

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和4年10月25日(2022.10.25)

【国際公開番号】WO2019/168847

【公表番号】特表2021-515036(P2021-515036A)

【公表日】令和3年6月17日(2021.6.17)

【出願番号】特願2020-567459(P2020-567459)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 P 9 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 4

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 C S P

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

30

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 9 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 2 8

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 8

A 6 1 P 3 7 / 0 6

A 6 1 P 7 / 0 2

A 6 1 P 9 / 1 0 1 0 1

A 6 1 P 9 / 1 0

40

A 6 1 P 9 / 0 4

A 6 1 P 2 5 / 1 6

A 6 1 P 3 / 1 0

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 6

【手続補正書】

50

【提出日】令和4年10月14日(2022.10.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

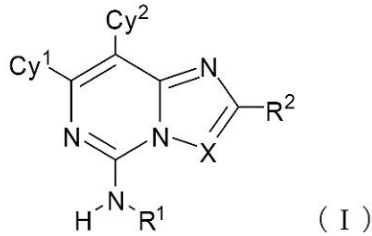
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化1】

10



またはその薬学的に許容可能な塩(式中：

Xは、 CR^3 であり；

20

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、及び C_{1-6} ハロアルキルから選択され；

R^2 は、H、D、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a2} 、 SR^{a2} 、 $NHOR^{a2}$ 、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $C(O)NR^{c2}(OR^{a2})$ 、 $C(O)OR^{a2}$ 、 $OC(O)R^{b2}$ 、 $OC(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}C(O)R^{b2}$ 、 $NR^{c2}C(O)OR^{a2}$ 、 $NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $C(=NR^{e2})R^{b2}$ 、 $C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}C(=NR^{e2})R^{b2}$ 、 $NR^{c2}S(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $NR^{c2}S(O)R^{b2}$ 、 $NR^{c2}S(O)R^{b2}$ 、 $NR^{c2}S(O)(=NR^{e2})R^{b2}$ 、 $NR^{c2}S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$ 、 $S(O)R^{b2}$ 、 $S(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $S(O)_2R^{b2}$ 、 $S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$ 、 $OS(O)(=NR^{e2})R^{b2}$ 、 $OS(O)_2R^{b2}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^{f2}R^{g2}$ 、 $OP(O)(OR^{h2})(OR^{i2})$ 、 $P(O)(OR^{h2})(OR^{i2})$ 、及び $BR^{j2}R^{k2}$ から選択され、 R^2 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^c 置換基で任意に置換されており；

30

40

R^3 は、H、D、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a3} 、 SR^{a3} 、 $NHOR^{a3}$ 、 $C(O)R^{b3}$ 、 $C(O)NR^{c3}R^{d3}$ 、

50

$C(O)NR^c{}^3(OR^a{}^3)$ 、 $C(O)OR^a{}^3$ 、 $OC(O)R^b{}^3$ 、 $OC(O)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3C(O)R^b{}^3$ 、 $NR^c{}^3C(O)OR^a{}^3$ 、 $NR^c{}^3C(O)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $C(=NR^e{}^3)R^b{}^3$ 、 $C(=NR^e{}^3)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3C(=NR^e{}^3)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3C(=NR^e{}^3)R^b{}^3$ 、 $NR^c{}^3S(O)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $NR^c{}^3S(O)R^b{}^3$ 、 $NR^c{}^3S(O)_2R^b{}^3$ 、 $NR^c{}^3S(O)(=NR^e{}^3)R^b{}^3$ 、 $NR^c{}^3S(O)_2NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $S(O)R^b{}^3$ 、 $S(O)NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $S(O)_2R^b{}^3$ 、 $S(O)_2NR^c{}^3R^d{}^3$ 、 $OS(O)(=NR^e{}^3)R^b{}^3$ 、 $OS(O)_2R^b{}^3$ 、 SF_5 、 $P(O)R^f{}^3R^g{}^3$ 、 $OP(O)(OR^h{}^3)(OR^i{}^3)$ 、 $P(O)(OR^h{}^3)(OR^i{}^3)$ 、及び $BR^j{}^3R^k{}^3$ から選択され、 R^3 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されており；

10

Cy^1 は、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、または4～14員ヘテロシクロアルキルであり、前記 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、または4～14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^E または R^M 置換基で任意に置換されており；

20

Cy^2 は、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、または4～14員ヘテロシクロアルキルであり、前記 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、または4～14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの $R^a{}^2$ 、 $R^c{}^2$ 、 $R^d{}^2$ 、 $R^a{}^3$ 、 $R^c{}^3$ 、及び $R^d{}^3$ は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 $R^a{}^2$ 、 $R^c{}^2$ 、 $R^d{}^2$ 、 $R^a{}^3$ 、 $R^c{}^3$ 、及び $R^d{}^3$ の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

30

または同じ N 原子に結合した任意の $R^c{}^2$ 及び $R^d{}^2$ は、それらが結合した前記 N 原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

40

または同じ N 原子に結合した任意の $R^c{}^3$ 及び $R^d{}^3$ は、それらが結合した前記 N 原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの $R^b{}^2$ 及び $R^b{}^3$ は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリ

50

ール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{b2} 及び R^{b3} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリアル、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e2} 及び R^{e3} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリアル、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{f2} 、 R^{g2} 、 R^{f3} 、及び R^{g3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリアル、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h2} 、 R^{i2} 、 R^{h3} 、及び R^{i3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリアル、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j2} 、 R^{k2} 、 R^{j3} 、及び R^{k3} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または同じB原子に結合した任意の R^{j2} 及び R^{k2} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

または同じB原子に結合した任意の R^{j3} 及び R^{k3} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリアル、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリアル) - C_{1-6} アルキル -、(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)NR^{c4}(OR^{a4})$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S($

10

20

30

40

50

$O) R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ 、 $S(O)R^{b4}$ 、 $S(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $S(O)_2R^{b4}$ 、 $S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ 、 $OS(O)(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $OS(O)_2R^{b4}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^fR^g$ 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び BR^jR^k から選択され、 R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

または、同じ N 原子に結合した任意の R^{c4} 及び R^{d4} は、それらが結合した前記 N 原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリーールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を任意に形成し、前記5または6員ヘテロアリーールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b4} は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{b4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、 H 、 OH 、 CN 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^f 及び R^g は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～

14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され;

それぞれの R^h 及び R^i は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され;

それぞれの R^j 及び R^k は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され;

または、同じB原子に結合した任意の R^j 及び R^k は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し;

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a 、 SR^a 、 $NHOR^a$ 、 $C(O)R^b$ 、 $C(O)NR^c$ 、 R^d 、 $C(O)NR^c(OR^a)$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $OC(O)R^b$ 、 $OC(O)NR^c$ 、 R^d 、 NR^c 、 R^d 、 NR^cNR^c 、 R^d 、 NR^c 、 $C(O)OR^a$ 、 NR^c 、 $C(O)NR^c$ 、 R^d 、 $C(=NR^e)R^b$ 、 $C(=NR^e)NR^c$ 、 R^d 、 NR^c 、 $C(=NR^e)NR^c$ 、 R^d 、 NR^c 、 $C(=NR^e)R^b$ 、 NR^c 、 $S(O)R^b$ 、 NR^c 、 $S(O)NR^c$ 、 R^d 、 NR^c 、 $S(O)_2R^b$ 、 NR^c 、 $S(O)_2NR^c$ 、 R^d 、 $OS(O)(=NR^e)R^b$ 、 $OS(O)_2R^b$ 、 SF_5 、 $P(O)R^f$ 、 RG^5 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び BR^jR^k から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており;

それぞれの R^a 、 R^c 、及び R^d は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^a 、 R^c 、及び R^d の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており;

それぞれの R^a 、 R^c 、及び R^d は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^a 、 R^c 、及び R^d の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており;

それぞれの R^a 、 R^c 、及び R^d は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^a 、 R^c 、及び R^d の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリーール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており;

または同じN原子に結合した任意の R^c 及び R^d は、それらが結合した前記N原子

と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{b5}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

10

それぞれのR^{e5}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され；

20

それぞれのR^{f5}及びR^{g5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され；

それぞれのR^{h5}及びRⁱ⁵は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され；

30

それぞれのR^{j5}及びR^{k5}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意のR^{j5}及びR^{k5}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれのR^Iは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a6}、SR^{a6}、NHOR^{a6}、C(O)R^{b6}、C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(O)NR^{c6}(OR^{a6})、C(O)OR^{a6}、OC(O)R^{b6}、OC(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(O)R^{b6}、NR^{c6}C(O)OR^{a6}、NR^{c6}C(O)NR^{c5}R^{d6}、C(=NR^{e6})R^{b6}、C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})R^{b6}、NR^{c6}S(O)R^{b6}、NR^{c6}S(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}S(O)₂R^{b6}、NR^{c6}S(O)(=NR^{e6})R^{b6}、NR^c

40

50

${}^6S(O)_2NR^c{}^6R^d{}^6$ 、 ${}^6S(O)R^b{}^6$ 、 ${}^6S(O)NR^c{}^6R^d{}^6$ 、 ${}^6S(O)_2R^b{}^6$ 、 ${}^6S(O)_2NR^c{}^6R^d{}^6$ 、 $OS(O)(=NR^e{}^6)R^b{}^6$ 、 $OS(O)_2R^b{}^6$ 、 SF_5 、 $P(O)R^f{}^6R^g{}^6$ 、 $OP(O)(OR^h{}^6)(OR^i{}^6)$ 、 $P(O)(OR^h{}^6)(OR^i{}^6)$ 、及び $BR^j{}^6R^k{}^6$ から選択され、 R^I の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

10

それぞれの $R^a{}^6$ 、 $R^c{}^6$ 、及び $R^d{}^6$ は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 $R^a{}^6$ 、 $R^c{}^6$ 、及び $R^d{}^6$ の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

20

または同じN原子に結合した任意の $R^c{}^6$ 及び $R^d{}^6$ は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの $R^b{}^6$ は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 $R^b{}^6$ の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

30

それぞれの $R^e{}^6$ は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

40

それぞれの $R^f{}^6$ 及び $R^g{}^6$ は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの $R^h{}^6$ 及び $R^i{}^6$ は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキ

50

ル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^j 及び R^k は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^j 及び R^k は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^J は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a7} 、 SR^{a7} 、 $NHOR^{a7}$ 、 $C(O)R^{b7}$ 、 $C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(O)NR^{c7}(OR^{a7})$ 、 $C(O)OR^{a7}$ 、 $OC(O)R^{b7}$ 、 $OC(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}C(O)OR^{a7}$ 、 $NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)R^{b7}$ 、 $S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)_2R^{b7}$ 、 $S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $OS(O)_2R^{b7}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^fR^g$ 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び BR^jR^k から選択され、 R^J の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c7} 及び R^{d7} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6}

10

20

30

40

50

6 アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - から選択され、R^{b7} の前記 C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^k 置換基で任意に置換されており；

10

それぞれの R^{e7} は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ハロアルキル、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれの R^{f7} 及び R^{g7} は、独立して、H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ハロアルキル、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - から選択され；

20

それぞれの R^{h7} 及び Rⁱ⁷ は、独立して、H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j7} 及び R^{k7} は、独立して、OH、C₁₋₆ アルコキシ、及び C₁₋₆ ハロアルコキシから選択され；

または、同じ B 原子に結合した任意の R^{j7} 及び R^{k7} は、それらが結合した前記 B 原子と一緒にあって、C₁₋₆ アルキル及び C₁₋₆ ハロアルキルから独立して選択される 1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

30

それぞれの R^k は、独立して、H、D、OH、ハロ、オキソ、CN、C(O)OH、NH₂、NO₂、SF₅、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - から選択され；

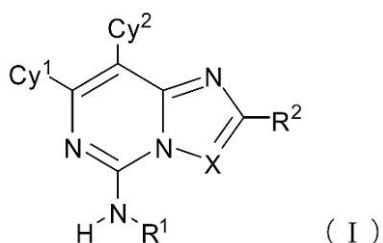
上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリール基は、任意の環形成窒素上に N - オキソを任意に含む)。

40

【請求項 2】

式 (I) の化合物：

【化 2】



またはその薬学的に許容可能な塩（式中：

X は、N であり；

R¹ は、H、C₁-6 アルキル、C₂-6 アルケニル、C₂-6 アルキニル、及び C₁-6 ハロアルキルから選択され；

R² は、H、D、ハロ、C₁-6 アルキル、C₁-6 ハロアルキル、C₂-6 アルケニル、C₂-6 アルキニル、C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、5~14 員ヘテロアリール、4~14 員ヘテロシクロアルキル、C₆-14 アリール-C₁-6 アルキル-、C₃-14 シクロアルキル-C₁-6 アルキル-、(5~14 員ヘテロアリール)-C₁-6 アルキル-、(4~14 員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6 アルキル-、CN、NO₂、OR^{a2}、SR^{a2}、NHOR^{a2}、C(O)R^{b2}、C(O)NR^{c2}R^{d2}、C(O)NR^{c2}(OR^{a2})、C(O)OR^{a2}、OC(O)R^{b2}、OC(O)NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(O)R^{b2}、NR^{c2}C(O)OR^{a2}、NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}、C(=NR^{e2})R^{b2}、C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(=NR^{e2})R^{b2}、NR^{c2}S(O)NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}S(O)R^{b2}、NR^{c2}S(O)₂R^{b2}、NR^{c2}S(O)(=NR^{e2})R^{b2}、NR^{c2}S(O)₂NR^{c2}R^{d2}、S(O)R^{b2}、S(O)NR^{c2}R^{d2}、S(O)₂R^{b2}、S(O)₂NR^{c2}R^{d2}、OS(O)(=NR^{e2})R^{b2}、OS(O)₂R^{b2}、SF₅、P(O)R^{f2}R^{g2}、OP(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、P(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、及び BR^{j2}R^{k2}から選択され、R²の前記 C₁-6 アルキル、C₂-6 アルケニル、C₂-6 アルキニル、C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、5~14 員ヘテロアリール、4~14 員ヘテロシクロアルキル、C₆-14 アリール-C₁-6 アルキル-、C₃-14 シクロアルキル-C₁-6 アルキル-、(5~14 員ヘテロアリール)-C₁-6 アルキル-、及び(4~14 員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6 アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^c置換基で任意に置換されており；

Cy¹ は、C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、または5~14 員ヘテロアリールであり、前記 C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、または5~14 員ヘテロアリールは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^eまたは R^m置換基で任意に置換されており；

Cy² は、C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、5~14 員ヘテロアリール、または4~14 員ヘテロシクロアルキルであり、前記 C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、5~14 員ヘテロアリール、または4~14 員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^f置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2}、R^{c2}、及び R^{d2} は、独立して、H、C₁-6 アルキル、C₁-6 ハロアルキル、C₂-6 アルケニル、C₂-6 アルキニル、C₆-14 アリール、C₃-14 シクロアルキル、5~14 員ヘテロアリール、4~14 員ヘテロシクロアルキル、C₆-14 アリール-C₁-6 アルキル-、C₃-14 シクロアルキル-C₁-6 アルキル-、(5~14 員ヘテロアリール)-C₁-6 アルキル-、及び(4~14 員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6 アルキル-から選択され、R^{a2}、R^{c2}、及び R^{d2}の前記 C₁-6

10

20

30

40

50

アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c2} 及び R^{d2} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

10

それぞれの R^{b2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{b2} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

20

それぞれの R^{e2} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{f2} 及び R^{g2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

30

それぞれの R^{h2} 及び R^{i2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

40

それぞれの R^{j2} 及び R^{k2} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または同じB原子に結合した任意の R^{j2} 及び R^{k2} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^C 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテ

50

ロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a4 、 SR^a4 、 $NHOR^a4$ 、 $C(O)R^b4$ 、 $C(O)NR^c4R^d4$ 、 $C(O)NR^c4(OR^a4)$ 、 $C(O)OR^a4$ 、 $OC(O)R^b4$ 、 $OC(O)NR^c4R^d4$ 、 NR^c4R^d4 、 $NR^c4NR^c4R^d4$ 、 $NR^c4C(O)R^b4$ 、 $NR^c4C(O)OR^a4$ 、 $NR^c4C(O)NR^c4R^d4$ 、 $C(=NR^e4)R^b4$ 、 $C(=NR^e4)NR^c4R^d4$ 、 $NR^c4C(=NR^e4)NR^c4R^d4$ 、 $NR^c4C(=NR^e4)R^b4$ 、 $NR^c4S(O)R^b4$ 、 $NR^c4S(O)NR^c4R^d4$ 、 $NR^c4S(O)_2R^b4$ 、 $NR^c4S(O)(=NR^e4)R^b4$ 、 $NR^c4S(O)_2NR^c4R^d4$ 、 $S(O)R^b4$ 、 $S(O)NR^c4R^d4$ 、 $S(O)_2R^b4$ 、 $S(O)_2NR^c4R^d4$ 、 $OS(O)(=NR^e4)R^b4$ 、 $OS(O)_2R^b4$ 、 SF_5 、 $P(O)R^f4R^g4$ 、 $OP(O)(OR^h4)(OR^i4)$ 、 $P(O)(OR^h4)(OR^i4)$ 、及び BR^j4R^k4 から選択され、 R^C 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14員ヘテロアリール、4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

10

20

それぞれの R^a4 、 R^c4 、及び R^d4 は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14員ヘテロアリール、4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^a4 、 R^c4 、及び R^d4 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14員ヘテロアリール、4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

30

または、同じN原子に結合した任意の R^c4 及び R^d4 は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル基を任意に形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^b4 は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14員ヘテロアリール、4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^b4 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14員ヘテロアリール、4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4 ~ 14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

40

それぞれの R^e4 は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキ

50

シ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^f 及び R^g は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

10

それぞれの R^h 及び R^i は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^j 及び R^k は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^j 及び R^k は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

20

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、NO₂、OR^{a5}、SR^{a5}、NHOR^{a5}、C(O)R^{b5}、C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(O)NR^{c5}(OR^{a5})、C(O)OR^{a5}、OC(O)R^{b5}、OC(O)NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(O)R^{b5}、NR^{c5}C(O)OR^{a5}、NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(=NR^{e5})R^{b5}、C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(=NR^{e5})R^{b5}、NR^{c5}S(O)R^{b5}、NR^{c5}S(O)NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}S(O)₂R^{b5}、NR^{c5}S(O)(=NR^{e5})R^{b5}、NR^{c5}S(O)₂NR^{c5}R^{d5}、S(O)R^{b5}、S(O)NR^{c5}R^{d5}、S(O)₂R^{b5}、S(O)₂NR^{c5}R^{d5}、OS(O)(=NR^{e5})R^{b5}、OS(O)₂R^{b5}、SF₅、P(O)R^{f5}R^{g5}、OP(O)(OR^{h5})(ORⁱ⁵)、P(O)(OR^{h5})(ORⁱ⁵)、及びBR^{j5}R^{k5}から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

30

40

それぞれの R^a 、 R^c 、及び R^d は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリーール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリーール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリーール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロア

50

ルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意のR^{c5}及びR^{d5}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{b5}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{e5}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{f5}及びR^{g5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{h5}及びRⁱ⁵は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{j5}及びR^{k5}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意のR^{j5}及びR^{k5}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれのR^Iは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~

10

20

30

40

50

14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル -、CN、NO₂、OR^{a6}、SR^{a6}、NHOR^{a6}、C(O)R^{b6}、C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(O)NR^{c6}(OR^{a6})、C(O)OR^{a6}、OC(O)R^{b6}、OC(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(O)R^{b6}、NR^{c6}C(O)OR^{a6}、NR^{c6}C(O)NR^{c5}R^{d6}、C(=NR^{e6})R^{b6}、C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})R^{b6}、NR^{c6}S(O)R^{b6}、NR^{c6}S(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}S(O)₂R^{b6}、NR^{c6}S(O)(=NR^{e6})R^{b6}、NR^{c6}S(O)₂NR^{c6}R^{d6}、S(O)R^{b6}、S(O)NR^{c6}R^{d6}、S(O)₂R^{b6}、S(O)₂NR^{c6}R^{d6}、OS(O)(=NR^{e6})R^{b6}、OS(O)₂R^{b6}、SF₅、P(O)R^{f6}R^{g6}、OP(O)(OR^{h6})(ORⁱ⁶)、P(O)(OR^{h6})(ORⁱ⁶)、及びBR^{j6}R^{k6}から選択され、R^Iの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

