７５】

特に上述の成分に加えて、本発明の製剤は、問題の製剤の種類を考慮して当該技術分野の従来の他の薬剤を含み得ること（例えば、経口投与に好適なものが香味剤を含み得ること）を理解されたい。

【０１７６】

本発明の化合物を使用して、活性成分として本発明の１つ以上の化合物を含有する制御放出薬学的製剤（「制御放出製剤」）を提供することができ、活性成分の放出は、より少ない頻度の投与を可能にするか、又は所与の本発明の化合物の薬物動態又は毒性プロファイルを改善するように制御及び調節され得る。別個の単位が本発明の１つ以上の化合物を含む経口投与に適合された制御放出製剤が、従来の方法に従って調製され得る。

【０１７７】

本発明の別の実施形態は、本発明の化合物の様々な前駆体又は「プロドラッグ」形態に関する。本発明の化合物を、それ自体が有意に生物活性ではないが、動物、哺乳動物、又はヒトに送達されるときに、体の正常な機能によって触媒される化学反応、とりわけ、胃又は血清中に存在する酵素によって触媒される化学反応を受ける化学種の形態で製剤化することが望ましくあり得、当該化学反応は、本明細書に定義される化合物を放出する効果を有する。したがって、「プロドラッグ」という用語は、インビボで活性薬学的成分に変換されるこれらの種に関する。

【０１７８】

本発明の化合物のプロドラッグは、製剤化剤に好適な任意の形態を有し得、例えば、エステルは、非限定的な一般的なプロドラッグ形態である。しかしながら、この場合において、プロドラッグは、必然的に、標的遺伝子座に存在する酵素の作用により共有結合が切断される形態で存在し得る。例えば、Ｃ－Ｃ共有結合は、当該標的遺伝子座における１つ以上の酵素によって選択的に切断され得、したがって、容易に加水分解可能な前駆体、とりわけ、エステル、アミドなど以外の形態のプロドラッグが使用され得る。プロドラッグ中の活性薬学的成分の対応物は、当該技術分野で知られているアミノ酸又はペプチド構造、アルキル鎖、糖部分などの異なる構造を有することができる。

【０１７９】

本発明の目的のために、「治療的に好適なプロドラッグ」という用語は、「単一又は複数の生物学的変換によって、プロドラッグが投与された動物、哺乳動物、又はヒトの組織と接触した際に、過度の毒性、刺激、又はアレルギー反応なしに、インビボで治療活性形態に変換されるように修飾され、意図された治療成果を達成する化合物」として本明細書で定義される。

【０１８０】

より具体的には、本明細書で使用される「プロドラッグ」という用語は、化合物の薬理学的に活性な形態を放出するために、体内で自発的又は酵素変換反応を受ける、本明細書に記載される構造式によって表されるような化合物の不活性又は有意に活性が低い誘導体に関する。総合的な検討のために、ＲａｕｔｉｏＪ．ｅｔ ａｌ．（“Ｐｒｏｄｒｕｇｓ：ｄｅｓｉｇｎ ａｎｄ ｃｌｉｎｉｃａｌ ａｐｐｌｉｃａｔｉｏｎｓ”Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ，２００８，ｄｏｉ：１０．１０３８／ｎｒｄ２４６８）を参照されたい。

【０１８１】

本発明の代表的な化合物は、以下に記載される一般的な合成方法に従って合成することができ、以下のスキームに例示される。スキームは例示であるため、本発明は、スキーム

及び実施例に記載される特定の化学反応及び特定の条件によって制限されると解釈されるべきではない。スキームで使用される様々な出発物質は、市販されているか、又は当業者によく知られた方法によって調製され得る。変数は、本明細書で定義されるように、かつ当業者の技量の範囲内である。

【実施例】

【０１８２】

以下の実施例は、本発明を更に例示するために提供され、決して本発明の範囲を限定することを意図するものではない。

【０１８３】

本発明の代表的な化合物は、以下に記載する一般的な合成方法に従って合成することができ、以下のスキームに例示される。スキームは例示であるため、本発明は、スキーム及び実施例に記載される特定の化学反応及び特定の条件によって制限されると解釈されるべきではない。スキームで使用される様々な出発物質は、市販されているか、又は当業者によく知られた方法によって調製され得る。変数は、本明細書で定義されるように、かつ当業者の技量の範囲内である。

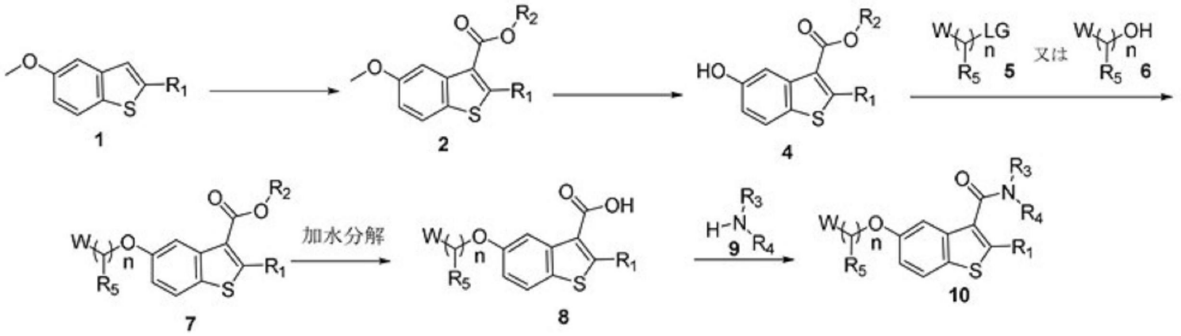
【０１８４】

本明細書において、特にスキーム及び実施例において使用される略語は、以下の通りである。ＡＣＮ－アセトニトリル、ＡｃＯＨ－酢酸、ＡＤＤＰ－１，１’－（アゾジカルボニル）ジピペリジド、ａｑ．－水性、ＡＩＢＮ－アゾビスイソブチロニトリル、ＣＡＮ－硝酸セリウムアンモニウム、ＣＯＭＵ－（１－シアノ－２－エトキシ－２－オキソエチリデンアミノオキシ）ジメチルアミノ－モルホリノ－カルベニウムヘキサフルオロホスフェート、ＤＡＢＣＯ－１，４－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン、ＤＡＳＴ－ジエチルアミノサルファートリフルオリド、ＤＢＵ－１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン、ＤＣＣ－Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミド、ＤＣＭ－ジクロロメタン、ＤＥＡＤ－ジエチルアゾジカルボキシレート、ＤＩＡ－ジアステレオマー、ＤＩＡＤ－アゾジカルボン酸ジイソプロピル、ＤＥＡ－ジエチルアミン、ＤＩＰＥＡ－ジイソプロピル－エチルアミン、ＤＭＥ－１，２－ジメトキシエタン、ＤＭＦ－Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ＤＭＳＯ－ジメチルスルホキシド、ＤＴＢＡＤ－ｔｅｒｔ－ブチルアゾジカルボキシレート、ＥＤＣＩ又はＥＤＣ－１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド、Ｅｎ－エナンチオマー、Ｅｔ２Ｏ－ジエチルエーテル、ＥｔＯＨ－エタノール、ＥｔＯＡｃ－酢酸エチル、Ｅｑ．－当量、ＦＡ－ギ酸、ＦＣＣ－フラッシュカラムクロマトグラフィー、ｈ－時間、ＨＡＴＵ－Ｏ－（７－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、ＨＰＬＣ－高性能液体クロマトグラフィー、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＬＡＨ－水素化アルミニウムリチウム、ＬＧ－離脱基、ＭｅＯＨ－メタノール、ＭｇＳＯ４－硫酸マグネシウム、ｍｉｎ．－分、Ｎａ２ＳＯ４－硫酸ナトリウム、ＮＢＳ－Ｎ－ブロモスクシンイミド、ＮＭＰ－１－メチル－２－ピロリジノン、Ｐｄ（ＰＰｈ３）４－テトラキス－（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）、Ｐｄ２（ｄｂａ）３－トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム、Ｐｅｔエーテル－石油エーテル、ＰＰｈ３－トリフェニルホスフィン、ＰＳ－ＤＩＥＡ－ポリスチレン担持ジイソプロピル－エチルアミン、ＰＳ－ＰＰｈ３－ポリスチレン担持トリフェニルホスフィン、ＰｙＢｏｐ－ベンゾトリアゾール－１－イル－オキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ＰＴＳＡ－ｐ－トルエンスルホン酸、ＲＦ：フロンティア比、ＲＭ－反応混合物、ＲＰ－逆相、ＲＴ－室温、ｓａｔ．－飽和、ＳＥＭ－［２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチルアセタール、ＳＦＣ－超臨界流体クロマトグラフィー、ＳＰＥ－固相抽出、ＴＢＤＭＳ－Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルエーテル、ＴＢＡＦ－水酸化テトラブチルアンモニウム、ＴＢＡＩ－ヨウ化テトラブチルアンモニウム、ＴＥＡ－トリエチルアミン、ＴＨＦ－テトラヒドロフラン、ＴＦＡ－トリフルオロ酢酸、ＴＬＣ－薄膜クロマトグラフィー、ＴＰＰ－トリフェニルホスフィン、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＴＭＳ－トリメチルシリル、Ｔ３Ｐ－プロピルホスホン酸無水物。

【０１８５】

対象となる化合物は、一般式（Ｉ）に従った構造を有し、本明細書に記載される全ての他の式及びその実施形態は、一般化学スキーム１に概説されるように調製され得る。

【化１５】



スキーム１：全てのｎ、Ｗ、Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４、及びＲ５は、本発明の化合物について記載される通りである。

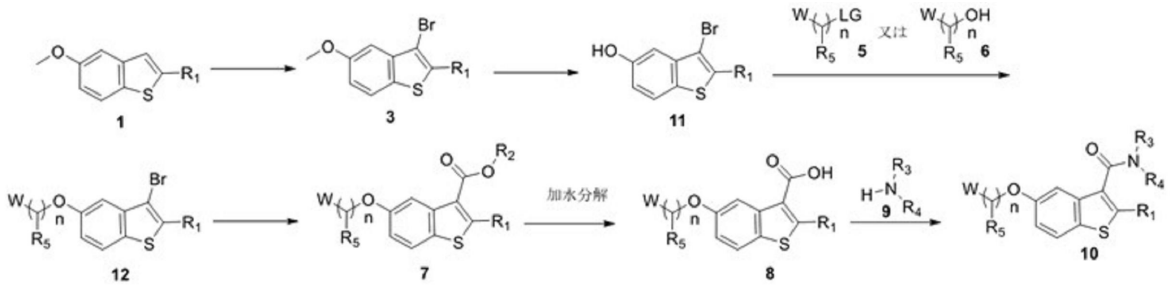
【０１８６】

式１のベンゾチオフェン（市販されているか、又は当業者に既知の手順によって合成される）は、式３の中間体をするために、０～還流の範囲の温度で、極性溶媒（例えば、ＣＨＣｌ$_3$等）中の臭素化剤（例えば、Ｂｒ２等）で臭素化することができる。式１１の５－ヒドロキシ－ベンゾチオフェンは、中間体３を極性溶媒（例えば、ＭｅＯＨ等）中の脱メチル化剤（例えば、ＢＢｒ$_3$、ＮａＳＥｔ等）と反応させることによって得ることができる。次いで、式１１の中間体は、式５の中間体（市販されているか、又は合成されている）を使用して、求核置換を介して、０～１００℃の温度範囲で、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）の有無にかかわらず、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中の基剤（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Ｃｓ$_2$ＣＯ$_3$など）の存在下で、式１２の所望の化合物（式中、ＬＧは、離脱基である）に変換させることができる。代替的に、式１１の中間体はまた、０～１００℃の温度範囲で、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中のアゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下で、式６の中間体（市販されているか、又は合成されている）と反応させて、式１２の所望の化合物を得ることもできる。ベンゾチオフェン誘導体７は、非プロトン性溶媒（例えば、ＴＨＦ等）中のリチウム化アルキル（例えば、ｎＢｕＬｉ、ｔＢｕＬｉ等）によって媒介されるブロモ誘導体１２のトランスメタル化、続いて、クロロホルメート誘導体の添加によって得ることができる。次いで、エステル誘導体７は、標準的な鹸化反応によって式８の所望の化合物に変換され得る。式１０の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中の標準的なペプチド結合条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で、式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）による反応によって、式８の酸誘導体から得ることができる。代替的に、式８のカルボン酸誘導体は、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、酸塩化物誘導体に変換され、次いで、式９のアミンと反応させて、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、式１０の所望の化合物を得ることができる。

【０１８７】

より特定の実施形態において、本発明の化合物は、スキーム２に示されるように、合成することができる。

【化１６】



スキーム２：全てのｎ、Ｗ、Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４、及びＲ５は、本発明の化合物について記載される通りである。

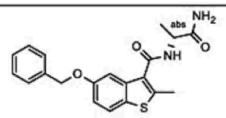
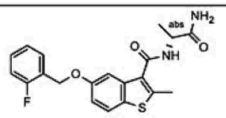
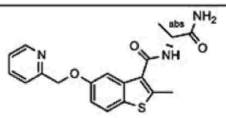
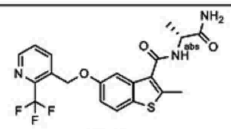
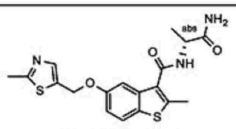
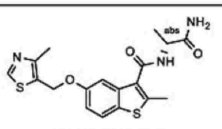
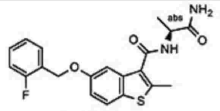
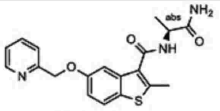
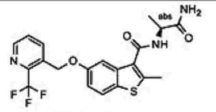
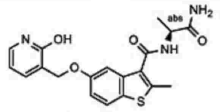
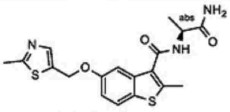
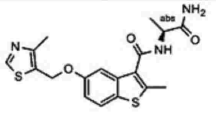
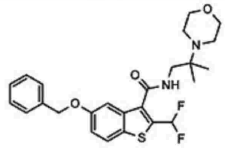
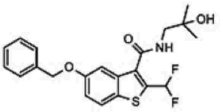
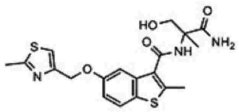
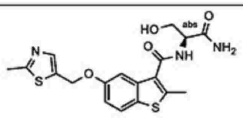
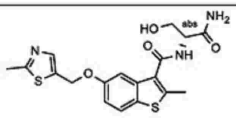
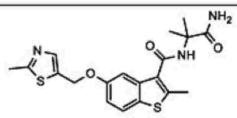
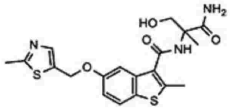
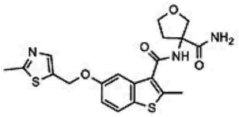
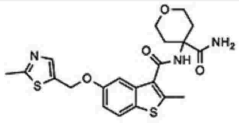
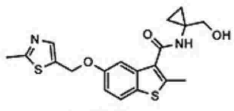
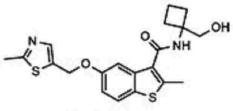
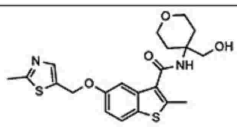
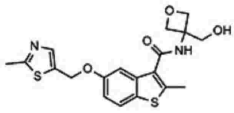
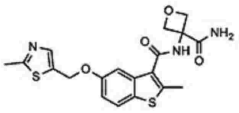
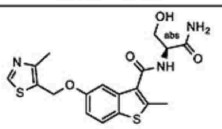
【０１８８】