10

それぞれのR^{a6}、R^{c6}、及びR^{d6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{a6}、R^{c6}、及びR^{d6}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

20

30

または同じN原子に結合した任意のR^{c6}及びR^{d6}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{b6}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

40

それぞれのR^{e6}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル

50

-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され;

それぞれのR^{f6}及びR^{g6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され;

それぞれのR^{h6}及びRⁱ⁶は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され;

それぞれのR^{j6}及びR^{k6}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され;

または、同じB原子に結合した任意のR^{j6}及びR^{k6}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し;

それぞれのR^jは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a7}、SR^{a7}、NHOR^{a7}、C(O)R^{b7}、C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(O)NR^{c7}(OR^{a7})、C(O)OR^{a7}、OC(O)R^{b7}、OC(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(O)R^{b7}、NR^{c7}C(O)OR^{a7}、NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(=NR^{e7})R^{b7}、C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)R^{b7}、NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}S(O)₂R^{b7}、NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、S(O)R^{b7}、S(O)NR^{c7}R^{d7}、S(O)₂R^{b7}、S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}、OS(O)₂R^{b7}、SF₅、P(O)R^{f7}R^{g7}、OP(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、P(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、及びBR^{j7}R^{k7}から選択され、R^jの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^k置換基で任意に置換されており;

それぞれのR^{a7}、R^{c7}、及びR^{d7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{a7}、R^{c7}、及びR^{d7}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5

10

20

30

40

50

～ 14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^k置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c7}及びR^{d7}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^k置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{b7}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^k置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e7}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれの R^{f7}及びR^{g7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h7}及びRⁱ⁷は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j7}及びR^{k7}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j7}及びR^{k7}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^kは、独立して、H、D、OH、ハロ、オキソ、CN、C(O)OH、NH₂、NO₂、SF₅、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリール基は、任意の環形成窒素上にN - オキドを任意に含む)。

【請求項3】

10

20

30

40

50

式中：

それぞれの R^J は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a7} 、 SR^{a7} 、 $NHOR^{a7}$ 、 $C(O)R^{b7}$ 、 $C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(O)NR^{c7}(OR^{a7})$ 、 $C(O)OR^{a7}$ 、 $OC(O)R^{b7}$ 、 $OC(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}C(O)OR^{a7}$ 、 $NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)R^{b7}$ 、 $S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)_2R^{b7}$ 、 $S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $OS(O)_2R^{b7}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^fR^g$ 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び BR^jR^k から選択され；

それぞれの R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

または同じN原子に結合した任意の R^{c7} 及び R^{d7} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^{b7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択される、請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項4】

式中：

それぞれの R^I は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a6} 、 SR^{a6} 、 $NHOR^{a6}$ 、 $C(O)R^{b6}$ 、 $C(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $C(O)NR^{c6}(OR^{a6})$ 、 $C(O)OR^{a6}$ 、 $OC(O)R^{b6}$ 、 $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$ 、 $NR^{c6}C(O)NR^{c5}R^{d6}$ 、 $C(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ 、 $S(O)R^{b6}$ 、 $S(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $S(O)_2R^{b6}$ 、 $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ 、 $OS(O)(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $OS(O)_2R^{b6}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^fR^g$ 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び BR^jR^k から選択され；

それぞれの R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

または同じN原子に結合した任意の R^{c6} 及び R^{d6} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^{b6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択される、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

【請求項5】

Cy^1 は、 C_{6-14} アリールであり、前記 C_{6-14} アリールは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

20

【請求項6】

Cy^1 は、 C_{3-14} シクロアルキルであり、前記 C_{3-14} シクロアルキルは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項7】

Cy^1 は、5～14員ヘテロアリールであり、前記5～14員ヘテロアリールは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項8】

Cy^1 は、4～14員ヘテロシクロアルキルであり、前記4～14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

30

【請求項9】

Cy^1 は、フェニルまたは5～10員ヘテロアリールであり、前記フェニルまたは5～10員ヘテロアリールは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項10】

Cy^1 は、フェニル、ピリジニル、フラニル、ベンゾフラニル、及びピラゾリルから選択され、これらのそれぞれは、 C_{1-3} アルキル、ハロ、CN、及び C_{1-3} アルコキシから選択される1、2、または3個の置換基で任意に置換されている、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

40

【請求項11】

前記任意に置換された Cy^1 は、シアノフェニル、シアノフルオロフェニル、2,3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2,3,-b]ピリジン、フェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、ピリジニル、メチルフラニル、ベンゾフラニル、及びメチル-1H-ピラゾリルから選択される、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項12】

前記任意に置換された Cy^1 は、2-シアノフェニル、3-シアノフェニル、3-シア

50

ノ - 2 - フルオロフェニル、2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2, 3, - b] ピリジン、フェニル、3 - メトキシフェニル、2 - フルオロフェニル、ピリジン - 4 - イル、2 - メチルフラン - 3 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、及び 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルから選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 13】

前記任意に置換された Cy^1 は、3 - シアノフェニル及びフェニルから選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 14】

Cy^2 は、 C_{6-14} アリールであり、前記 C_{6-14} アリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

【請求項 15】

Cy^2 は、 C_{3-14} シクロアルキルであり、前記 C_{3-14} シクロアルキルは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 16】

Cy^2 は、5 ~ 14 員ヘテロアリールであり、前記 5 ~ 14 員ヘテロアリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

20

【請求項 17】

Cy^2 は、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルであり、前記 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 18】

Cy^2 は、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、5 ~ 10 員ヘテロアリール、及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルから選択され；

前記 5 ~ 10 員ヘテロアリール及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、または 3 個の窒素原子を環形成ヘテロ原子として含み、前記 1 または 2 個の窒素原子のうちの 1 つは任意に N - オキシドであり、環形成炭素原子は、オキソによって任意に置換されており；

30

前記 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、5 ~ 10 員ヘテロアリール、及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル - OH、ハロ、CN、 C_{1-3} アルコキシ、及び $C(O)NH_2$ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 19】

Cy^2 は、ピリジニル、テトラヒドロピリジニル、ペリジニル、ピリジン - N - オキシド、オキソ - ジヒドロピリジニル、フェニル、ピラゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ [1, 5 - b] ピリダジニル、ピラゾリル、ピリミジニル、キノリニル、オキサゾリル、2, 3 - ジヒドロ - [1, 4] ジオキシノ [2, 3 - b] ピリジン - 8 - イル、及びトリアゾリルから選択され、これらのそれぞれは、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル - OH、ハロ、CN、 C_{1-3} アルコキシ、及び $C(O)NH_2$ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

40

【請求項 20】

Cy^2 は、 C_{1-3} アルキル、ハロ、CN、 C_{1-3} アルコキシ、及び $C(O)NH_2$ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されたシクロプロピルである、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 21】

50

前記任意に置換された Cy^2 は、2, 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル、ピリジン - 4 - イル、2 - メチルピリジン - 4 - イル、1 - カルバモイル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル、1 - カルバモイルピペリジン - 4 - イル、2 - メトキシピリジン - 4 - イル、2 - メトキシ - 6 - メチルピリジン - 4 - イル、2, 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル - 1 - オキシド、1 - エチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル、3 - メチルピリジン - 4 - イル、3 - フルオロピリジン - 4 - イル、3 - クロロピリジン - 4 - イル、3 - メトキシピリジン - 4 - イル、3 - シアノピリジン - 4 - イル、4 - カルバモイルフェニル、ピラゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ [1, 5 - b] ピリダジン - 3 - イル、5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル、1 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル、1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル、ピリミジン - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロ - [1, 4] ジオキシノ [2, 3 - b] ピリジン - 8 - イル、キノリン - 5 - イル、5 - フルオロピリミジン - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、4 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - エチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (メトキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、1 - エチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、及びシクロプロピルから選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

【請求項 2 2】

R^1 は、H 及び C_{1-6} アルキルから選択される、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

20

【請求項 2 3】

R^1 は、H または C_{1-3} アルキルである、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 4】

R^1 は、H またはエチルである、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 5】

R^1 は、H である、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

30

【請求項 2 6】

R^2 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル - 、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - 、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル - 、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - 、 OR^a2 、 NR^c2R^d2 、 $C(O)R^b2$ 、 $C(O)NR^c2R^d2$ 、及び $C(O)OR^a2$ から選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル - 、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - 、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル - 、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、または 3 個の独立して選択される R^c 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

40

【請求項 2 7】

R^2 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル - 、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - 、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル - 、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - 、 OR^a2 、 NR^c2R^d2 、 $C(O)R^b2$ 、 $C(O)NR^c2R^d2$ 、及び $C(O)OR^a2$ から選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロア

50

ルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、または3個の独立して選択される R^C 置換基で置換されている、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項28】

R^2 は、H、フェニル、5～6員ヘテロアリール、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}$ 、 R^{d2} 、及び $C(O)OR^{a2}$ から選択され、前記フェニル及び5～6員ヘテロアリールはそれぞれ、1または2個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されている、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

【請求項29】

R^2 は、H、 $C(O)OEt$ 、 $CONH_2$ 、及び $C(O)NHEt$ から選択される、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項30】

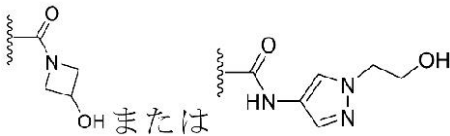
R^2 は、フェニル及び5～6員ヘテロアリールから選択され、これらのそれぞれは、 $C(O)OMe$ で任意に置換されている、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項31】