式１のベンゾチオフェン（市販されているか、又は当業者に既知の手順によって合成される）は、式３の中間体をするために、０～還流の範囲の温度で、極性溶媒（例えば、ＣＨＣｌ$_3$等）中の臭素化剤（例えば、Ｂｒ２等）で臭素化することができる。式１１の５－ヒドロキシ－ベンゾチオフェンは、中間体３を極性溶媒（例えば、ＭｅＯＨ等）中の脱メチル化剤（例えば、ＢＢｒ$_3$、ＮａＳＥｔ等）と反応させることによって得ることができる。次いで、式１１の中間体は、式５の中間体（市販されているか、又は合成されている）を使用して、求核置換を介して、０～１００℃の温度範囲で、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）の有無にかかわらず、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中の基剤（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Ｃｓ$_2$ＣＯ$_3$など）の存在下で、式１２の所望の化合物（式中、ＬＧは、離脱基である）に変換させることができる。代替的に、式１１の中間体はまた、０～１００℃の温度範囲で、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中のアゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下で、式６の中間体（市販されているか、又は合成されている）と反応させて、式１２の所望の化合物を得ることもできる。ベンゾチオフェン誘導体７は、非プロトン性溶媒（例えば、ＴＨＦ等）中のリチウム化アルキル（例えば、ｎＢｕＬｉ、ｔＢｕＬｉ等）によって媒介されるブロモ誘導体１２のトランスメタル化、続いて、クロロホルメート誘導体の添加によって得ることができる。次いで、エステル誘導体７は、標準的な鹸化反応によって式８の所望の化合物に変換され得る。式１０の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中の標準的なペプチド結合条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で、式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）による反応によって、式８の酸誘導体から得ることができる。代替的に、式８のカルボン酸誘導体は、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、酸塩化物誘導体に変換され、次いで、式９のアミンと反応させて、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、式１０の所望の化合物を得ることができる。

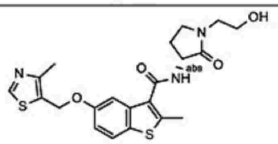
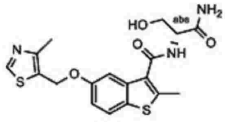
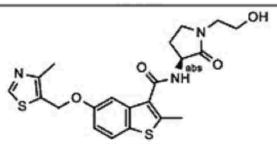
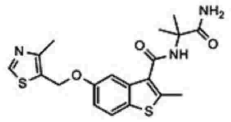
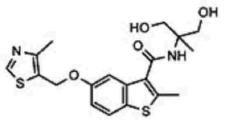
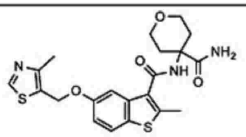
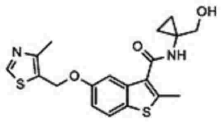
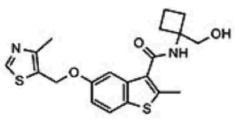
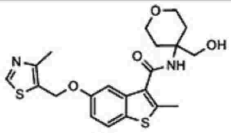
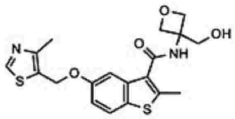
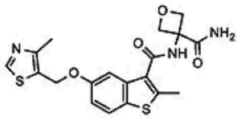
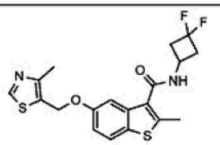
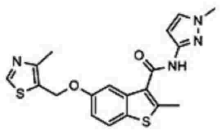
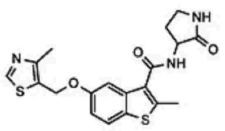
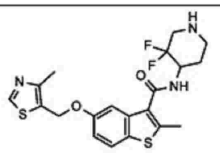
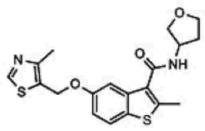
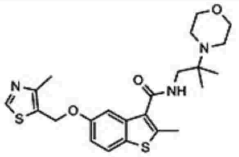
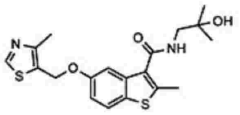
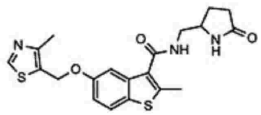
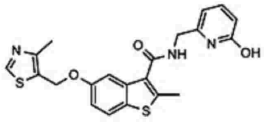
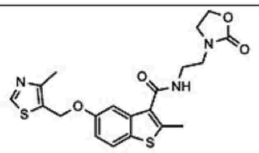
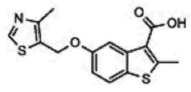
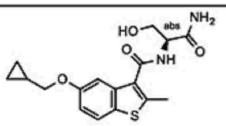
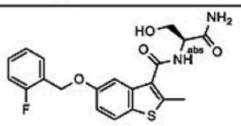
【０１８９】

実施例

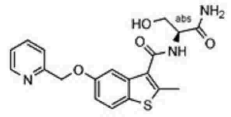
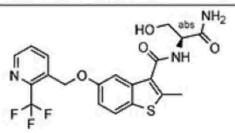
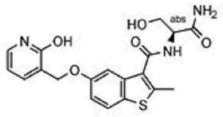
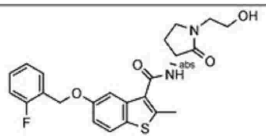
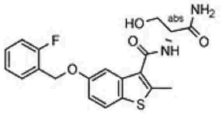
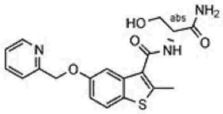
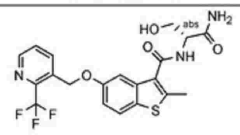
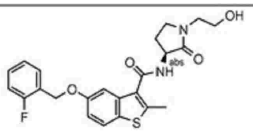
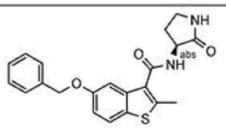
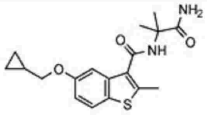
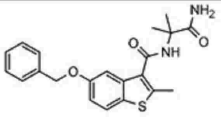
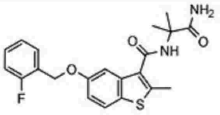
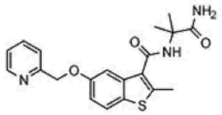
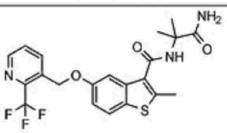
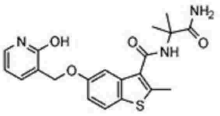
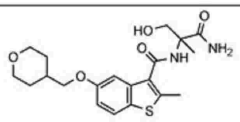
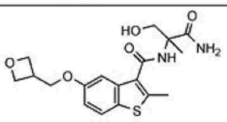
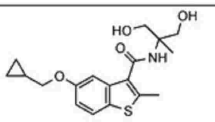
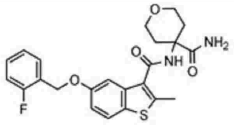
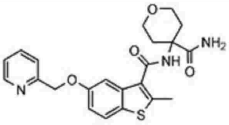
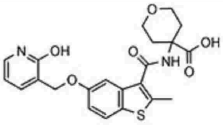
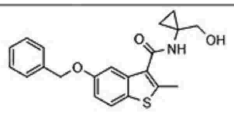
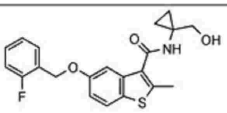
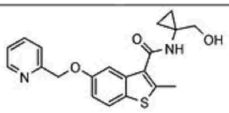
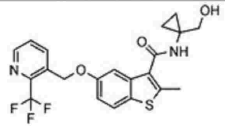
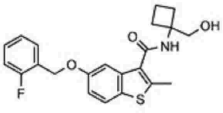
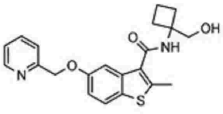
【表２１－１】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 001	 化合物 002	 化合物 003
 化合物 004	 化合物 005	 化合物 006
 化合物 007	 化合物 008	 化合物 009
 化合物 010	 化合物 011	 化合物 012
 化合物 013	 化合物 014	 化合物 015
 化合物 016	 化合物 017	 化合物 018
 化合物 019	 化合物 020	 化合物 021
 化合物 022	 化合物 023	 化合物 024
 化合物 025	 化合物 026	 化合物 027

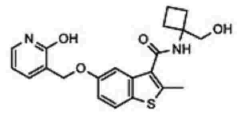
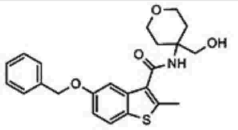
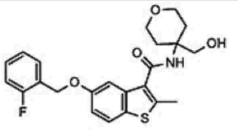
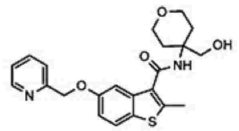
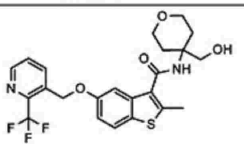
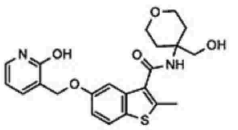
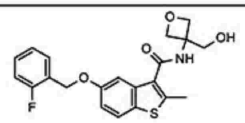
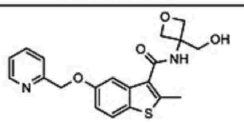
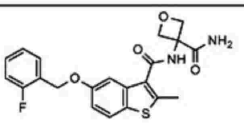
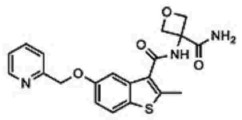
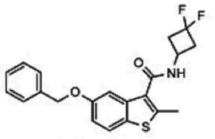
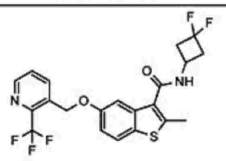
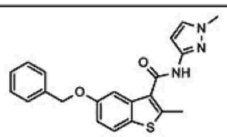
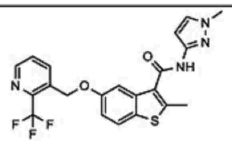
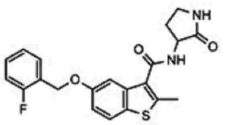
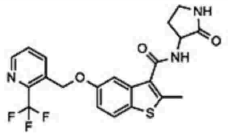
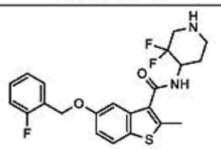
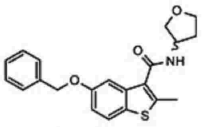
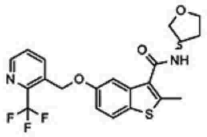
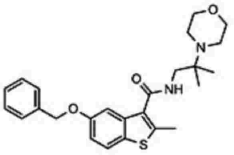
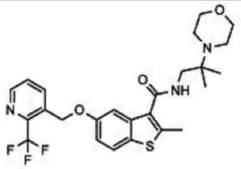
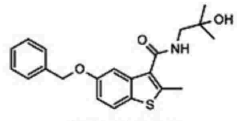
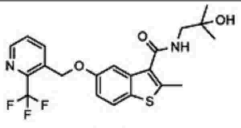
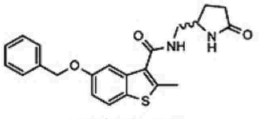
【表２１－２】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 028	 化合物 029	 化合物 030
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036
 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042
 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045
 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048
 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051

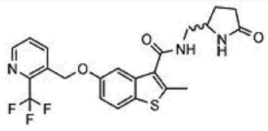
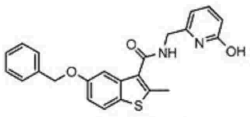
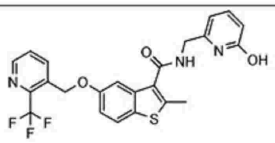
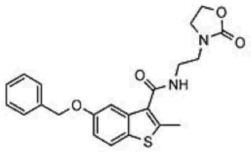
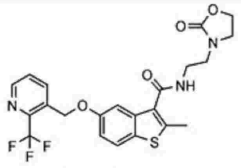
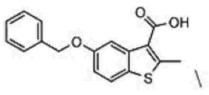
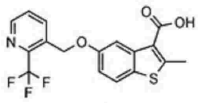
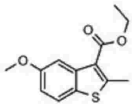
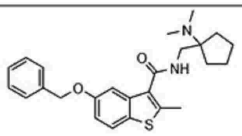
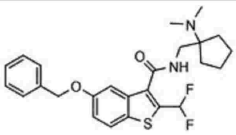
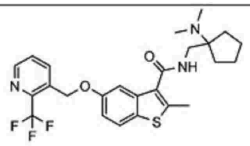
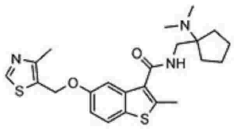
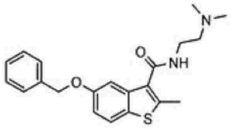
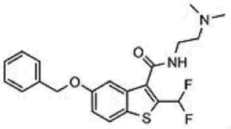
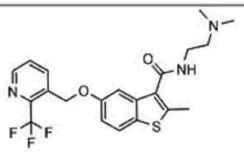
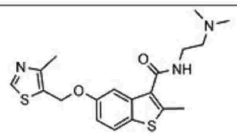
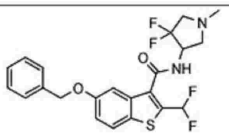
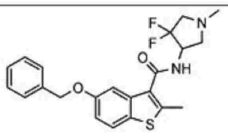
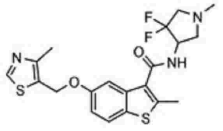
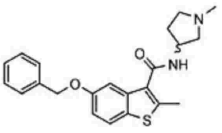
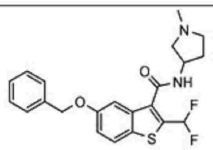
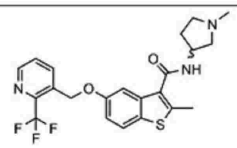
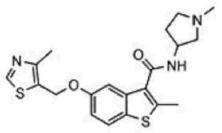
【表２１－３】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 **052**	 化合物 **053**	 化合物 **054**
 化合物 **055**	 化合物 **056**	 化合物 **057**
 化合物 **058**	 化合物 **059**	 化合物 **060**
 化合物 **061**	 化合物 **062**	 化合物 **063**
 化合物 **064**	 化合物 **065**	 化合物 **066**
 化合物 **067**	 化合物 **068**	 化合物 **069**
 化合物 **070**	 化合物 **071**	 化合物 **072**
 化合物 **073**	 化合物 **074**	 化合物 **075**
 化合物 **076**	 化合物 **077**	 化合物 **078**

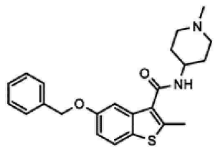
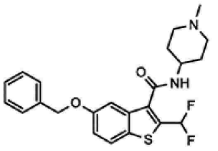
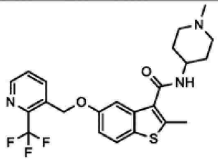
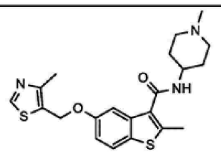
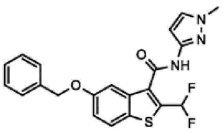
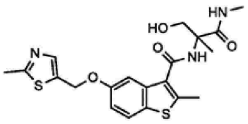
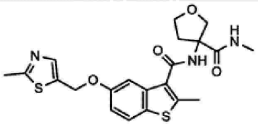
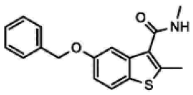
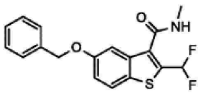
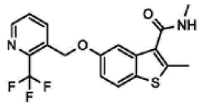
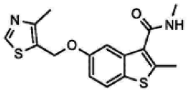
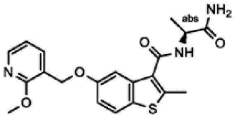
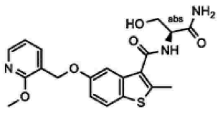
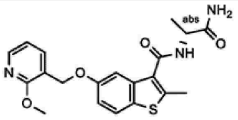
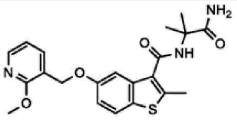
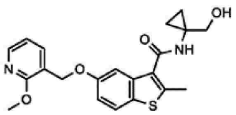
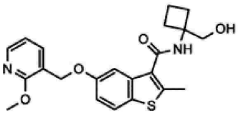
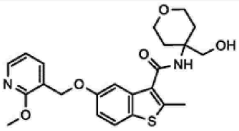
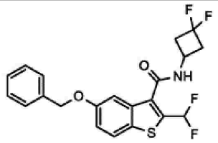
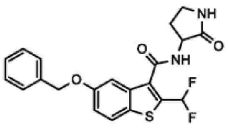
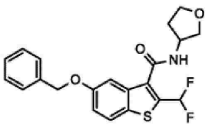
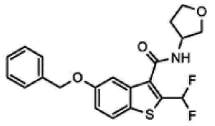
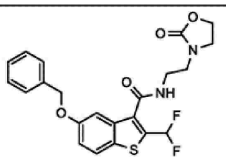
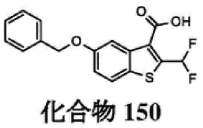
【表２１－４】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 079	 化合物 080	 化合物 081
 化合物 082	 化合物 083	 化合物 084
 化合物 085	 化合物 086	 化合物 087
 化合物 088	 化合物 089	 化合物 090
 化合物 091	 化合物 092	 化合物 093
 化合物 094	 化合物 095	 化合物 096
 化合物 097	 化合物 098	 化合物 099
 化合物 100	 化合物 101	 化合物 102

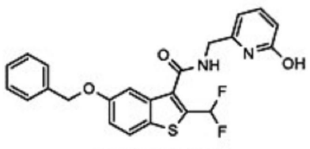
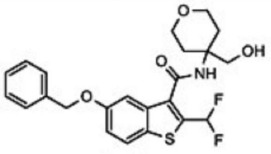
【表２１－５】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 **103**	 化合物 **104**	 化合物 **105**
 化合物 **106**	 化合物 **107**	 化合物 **108**
 化合物 **109**	 化合物 **110**	 化合物 **111**
 化合物 **112**	 化合物 **113**	 化合物 **114**
 化合物 **115**	 化合物 **116**	 化合物 **117**
 化合物 **118**	 化合物 **119**	 化合物 **120**
 化合物 **121**	 化合物 **122**	 化合物 **123**
 化合物 **124**	 化合物 **125**	 化合物 **126**

【表２１－６】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 127	 化合物 128	 化合物 129
 化合物 130	 化合物 131	 化合物 132
 化合物 133	 化合物 134	 化合物 135
 化合物 136	 化合物 137	 化合物 138
 化合物 139	 化合物 140	 化合物 141
 化合物 142	 化合物 143	 化合物 144
 化合物 145	 化合物 146	 化合物 147
 化合物 148	 化合物 149	 化合物 150

【表２１－７】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 151	 化合物 152	

【０１９０】
上記の実施例は、本発明を例示する目的で提供され、決して本発明の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。
【０１９１】
パートＡは、化合物の調製を表し、パートＢは、薬理学的実施例を表す。
【０１９２】
パートＡ
明示的に記載されていない全ての出発物質は、市販されている（例えば、ＡＢＣＲ、Ａｐｏｌｌｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ Ｃｏｍｂｉ－Ｂｌｏｃｋｓ、Ｅｎａｍｉｎｅ、ＦｌｕｏｒｏＣｈｅｍ、ＭａｔｒｉｘＳｃｉｅｎｔｉｆｉｃ、Ｍａｙｂｒｉｄｇｅ、Ｍｅｒｃｋ、ＴＣＩなどの供給業者の詳細は、例えば、ＳｃｉＦｉｎｄｅｒ（登録商標）データベースに見出され得る）、又はそれらの合成は、既に専門文献に正確に記載されている（例えば、実験ガイドラインは、それぞれ、Ｒｅａｘｙｓ（登録商標）データベース又はＳｃｉＦｉｎｄｅｒ（登録商標）データベースに見出され得る）、又は当業者に既知の従来の方法を使用して調製され得る。
【０１９３】
反応は、必要に応じて、不活性雰囲気（主にアルゴン及びN_2）下で行われた。試薬の当量の数、使用される溶媒の量、並びに反応温度及び時間は、類似の方法によって実行される異なる反応の間でわずかに変わり得る。加工方法及び精製方法は、各化合物の特徴的な特性に従って適合させ、類似の方法のためにわずかに変わり得る。調製された化合物の収率は、最適化されていない。
【０１９４】
「当量」（「ｅｑ．」又は「ｅｑ」又は「ｅｑｕｉｖ．」）という表示は、モル当量を意味し、「ＲＴ」又は「ｒｔ」は、室温Ｔ（２３±７℃）を意味し、「Ｍ」は、ｍｏｌ／ｌにおける濃度の表示であり、「ｓｏｌ．」は、溶液を意味し、「ｃｏｎｃ．」は、濃度を意味する。溶媒の混合比は、通常、体積／体積比で表される。
【０１９５】
主要な分析的特徴付けは、全ての例示的な化合物及び選択された中間生成物について、^{1}Ｈ－ＮＭＲ分光法及び／又は質量分析（ＭＳ、$[M+H]^+$及び／又は$[M-H]^-$におけるｍ／ｚ）によって実施された。ある特定の場合において、例えば、位置異性体及び／又はジアステレオマーが形成され得る場合において、例えば、^{13}Ｃ ＮＭＲ及びＮＯＥ（核オーバーハウザー効果）ＮＭＲ実験などの追加の分析が、いくつかの場合において行われた。
【０１９６】
使用された分析機器は、例えば、ＮＭＲ分析のために、ＢＲＵＫＥＲ ４００ＭＨｚ又はＢＲＵＫＥＲ ５００ＭＨｚ機械（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｔｏｐｓｐｉｎ）であり、代替的に、ＢＲＵＫＥＲ ＡＶＡＮＣＥ ３００ＭＨｚ及び４００Ｍｈｚを使用した。ＬＣ／ＭＳ分析のために、例えば、Ａｇｉｌｅｎｔ １２９０ ｉｎｆｉｎｉｔｙ，Ｍａｓｓ：６１５０ ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）又はＡｇｉｌｅｎｔ １２００ ＳＥＲＩＥＳ，Ｍａｓｓ：６１３０ ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）を用いた。分析用ＨＰＬＣは、例えば、Ｗａｔｅｒｓ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｅｍｐｏｗｅｒ）、Ａｇｉｌｅｎｔ－１２００－ＥＬＳＤ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）、又はＡｇｉｌｅｎｔ－１２６０（Ｓｏｆｔｗａｒｅ ＯｐｅｎＬＡＢ）で測定した。分析的ＳＦＣを、例えば、ＰＩＣ溶液（Ｓｏｆｔｗａｒｅ：ＳＦＣ ＰＩＣＬＡＢ ＯＮＬＩＮＥ）、ＷＡＴＥＲＳ－Ｘ５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ ＭＡＳＳＬＹＮＸ）、又はＷＡＴＥＲＳ－ＵＰＣ２（Ｅｍｐｏｗｅｒ）で実施した。
【０１９７】
分取ＨＰＬＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ ２９９８（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｅｍｐｏｗｅｒ）又はＹＭＣ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｋ－Ｐｒｅｐ）で実施した。分取ＳＦＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－２００（Ｓｏｆｔｗａｒｅ Ｃｈｒｏｍｓｃｏｐｅ若しくはＳ

ｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－８０（Ｓｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、又はＰＩＣ、ＰＩＣ－１７５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｓ１０－１００）で実施した。

【０１９８】

立体中心を含む例示的な化合物の構造は、既知の場合、絶対立体化学で描き表され、命名される。未知の絶対立体化学の場合、化合物は、ラセミ、ジアステレオマーの混合物、未知の立体化学の純粋なジアステレオマー、又は未知の立体化学の純粋なエナンチオマーのいずれかであり得る。Ｄｉａ１及びＤｉａ２は、ジアステレオソマーが分離されたが、立体化学が不明であることを意味する。Ｅｎ１及びＥｎ２は、両方のエナンチオマーが分離されたが、絶対配置が不明であることを意味する。化合物の化学名が正確な立体化学を特定しない限り、化合物コードの後に接尾辞が付されていない場合は、それぞれ、立体中心を含む化合物がラセミ混合物又はジアステレオマーの混合物として得られたことを意味する。

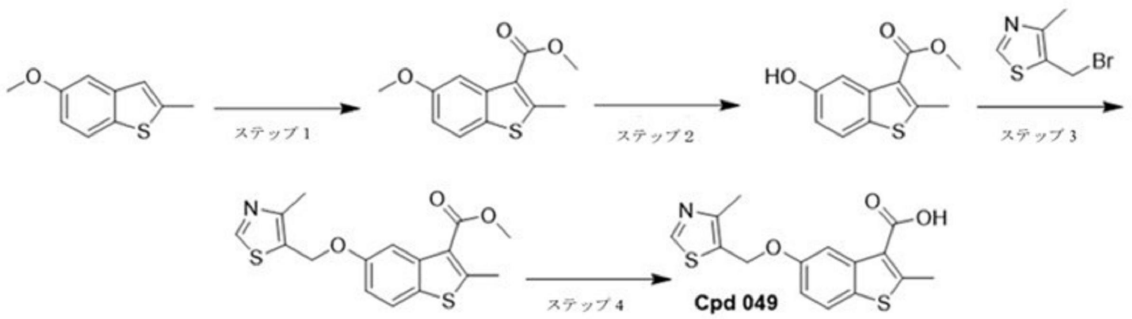
【０１９９】

実験部分で言及したＬＣ／ＭＳ分析は、ＥＳＩモードの質量分析計Ｗａｔｅｒｓ　３１００質量検出器に接続されたＡｌｌｉａｎｃｅ　Ｗａｔｅｒｓ　ＨＰＬＣ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計Ｍａｓｓ　ＳＱＤ　２検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計Ｍａｓｓ　Ｘｅｖｏ　ＴＱＳ検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で実施した。Ｃｏｌｕｍｎ　Ａｃｑｕｉｔｙ　ＢＥＨ（５０ｍｍ×２．１ｍｍ）１．７μｍを、水中の０．０５％ギ酸又は水中の０．０５％ＴＦＡの移動相Ａ、及びＭｅＣＮ中の０．０５％ギ酸又はＭｅＣＮ中の０．０５％ＴＦＡの移動相Ｂとともに使用した。又は、カラムＸ　ｂｒｉｄｇｅ　Ｃ１８（７５ｍｍ×４．６ｍｍ）３．５μｍを、水中の５ｍＭの重炭酸アンモニウムの移動相Ａ及びＭｅＣＮの移動相Ｂとともに使用した。

【０２００】

２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（化合物０４９）の合成。

【化１７】



ステップ１：ＤＣＭ（５００ｍｌ）中のＡｌＣｌ$_3$（７３．３ｇ、０．５５ｍｏｌ）の撹拌懸濁液に、ＤＣＭ（２７５ｍｌ、０．５５ｍｏｌ）中の塩化オキサリルの２Ｍ溶液を０℃で添加し、０℃で４５分間撹拌した。ＲＭに、ＤＣＭ（１００ｍｌ）中の５－メトキシ－２－メチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン（２０ｇ、０．１１ｍｏｌ）の溶液を０℃で滴加した。得られた懸濁液を室温で２時間撹拌した。出発物質の完成後に（ＴＬＣによって監視）、ＲＭを、砕いた氷に注ぎ、２つの層を分離した。水性部分をＤＣＭ（２×１５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を０℃でＭｅＯＨ（５００ｍｌ）に溶解させ、Ｋ$_2$ＣＯ$_3$（２２．８ｇ、０．１６ｍｏｌ）を添加した。ＲＭを、室温で１６時間更に撹拌し、減圧下で濃縮した。残渣を、ＤＣＭ（６００ｍｌ）に溶解させ、冷水（２００ｍｌ）、続いて、ブライン（２５０ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカ１００～２００及び１０％のＥＡヘキサンを使用）によって精

製して、５－メトキシ－２－メチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（１３．５ｇ、５０％）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ Ｍｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）ｄ［ｐｐｍ］：７．８３－７．８１（ｍ，２Ｈ），７．０４－７．０１（ｄｄ，１Ｈ），３．８９（ｓ，３Ｈ），３．８１（ｓ，３Ｈ），２．７７（ｓ，３Ｈ）。

【０２０１】

ステップ２：ＤＣＭ（５００ｍｌ）中の５－メトキシ－２－メチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（８ｇ、０．０３３ｍｏｌ）の撹拌溶液に、BBr_3（４９．５ｍｌ、０．０４９ｍｏｌ、ＤＣＭ中で１Ｍ）を０℃で滴加した。得られた溶液を、０℃で３０分間撹拌し、次いで、冷水でクエンチした。２つの層を分離し、水相をＤＣＭ（２×１５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２５０ｍｌ）、続いて、ブライン（２５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカ１００～２００及び２０％ＥＡ－ヘキサンを使用）によって精製して、５－ヒドロキシ－２－メチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（４ｇ、５３％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ Ｍｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）ｄ［ｐｐｍ］：９．５２（ｓ，１Ｈ），７．７２－７．６８（ｍ，２Ｈ），６．８７－６．８５（ｄｄ，１Ｈ），３．８７（ｓ，３Ｈ），２．７５（ｓ，３Ｈ）。

【０２０２】

ステップ３：ＴＨＦ（２５ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（１ｇ、０．００４４ｍｏｌ）の撹拌溶液に、Cs_2CO_3（２．９ｇ、０．００８８ｍｍｏｌ）及び５－ボモメチル－４－メチル－チアゾール（１．７２ｇ、０．００８８ｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、このパッドをＥｔＯＡｃで洗浄した。組み合わせた濾液を濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ、１５％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶離）によって精製し、２－メチル－５－（４－メチル－チアゾール－５－イルメトキシ）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸エチルエステル（８００ｍｇ、５３％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０２０３】

ステップ４：ＴＨＦ：ＭｅＯＨ：Ｈ２Ｏ（１：１：１、５０ｍｌ）中の２－メチル－５－（４－メチル－チアゾール－５－イルメトキシ）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸エチルエステル（１．３ｇ、３．８９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ（０．８１ｇ、１９．４５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。ＲＭを、０℃に冷却し、水中の$NaHSO_4$溶液で酸性化した。沈殿物を、濾過によって収集し、水で洗浄し、真空下で乾燥させて、２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（化合物０４９）（１ｇ、７２％）をオフホワイト色の固体として得た。