R^2 は、

20

【化3】



である、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項32】

前記任意に置換された R^2 は、ピリジニルメチル、ヒドロキシ(フェニル)メチル、ヒドロキシエチルアミノ(フェニル)エチル、シクロヘキシルメチル、フルオロベンジル、ヒドロキシ(フルオロフェニル)メチル、(メチルピリジニル)メチル、(フルオロピリジニル)メチル、(トリフルオロメチルピリジニル)メチル、((ヒドロキシメチル)ピリジニル)メチル、(メトキシピリジニル)メチル、(メチルピラゾリル)ベンジル、(メチルピラゾリル)メチル、ベンゾイソオキサゾリルメチル、(メチルインダゾリル)メチル、(ヒドロキシアゼチジニル)メチル、ベンゾイル、フェニルシクロプロピル、(シアノ(フェニル)メチル)アミノ、テトラヒドロフラン、フェニル(ピリジニルオキシ)メチル、フルオロ((フルオロヒドロキシピロリジニル)メチル)ベンジル、((カルボキシピペリジニル)メチル)フルオロベンジル、フルオロ((N-メチルメチルスルホンアミド)メチル)ベンジル、((ジオキソイミダゾリジニル)メチル)フルオロベンジル、(ジフルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(ピリジニル-1H-テトラゾリル)メチル、(ピラゾリル-1H-テトラゾリル)メチル、(チアゾリル-1H-テトラゾリル)メチル、(メチルトリフルオロメチルピラゾリル)メチル、((1,1-ジオキソイソチアゾリジニル)メチル)フルオロベンジル、((メチル-2,5-ジオキソイミダゾリジニル)メチル)ベンジル、及び(シアノフェノキシ)メチルから選択される、請求項1～25のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

30

40

【請求項33】

前記任意に置換された R^2 は、ピリジン-2-イルメチル、ヒドロキシ(フェニル)メチル、(2-ヒドロキシエチルアミノ)(フェニル)メチル、シクロヘキシルメチル、2-フルオロベンジル、(2-フルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(6-メチルピ

50

リジン - 2 - イル)メチル、(3 - フルオロピリジン - 2 - イル)メチル、(3 - メトキシピリジン - 2 - イル)メチル、2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)ベンジル、ベンゾ[d]イソキサゾール - 3 - イルメチル、(1 - メチル - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル、(3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル)メチル、ベンゾイル、1 - フェニルシクロプロピル、(シアノ(フェニル)メチル)アミノ、テトラヒドロフラン - 3 - イル、フェニル(ピリジン - 2 - イルオキシ)メチル、2 - フルオロ - 6 - ((3 R, 4 R) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル)メチル)ベンジル、2 - ((4 - カルボキシピペリジン - 1 - イル)メチル) - 6 - フルオロベンジル、2 - フルオロ - 6 - (N - メチルメチルスルホンアミド)メチル)ベンジル、2 - (2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル)メチル) - 6 - フルオロベンジル、(2, 6 - ジフルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(5 - (ピリジン - 2 - イル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル)メチル、(5 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル)メチル、(5 - (チアゾール - 4 - イル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル)メチル、(3 - メチルピリジン - 2 - イル)メチル、2 - ((1, 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル)メチル) - 6 - フルオロベンジル、2 - フルオロ - 6 - ((3 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル)メチル)ベンジル、(6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル、(3 - (ヒドロキシメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル、(1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)メチル、及び(2 - シアノフェノキシ)メチル、(3 - メチルピリジン - 2 - イル)メトキシ、(6 - メチルピリジン - 2 - イル)メトキシ、ならびに((3 - メチルピリジン - 2 - イル)メチル)アミノから選択される、請求項 1 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

20

【請求項 34】

それぞれの R^C は、独立して、ハロ、C₁ - 6 アルキル、C₆ - 14 アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁ - 6 アルキル -、OR^a 4、C(O)OR^a 4、及び NR^c 4 R^d 4 から選択され、前記 C₁ - 6 アルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁ - 6 アルキル - は、1、2、または 3 個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されている、請求項 1 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

30

【請求項 35】

それぞれの R^H は、独立して、ハロ、オキソ、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、OR^a 5、C(O)OR^a 5、及び NR^c 5 S(O)₂ R^b 5 から選択される、請求項 1 ~ 28 及び 34 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 36】

R³ は、H、ハロ、C₁ - 6 アルキル、C₆ - 14 アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、CN、及び OR^a 3 から選択され、前記 C₁ - 6 アルキル、C₆ - 14 アリール、及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または 3 個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されている、請求項 1 及び 3 ~ 35 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

40

【請求項 37】

R³ は、H、C₁ - 3 アルキル、ハロ、CN、モルホリノメチル、4 - エトキシフェニル、2 - ヒドロキシエトキシ、及びピリジニルから選択される、請求項 1 及び 3 ~ 35 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 38】

R³ は、H、メチル、プロモ、CN、モルホリノメチル、4 - エトキシフェニル、2 - ヒドロキシエトキシ、及びピリジニルから選択される、請求項 1 及び 3 ~ 35 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 39】

式中：

50

R^1 は、H 及び C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 は、H、D、 C_{6-14} アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、及び $C(O)OR^{a2}$ から選択され、 R^2 の前記 C_{6-14} アリール及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されており；

R^3 は、H、D、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-14} アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、CN、及び OR^{a3} から選択され、 R^3 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されており；

Cy^1 は、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^M 置換基で任意に置換されたフェニル、または C_{10-14} アリールもしくは 5 ~ 14 員ヘテロアリールであり、 Cy^1 の前記 C_{10-14} アリール及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されており；

Cy^2 は、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリールまたは 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルであり、 Cy^2 の前記 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^M は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、2 - CN、3 - CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R$

d^4 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^M の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b4} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a5} 、 SR^{a5} 、 $NHOR^{a5}$ 、 $C(O)R^{b5}$ 、 $C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(O)OR^{a5}$ 、 $OC(O)R^{b5}$ 、 $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$ 、 $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}S(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$ 、及び $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$ から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a5} 、 R^{c5} 、及び R^{d5} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b5} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリーール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリーール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e5} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ

10

20

30

40

50

シ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^I は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、NO₂、OR^{a6}、SR^{a6}、NHOR^{a6}、C(O)R^{b6}、C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(O)OR^{a6}、OC(O)R^{b6}、OC(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(O)R^{b6}、NR^{c6}C(O)OR^{a6}、NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(=NR^{e6})R^{b6}、C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}S(O)R^{b6}、NR^{c6}S(O)₂R^{b6}、及びNR^{c6}S(O)₂NR^{c6}R^{d6}から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

10

それぞれの R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

20

それぞれの R^{b6} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e6} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^J は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、NO₂、OR^{a7}、SR^{a7}、NHOR^{a7}、C(O)R^{b7}、C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(O)OR^{a7}、OC(O)R^{b7}、OC(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(O)R^{b7}、NR^{c7}C(O)OR^{a7}、NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(=NR^{e7})R^{b7}、C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}S(O)R^{b7}、NR^{c7}S(O)₂R^{b7}、及びNR^{c7}S(O)₂NR^{c7}R^{d7}から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

30

40

それぞれの R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～1

50

4員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^K置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{e7}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

それぞれのR^Kは、独立して、H、D、OH、ハロ、オキソ、CN、C(O)OH、NH₂、NO₂、SF₅、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

10

上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリアル基は、任意の環形成窒素上にN-オキソドを任意に含む、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項40】

式中：

R¹は、H及びC₁₋₆アルキルから選択され；

R²は、H、D、C₆₋₁₄アリアル、5～14員ヘテロアリアル、C(O)R^{b2}、C(O)NR^{c2}R^{d2}、及びC(O)OR^{a2}から選択され、R²の前記C₆₋₁₄アリアル及び5～14員ヘテロアリアルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^C置換基で任意に置換されており；

20

R³は、H、D、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₄アリアル、5～14員ヘテロアリアル、CN、及びOR^{a3}から選択され、R³の前記C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₄アリアル、及び5～14員ヘテロアリアルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^D置換基で任意に置換されており；

Cy¹は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^M置換基で任意に置換されたフェニル、またはC₁₀₋₁₄アリアルもしくは5～14員ヘテロアリアルであり、Cy¹の前記C₁₀₋₁₄アリアル及び5～14員ヘテロアリアルは、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^E置換基で任意に置換されており；

Cy²は、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアルまたは4～14員ヘテロシクロアルキルであり、Cy²の前記C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^F置換基で任意に置換されており；

30

それぞれのR^{a2}、R^{c2}、R^{d2}、及びR^{a3}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、R^{a2}、R^{c2}、R^{d2}、及びR^{a3}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して

40

選択されるR^G置換基で任意に置換されており；
それぞれのR^{b2}は、独立して、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^G置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^C、R^D、R^E、R^F、及びR^Gは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリアル、C₃₋₁₄シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、

50

NO₂、OR^{a4}、SR^{a4}、NHOR^{a4}、C(O)R^{b4}、C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(O)OR^{a4}、OC(O)R^{b4}、OC(O)NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(O)R^{b4}、NR^{c4}C(O)OR^{a4}、NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(=NR^{e4})R^{b4}、C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}S(O)R^{b4}、NR^{c4}S(O)₂R^{b4}、及びNR^{c4}S(O)₂NR^{c4}R^{d4}から選択され、R^C、R^D、R^E、R^F、及びR^Gの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^Mは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、2-CN、3-CN、NO₂、OR^{a4}、SR^{a4}、NHOR^{a4}、C(O)R^{b4}、C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(O)OR^{a4}、OC(O)R^{b4}、OC(O)NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(O)R^{b4}、NR^{c4}C(O)OR^{a4}、NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(=NR^{e4})R^{b4}、C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}S(O)R^{b4}、NR^{c4}S(O)₂R^{b4}、及びNR^{c4}S(O)₂NR^{c4}R^{d4}から選択され、R^Mの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルから選択され、R^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b4}は、独立して、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{e4}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