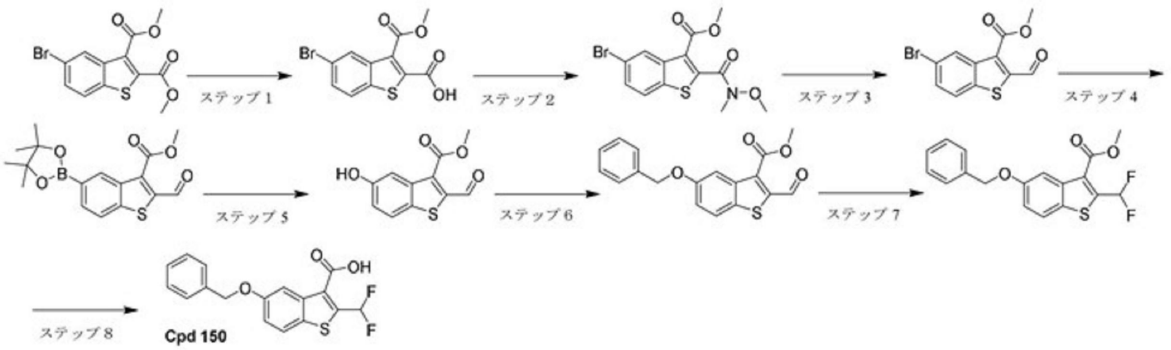
【０２０４】

以下の化合物を、化合物０４９について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物１０８及び化合物１０９。

【０２０５】

５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（化合物１５０）の合成。

【化１８】



ステップ１：ＴＨＦ：ＭｅＯＨ（４：１、３００ｍｌ）中の５－ブロモ－ベンゾ［ｂ］チオフェン－２，３－ジカルボン酸ジメチルエステル（３０ｇ、３．８９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１ＮのＮａＯＨ（１８０ｍｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。ＲＭを１ＮのＨＣｌ溶液で酸性化した。得られた酸性水溶液をＥｔＯＡｃ（２×５５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（６５０ｍｌ）及びブライン（６５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、５－ブロモ－ベンゾ［ｂ］チオフェン－２，３－ジカルボン酸３－メチルエステル（１５ｇ、３０％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　Ｍｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）ｄ［ｐｐｍ］：１４．１（ｂｓ，１Ｈ），８．１３－８．０７（ｍ，２Ｈ），７．７５－７．７３（ｄ，Ｊ＝７．６４　Ｈｚ，１Ｈ），３．９２（ｓ，３Ｈ）。

【０２０６】

ステップ２：ＴＨＦ（２４０ｍｌ）中の５－ブロモ－ベンゾ［ｂ］チオフェン－２，３－ジカルボン酸３－メチルエステル（１２ｇ、０．０３８ｍｏｌ）の撹拌懸濁液に、Ｏ，Ｎ－ジメチル－ヒドロキシルアミンヒドロクロリド（５．５６ｇ、０．０５７ｍｏｌ）、ＥＤＣ．ＨＣｌ（８．７４ｇ、０．０４５ｍｏｌ）、及びＨＯＢｔ（６．１６ｇ、０．０４５ｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１５分間撹拌し、続いて、ＴＥＡ（２１ｍｌ、０．１５２ｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、ＥｔＯＡｃで希釈し、水、$NaHCO_3$の飽和溶液、続いて、ＮＨ４Ｃｌの飽和溶液、及びブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗物を得た。粗化合物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュシリカゲル及び１０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサン溶離液）によって精製して、５－ブロモ－２－（メトキシ－メチル－カルバモイル）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（８ｇ、５８％）を白色の固体として得た。

【０２０７】

ステップ３：ＴＨＦ（４００ｍｌ）中の５－ブロモ－２－（メトキシ－メチル－カルバモイル）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（８ｇ、０．０２２ｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＢＡＬ－Ｈ（２７．５ｍｌ、０．０２７５ｍｏｌ、トルエン中で１Ｍ）を－７８℃で滴加した。ＲＭを－７８℃で３０分間撹拌した。ＲＭを飽和NH_4Cl溶液でクエンチした。得られた水溶液をＥｔＯＡｃ（２×５５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（６５０ｍｌ）及びブライン（３５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗物を得た。粗化合物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュシリカゲル及び１０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサン溶離液）によって精製して、５－ブロモ－２－ホルミル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（５．６ｇ、８４％）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　Ｍｚ，ＣＤＣｌ３）ｄ［ｐｐｍ］：１０．７（ｓ，１Ｈ），８．７０（ｓ，１Ｈ），７．７５－７．７３（ｄ，Ｊ＝８．６　Ｈｚ，１Ｈ），７．６３－７．６１（ｄ，Ｊ＝８．６　Ｈｚ，１Ｈ），４．０７（ｓ，３Ｈ）。

【０２０８】

ステップ４：ジオキサン（６０ｍｌ）中の５－ブロモ－２－ホルミル－ベンゾ［ｂ］チ

オフェン－３－カルボン酸メチルエステル（２．５ｇ、８．３５ｍｍｏｌ）の撹拌懸濁液に、ビス－ピナコラトジボラン（２．３ｇ、９．１８ｍｍｏｌ）、続いて、ＫＯＡｃ（２．４ｇ、２５．０５ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを、窒素で１０分間、次いで、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ２で脱気した。ＤＣＭ付加物（２０４ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを、１１０℃で加熱し、３時間撹拌した。ＲＭを、セライト床を通して濾過し、床をＥｔＯＡｃで洗浄した。全濾液を濃縮して、２－ホルミル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－［１，３，２］ジオキサボロラン－２－イル）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（２．８ｇ、粗物）を黒色の粘性物質として得た。粗物質をそのまま以後の反応に使用した。

【０２０９】

ステップ５：ＤＭＥ（５５ｍｌ）中の２－ホルミル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－［１，３，２］ジオキサボロラン－２－イル）－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（２．８ｇ、８．３５ｍｍｏｌ）の撹拌懸濁液に、粉末ＮａＯＨ（１．６ｇ、４１．７ｍｍｏｌ）、続いて、H_2O_2（２２ｍｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１時間撹拌した。ＲＭをＥｔＯＡｃ（２×１５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（１００ｍｌ）及びブライン（１００ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、２－ホルミル－５－ヒドロキシ－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（２．１ｇ、粗物）をオフホワイト色の固体として得た。

【０２１０】

ステップ６：ＴＨＦ（６０ｍｌ）中の２－ホルミル－５－ヒドロキシ－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（２．１ｇ、８．８９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Cs_2CO_3（５．７９ｇ、１７．７８ｍｏｌ）及び臭化ベンジル（３．０４ｇ、１７．７８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、このパッドをＥｔＯＡｃで洗浄した。全濾液を濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ、１０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶離）によって精製して、５－ベンジルオキシ－２－ホルミル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（８）（１．８ｇ、３ステップで６５％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　Ｍｚ，ＣＤＣｌ３）ｄ［ｐｐｍ］：１０．６７（ｓ，１Ｈ），８．０７（ｍ，１Ｈ），７．７４－７．７２（ｄ，Ｊ＝８．８８　Ｈｚ，１Ｈ），７．４９－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．４０－７．３８（ｔ，２Ｈ），７．３６－７．３４（ｍ，１Ｈ），７．２６－７．２３（ｍ，１Ｈ），５．１６（ｓ，２Ｈ），４．０４（ｓ，３Ｈ）。

【０２１１】

ステップ７：ＤＣＭ（３０ｍｌ）中の５－ベンジルオキシ－２－ホルミル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（１．８ｇ、５．１５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＡＳＴ（１．２４ｇ、７．７２ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを０℃で６時間撹拌した。ＲＭを飽和ＮａＨＣＯ３溶液でクエンチした。得られた水溶液をＤＣＭ（２×１５０ｍｌ）で抽出した。全有機部分を、水（１５０ｍｌ）及びブライン（１５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗物を得た。粗化合物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュシリカゲル及び１０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサン溶離液）によって精製して、５－ベンジルオキシ－２－ジフルオロメチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル（９）（１．１ｇ、５７％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　Ｍｚ，ＣＤＣｌ３）ｄ［ｐｐｍ］：８．０９（ｍ，１Ｈ），７．７４－７．７１（ｍ，１．３Ｈ），７．５７（ｍ，０．５Ｈ），７．４８－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．４３－７．３５（ｍ，２．３Ｈ），７．３５－７．３１（ｍ，１Ｈ），７．２０－７．１８（ｍ，１Ｈ），５．１６（ｓ，２Ｈ），３．９９（ｓ，３Ｈ）。

【０２１２】

ステップ８：ＴＨＦ：ＭｅＯＨ：Ｈ２Ｏ（１：１：１、３０ｍｌ）中の５－ベンジルオキシ－２－ジフルオロメチル－ベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸メチルエステル

（９）（１．１ｇ、３．１５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ（０．２６ｇ、６．３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを水中のＮａＨＳＯ$_4$溶液で酸性化した。沈殿物を、濾過によって収集し、水で洗浄し、真空下で乾燥させて、５－（ベンジルオキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（化合物１５０）（１ｇ、７２％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０２１３】

２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物０３１）の合成。

【化１９】



ステップ１：メチル－５－［（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ］ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（０．０９ｍｍｏｌ、３０ｍｇ、１．０当量）、ＨＡＴＵ（０．１９ｍｍｏｌ、７１ｍｇ、２．０当量）、及び２－アミノ－メチルプロパンアミドヒドロクロリド（３９ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ、３．０当量）を窒素雰囲気下でバイアルに秤量した。バイアルを密封し、続いて、ＤＭＦ（１．６ｍｌ）及びＤＩＰＥＡ（０．０８ｍｌ、５．０当量）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＤＣＭとＮａＨＣＯ$_3$の飽和溶液とを添加し、疎水性フリットを介して層を分離し、有機層を減圧下で蒸発させた。残渣を、逆相ＨＰＬＣを介して精製して、２２ｍｇ（５８％）の２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物０３１）を得た。

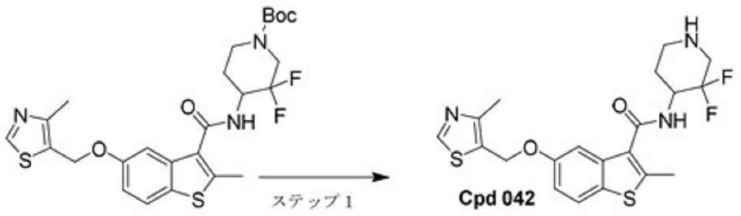
【０２１４】

以下の化合物を、化合物０３１について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００１、化合物００４、化合物００６、化合物００９、化合物０１２、化合物０１３、化合物０１４、化合物０２７、化合物０２８、化合物０２９、化合物０３０、化合物０３２、化合物０３３、化合物０３４、化合物０３５、化合物０３６、化合物０３７、化合物０３８、化合物０３９、化合物０４０、化合物０４１、化合物０４３、化合物０４４、化合物０４５、化合物０４６、化合物０４７、化合物０４８、化合物０５３、化合物０５８、化合物０６０、化合物０６２、化合物０６５、化合物０６７－Ｅｎ１、化合物０６７－Ｅｎ２、化合物０６８－Ｅｎ１、化合物０６８－Ｅｎ２、化合物０７３、化合物０７６、化合物０８０、化合物０８３、化合物０８９、化合物０９０、化合物０９１、化合物０９２、化合物０９４、化合物０９６、化合物０９７、化合物０９８、化合物０９９、化合物１００、化合物１０１、化合物１０２、化合物１０３、化合物１０４、化合物１０５、化合物１０６、化合物１０７、化合物１１１、化合物１１２、化合物１１３、化合物１１４、化合物１１５、化合物１１６、化合物１１７、化合物１１８、化合物１１９、化合物１２０、化合物１２１、化合物１２２、化合物１２３、化合物１２４、化合物１２５、化合物１２６、化合物１２８、化合物１２９、化合物１３０、化合物１３１、化合物１３４、化合物１３５、化合物１３６、化合物１３７、化合物１４５、化合物１４６、化合物１４７、化合物１４８、化合物１４９、化合物１５１、及び化合物１５２。

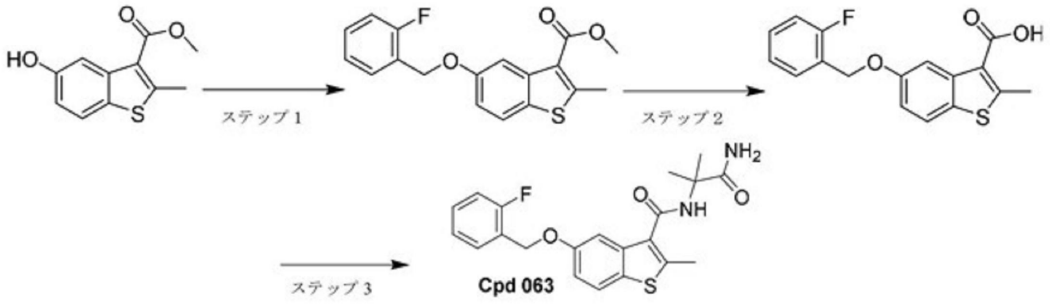
【０２１５】

Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミ

ド（化合物０４２）の合成。
【化２０】



ステップ１：ｔｅｒｔ－ブチル３，３－ジフルオロ－４－［［２－メチル－５－［（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ］ベンゾチオフェン－３－カルボニル］アミノ］ピペリジン－１－カルボキシレート［化合物０．３１について記載のプロトコルに基づいて合成］（０．１８７８ｍｍｏｌ、１０１ｍｇ、１．０当量、エナンチオマー１）を窒素雰囲気下でバイアルに秤量した。バイアルを密封し、ＤＣＭ（１．９ｍｌ）を添加した。混合物を０℃に冷却した。次いで、ＴＦＡ（０．０７ｍｌ、５．０当量）を添加し、混合物を周囲温度で１６時間撹拌した。次いで、反応混合物をＤＣＭで希釈し、続いて、飽和ＮａＨＣＯ３溶液を添加した。疎水性フリットを通して混合物を濾過し、有機層を減圧下で蒸発させた。残渣を、逆相ＨＰＬＣを介して精製して、１９ｍｇ（２３％）のＮ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド（化合物０４２）を得た。
【０２１６】
分取キラルＳＦＣを、化合物０４２のラセミ混合物上で行い、化合物０４２－Ｅｎ１及び化合物０４２－Ｅｎ２を得た。
【０２１７】
２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド（化合物０６３）の合成。
【化２１】



ステップ１：メチル５－ヒドロキシ－２－メチル－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレート［化合物０４９の合成に記載の合成手順］（２００ｍｇ、０．９０ｍｍｏｌ）及びＡＤＤＰ（１８１ｍｇ、０．７２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下でマイクロ波バイアルに秤量した。バイアルを密封し、続いて、ＴＨＦ（９．０ｍｌ）を添加した。ＲＭを窒素で脱気した。次いで、２－フルオロフェニル）メタノール（１７０ｍｇ、１．３５ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、Bu_3P（１．２６ｍｍｏｌ、２５５ｍｇ）を添加した。ＲＭを５分間撹拌した。白色の沈殿物が形成された。次いで、ＴＨＦ（０．５ｍｌ）中のＡＤＤＰ（４５ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを２時間撹拌した。次いで、混合物を飽和$NaHCO_3$溶液及びＥｔＯＡｃで希釈し、層を分離した。水層をＥｔＯＡｃで抽出し、組み合わせた有機層を、ブラインで洗浄し、ＭｇＳＯ４で乾燥させ、シリカゲルカラムを使用して精製して、２４０ｍｇ（８１％）の５－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボキシレートを得た。