それぞれのR^Hは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、CN、NO₂、OR^{a5}、SR^{a5}、NHOR^{a5}、C(O)R^{b5}、C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(O)OR^{a5}、OC(O)R^{b5}、OC(O)NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(O)R^{b5}、NR^{c5}C(O)OR^{a5}、NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(=NR^{e5})R^{b5}、C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}S(O)R^{b5}、NR^{c5}S(O)₂R^{b5}、及びNR^{c5}S(O)₂NR^{c5}R^{d5}から選択され；

それぞれのR^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}は、独立して、H、及びC₁₋₆アルキルから選択され；

それぞれのR^{b5}は、独立して、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、及び4~14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれのR^{e5}は、独立して、H及びC₁₋₆アルキルから選択される、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

20

30

40

50

【請求項 4 1】

式中：

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、及び5～14員ヘテロアリアルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル及び5～14員ヘテロアリアルはそれぞれ、1、2、または3個の独立して選択される R^B 置換基で任意に置換されており；

R^2 は、H、D、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリアル、5～14員ヘテロアリアル、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリアル)- C_{1-6} アルキル-、(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、 $NR^{c2}R^{d2}$ 、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、及び $C(O)OR^{a2}$ から選択され、 R^2 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリアル、5～14員ヘテロアリアル、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリアル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリアル)- C_{1-6} アルキル-、(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されており；

Cy^1 は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^M 置換基で任意に置換されたフェニル、または C_{10-14} アリアルもしくは5～14員ヘテロアリアルであり、 Cy^1 の前記 C_{10-14} アリアル及び5～14員ヘテロアリアルは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されており；

Cy^2 は、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアルまたは4～14員ヘテロシクロアルキルであり、 Cy^2 の前記 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2} 、 R^{c2} 、及び R^{d2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{6-14} アリアル- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a2} 、 R^{c2} 、及び R^{d2} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{6-14} アリアル- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^B 、 R^C 、 R^E 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^B 、 R^C 、 R^E 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリアル、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリアル、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^M は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケ

10

20

30

40

50

ニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、2-CN、3-CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^M の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b4} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a5} 、 SR^{a5} 、 $NHOR^{a5}$ 、 $C(O)R^{b5}$ 、 $C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(O)OR^{a5}$ 、 $OC(O)R^{b5}$ 、 $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$ 、 $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}S(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$ 、及び $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$ から選択され；

それぞれの R^{a5} 、 R^{c5} 、及び R^{d5} は、独立して、H、及び C_{1-6} アルキルから選択され；

それぞれの R^{b5} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれの R^{e5} は、独立して、H及び C_{1-6} アルキルから選択される、請求項2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項42】

3-(5-アミノ-8-(2,6-ジメチルピリジン-4-イル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-7-イル)ベンゾニトリル；

7-(2,3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-8-(2,6-ジメチルピリジン-4-イル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-5-アミン；

8-(2,6-ジメチルピリジン-4-イル)-3-(モルホリノメチル)-7-フェニルイミダゾ[1,2-c]ピリミジン-5-アミン；

7-(3-メトキシフェニル)-8-(ピリジン-4-イル)イミダゾ[1,2-c]ピリミジン-5-アミン；

10

20

30

40

50

- 7, 8 - ジ (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - メチルフラン - 3 - イル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (2 - フルオロフェニル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (ベンゾフラン - 2 - イル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 7 - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2, 7 - ジフェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ; 10
- エチル 5 - アミノ - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキシレート ;
 メチル 5 - (5 - アミノ - 7 - フェニル - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - カルボキシレート ;
 3 - (4 - エトキシフェニル) - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
 5 - アミノ - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 8 - (1 - カルバモイル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル) - N - エチル - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ; 20
- 5 - アミノ - 8 - (1 - カルバモイルピペリジン - 4 - イル) - N - エチル - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 3 - (2 - ヒドロキシエトキシ) - 8 - (2 - メトキシピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (2 - メトキシピリジン - 4 - イル) - 3 - メチルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (2 - メトキシピリジン - 4 - イル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ; 30
- 5 - アミノ - 3 - プロモ - 8 - (2, 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 3 - シアノ - 8 - (2, 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 8 - (2, 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル - 5 - (エチルアミノ) - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 4 - (5 - アミノ - 2 - (エチルカルバモイル) - 7 - フェニルイミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 8 - イル) - 2, 6 - ジメチルピリジン 1 - オキシド ; 40
- 3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル) - 2 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - カルボニル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (1 - エチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - メチルピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1, 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ; 50

- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - クロロピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - メトキシピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - シアノピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 8 - (4 - カルバモイルフェニル) - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (2 , 3 - ジヒドロ - [1 , 4] ジオキシノ [2 , 3 - b] ピリジン - 8 - イル) - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ; 及び
- 5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - シクロプロピル - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

10

20

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

- 3 - (5 - アミノ - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 8 - (キノリン - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 8 - (5 - フルオロピリミジン - 4 - イル) - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 8 - (5 - フルオロピリミジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 2 - ((2 - ヒドロキシエチルアミノ) (フェニル) メチル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
- 3 - (5 - アミノ - 2 - (シクロヘキシルメチル) - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベ

30

40

50

ンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ((2 - フルオロフェニル) (ヒドロキシ) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ((6 - メチルピリジン - 2 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル) メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル； 10

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - メトキシピリジン - 2 - イル) メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - (ベンゾ [d] イソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル； 20

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((1 - メチル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (3 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル； 30

3 - (5 - アミノ - 8 - (2 - メトキシ - 6 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (ピラゾロ [1, 5 - b] ピリダジン - 3 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル； 40

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - (メトキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

(S) - 3 - (5 - アミノ - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

(R) - 3 - (5 - アミノ - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベン 50

ゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ベンゾイル - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - フェニルシクロプロピル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ((シアノ(フェニル)メチル)アミノ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (ピリジン - 4 - イル) - 2 - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；及び

3 - (5 - アミノ - 2 - (フェニル(ピリジン - 2 - イルオキシ)メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロ - 6 - ((3R, 4R) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル)メチル)ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

1 - (2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル)メチル) - 3 - フルオロベンジル)ピペリジン - 4 - カルボン酸；

N - (2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル)メチル) - 3 - フルオロベンジル) - N - メチルメタンスルホンアミド；

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - ((2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル)メチル) - 6 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；及び

3 - (5 - アミノ - 2 - ((2, 6 - ジフルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル)メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - エチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル)メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル)メチル) - 8 - (4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - ((1, 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル) - 2 - イル) - 2 - イル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル；

10

20

30

40

50

メチル) - 6 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロ - 6 - ((3 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) メチル) ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) - 2 - フルオロベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - (ヒドロキシメチル) ピリジン - 2 - イル) メチル) - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) メチル) - 8 - (オキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル) メトキシ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((6 - メチルピリジン - 2 - イル) メトキシ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) メトキシ) ベンゾニトリル ; 及び

3 - (5 - アミノ - 2 - (((3 - メチルピリジン - 2 - イル) メチル) アミノ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

化合物が、3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - (ピリジン - 2 - イル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリルである、請求項 2 に記載の化合物

【請求項 4 7】

化合物が、3 - (5 - アミノ - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリルである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

請求項 1 ~ 4 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、及び薬学的に許容可能な賦形剤または担体を含む薬学的組成物。

【請求項 4 9】

患者における疾患または障害の治療に用いるためのものであり、前記疾患または障害が

10

20

30

40

50

膀胱癌、肺癌、乳癌、卵巣癌、大腸癌、膵臓癌、前立腺癌、または頭頸部癌である、請求項 4 8 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 0】

前記疾患または障害が、頭頸部癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 1】

前記頭頸部癌が、頭頸部扁平上皮癌である、請求項 5 0 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 2】

前記疾患または障害が、肺癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 3】

前記肺癌が、非小細胞肺癌 (NSCLC) である、請求項 5 2 に記載の薬学的組成物。

10

【請求項 5 4】

前記疾患または障害が、卵巣癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 5】

前記疾患または障害が、前立腺癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 6】

前記前立腺癌が、転移性去勢抵抗性前立腺癌である、請求項 5 5 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 7】

前記疾患または障害が、乳癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 8】

前記疾患または障害が、膀胱癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

20

【請求項 5 9】

前記疾患または障害が、大腸癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 0】

前記疾患または障害が、膵臓癌である、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 4 4 6

【補正方法】変更

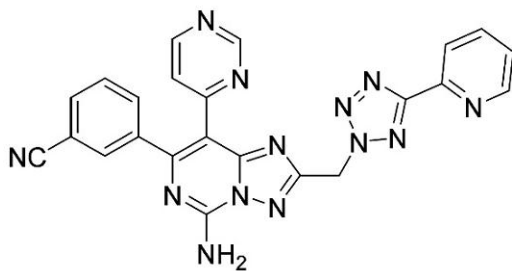
【補正の内容】

【0 4 4 6】

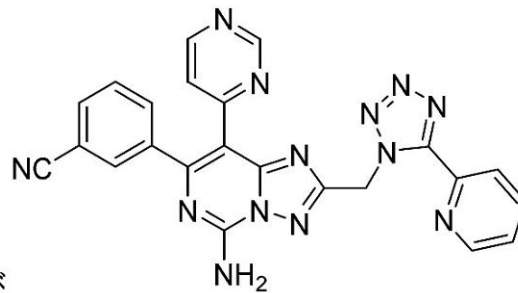
30

実施例 7 8 A - 7 8 B . 3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - (ピリジン - 2 - イル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル (実施例 7 8 A) 及び 3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - (ピリジン - 2 - イル) - 1 H - テトラゾール - 1 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル (実施例 7 8 B)

【化 1 7 9】



および



40

DMF (1 m L) 中の 3 - (5 - アミノ - 2 - (クロロメチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル (1 0 m g 、 0 . 0 2 8 m m o l) (実施例 7 2 、 工程 4 から) 、 2 - (1 H - テ