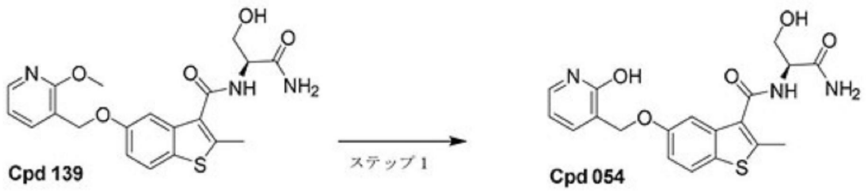
【０２１８】
ステップ２：メチル５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレート（２４０ｍｇ、０．７２６ｍｍｏｌ）に、ＭｅＯＨ（２．４ｍｌ）及び１，４－ジオキサン（１．２ｍｌ）を添加し、続いて、２ＭのＮａＯＨ溶液（２．７ｍｌ、５．４５ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを、室温で１６時間撹拌し、次いで、６０℃に２時間加熱した。ジオキサン（４Ｍ、１．４ｍｌ）中のＨＣｌを添加し、混合物を真空下で濃縮した。残渣に水を添加した。沈殿物を、濾過し、水で洗浄し、乾燥させて、２１０ｍｇ（９１％）の５－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸を得た。

【０２１９】
ステップ３：５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－ベンゾチオフェン－３－カルボン酸（０．２５ｍｍｏｌ、８０ｍｇ）、ＨＡＴＵ（０．６３ｍｍｏｌ、２４０ｍｇ）、及び２－アミノ－２－メチル－プロパンアミドヒドロクロリド（７０ｍｇ、０．５１ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下でバイアルに秤量した。バイアルを密封し、続いて、ＴＨＦ（２．５ｍｌ）及びＤＩＰＥＡ（０．１８ｍｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＤＣＭ及び飽和$NaHCO_3$を添加し、疎水性フリットを介して層を分離し、有機層を減圧下で蒸発させた。残渣を、シリカゲルクロマトグラフィーを介して精製して、８０ｍｇ（７９％）の２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）－２－メチルプロパンアミド（化合物０６３）を得た。

【０２２０】
以下の化合物を、化合物０６３について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００２、化合物００３、化合物００５、化合物００７、化合物００８、化合物０１１、化合物０１５－Ｅｎ１、化合物０１５－Ｅｎ２、化合物０１６、化合物０１７、化合物０１８、化合物０１９－Ｅｎ１、化合物０１９－Ｅｎ２、化合物０２０、化合物０２１、化合物０２２、化合物０２３、化合物０２４、化合物０２５、化合物０２６、化合物０５０、化合物０５１、化合物０５２、化合物０５５、化合物０５６、化合物０５７、化合物０５９、化合物０６１、化合物０６４、化合物０６９、化合物０７０、化合物０７１、化合物０７４、化合物０７５、化合物０７７、化合物０７８、化合物０８１、化合物０８２、化合物０８５、化合物０８６、化合物０８７、化合物０８８、化合物０９３、化合物０９５－Ｅｎ１、化合物０９５－Ｅｎ２、化合物１３２－Ｅｎ１、化合物１３２－Ｅｎ２、化合物１３３－Ｅｎ１、化合物１３３－Ｅｎ２、化合物１３８、化合物１３９、化合物１４０、化合物１４１、化合物１４２、化合物１４３、及び化合物１４４。

【０２２１】
（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物０５４）の合成。

【化２２】



ステップ１：Ｎ－［（１Ｓ）－２－アミノ－１－（ヒドロキシメチル）－２－オキソ－エチル］－５－［（２－メトキシ－３－ピリジル）メトキシ］－２－メチル－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド（化合物１３９）（０．０９６３ｍｍｏｌ、４０ｍｇ）及びＮａＩ（０．１９２６ｍｍｏｌ、２９ｍｇ）を窒素雰囲気下でバイアルに秤量した。バイ

アルを密封し、ＭｅＣＮ（１．０ｍｌ）を添加し、続いて、ＴＭＳＣｌ（０．０２ｍｌ、０．１９ｍｍｏｌ）を添加した。次いで、ＲＭを７０℃に１時間加熱し、次いで、室温で５日間撹拌した。得られた沈殿物を、濾過し、次いで、逆相ＨＰＬＣを介して精製して、７ｍｇ（１８％）の２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛５－［（２－ヒドロキシピリジン－３－イル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物０５４）を得た。

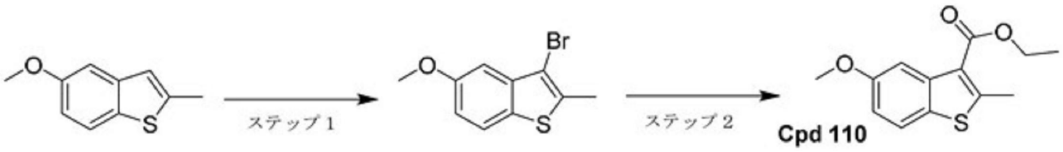
【０２２２】

以下の化合物を、化合物０５４について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０１０、化合物０６６、化合物０７２、化合物０７９、及び化合物０８４。

【０２２３】

エチル５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレート（化合物１１０）の合成。

【化２３】



ステップ１：クロロホルム（２４ｍｌ）中の５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン（２．１５ｇ、１２．０６ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下、－６０℃で、クロロホルム（５．４３ｍＬ、５．４３ｍｍｏｌ）中の臭素の１Ｍ溶液をゆっくりと添加した。ＲＭを１時間撹拌し、温度を－２０℃に上昇させ、次いで、ＲＭを亜ジチオン酸ナトリウムの飽和溶液でクエンチした。水相をＤＣＭで抽出し、組み合わせた有機物を、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。ヘプタン中のジクロロメタンの勾配（１０～３０％）を使用するシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによる精製によって、０．７８４ｇ（２５％）の予想される３－ブロモ－５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェンを白色の固体として与えた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（ＣＤＣｌ３，４００　ＭＨｚ）：ｄ（ｐｐｍ）７．５６（ｄ，１Ｈ）；７．１５（ｄ，１Ｈ）；６．９６（ｄｄ，１Ｈ）；３．９０（ｓ，３Ｈ）；２．５２（ｓ，３Ｈ）。

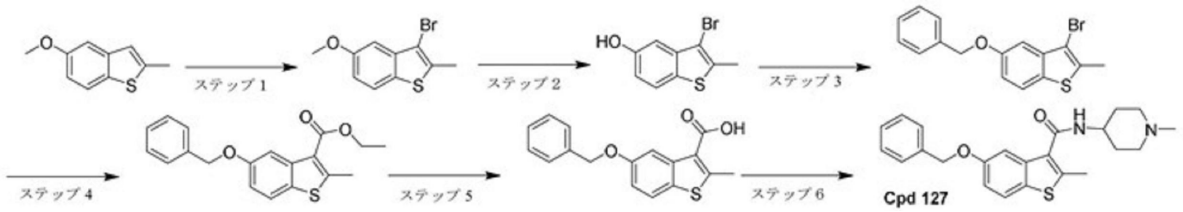
【０２２４】

ステップ２：ＴＨＦ（５ｍｌ）中の３－ブロモ－５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン（０．１２９ｇ、０．５ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下、－７８℃で、ｔｅｒｔ－ブチルリチウム（ペンタン中で１．６Ｍ、０．３２８ｍＬ；０．５２５ｍｍｏｌ）の溶液を滴加した。ＲＭを５分間撹拌し、次いで、クロロギ酸エチル（０．１４３ｍＬ、１．５ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを、室温まで温め、次いで、塩化アンモニウムの飽和溶液で加水分解した。ＲＭを酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機物層を、ブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。ヘプタン中のジクロロメタンの勾配（２０～８０％）を使用するシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによる精製によって、０．０８５ｇ（６８％）の５－メトキシ－２－メチル－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキシレート（化合物１１０）を無色の油として与えた。

【０２２５】

５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド（化合物１２７）の合成。

【化２４】



ステップ１：クロロホルム（２４ｍｌ）中の５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン（２．１５ｇ、１２．０６ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下、－６０℃で、クロロホルム（５．４３ｍＬ、５．４３ｍｍｏｌ）中の臭素の１Ｍ溶液をゆっくりと添加した。ＲＭを１時間撹拌し、温度を－２０℃に上昇させ、次いで、ＲＭを亜ジチオン酸ナトリウムの飽和溶液でクエンチした。水相をＤＣＭで抽出し、組み合わせた有機物を、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。ヘプタン中のジクロロメタンの勾配（１０～３０％）を使用するシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによる精製によって、０．７８４ｇ（２５％）の予想される３－ブロモ－５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェンを白色の固体として与えた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（ＣＤＣｌ３，４００　ＭＨｚ）：ｄ（ｐｐｍ）７．５６（ｄ，１Ｈ）；７．１５（ｄ，１Ｈ）；６．９６（ｄｄ，１Ｈ）；３．９０（ｓ，３Ｈ）；２．５２（ｓ，３Ｈ）。

【０２２６】

ステップ２：乾燥ＤＣＭ（２１ｍＬ）中の３－ブロモ－５－メトキシ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン（１．０８ｇ、４．２ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下、－７８℃で、ＤＣＭ中のBBr_3の１Ｍ溶液（１２．６ｍＬ、１２．６ｍｍｏｌ）を滴加した。ＲＭを、５時間撹拌し、室温まで上昇させ、次いで、塩化ナトリウムの飽和溶液をゆっくりと添加した。水相をＤＣＭで抽出し、組み合わせた有機物を、水で洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘプタン中のＤＣＭの勾配（２０～１００％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、０．７２４ｇ（７１％）の３－ブロモ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－５－オールを白色の固体として得た。

【０２２７】

ステップ３：３－ブロモ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－５－オール（０．８８０ｇ、３．６２ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（２７ｍｌ）溶液に、炭酸セシウム（２．３６ｇ、７．２４ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１０分間撹拌した。次いで、臭化ベンジル（０．８６０ｍｌ、７．２４ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを９５℃で３時間加熱した。室温への冷却後に、ＲＭを、濾過し、水（２５ｍｌ）で希釈し、ＥｔＯＡｃで抽出した。組み合わせた有機物を、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘプタン中のＤＣＭの勾配（０～７０％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、１．０６ｇ（８７％）の５－（ベンジルオキシ）－３－ブロモ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェンを白色の固体として得た。

【０２２８】

ステップ４：ＴＨＦ（１５ｍｌ）中の５－（ベンジルオキシ）－３－ブロモ－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン（１ｇ、３ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下、－７８℃で、ｔｅｒｔ－ブチルリチウム（ペンタン中で１．６Ｍ、１．９７ｍＬ；３．１５ｍｍｏｌ）の溶液を滴加した。ＲＭを、５分間撹拌し、次いで、クロロギ酸エチル（０．８５７ｍＬ、９ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを、室温まで温め、次いで、塩化アンモニウムの飽和溶液を添加した。ＲＭをＥｔＯＡｃで抽出し、組み合わせた有機物を、ブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ヘプタン中のＤＣＭの勾配（２０～１００％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、０．４２０ｇ（４３％）のエチル５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボキシレートを白色の固体として得た。

【０２２９】

ステップ５：混合物ＭｅＯＨ：ＥｔＯＨ（２：１）（３９ｍｌ）中のエチル５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボキシレート（０．４２０ｇ、１．２９ｍｍｏｌ）の懸濁液に、２ＮのＮａＯＨ溶液（１９．５ｍＬ、３９ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを９０℃に６時間加熱した。有機揮発物を減圧下で除去し、溶液をＨＣｌ溶液（２Ｎ）でｐＨ２まで酸性化した。沈殿物を、濾過し、ＥｔＯＡｃで溶解させ、濾液をＥｔＯＡｃで抽出した。組み合わせた有機物を、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、０．３ｇ（７８％）の５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸を白色の固体として得た。

【０２３０】

ステップ６：ＤＭＦ（１０ｍｌ）中の５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾ［ｂ］チオフェン－３－カルボン酸（０．２９９ｇ、１ｍｍｏｌ）と、ＣＯＭＵ（０．５１５ｇ、１．２ｍｍｏｌ）と、担持ジイソプロピルエチルアミン（充填＝３．５６ｍｍｏｌ／ｇ、０．８４３ｇ、３ｍｍｏｌ）との混合物を室温で１０分間撹拌した。次いで、１－メチルピペリジン－４－アミン（０．２５３ｍＬ、２ｍｍｏｌ）を添加し、ＲＭを１８時間撹拌した。ＲＭを、濾過し、ＥｔＯＡｃで洗浄し、濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、ＤＣＭ中のＭｅＯＨ中のアンモニア２Ｍ溶液の勾配（０～２５％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって、次いで、水中のＭｅＣＮの勾配（０～８０％）を使用する逆相クロマトグラフィーによって精製して、０．０９８ｇ（２４．８％）の５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾチオフェン－３－カルボキサミド（化合物１２７）の５合成を得た。

【表２２－１】

分析データ

化合物	[M+H]+(m/z)：	^{1}H NMR（δ ppm）
化合物 001	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.259（d，1H），7.765（d，1H），7.562（d，1H），7.510 -7.445（m，2H），7.426 -7.360（m，3H），7.360 -7.298（m，1H），7.032（dd，2H），5.177 -5.090（m，2H），4.592 -4.424（m，1H），2.607（s，3H），1.333（d，3H）.
化合物 002	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.283（d，1H），7.776（d，1H），7.615 -7.552（m，2H），7.426（ddd，2H），7.243（qd，2H），7.032（dd，1H），7.014（s，1H），5.169（q，2H），4.610 -4.440（m，1H），2.611（s，3H），1.334（d，3H）.
化合物 003	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.576（ddd，1H），8.261（d，1H），7.831（td，1H），7.782（d，1H），7.585 -7.533（m，2H），7.398（s，1H），7.345（ddd，1H），7.065（dd，1H），7.018（s，1H），5.284 -5.109（m，2H），4.499（p，1H），2.606（s，3H），1.329（d，3H）.
化合物 004	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.729（dd，1H），8.299 -8.235（m，2H），7.828 -7.746（m，2H），7.552（d，1H），7.403（s，1H），7.051（dd，1H），6.989（s，1H），5.369 -5.285（m，2H），4.556 -4.442（m，1H），2.616（s，3H），1.324（d，3H）.
化合物 005	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.274（d，1H），7.769（d，1H），7.713（s，1H），7.580（d，1H），7.428（s，1H），7.048 -6.983（m，2H），5.336（s，2H），4.546 -4.487（m，1H），2.625（s，3H），2.605（s，3H），1.339（d，3H）.
化合物 006	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.273（d，0H），7.023（dd，1H），5.375 -5.287（m，1H），4.523（p，0H），2.613（s，1H），2.425（s，1H），1.338（d，1H）.
化合物 007	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.282（d，1H），7.777（d，1H），7.616 -7.554（m，2H），7.462 -7.393（m，1H），7.407（s，1H），7.283 -7.205（m，2H），7.026（td，2H），5.188（d，1H），5.150（d，1H），4.513（p，1H），2.611（s，3H），1.334（d，3H）.
化合物 008	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.576（dt，1H），8.261（d，1H），7.831（td，1H），7.782（d，1H），7.579 -7.513（m，2H），7.398（s，1H），7.344（ddd，1H），7.065（dd，1H），7.017（s，1H），5.245 -5.160（m，2H），4.499（p，1H），2.605（s，3H），1.329（d，3H）.
化合物 009	-	1H NMR（600 MHz，CDCl3）d 8.653（dd，1H），8.177（d，1H），7.640（d，1H），7.561 -7.501（m，2H），7.032（dd，1H），6.460（d，1H），6.004（s，2H），5.408 -5.320（m，2H），4.784（p，1H），2.711（s，3H），1.535（d，3H）.

【表２２－２】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 010	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.262（d，1H），7.767（d，1H），7.580（dd，1H），7.476（d，1H），7.417 -7.328（m，2H），7.018（dd，1H），6.991（s，1H），6.216（t，1H），4.932 -4.849（m，2H），4.499（p，1H），2.615（s，3H），1.331（d，3H）.
化合物 011	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.274（d，1H），7.769（d，1H），7.713（s，1H），7.580（d，1H），7.428（s，1H），7.048 - 6.983（m，2H），5.335（s，2H），4.516（p，1H），2.625（s，3H），2.605（s，3H），1.339（d，3H）.
化合物 012	-	(DMSO-d6）:8.98（s，1H），8.29（d，1H），7.78（d，1H），7.57（d，1H），7.44（s，1H），7.04（d，1H），7.02（d，1H），5.38 5.29（m，2H），4.53（m,1H），2.62（s，3H），2.43（s，3H），1.35（d，3H）
化合物 013	475.4	-
化合物 014	406.4	-
化合物 015-En1	420	(400 MHz，DMSO）δ［ppm]:7.80-7.76（m，2H），7.61-7.60（d，1H），7.57（s，1H），7.27（bs，1H），7.17（bs，1H），7.04-7.02（m，1H），5.16-5.13（t，1H），5.10（s，2H），3.91-3.87（m，1H），3.81-3.77（m，1H），2.66（s，3H），2.61（s，3H），1.50（s，3H）.
化合物 015-En2	420	(400 MHz，DMSO）δ［ppm]:7.82-7.76（m，2H），7.60-7.57（m，2H），7.28（bs，1H），7.17（bs，1H），7.04-7.02（m，1H），5.19（m，1H），5.10（s，2H），3.90-3.87（m，1H），3.80-3.77（m，1H），2.65（s，3H），2.61（s，3H），1.50（s，3H）.
化合物 016	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.005（d，1H），7.781（d，1H），7.709（s，1H），7.653（d，1H），7.415（s，1H），7.140（s，1H），7.012（dd，1H），5.332（s，2H），4.980 -4.875（m，1H），4.545（ddd，1H），3.791 -3.690（m，2H），2.628（d，6H）.
化合物 017	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.011（d，1H），7.782（d，1H），7.709（s，1H），7.654（d，1H），7.420（s，1H），7.163 - 7.127（m，1H），7.012（dd，1H），5.349 -5.315（m，2H），4.940（dd，1H），4.545（ddd，1H），3.791 -3.680（m，2H），2.628（d，6H）.
化合物 018	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.116（s，1H），7.776（d，1H），7.709（s，1H），7.434（d，1H），7.121（s，1H），7.023（dt，2H），5.324（s，2H），2.626（s，3H），2.592（s，3H），1.520（s，6H）.
化合物 019-En1	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.777（d，2H），7.709（s，1H），7.585（d，1H），7.247（s，1H），7.142（s，1H），7.017（dd，1H），5.305（s，2H），5.122（s，1H），3.891（dd，1H），3.799（dd，1H），2.622（d，6H），1.514（s，3H）.

【表２２－３】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 019-En2	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.777（d，2H），7.709（s，1H），7.586（d，1H），7.195（d，2H），7.017（dd，1H），5.306（s，2H），5.122（t，1H），3.846（ddd，2H），2.622（d，6H），1.514（s，3H）.
化合物 020	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.654（s，1H），7.787（d，1H），7.703（s，1H），7.411（d，1H），7.135（s，1H），7.095 -7.007（m，2H），5.318（s，2H），4.186（d，1H），4.010（d，1H），3.925 -3.817（m，2H），2.614（d，6H），2.397 -2.309（m，2H）.
化合物 021	-	1H NMR（600 MHz，MeOD）d 8.151（q，1H），7.690（d，1H），7.505（d，1H），7.037（dd，1H），5.439（s，2H），3.896（dt，2H），3.775（ddd，2H），2.949 -2.911（m，3H），2.708（s，3H），2.275 -2.163（m，4H）.
化合物 022	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.434（s，1H），7.762（d，1H），7.699（s，1H），7.377（d，1H），7.016（dd，1H），5.322（s，2H），4.782（t，1H），3.607（d，2H），2.631（s，3H），2.550（s，3H），0.818 -0.723（m，4H）.
化合物 023	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.151（s，1H），7.764（d，1H），7.699（s，1H），7.415（d，1H），7.014（dd，1H），5.319（s，2H），4.896（t，1H），3.717（d，2H），2.626（s，3H），2.587（s，3H），2.286（tdd，2H），2.159（dddd，2H），1.877（dtt，1H），1.771（dp，1H）.
化合物 024	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.793 -7.733（m，2H），7.688（s，1H），7.406（d，1H），7.019（dd，1H），5.313（s，2H），4.907（td，1H），3.738 -3.669（m，4H），3.612（td，2H），2.626（s，3H），2.606（s，3H），2.179（dq，2H），1.619（ddd，2H）.
化合物 025	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.729（s，1H），7.785（d，1H），7.698（s，1H），7.428（d，1H），7.029（dd，1H），5.324（s，2H），5.223（t，1H），4.677（d，2H），4.565（d，2H），3.852（d，2H），2.620（d，6H）.
化合物 026	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 9.141（s，1H），7.802（d，1H），7.707（s，1H），7.485（d，1H），7.296（d，2H），7.051（dd，1H），5.352 -5.316（m，2H），4.910（d，2H），4.696（d，2H），2.657（s，3H），2.626（s，3H）.
化合物 027	-	(DMSO-d6)：8.99（s，1H），8.10（d，1H），7.80（d，1H），7.66（d，1H），7.44（s，1H），7.13（s，1H），7.03（dd，1H），5.33（d，2H），5.05（s，1H），4.64 4.47（m，1H），3.79 3.69（m，2H），2.65（s，3H），2.43（s，3H）
化合物 028	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.971（s，1H），8.487（d，1H），7.781（d，1H），7.598（d，1H），7.025（dd，1H），5.338（q，3H），4.786 -4.695（m，1H），3.523（q，2H），3.448（td，2H），3.187（dt，1H），2.611（s，4H），2.435（s，3H），2.359（d，1H），1.997 -1.891（m，1H）.

【表２２－４】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm)
化合物 029	-	(DMSO-d6)：8.99（s，1H)，8.03（d，1H)，7.80（d，1H)，7.66（d，1H)，7.42（s，1H)，7.20-7.13（m，1H)，7.03（dd，1H)，5.33（d，2H)，5.01-4.87（m，1H)，4.62-4.49（m，1H)，3.80-3.68（m，2H)，2.65（s，3H)，2.43（s，3H)
化合物 030	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.972（s，1H)，8.488（d，1H)，7.782（d，1H)，7.599（d，1H)，7.026（dd，1H)，5.388 - 5.289（m，2H)，4.744（dt，1H)，3.523（q，2H)，3.449（td，2H)，3.188（dt，1H)，2.611（s，3H)，2.436（s，3H)，2.384（s，4H).
化合物 031	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.973（s，1H)，8.100（s，1H)，7.782（d，1H)，7.442 -7.398（m，1H)，7.123（s，1H)，7.041（dd，1H)，6.991（s，1H)，5.321（s，2H)，2.600（s，3H)，2.422（s，3H)，1.518（s，6H).
化合物 032	-	(600 MHz，DMSO）d 8.977（s，1H)，7.771（d，1H)，7.472（d，1H)，7.414（s，1H)，7.018（dd，1H)，5.310（s，2H)，4.832（t，2H)，3.659（dd，2H)，3.608（dd，2H)，2.585（s，3H)，2.430（s，3H)，1.313（s，3H).
化合物 033	-	(600 MHz，DMSO）d 8.980（s，1H)，8.259（s，1H)，7.799（d，1H)，7.431（d，1H)，7.060（dd，1H)，7.030（s，2H)，5.309（s，2H)，3.792 -3.721（m，2H)，3.649（td，2H)，2.642（s，3H)，2.415（s，3H)，2.147 -2.076（m，2H)，2.005（ddd，2H).
化合物 034	-	(DMSO-d6)：8.99（s，1H)，8.44（s，1H)，7.77（d，1H)，7.38（d，1H)，7.03（dd，1H)，5.33（s，2H)，4.87-4.70（m，1H)，3.61（d，2H)，2.56（s，3H)，2.44（s，3H)，0.82-0.73（m，4H).
化合物 035	-	(600 MHz，DMSO）d 8.973（s，1H)，8.149（s，1H)，7.769（d，1H)，7.409（d，1H)，7.022（dd，1H)，5.318（s，2H)，4.883（tq，1H)，3.709（d，2H)，2.590（s，3H)，2.428（s，3H)，2.285（tdd，2H)，2.196 -2.114（m，2H)，1.873（dtt，1H)，1.771（qt，1H).
化合物 036	431.3	-
化合物 037	-	(600 MHz，DMSO）d 8.980（s，1H)，8.729（s，1H)，7.793（d，1H)，7.431（d，1H)，7.040（dd，1H)，5.327（s，2H)，4.681（d，2H)，4.563（d，2H)，3.852（s，2H)，2.620（s，3H)，2.431（s，3H).
化合物 038	-	(600 MHz，DMSO）d 9.145（s，1H)，8.977（s，1H)，7.809（d，1H)，7.476（d，1H)，7.291（d，2H)，7.063（dd，1H)，5.332（s，2H)，4.906（d，2H)，4.695（d，2H)，2.667（s，3H)，2.423（s，3H).
化合物 039	409.2	-
化合物 040	399.3	-

【表２２－５】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 041	402.3	-
化合物 042-En1	-	(600 MHz, DMSO) d 8.976 (s, 1H), 8.663 (d, 1H), 7.815 (d, 1H), 7.314 (d, 1H), 7.066 (dd, 1H), 5.306 (s, 2H), 4.743 (dd, 1H), 3.566 (s, 1H), 3.457 -3.324 (m, 1H), 3.185 (d, 1H), 3.058 -2.954 (m, 1H), 2.587 (s, 3H), 2.418 (s, 3H), 2.011 (d, 1H), 1.935 -1.806 (m, 1H).
化合物 042-En2	-	(600 MHz, DMSO) d 8.971 (s, 1H), 8.528 (d, 1H), 7.797 (d, 1H), 7.326 (d, 1H), 7.046 (dd, 1H), 5.301 (s, 2H), 4.504 (dd, 1H), 3.118 (s, 1H), 2.926 (d, 1H), 2.853 (dd, 1H), 2.670 -2.601 (m, 1H), 2.581 (s, 3H), 2.415 (s, 3H), 1.816 (d, 1H), 1.686 (dd, 1H).
化合物 043	389.2	(400 MHz, DMSO) d 8.97 (s, 1H), 8.51 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.01 (dd, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.50-4.49 (m, 1H), 3.90-3.80 (m, 2H), 3.74 (dt, 1H),3.63 (dd, 1H), 2.56 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.20-2.15 (m, 1H), 1.93-1.90 (m, 1H).
化合物 044	460.3	(400 MHz, DMSO) d 8.98 (s, 1H), 7.95 (m, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.54 (m, 4H), 2.66 (s, 3H), 2.56-2.50 (m, 4H), 2.66 (s, 3H), 1.03 (s, 6H)).
化合物 045	391.3	-
化合物 046	416.3	-
化合物 047	426.2	1H NMR (400 MHz, DMSO) d 11.59 (s, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.73 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.336 (d, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.23-6.14 (m, 2H), 5.31 (s, 2H), 4.36 (d, 2H), 2.66 (s, 3H), 2.33 (s, 3H).
化合物 048	432.2	-
化合物 049	320	(400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:13.0 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.83-7.81 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.09-7.06 (dd, 1H), 5.35 (s, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.44 (s, 3H).
化合物 050	-	1H NMR (600 MHz, DMSO) d 7.969 (d, 1H), 7.742 (d, 1H), 7.469 (d, 1H), 7.391 (s, 1H), 7.111 (s, 1H), 6.961 (dd, 1H), 4.956 -4.899 (m, 1H), 4.516 (ddd, 1H), 3.883 -3.799 (m, 2H), 3.780 -3.661 (m, 2H), 2.621 (s, 3H), 1.319 -1.169 (m, 1H), 0.639 -0.507 (m, 2H), 0.393 -0.265 (m, 2H).
化合物 051	-	1H NMR (600 MHz, DMSO) d 8.030 (d, 1H), 7.786 (d, 1H), 7.673 (d, 1H), 7.586 (td, 1H), 7.464 -7.387 (m, 2H), 7.283 -7.206 (m, 2H), 7.147 -7.112 (m, 1H), 7.033 (dd, 1H), 5.200 -5.121 (m, 2H), 4.541 (ddd, 1H), 3.789 -3.675 (m, 2H), 2.636 (s, 3H).

【表２２－６】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 052	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.577（dd，1H），8.014（d，1H），7.834（td，1H），7.792（d，1H），7.641（d，1H），7.562（d，1H），7.398（s，1H），7.347（dd，1H），7.132（s，1H），7.069（dd，1H），5.198（s，2H），4.531（dt，1H），3.730（dq，2H），2.632（s，3H）.
化合物 053	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.734（dd，1H），8.287 -8.237（m，1H），8.026（d，1H），7.836 -7.749（m，2H），7.646（d，1H），7.399（s，1H），7.109（s，1H），7.046（dd，1H），5.315（s，2H），4.943 -4.888（m，1H），4.530（ddd，1H），3.780 -3.668（m，2H），2.645（s，3H）.
化合物 054	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.010（d，1H），7.776（d，1H），7.604 -7.573（m，1H），7.562（d，1H），7.423 -7.352（m，2H），7.105（s，1H），7.019（dd，1H），6.219（t，1H），4.888（d，2H），4.530（ddd，1H），3.820 -3.624（m，2H），2.641（s，3H）.
化合物 055	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.491（d，1H），7.783（d，1H），7.622 -7.560（m，2H），7.425（tdd，1H），7.282 -7.206（m，2H），7.041（dd，1H），5.217 -5.133（m，2H），4.740（dd，1H），4.699（ddd，1H），3.519（q，2H），3.483 -3.381（m，1H），3.400（s，2H），3.178（dt，1H），2.613（s，3H），2.414 -2.331（m，1H），1.952（dq，1H）.
化合物 056	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.031（d，1H），7.786（d，1H），7.674（d，1H），7.586（td，1H），7.425（dddd，2H），7.283 -7.207（m，2H），7.130（s，1H），7.033（dd，1H），5.200 -5.122（m，2H），4.542（ddd，1H），3.734（dtd，2H），2.637（s，3H）.
化合物 057	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.577（dd，1H），8.012（d，1H），7.834（td，1H），7.792（d，1H），7.641（d，1H），7.562（d，1H），7.398（s，1H），7.347（dd，1H），7.132（s，1H），5.198（s，2H），4.937（t，1H），4.531（dt，1H），3.787 -3.673（m，2H），2.632（s，3H），0.793（s，1H）.
化合物 058	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.735（dd，1H），8.288 -8.238（m，1H），8.026（d，1H），7.813（d，1H），7.777（dd，1H），7.647（d，1H），7.416 -7.381（m，1H），7.109（s，1H），7.047（dd，1H），5.315（d，2H），4.914（t，1H），4.529（d，1H），3.783 -3.667（m，2H），2.645（s，3H）.
化合物 059	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.491（d，1H），7.782（d，1H），7.622 -7.559（m，2H），7.424（tdd，1H），7.282 -7.206（m，2H），7.041（dd，1H），5.216 -5.132（m，2H），4.732（d，1H），4.696（s，1H），3.519（q，2H），3.483 -3.364（m，3H），3.177（dt，1H），2.613（s，3H），2.372（dddd，1H），1.951（dq，1H）.