50

トラゾール - 5 - イル) ピリジン (8 . 1 m g 、 0 . 0 5 5 m m o l) 及び Cs_2CO_3 (2 0 . 7 m g 、 0 . 0 6 4 m m o l) の混合物を 1 0 0 で 1 0 分間攪拌した。次いで反応混合物を室温に冷却し、メタノール (4 m L) で希釈し、分取 LC - MS (p H 2 、 T F A を有するアセトニトリル / 水) によって精製して生成物の混合物 (実施例 7 8 A : 実施例 7 8 B の比率 1 . 5 : 1) を T F A 塩として得た。 $C_{23}H_{16}N_{13}(M+H)^+$ について計算された LCMS : 4 7 4 . 2 ; 実測値 4 7 4 . 2 。 実施例 7 8 A : 1H NMR (5 0 0 M H z , D M S O) 8 . 9 9 (d , J = 1 . 4 H z , 1 H) , 8 . 8 5 (d , J = 5 . 3 H z , 1 H) , 8 . 8 0 - 8 . 7 1 (m , 1 H) , 8 . 7 1 - 8 . 3 9 (b , 2 H) , 8 . 1 8 (d , J = 7 . 7 , 1 . 1 H z , 1 H) , 8 . 0 4 (t , J = 7 . 8 , 1 . 8 H z , 1 H) , 7 . 8 5 (m , 2 H) , 7 . 8 0 - 7 . 7 6 (m , 1 H) , 7 . 6 2 - 7 . 5 5 (m , 2 H) , 7 . 5 3 (t , J = 7 . 8 H z , 1 H) , 6 . 3 9 (s , 2 H) 。

10

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0486

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0486】

本発明の様々な改変は、本明細書に記載されているものに加えて、前述の記載から当業者に明らかである。そのような改変はまた、添付の特許請求の範囲の範囲に入ることが意図されている。本出願で引用されたすべての特許、特許出願、及び刊行物を含む各参考文献は、その全体が参照により本明細書に組み込まれる。

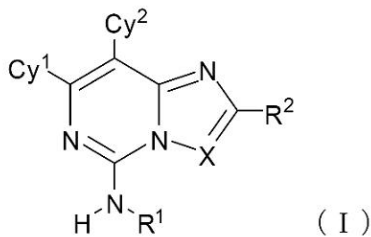
20

本願は、下記の態様も包含する。

[態様 1]

式 (I) の化合物 :

【化 2 1 2】



30

またはその薬学的に許容可能な塩 (式中 :

X は、 CR^3 であり ;

R^1 は、 H 、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 及び $C_1 - 6$ ハロアルキルから選択され ;

R^2 は、 H 、 D 、 ハロ、 $C_1 - 6$ アルキル、 $C_1 - 6$ ハロアルキル、 $C_2 - 6$ アルケニル、 $C_2 - 6$ アルキニル、 $C_6 - 14$ アリール、 $C_3 - 14$ シクロアルキル、 5 ~ 14 員ヘテロアリール、 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - 14$ アリール - $C_1 - 6$ アルキル - 、 $C_3 - 14$ シクロアルキル - $C_1 - 6$ アルキル - 、 (5 ~ 14 員ヘテロアリール) - $C_1 - 6$ アルキル - 、 (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - $C_1 - 6$ アルキル - 、 CN、 NO_2 、 OR^a2 、 SR^a2 、 $NHOR^a2$ 、 $C(O)R^b2$ 、 $C(O)NR^c2R^d2$ 、 $C(O)NR^c2(OR^a2)$ 、 $C(O)OR^a2$ 、 $OC(O)R^b2$ 、 $OC(O)NR^c2R^d2$ 、 NR^c2R^d2 、 $NR^c2NR^c2R^d2$ 、 $NR^c2C(O)R^b2$ 、 $NR^c2C(O)OR^a2$ 、 $NR^c2C(O)NR^c2R^d2$ 、 $C(=NR^e2)R^b2$ 、 $C(=NR^e2)NR^c2R^d2$ 、 $NR^c2C(=NR^e2)NR^c2R^d2$ 、 $NR^c2C(=NR^e2)R^b2$ 、 $NR^c2S(O)NR^c2R^d2$ 、 $NR^c2S(O)R^b2$ 、 $NR^c2S(O)R^b2$ 、 $NR^c2S(O)(=NR^e2)R^b2$ 、 $NR^c2S(O)_2NR^c2R^d2$ 、 S

40

50

(O)R^{b2}、S(O)NR^{c2}R^{d2}、S(O)₂R^{b2}、S(O)₂NR^{c2}R^{d2}、OS(O)(=NR^{e2})R^{b2}、OS(O)₂R^{b2}、SF₅、P(O)R^{f2}R^{g2}、OP(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、P(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、及びBR^{j2}R^{k2}から選択され、R²の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^C置換基で任意に置換されており；

R³は、H、D、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a3}、SR^{a3}、NHOR^{a3}、C(O)R^{b3}、C(O)NR^{c3}R^{d3}、C(O)NR^{c3}(OR^{a3})、C(O)OR^{a3}、OC(O)R^{b3}、OC(O)NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}C(O)R^{b3}、NR^{c3}C(O)OR^{a3}、NR^{c3}C(O)NR^{c3}R^{d3}、C(=NR^{e3})R^{b3}、C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}C(=NR^{e3})R^{b3}、NR^{c3}S(O)NR^{c3}R^{d3}、NR^{c3}S(O)R^{b3}、NR^{c3}S(O)₂R^{b3}、NR^{c3}S(O)(=NR^{e3})R^{b3}、NR^{c3}S(O)₂NR^{c3}R^{d3}、S(O)R^{b3}、S(O)NR^{c3}R^{d3}、S(O)₂R^{b3}、S(O)₂NR^{c3}R^{d3}、OS(O)(=NR^{e3})R^{b3}、OS(O)₂R^{b3}、SF₅、P(O)R^{f3}R^{g3}、OP(O)(OR^{h3})(ORⁱ³)、P(O)(OR^{h3})(ORⁱ³)、及びBR^{j3}R^{k3}から選択され、R³の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^D置換基で任意に置換されており；

Cy¹は、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、または4~14員ヘテロシクロアルキルであり、前記C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、または4~14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^EまたはR^M置換基で任意に置換されており；

Cy²は、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、または4~14員ヘテロシクロアルキルであり、前記C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、または4~14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^F置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a2}、R^{c2}、R^{d2}、R^{a3}、R^{c3}、及びR^{d3}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{a2}、R^{c2}、R^{d2}、R^{a3}、R^{c3}、及びR^{d3}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロア

10

20

30

40

50

リール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c2} 及び R^{d2} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c3} 及び R^{d3} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} 及び R^{b3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{b2} 及び R^{b3} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e2} 及び R^{e3} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{f2} 、 R^{g2} 、 R^{f3} 、及び R^{g3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{h2} 、 R^{i2} 、 R^{h3} 、及び R^{i3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{j2} 、 R^{k2} 、 R^{j3} 、及び R^{k3} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または同じB原子に結合した任意の R^{j2} 及び R^{k2} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基

10

20

30

40

50

を形成し；

または同じB原子に結合した任意のR^{j3}及びR^{k3}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれのR^C、R^D、R^E、R^M、R^F、及びR^Gは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a4}、SR^{a4}、NHOR^{a4}、C(O)R^{b4}、C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(O)NR^{c4}(OR^{a4})、C(O)OR^{a4}、OC(O)R^{b4}、OC(O)NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(O)R^{b4}、NR^{c4}C(O)OR^{a4}、NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(=NR^{e4})R^{b4}、C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(=NR^{e4})R^{b4}、NR^{c4}S(O)R^{b4}、NR^{c4}S(O)NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}S(O)₂R^{b4}、NR^{c4}S(O)(=NR^{e4})R^{b4}、NR^{c4}S(O)₂NR^{c4}R^{d4}、S(O)R^{b4}、S(O)NR^{c4}R^{d4}、S(O)₂R^{b4}、S(O)₂NR^{c4}R^{d4}、OS(O)(=NR^{e4})R^{b4}、OS(O)₂R^{b4}、SF₅、P(O)R^{f4}R^{g4}、OP(O)(OR^{h4})(ORⁱ⁴)、P(O)(OR^{h4})(ORⁱ⁴)、及びBR^{j4}R^{k4}から選択され、R^C、R^D、R^E、R^M、R^F、及びR^Gの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

または、同じN原子に結合した任意のR^{c4}及びR^{d4}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を任意に形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b4}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆ア

10

20

30

40

50

ルキル - から選択され、 R^{b4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{f4} 及び R^{g4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h4} 及び R^{i4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j4} 及び R^{k4} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j4} 及び R^{k4} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^a5 、 SR^a5 、 $NHOR^a5$ 、 $C(O)R^b5$ 、 $C(O)NR^c5R^d5$ 、 $C(O)NR^c5(OR^a5)$ 、 $C(O)OR^a5$ 、 $OC(O)R^b5$ 、 $OC(O)NR^c5R^d5$ 、 NR^c5R^d5 、 $NR^c5NR^c5R^d5$ 、 $NR^c5C(O)R^b5$ 、 $NR^c5C(O)OR^a5$ 、 $NR^c5C(O)NR^c5R^d5$ 、 $C(=NR^e5)R^b5$ 、 $C(=NR^e5)NR^c5R^d5$ 、 $NR^c5C(=NR^e5)NR^c5R^d5$ 、 $NR^c5C(=NR^e5)R^b5$ 、 $NR^c5S(O)R^b5$ 、 $NR^c5S(O)NR^c5R^d5$ 、 $NR^c5S(O)_2R^b5$ 、 $NR^c5S(O)(=NR^e5)R^b5$ 、 $NR^c5S(O)_2NR^c5R^d5$ 、 $S(O)R^b5$ 、 $S(O)NR^c5R^d5$ 、 $S(O)_2R^b5$ 、 $S(O)_2NR^c5R^d5$ 、 $OS(O)(=NR^e5)R^b5$ 、 $OS(O)_2R^b5$ 、 SF_5 、 $P(O)R^f5R^g5$ 、 $OP(O)(OR^h5)(OR^i5)$ 、 $P(O)(OR^h5)(OR^i5)$ 、及び BR^j5R^k5 から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリ

10

20

30

40

50

ール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a5} 、 R^{c5} 、及び R^{d5} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{a5} 、 R^{c5} 、及び R^{d5} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