【表２２－７】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 061	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.091（s，1H），7.739（d，1H），7.319（d，1H），7.107（s，1H），6.963（dd，2H），3.836（d，2H），2.591（s，3H），1.513（s，6H），1.300 -1.188（m，1H），0.574（dd，2H），0.368 -0.313（m，2H）.
化合物 062	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.098（s，1H），7.767（d，1H），7.503 -7.439（m，2H），7.420（d，1H），7.419 -7.356（m，2H），7.356 -7.297（m，1H），7.110（s，1H），7.043（dd，1H），7.004（s，1H），5.129（s，2H），2.589（s，3H），1.505（s，6H）.
化合物 063	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.116（s，1H），7.781（d，1H），7.572（td，1H），7.458 -7.385（m，2H），7.280 -7.200（m，2H），7.114（s，1H），7.050（dd，1H），6.987（s，1H），5.167（s，2H），2.595（s，3H），1.508（s，6H）.
化合物 064	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.572（d，1H），8.100（s，1H），7.858 -7.805（m，1H），7.786（dd，1H），7.539（d，1H），7.421（t，1H），7.370 -7.315（m，1H），7.120 -7.047（m，2H），6.996（s，1H），5.204（d，2H），2.588（d，3H），1.500（d，6H）.
化合物 065	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.727（dd，1H），8.247（dd，1H），8.100（s，1H），7.814（d，1H），7.773（dd，1H），7.420（d，1H），7.106（s，1H），7.072（dd，1H），6.967（s，1H），5.331（d，2H），2.600（s，3H），1.493（s，6H）.
化合物 066	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.104（s，1H），7.770（d，1H），7.564（dd，1H），7.417 -7.332（m，2H），7.107（s，1H），7.027（dd，1H），6.954（s，1H），6.213（d，1H），4.898（s，2H），2.594（s，3H），1.501（s，7H）.
化合物 067-En1	407.2	(400 MHz，DMSO-d6）δ［ppm]:7.76-7.74（d，1H），7.48-7.47（d,1H），7.26-7.16（m，2H），6.97-6.94（d，1H），5.11（bs，1H），3.87-3.78（m，5H），3.31（m，1H），2.67（s，3H），2.03-2.02（m，1H），1.70-1.67（m，2H），1.34（s，3H），1.124-1.23（m，3H）.
化合物 067-En2	407.2	(400 MHz，DMSO-d6）δ［ppm]:7.76-7.74（d，1H），7.48-7.47（d,1H），7.26-7.16（m，2H），6.97-6.94（d，1H），5.11（bs，1H），3.87-3.78（m，5H），3.31（m，1H），2.67（s，3H），2.03-2.02（m，1H），1.70-1.67（m，2H），1.34（s，3H），1.124-1.23（m，3H）
化合物 068-En1	377.2	(400 MHz，DMSO-d6）δ［ppm]:7.78-7.75（d，2H），7.53（s,1H），7.27（bs，1H），7.17（bs，1H），6.99-6.97（d，1H），5.14-5.12（t，1H），4.73-4.69（m，2H），4.44-4.41（t，2H），4.21-420（d，2H），3.90-3.77（m，2H），3.38（m，1H），2.61（s，3H），1.50（s，3H）.

【表２２－８】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm)
化合物 068-En2	377.1	(400 MHz, DMSO-d6) δ［ppm]:7.81-7.75（d, 2H), 7.51（s,1H), 7.28（s, 1H), 7.17(s, 1H), 6.99-6.97（d, 1H), 5.14-5.12（t, 1H), 4.73-4.69（m, 2H), 4.44-4.41（t, 2H), 4.21-420（d, 2H), 3.90-3.77（m, 2H), 3.38（m, 1H), 2.61（s, 3H), 1.50（s, 3H).
化合物 069	-	1H NMR（DMSO-d6）:7.74（d, 1H), 7.38（s, 1H), 7.37（d,1H), 6.96（dd, 1H), 4.94-4.78（m, 2H), 3.84（d, 2H), 3.66（dd, 2H), 3.61（dd, 2H), 2.58（s, 3H), 1.32（s, 3H), 1.30-1.20（m, 1H), 0.64-0.54（m, 2H), 0.40-0.25（m, 2H)
化合物 070	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.277（s, 1H), 7.796（d, 1H), 7.579（d, 1H), 7.460（d, 1H), 7.427（tdd, 1H), 7.287 - 7.209（m, 2H), 7.061（dd, 1H), 7.035（s, 2H), 5.156（s, 2H), 3.783 -3.717（m, 2H), 3.641（td, 2H), 2.638（s, 3H), 2.144 -2.075（m, 2H), 2.002（ddd, 2H).
化合物 071	-	1H NMR（DMSO-d6）:8.59（d, 1H), 8.27（s, 1H), 7.84（td, 1H), 7.81（d, 1H), 7.55（d, 1H), 7.45（d, 1H), 7.36（dd, 1H), 7.09（dd, 1H), 7.04（s, 1H), 5.20（s, 2H), 3.80 3.70（m, 2H), 3.64（s, 2H), 2.64（s, 3H), 2.11（d, 1H), 2.01（d, 2H)
化合物 072	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.662（s, 1H), 7.784（d, 1H), 7.570（dd, 1H), 7.398 -7.340（m, 2H), 7.030（dd, 1H), 6.218（t, 1H), 4.870（s, 2H), 3.776 -3.719（m, 2H), 3.661 -3.585（m, 2H), 2.625（s, 3H), 2.140 -1.920（m, 4H).
化合物 073	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.429（s, 1H), 7.754（d, 1H), 7.522 -7.442（m, 2H), 7.432 -7.359（m, 3H), 7.359 - 7.300（m, 1H), 7.033（dd, 1H), 5.126（s, 2H), 4.804 -4.738（m, 1H), 3.600（d, 2H), 2.546（s, 3H), 0.755（d, 4H).
化合物 074	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.447（s, 1H), 7.768（d, 1H), 7.572（td, 1H), 7.462 -7.366（m, 2H), 7.285 -7.205（m, 2H), 7.037（dd, 1H), 5.166（s, 2H), 4.768（t, 1H), 3.600（d, 2H), 2.552（s, 3H), 0.806 -0.709（m, 4H).
化合物 075	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.580（ddd, 1H), 8.430（s, 1H), 7.828（td, 1H), 7.768（d, 1H), 7.536（dt, 1H), 7.380 - 7.318（m, 2H), 7.061（dd, 1H), 5.204（s, 2H), 4.774（d, 1H), 3.596（d, 2H), 2.544（s, 3H), 0.848 -0.660（m, 4H).
化合物 076	-	1H NMR（600 MHz, DMSO）d 8.730（dd, 1H), 8.452（s, 1H), 8.244（dd, 1H), 7.824 -7.745（m, 2H), 7.341（d, 1H), 7.057（dd, 1H), 5.324（s, 2H), 4.749（tt, 1H), 3.589（d, 2H), 2.556（s, 3H), 0.880 -0.649（m, 4H).

【表２２－９】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 077	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.163（s，1H），7.771（d，1H），7.574（td，1H），7.459 -7.386（m，2H），7.280 -7.201（m，2H），7.038（dd，1H），5.166（s，2H），4.871（td，1H），3.703（d，2H），2.588（s，3H），2.273（tdd，2H），2.157（dddd，2H），1.921 -1.821（m，1H），1.765（dt，1H）.
化合物 078	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.572（ddd，1H），8.147（s，1H），7.825（td，1H），7.771（d，1H），7.537（d，1H），7.394（d，1H），7.342（ddd，1H），7.061（dd，1H），5.201（s，2H），4.878（tq，1H），3.692（d，2H），2.577（s，3H），2.253（tdd，2H），2.153（dddd，2H），1.939 -1.709（m，2H）.
化合物 080	412.3	(400 MHz，DMSO）d 7.78-7.76（m，2H），7.47 -7.33（m，6H),7.03（d，1H），5.12（s，2H），4.92（t，1H），3.71-3.57（m，6H），2.59（s，3H），2.16（d，2H），1.60（t，2H）.
化合物 081	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.799 -7.738（m，2H），7.567（td，1H），7.459 -7.387（m，2H），7.280 -7.203（m，2H），7.039（dd，1H），5.160（s，2H），4.891（t，1H），3.733 -3.656（m，4H），3.607（td，2H），2.607（s，3H），2.171（dd，2H），1.620（ddd，2H）.
化合物 082	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.578（dd，1H），7.829（td，1H），7.777（d，1H），7.744（s，1H），7.535（d，1H），7.386（d，1H），7.346（dd，1H），7.063（dd，1H），5.197（s，2H），3.695（dt，2H），3.664（s，2H），3.602（qd，2H），2.597（s，3H），2.156（d，2H），1.621（ddd，2H）.
化合物 083	481.3	(400 MHz，DMSO）d 8.72（d，1H），8.25（d，1H）；7.82-7.76（m，3H），7.38（s，1H),7.05（d，1H），5.32（s，2H），4.88（t，1H），3.70-3.55（m，6H），2.61（s，3H），2.17（d，2H），1.60（t，2H）.
化合物 085	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.737（s，1H），7.790（d，1H），7.575（td，1H），7.465 -7.389（m，2H），7.282 -7.204（m，2H），7.050（dd，1H），5.210（td，1H），5.167（s，2H），4.669（d，2H），4.561（d，2H），3.840（d，2H），2.614（s，3H）.
化合物 086	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.721（s，1H），8.599 -8.553（m，1H），7.828（td，1H），7.787（d，1H），7.569 -7.519（m，1H），7.419（d，1H），7.344（ddd，1H），7.074（dd，1H），5.238（tq，1H），5.204（s，2H），4.657（d，2H），4.564（d，2H），3.827（d，2H），2.601（s，3H）.
化合物 087	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 9.150（s，1H），7.808（d，1H），7.583（td，1H），7.507（d，1H），7.425（tdd，1H），7.316 -7.207（m，4H），7.071（dd，1H），5.174（s，2H），4.904（d，2H），4.687（d，2H），2.662（s，3H）.

【表２２－１０】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm)
化合物 088	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 9.142（s，1H），8.574（ddd，1H），7.831（td，1H），7.805（d，1H），7.554（dd，1H），7.495（d，1H），7.344（ddd，1H），7.293（s，1H），7.258（s，1H），7.091（dd，1H），5.212（s，2H），4.902（d，2H），4.676（d，2H），2.648（s，3H).
化合物 089	388.2	(400 MHz，DMSO）d 8.75（d，1H），7.80（d，1H）；7.47-7.32（m，6H),7.05（dd，1H），5.13（s，2H），4.30（t，1H），3.02-2.97（m，2H），2.75-2.67（m，2H），2,59（s，3H).
化合物 090	457.2	-
化合物 091	378.4	-
化合物 092	447.3	-
化合物 093	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.457（d，1H），7.857（s，1H），7.783（d，1H），7.642 -7.559（m，2H），7.463 -7.391（m，1H），7.283 -7.207（m，2H），7.035（dd，1H），5.218 -5.131（m，2H），4.650（dt，1H），3.239（d，1H），2.614（s，3H），2.393（dddd，1H），2.010（ddt，1H).
化合物 094	450.3	-
化合物 095-En1	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.683（d，1H），7.816（d，1H），7.564（td，1H），7.427（tdd，1H），7.343（d，1H），7.296 -7.192（m，2H），7.074（dd，1H），5.147（d，2H），4.795 -4.696（m，1H），3.582（s，1H），3.407（dd，1H），3.195（d，1H），3.018（t，1H），2.587（s，3H），2.539（s，1H），2.015（d，1H），1.944 -1.815（m，1H).
化合物 095-En2	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.752（d，1H），7.821（d，1H），7.564（td，1H），7.426（ddd，1H），7.339（d，1H），7.311 -7.175（m，2H），7.080（dd，1H），5.200 -5.098（m，2H），4.849（d，1H），3.788（s，1H），3.657（dd，1H），3.198（td，1H），2.590（s，3H），2.152 -2.064（m，1H），2.041 -1.911（m，1H).
化合物 096	368.2	(400 MHz，DMSO）d 8.52（d，1H），7.78（d，1H）；7.46-7.29（m，6H),7.05（dd，1H），5.13（s，2H），4.49（t，1H），3.96-3.81（m，2H），3.76-3.72（m，1H），3.70-3.61（m，1H），2.56（s，3H），2.19-2.14(m，1H），1.93-1.88（m，1H).
化合物 097	437.2	(400 MHz，DMSO）d 8.72（d，1H），8.52（d，1H），8.24（d，1H），7.82（d，1H），7.77（dd，1H），7.29（d，1H),7.07（dd，1H），5.32（s，2H），4.48（t，1H），3.89-3.3.75（m，2H），3.74-3.73（m，1H），3.72-3.61（m，1H），2.56（s，3H），2.16-2.14(m，1H），1.91-1.85（m，1H).
化合物 098	439.4	-
化合物 099	508.3	-

【表２２－１１】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm)
化合物 100	470.3	(400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:8.13 (t, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.46 (d, 2H), 7.41-7.33 (m, 4H), 7.04 (dd, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.52 (s, 1H), 3.30-3.26 (m, 2H) 2.59 (s, 3H), 1.16 (s, 6H).
化合物 101	439.3	-
化合物 102	395.2	-
化合物 103	464.3	-
化合物 104	405.2	-
化合物 105	474.2	-
化合物 106	411.3	-
化合物 107	480.3	-
化合物 108	-	(400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:12.99 (bs, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.82-7.80 (d, J = 8.8Hz, 1H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.39-7.37 (d, J = 7.56 Hz, 2H), 7.33-7.31 (m, 1H), 7.10-7.07 (dd, 1H), 5.14 (s, 2H), 2.77 (s, 3H).
化合物 109	368.3	400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:13.0 (s, 1H), 8.73-8.72 (d, J = 4.44 Hz, 1H), 8.26-8.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.96 (m, 1H), 7.86-7.84 (d, J = 8.76 Hz, 1H), 7.78-7.75 (m, 1H), 7.13-7.10 (dd 1H), 5.35 (s, 2H), 2.78 (s, 3H).
化合物 111	423.3	-
化合物 112	459.4	-
化合物 113	492.3	-
化合物 114	444.3	-
化合物 115	369.3	-
化合物 116	405.4	(400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:8.61 (t, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.63-7.7.26 (m, 8H), 5.16 (s, 2H), 3.45-3.42 (m, 2H), 2.46-2.42 (m, 2H),2.22 (s, 6H).
化合物 117	438.3	(400 Mz, DMSO-d6) d [ppm]:8.73 (d, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.18 (t, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.06 (dd 1H), 5.31 (s, 2H),3.38 (q, 2H), 2.58 (s, 3H).2.41 (t, 2H), 2.18 (s, 6H).
化合物 118	390.3	-
化合物 119	453.3	-
化合物 120	417.4	-
化合物 121	486.3	-
化合物 122	438.4	-
化合物 123	381.3	-
化合物 124	417.4	-
化合物 125	450.3	-

【表２２－１２】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm）
化合物 126	402.3	1H NMR（400 MHz，DMSO）d 8.98（s，1H），8.41（d，1H），7.78（d，1H），7.30（d，1H），7.02（dd，1H），5.33（s，2H），4.41-4.40（m，1H），2.76（dt，1H），2.57-2.54（m，4H），2.46-2.33（m，5H），2.25（s，3H），2.20-2.16（m，1H），1.76-1.71（m，1H）.
化合物 128	431.4	-
化合物 129	462.4	-
化合物 130	416.3	-
化合物 131	414.3	-
化合物 132-En1	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.816 -7.749（m，2H），7.711（s，1H），7.635（q，1H），7.558（d，1H），7.022（dd，1H），5.317（s，2H），5.133（td，1H），3.831（dd，1H），3.760（dd，1H），2.639（dd，9H），1.502（s，3H）.
化合物 132-En2	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 7.816 -7.750（m，2H），7.712（s，1H），7.635（q，1H），7.558（d，1H），7.022（dd，1H），5.317（s，2H），5.133（tq，1H），3.832（dd，1H），3.760（dd，1H），2.639（dd，9H），1.502（s，3H）.
化合物 133-En2	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.617（s，1H），7.749（d，1H），7.665（s，1H），7.522（q，1H），7.358（d，1H），7.001（dd，1H），5.292（s，2H），4.131（d，1H），3.972（d，1H），3.902 -3.783（m，2H），2.476 -2.444（m，5H），2.384（s，0H），2.305（t，2H）.
化合物 134	312.2	-
化合物 135	348.3	-
化合物 136	381.3	-
化合物 137	333.3	-
化合物 138	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.260（d，1H），8.156（dd，1H），7.824（dd，1H），7.771（d，1H），7.522（d，1H），7.397（s，1H），7.051 -7.005（m，2H），6.995（s，1H），5.118 -5.037（m，2H），4.504（t，1H），3.927（s，3H），2.616（s，3H），1.329（d，3H）.
化合物 139	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.159（dd，1H），8.011（d，1H），7.829（dd，1H），7.780（d，1H），7.609（d，1H），7.398（s，1H），7.112（s，1H），7.064 -6.993（m，2H），5.110 -5.033（m，2H），4.919（dd，1H），4.535（ddd，1H），3.924（s，3H），3.790 -3.670（m，2H），2.642（s，3H）.
化合物 140	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.261（d，1H），8.154（dd，1H），7.821（dd，1H），7.769（d，1H），7.517（d，1H），7.400（s，1H），7.053 -6.991（m，2H），6.993（s，1H），5.116 -5.035（m，2H），4.501（p，1H），3.924（s，3H），2.613（s，3H），1.328（d，3H）.

【表２２－１３】

化合物	[M+H]+(m/z)：	1H NMR（δ ppm)
化合物 141	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.152（dd，1H），8.092（s，1H），7.826 -7.752（m，2H），7.399（d，1H），7.105（s，1H），7.030（ddd，2H），6.970（s，1H），5.079（s，2H），3.926（s，3H），2.597（s，3H），1.492（s，6H).
化合物 144	-	1H NMR（600 MHz，DMSO）d 8.153（dd，1H），7.821 -7.730（m，3H），7.378（d，1H），7.026（ddd，2H），5.076（s，2H），4.865（s，1H），3.926（s，3H），3.695（dt，2H），3.665（d，2H），3.592（td，2H），2.607（s，3H），2.190 -2.126（m，2H），1.620（ddd，2H).
化合物 145	424.3	-
化合物 146	417.3	-
化合物 147	404.3	(400 Mz，DMSO-d6）d［ppm]:8.92（d，1H），8.02（d，1H），7.55-7.27（m，8H），5.18（s，2H），4.49（s，1H），3.90-3.76（m，2H），3.75-3.65（m，2H），2.22-2.14（m，1H),1.92-1.88（m，1H).
化合物 148	431.3	-
化合物 149	447.3	-
化合物 150	333.2	(400 Mz，CDCl3）d［ppm]:14.03（bs，1H），8.13（m，1H），8.03-8.01（m，1H），7.97-7.7（m，1H），7.50-7.49（m，2H），7.41-7.38（m，2H），7.35-7.31（m，1H），7.28-7.26（m，1H），5.18（s，2H).
化合物 151	441.3	-
化合物 152	448.4	-

【０２３１】

【表２３】

キラル分析データ

キラル SFC 分析						
化合物	カラム名	共溶媒	共溶媒%	流量[g/分]	RT[分]	*純度[%]*
化合物 067-En1	C-アミロース A	EtOH 中の 0.5%IPAmine	40	2	8.74	>99.9
化合物 067-En2	C-アミロース A	EtOH 中の 0.5%IPAmine	40	2	11.1	>99.9
化合物 068-En1	C-アミロース A	IPA 中の 0.5%IPAmine	40	2	3.38	>99.9
化合物 068-En2	C-アミロース A	IPA 中の 0.5%IPAmine	40	2	3.91	99.2

【０２３２】

パートＢ

ＴＲＰＭ３イオンチャネル駆動型Ｃａ$^{2+}$取り込みのモニタリング

本発明の化合物によるマウスＴＲＰＭ３α２（ｍＴＲＰＭ３）イオンチャネルの阻害を監視するために、ｍＴＲＰＭ３ａｌｐｈａ２又はｈＴＲＰＭ３過剰発現細胞株（フリップインＨＥＫ２９３）を使用する細胞系を使用した。ＴＲＰＭ３チャネルを、Ca^{2+}流入をもたらす硫酸プレグネノロン（ＰＳ）（５０μＭ）で刺激した／開口した。

【０２３３】

ｍＴＲＰＭ３について、細胞内Ca^{2+}を、カルシウム応答性染料、Ｆｌｕｏｒ－４ＡＭエステル（Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ）で測定した。細胞を８０～９０％のコンフルエンスまで培養し、Ｖｅｒｓｅｎｅ（Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ）で洗浄し、０．０５％トリプシン（Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ）による短時間インキュベーションによって表面から分離した。完全な細胞培養培地（ＤＭＥＭ、ｇｌｕｔａｍａｘ、１０％ＦＣＳ、ＮＥＡＡ、Ｐｅｎ－Ｓｔｒｅｐ）の添加によって、トリプシン処理プロセスを停止させた。細胞を収集し、室温でカルシウムを含まないＫｒｅｂｓ緩衝液に再懸濁した。

【０２３４】

細胞播種の前に（黒色の３８４ウェルプレート（Ｇｒｅｉｎｅｒ）への±２０００細胞／ウェル）、希釈された化合物を、カルシウムを含むＫｒｅｂｓ緩衝液に溶解したＰＳとともに、アッセイプレートに添加した。これにより、２．４ｍＭ　Ca^{2+}アッセイ溶液が得られた。細胞添加の直後に、プレートを、４８５ｎＭの励起及び５３５ｎＭの放出によってＥｎｖｉｓｉｏｎ蛍光リーダ（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）上で読み取った。

【０２３５】

チャネル阻害は、ビヒクルを用いてＰＳ（５０μＭ）で刺激された状態と比較して、非ＰＳ刺激対照と比較して計算した。本発明の化合物が、この活性を阻害する能力を、以下のように決定した：パーセンテージ阻害＝［１－（（試験化合物が存在する試料に対して決定されたＲＦＵ－陽性対照阻害剤を有する試料に対して決定されたＲＦＵ）／（ビヒクルの存在下で決定されたＲＦＵ－陽性対照阻害剤を有する試料に対して決定されたＲＦＵ）］×１００。

【０２３６】

試験した実施例の化合物の活性を、以下の表に示す。活性範囲Ａ、Ｂ、及びＣは、以下のＦｌｕｏ－４ＡＭアッセイにおけるＩＣ５０値を指す。「Ａ」：IC_{50}＜１μＭ、「Ｂ」：１μＭ≦IC_{50}≦２０μＭ、及び「Ｃ」：IC_{50}＞２０　μＭ

【表２４－１】

化合物	IC50	化合物	IC50	化合物	IC50
化合物 001	A	化合物 056	A	化合物 111	A
化合物 002	A	化合物 057	A	化合物 112	B
化合物 003	A	化合物 058	A	化合物 113	A
化合物 004	A	化合物 059	A	化合物 114	A
化合物 005	A	化合物 060	A	化合物 115	B
化合物 006	A	化合物 061	A	化合物 116	B
化合物 007	A	化合物 062	A	化合物 117	A
化合物 008	A	化合物 063	A	化合物 118	A
化合物 009	A	化合物 064	A	化合物 119	B
化合物 010	A	化合物 065	A	化合物 120	A
化合物 011	A	化合物 066	A	化合物 121	A
化合物 012	A	化合物 067-En1	C	化合物 122	A
化合物 013	B	化合物 067-En2	B	化合物 123	A
化合物 014	C	化合物 068-En1	C	化合物 124	B
化合物 015-En1	A	化合物 068-En2	B	化合物 125	A
化合物 015-En2	A	化合物 069	A	化合物 126	A
化合物 016	A	化合物 070	A	化合物 127	B
化合物 017	A	化合物 071	A	化合物 128	B
化合物 018	A	化合物 072	C	化合物 129	A
化合物 019-En1	A	化合物 073	B	化合物 130	B
化合物 019-En2	A	化合物 074	A	化合物 131	B
化合物 020	A	化合物 075	B	化合物 132-En1	A
化合物 021	A	化合物 076	A	化合物 132-En2	A
化合物 022	B	化合物 077	A	化合物 133-En1	A
化合物 023	A	化合物 078	A	化合物 133-En2	A
化合物 024	B	化合物 079	B	化合物 134	C
化合物 025	A	化合物 080	B	化合物 135	C
化合物 026	A	化合物 081	A	化合物 136	A
化合物 027	A	化合物 082	B	化合物 137	B
化合物 028	B	化合物 083	B	化合物 138	A
化合物 029	A	化合物 084	A	化合物 139	A
化合物 030	A	化合物 085	A	化合物 140	A
化合物 031	A	化合物 086	A	化合物 141	A
化合物 032	A	化合物 087	A	化合物 142	B
化合物 033	A	化合物 088	A	化合物 143	A
化合物 034	A	化合物 089	C	化合物 144	B
化合物 035	A	化合物 090	C	化合物 145	C
化合物 036	A	化合物 091	A	化合物 146	A
化合物 037	A	化合物 092	A	化合物 147	B
化合物 038	A	化合物 093	A	化合物 148	C
化合物 039	A	化合物 094	A	化合物 149	C

【表２４－２】

化合物	IC50
化合物 040	A
化合物 041	A
化合物 042-En1	A
化合物 042-En2	A
化合物 043	A
化合物 044	A
化合物 045	A
化合物 046	A
化合物 047	A
化合物 048	B
化合物 049	B
化合物 050	A
化合物 051	A
化合物 052	A
化合物 053	A
化合物 054	B
化合物 055	B

化合物	IC50
化合物 095-En1	B
化合物 095-En2	B
化合物 096	A
化合物 097	A
化合物 098	B
化合物 099	B
化合物 100	B
化合物 101	A
化合物 102	B
化合物 103	A
化合物 104	C
化合物 105	A
化合物 106	B
化合物 107	B
化合物 108	A
化合物 109	A
化合物 110	C

化合物	IC50
化合物 150	A
化合物 151	C
化合物 152	C

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063996

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A61P25/04 A61P29/00 C07D333/68 C07D409/12 C07D413/12
C07D417/12 C07D417/14 A61K31/381 A61K31/401 A61K31/4166
A61K31/4155 A61K31/4409
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)
A61P 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, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	MARTIN-SMITH M ET AL: "BENZO[B]THIOPHEN DERIVATIVES. PART VI. THE SYNTHESES OF 3-(2-AMINO-ETHYL)-5-HYDROXYBENZOÚB3?4THIOP HEN AND RELATED COMPOUNDS", JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, SECTION C: ORGANIC CHEMISTRY.>6015C, CHEMICAL SOCIETY. LETCHWORTH, GB, 1 January 1967 (1967-01-01), pages 1899-1905, XP002058536, ISSN: 0022-4952, DOI: 10.1039/J39670001899 page 1900; compound IV ----- -/--	1-15

[x] Further documents are listed in the continuation of Box C. [ ] 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
6 July 2023	14/07/2023

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	Panday, Narendra

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063996

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	STRAUB ISABELLE ET AL: "Flavanones That Selectively Inhibit TRPM3 Attenuate Thermal Nociception In Vivo", MOLECULAR PHARMACOLOGY , vol. 84, no. 5 7 November 2013 (2013-11-07), pages 736-750, XP055777082, US ISSN: 0026-895X, DOI: 10.1124/mol.113.086843 Retrieved from the Internet: URL:http://dx.doi.org/10.1124/mol.113.086843 the whole document -----	1-15
A	XIONG W.-H. ET AL: "Voriconazole, an Antifungal Triazol That Causes Visual Side Effects, Is an Inhibitor of TRPM1 and TRPM3 Channels", INVESTIGATIVE OPHTHALMOLOGY & VISUAL SCIENCE, vol. 56, no. 2, 25 February 2015 (2015-02-25), pages 1367-1373, XP055969139, US ISSN: 0146-0404, DOI: 10.1167/iovs.14-15270 the whole document -----	1-15
A	SUZUKI HIROKA ET AL: "3 isoforms", PHARMACOLOGY RESEARCH & PERSPECTIVES , vol. 4, no. 3 1 June 2016 (2016-06-01), page 232, XP055909852, GB ISSN: 2052-1707, DOI: 10.1002/prp2.232 Retrieved from the Internet: URL:https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC4876142/pdf/PRP2-4-e00232.pdf the whole document ----- -/--	1-15

2

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063996

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	KRÜGEL UTE ET AL: "Primidone inhibits TRPM3 and attenuates thermal nociception in vivo", PAIN , vol. 158, no. 5 1 May 2017 (2017-05-01), pages 856-867, XP055892729, NL ISSN: 0304-3959, DOI: 10.1097/j.pain.0000000000000846 Retrieved from the Internet: URL:https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC5402713/pdf/jop-158-856.pdf the whole document -----	1-15

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

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）
Ａ６１Ｋ　31/427(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/427	
Ａ６１Ｋ　31/5377(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/5377	
Ｃ０７Ｄ 417/14 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	417/14	
Ａ６１Ｋ　31/454(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/454	
Ａ６１Ｋ　31/4439(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/4439	
Ａ６１Ｋ　31/4025(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/4025	
Ａ６１Ｋ　31/4155(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/4155	
Ｃ０７Ｄ 413/14 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	413/14	
Ａ６１Ｐ　29/00 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	29/00	
Ａ６１Ｐ　25/08 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	25/08	
Ａ６１Ｐ　43/00 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	43/00	１１１

,MC,ME,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,CV,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,MG,MK,MN,MU,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,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

ルトラ、ロード・タウン、ピー・オー・ボックス１７３、リッター・ハウス
(74)代理人　100145403
弁理士　山尾 憲人
(74)代理人　100156144
弁理士　落合 康
(72)発明者　マルシャン，アルノー
ベルギー３３６０ビールベーク、ライスブルークストラート５９アー
(72)発明者　ファンヘルク，ジャン－クリストフ
ベルギー３００１ヘフェルレー、ズワールウェンラーン４８
(72)発明者　シャルタン，パトリック
ベルギー１３７０ゼトルー－リュメ、ショッセ・ドゥ・ティルルモン４６７
(72)発明者　ライヒ，メラニー
ドイツ５２０７２アーヘン、ティッタルツフェルト５３
(72)発明者　クリューガー，ゼバスティアン
ドイツ５２０６２アーヘン、ベルクドリーシュ２２
(72)発明者　キロンダ，アムリ
ベルギー３３７０バウテルセム、ルブベークセストラート３１
(72)発明者　フーツ，トーマス
ベルギー３０１０ケッセル－ロー、ティーンセステーンウェッヒ１４９
(72)発明者　フリーンス，ヨーリス
ベルギー３１５０ワッケルゼール、ケルフスストラート９４

Ｆターム（参考）　4C086　AA01 AA02 AA03 BB03 BC08 BC17 BC36 BC73 BC82 GA02
GA04 GA08 GA09 GA10 GA12 MA01 MA04 NA14 ZA06 ZA08 ZC02