または同じ N 原子に結合した任意の R^{c5} 及び R^{d5} は、それらが結合した前記 N 原子と一緒にあって、5 または 6 員ヘテロアリールまたは 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記 5 または 6 員ヘテロアリールまたは 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b5} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{b5} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e5} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{f5} 及び R^{g5} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h5} 及び R^{i5} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j5} 及び R^{k5} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

10

20

30

40

50

または、同じB原子に結合した任意の R^{j5} 及び R^{k5} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^I は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a6} 、 SR^{a6} 、 $NHOR^{a6}$ 、 $C(O)R^{b6}$ 、 $C(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $C(O)NR^{c6}(OR^{a6})$ 、 $C(O)OR^{a6}$ 、 $OC(O)R^{b6}$ 、 $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$ 、 $NR^{c6}C(O)NR^{c5}R^{d6}$ 、 $C(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ 、 $S(O)R^{b6}$ 、 $S(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $S(O)_2R^{b6}$ 、 $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ 、 $OS(O)(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $OS(O)_2R^{b6}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^fR^g$ 、 $OP(O)(OR^h)(OR^i)$ 、 $P(O)(OR^h)(OR^i)$ 、及び $BR^{j6}R^{k6}$ から選択され、 R^I の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c6} 及び R^{d6} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{b6} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14}

シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e6}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれの R^{f6}及び R^{g6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h6}及び Rⁱ⁶は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j6}及び R^{k6}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j6}及び R^{k6}は、それらが結合した前記B原子と一緒に、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^Jは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル -、CN、NO₂、OR^{a7}、SR^{a7}、NHOR^{a7}、C(O)R^{b7}、C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(O)NR^{c7}(OR^{a7})、C(O)OR^{a7}、OC(O)R^{b7}、OC(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(O)R^{b7}、NR^{c7}C(O)OR^{a7}、NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(=NR^{e7})R^{b7}、C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)R^{b7}、NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}S(O)₂R^{b7}、NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、S(O)R^{b7}、S(O)NR^{c7}R^{d7}、S(O)₂R^{b7}、S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}、OS(O)₂R^{b7}、SF₅、P(O)R^{f7}R^{g7}、OP(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、P(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、及びBR^{j7}R^{k7}から選択され、R^Jの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a7}、R^{c7}、及び R^{d7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆

10

20

30

40

50

ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

10

または同じN原子に結合した任意の R^{c7} 及び R^{d7} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{b7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

20

それぞれの R^{e7} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

30

それぞれの R^{f7} 及び R^{g7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h7} 及び R^{i7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

40

それぞれの R^{j7} 及び R^{k7} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j7} 及び R^{k7} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^K は、独立して、H、D、OH、ハロ、オキソ、CN、C(O)OH、NH₂、NO₂、SF₅、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ

50

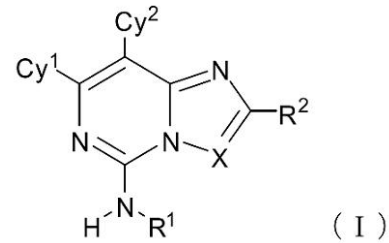
C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆-14アリール-C₁-6アルキル-、C₃-14シクロアルキル-C₁-6アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁-6アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6アルキル-から選択され；

上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリール基は、任意の環形成窒素上にN-オキsidを任意に含む)。

[態様 2]

式 (I) の化合物：

【化 2 1 3】



またはその薬学的に許容可能な塩 (式中：

X は、N であり；

R¹ は、H、C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、及びC₁-6ハロアルキルから選択され；

R² は、H、D、ハロ、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆-14アリール-C₁-6アルキル-、C₃-14シクロアルキル-C₁-6アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁-6アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6アルキル-、CN、NO₂、OR^{a2}、SR^{a2}、NHOR^{a2}、C(O)R^{b2}、C(O)NR^{c2}R^{d2}、C(O)NR^{c2}(OR^{a2})、C(O)OR^{a2}、OC(O)R^{b2}、OC(O)NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(O)R^{b2}、NR^{c2}C(O)OR^{a2}、NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}、C(=NR^{e2})R^{b2}、C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}C(=NR^{e2})R^{b2}、NR^{c2}S(O)NR^{c2}R^{d2}、NR^{c2}S(O)R^{b2}、NR^{c2}S(O)₂R^{b2}、NR^{c2}S(O)(=NR^{e2})R^{b2}、NR^{c2}S(O)₂NR^{c2}R^{d2}、S(O)R^{b2}、S(O)NR^{c2}R^{d2}、S(O)₂R^{b2}、S(O)₂NR^{c2}R^{d2}、OS(O)(=NR^{e2})R^{b2}、OS(O)₂R^{b2}、SF₅、P(O)R^{f2}R^{g2}、OP(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、P(O)(OR^{h2})(ORⁱ²)、及びBR^{j2}R^{k2}から選択され、R²の前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆-14アリール-C₁-6アルキル-、C₃-14シクロアルキル-C₁-6アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁-6アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁-6アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^C置換基で任意に置換されており；

Cy¹ は、C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、または5~14員ヘテロアリールであり、前記C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、または5~14員ヘテロアリールは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択されるR^EまたはR^M置換基で任意に置換されており；

Cy² は、C₆-14アリール、C₃-14シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、または4~14員ヘテロシクロアルキルであり、前記C₆-14アリール、C₃-14シ

10

20

30

40

50

クロアルキル、5～14員ヘテロアリール、または4～14員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2} 、 R^{c2} 、及び R^{d2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{a2} 、 R^{c2} 、及び R^{d2} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意の R^{c2} 及び R^{d2} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され、 R^{b2} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e2} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{f2} 及び R^{g2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

それぞれの R^{h2} 及び R^{i2} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5～14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-から選択され；

10

20

30

40

50

それぞれの R^{j2} 及び R^{k2} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または同じB原子に結合した任意の R^{j2} 及び R^{k2} は、それらが結合した前記B原子と一緒に、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^C 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)NR^{c4}(OR^{a4})$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ 、 $S(O)R^{b4}$ 、 $S(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $S(O)_2R^{b4}$ 、 $S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ 、 $OS(O)(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $OS(O)_2R^{b4}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^{f4}R^{g4}$ 、 $OP(O)(OR^{h4})(OR^{i4})$ 、 $P(O)(OR^{h4})(OR^{i4})$ 、及び $BR^{j4}R^{k4}$ から選択され、 R^C 、 R^E 、 R^M 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル- から選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル- はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

または、同じN原子に結合した任意の R^{c4} 及び R^{d4} は、それらが結合した前記N原子と一緒に、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を任意に形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール- C_{1-6} アルキル-、 C_{3-14} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)- C_{1-6} アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} ア

10

20

30

40

50

ルキル - から選択され、 R^{b4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、4、5、6、7、または8個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{f4} 及び R^{g4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h4} 及び R^{i4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{j4} 及び R^{k4} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j4} 及び R^{k4} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^{a5} 、 SR^{a5} 、 $NHOR^{a5}$ 、 $C(O)R^{b5}$ 、 $C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(O)NR^{c5}(OR^{a5})$ 、 $C(O)OR^{a5}$ 、 $OC(O)R^{b5}$ 、 $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$ 、 $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$ 、 $S(O)R^{b5}$ 、 $S(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $S(O)_2R^{b5}$ 、 $S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$ 、 $OS(O)(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $OS(O)_2R^{b5}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^{f5}R^{g5}$ 、 $OP(O)(OR^{h5})(OR^{i5})$ 、 $P(O)(OR^{h5})(OR^{i5})$ 、及び $BR^{j5}R^{k5}$ から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリ

10

20

30

40

50

ール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意のR^{c5}及びR^{d5}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され、R^{b5}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{e5}は、独立して、H、OH、CN、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{f5}及びR^{g5}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{h5}及びRⁱ⁵は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール - C₁₋₆アルキル -、C₃₋₁₄シクロアルキル - C₁₋₆アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C₁₋₆アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆アルキル - から選択され；

それぞれのR^{j5}及びR^{k5}は、独立して、OH、C₁₋₆アルコキシ、及びC₁₋₆ハロアルコキシから選択され；

10

20

30

40

50

または、同じB原子に結合した任意のR^{j5}及びR^{k5}は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、C₁₋₆アルキル及びC₁₋₆ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれのR^Iは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a6}、SR^{a6}、NHOR^{a6}、C(O)R^{b6}、C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(O)NR^{c6}(OR^{a6})、C(O)OR^{a6}、OC(O)R^{b6}、OC(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(O)R^{b6}、NR^{c6}C(O)OR^{a6}、NR^{c6}C(O)NR^{c5}R^{d6}、C(=NR^{e6})R^{b6}、C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}C(=NR^{e6})R^{b6}、NR^{c6}S(O)R^{b6}、NR^{c6}S(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}S(O)₂R^{b6}、NR^{c6}S(O)(=NR^{e6})R^{b6}、NR^{c6}S(O)₂NR^{c6}R^{d6}、S(O)R^{b6}、S(O)NR^{c6}R^{d6}、S(O)₂R^{b6}、S(O)₂NR^{c6}R^{d6}、OS(O)(=NR^{e6})R^{b6}、OS(O)₂R^{b6}、SF₅、P(O)R^{f6}R^{g6}、OP(O)(OR^{h6})(ORⁱ⁶)、P(O)(OR^{h6})(ORⁱ⁶)、及びBR^{j6}R^{k6}から選択され、R^Iの前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a6}、R^{c6}、及びR^{d6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{a6}、R^{c6}、及びR^{d6}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

または同じN原子に結合した任意のR^{c6}及びR^{d6}は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^J置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b6}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され、R^{b6}の前記C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄

10

20

30

40

50

シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^e6 は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^f6 及び R^g6 は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^h6 及び R^i6 は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^j6 及び R^k6 は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^j6 及び R^k6 は、それらが結合した前記B原子と一緒に、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} ハロアルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^J は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、CN、 NO_2 、 OR^{a7} 、 SR^{a7} 、 $NHOR^{a7}$ 、 $C(O)R^{b7}$ 、 $C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(O)NR^{c7}(OR^{a7})$ 、 $C(O)OR^{a7}$ 、 $OC(O)R^{b7}$ 、 $OC(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}C(O)OR^{a7}$ 、 $NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)R^{b7}$ 、 $S(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $S(O)_2R^{b7}$ 、 $S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ 、 $OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $OS(O)_2R^{b7}$ 、 SF_5 、 $P(O)R^{f7}R^{g7}$ 、 $OP(O)(OR^{h7})(OR^{i7})$ 、 $P(O)(OR^{h7})(OR^{i7})$ 、及び $BR^{j7}R^{k7}$ から選択され、 R^J の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5~14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6}

10

20

30

40

50

八口アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

10

または同じN原子に結合した任意の R^{c7} 及び R^{d7} は、それらが結合した前記N原子と一緒にあって、5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基を形成し、前記5または6員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキル基は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 八口アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され、 R^{b7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

20

それぞれの R^{e7} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} 八口アルキル、 C_{1-6} 八口アルコキシ、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

30

それぞれの R^{f7} 及び R^{g7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} 八口アルキル、 C_{1-6} 八口アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

それぞれの R^{h7} 及び R^{i7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 八口アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、(5～14員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び(4～14員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - から選択され；

40

それぞれの R^{j7} 及び R^{k7} は、独立して、OH、 C_{1-6} アルコキシ、及び C_{1-6} 八口アルコキシから選択され；

または、同じB原子に結合した任意の R^{j7} 及び R^{k7} は、それらが結合した前記B原子と一緒にあって、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} 八口アルキルから独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で任意に置換された5または6員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれの R^K は、独立して、H、D、OH、八口、オキソ、CN、C(O)OH、NH₂、NO₂、SF₅、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} 八口アルコキシ

50

C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され；

上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリール基は、任意の環形成窒素上にN-オキシドを任意に含む)。

[態様 3]

式中：

それぞれのR^Jは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a7}、SR^{a7}、NHOR^{a7}、C(O)R^{b7}、C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(O)NR^{c7}(OR^{a7})、C(O)OR^{a7}、OC(O)R^{b7}、OC(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(O)R^{b7}、NR^{c7}C(O)OR^{a7}、NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}、C(=NR^{e7})R^{b7}、C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}C(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)R^{b7}、NR^{c7}S(O)NR^{c7}R^{d7}、NR^{c7}S(O)₂R^{b7}、NR^{c7}S(O)(=NR^{e7})R^{b7}、NR^{c7}S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、S(O)R^{b7}、S(O)NR^{c7}R^{d7}、S(O)₂R^{b7}、S(O)₂NR^{c7}R^{d7}、OS(O)(=NR^{e7})R^{b7}、OS(O)₂R^{b7}、SF₅、P(O)R^{f7}R^{g7}、OP(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、P(O)(OR^{h7})(ORⁱ⁷)、及びBR^{j7}R^{k7}から選択され；

それぞれのR^{a7}、R^{c7}、及びR^{d7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択され；

または同じN原子に結合した任意のR^{c7}及びR^{d7}は、それらが結合した前記N原子と一緒に、5または6員ヘテロアリールまたは4~14員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

それぞれのR^{b7}は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-から選択される、態様1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 4]

式中：

それぞれのR^Iは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₆₋₁₄アリール、C₃₋₁₄シクロアルキル、5~14員ヘテロアリール、4~14員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄アリール-C₁₋₆アルキル-、C₃₋₁₄シクロアルキル-C₁₋₆アルキル-、(5~14員ヘテロアリール)-C₁₋₆アルキル-、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)-C₁₋₆アルキル-、CN、NO₂、OR^{a6}、SR^{a6}、NHOR^{a6}、C(O)R^{b6}、C(O)NR^{c6}R^{d6}、C(O)NR^{c6}(OR^{a6})、C(O)OR^{a6}、OC(O)R^{b6}、OC(O)NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}NR^{c6}R^{d6}、NR^{c6}

[態様 1 1]

前記任意に置換された C_y^1 は、シアノフェニル、シアノフルオロフェニル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロロ [2, 3, - b] ピリジン、フェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、ピリジニル、メチルフラニル、ベンゾフラニル、及びメチル - 1H - ピラゾリルから選択される、態様 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 1 2]

前記任意に置換された C_y^1 は、2 - シアノフェニル、3 - シアノフェニル、3 - シアノ - 2 - フルオロフェニル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロロ [2, 3, - b] ピリジン、フェニル、3 - メトキシフェニル、2 - フルオロフェニル、ピリジン - 4 - イル、2 - メチルフラン - 3 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、及び 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イルから選択される、態様 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

[態様 1 3]

前記任意に置換された C_y^1 は、3 - シアノフェニル及びフェニルから選択される、態様 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 1 4]

C_y^2 は、 C_{6-14} アリールであり、前記 C_{6-14} アリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

20

[態様 1 5]

C_y^2 は、 C_{3-14} シクロアルキルであり、前記 C_{3-14} シクロアルキルは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 1 6]

C_y^2 は、5 ~ 14 員ヘテロアリールであり、前記 5 ~ 14 員ヘテロアリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 1 7]

C_y^2 は、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルであり、前記 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

30

[態様 1 8]

C_y^2 は、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、5 ~ 10 員ヘテロアリール、及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルから選択され；

前記 5 ~ 10 員ヘテロアリール及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、または 3 個の窒素原子を環形成ヘテロ原子として含み、前記 1 または 2 個の窒素原子のうちの 1 つは任意に N - オキシドであり、環形成炭素原子は、オキソによって任意に置換されており；

前記 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、5 ~ 10 員ヘテロアリール、及び 5 ~ 10 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル - OH、ハロ、CN、 C_{1-3} アルコキシ、及び $C(O)NH_2$ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

40

[態様 1 9]

C_y^2 は、ピリジニル、テトラヒドロピリジニル、ピペリジニル、ピリジン - N - オキシド、オキソ - ジヒドロピリジニル、フェニル、ピラゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ [1, 5 - b] ピリダジニル、ピラゾリル、ピリミジニル、キノリニル、オキサゾリル、2, 3 - ジヒドロ - [1, 4] ジオキシノ [2, 3 - b] ピリジン - 8 - イル、及びトリアゾリルから選択され、これらのそれぞれは、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-}

50

3 アルキル - OH、ハロ、CN、C₁ - 3 アルコキシ、及び C(O)NH₂ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 20]

C_y² は、C₁ - 3 アルキル、ハロ、CN、C₁ - 3 アルコキシ、及び C(O)NH₂ から選択される 1、2、または 3 個の置換基で任意に置換されたシクロプロピルである、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 21]

前記任意に置換された C_y² は、2,6 - ジメチルピリジン - 4 - イル、ピリジン - 4 - イル、2 - メチルピリジン - 4 - イル、1 - カルバモイル - 1,2,3,6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル、1 - カルバモイルピペリジン - 4 - イル、2 - メトキシピリジン - 4 - イル、2 - メトキシ - 6 - メチルピリジン - 4 - イル、2,6 - ジメチルピリジン - 4 - イル - 1 - オキシド、1 - エチル - 6 - オキソ - 1,6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル、3 - メチルピリジン - 4 - イル、3 - フルオロピリジン - 4 - イル、3 - クロロピリジン - 4 - イル、3 - メトキシピリジン - 4 - イル、3 - シアノピリジン - 4 - イル、4 - カルバモイルフェニル、ピラゾロ [1,5 - a] ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ [1,5 - b] ピリダジン - 3 - イル、5 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - エチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル、1 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル、1 - プロピル - 1H - ピラゾール - 5 - イル、ピリミジン - 4 - イル、2,3 - ジヒドロ - [1,4] ジオキシノ [2,3 - b] ピリジン - 8 - イル、キノリン - 5 - イル、5 - フルオロピリミジン - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、4 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - エチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (メトキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル、1 - エチル - 1H - 1,2,3 - トリアゾール - 5 - イル、及びシクロプロピルから選択される、態様 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 22]

R¹ は、H 及び C₁ - 6 アルキルから選択される、態様 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 23]

R¹ は、H または C₁ - 3 アルキルである、態様 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 24]

R¹ は、H またはエチルである、態様 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 25]

R¹ は、H である、態様 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 26]

R² は、H、C₁ - 6 アルキル、C₆ - 14 アリール、C₃ - 14 シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆ - 14 アリール - C₁ - 6 アルキル - 、C₃ - 14 シクロアルキル - C₁ - 6 アルキル - 、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁ - 6 アルキル - 、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁ - 6 アルキル - 、OR^{a2}、NR^{c2}R^{d2}、C(O)R^{b2}、C(O)NR^{c2}R^{d2}、及び C(O)OR^{a2} から選択され、前記 C₁ - 6 アルキル、C₆ - 14 アリール、C₃ - 14 シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆ - 14 アリール - C₁ - 6 アルキル - 、C₃ - 14 シクロアルキル - C₁ - 6 アルキル - 、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁ - 6 アルキル - 、及び (4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁ - 6 アルキル - はそれぞれ、1、2、または 3 個の独立して選択される R^c 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的

10

20

30

40

50

に許容可能な塩。

[態様 27]

R^2 は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、 $5 \sim 14$ 員ヘテロアリール、 $4 \sim 14$ 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、 $(5 \sim 14$ 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、 $(4 \sim 14$ 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル -、 OR^a 、 NR^cR^d 、 $C(O)R^b$ 、 $C(O)NR^cR^d$ 、及び $C(O)OR^a$ から選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、 $5 \sim 14$ 員ヘテロアリール、 $4 \sim 14$ 員ヘテロシクロアルキル、 C_{6-14} アリール - C_{1-6} アルキル -、 C_{3-14} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル -、 $(5 \sim 14$ 員ヘテロアリール) - C_{1-6} アルキル -、及び $(4 \sim 14$ 員ヘテロシクロアルキル) - C_{1-6} アルキル - はそれぞれ、1、2、または3個の独立して選択される R^c 置換基で置換されている、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

10

[態様 28]

R^2 は、 H 、フェニル、 $5 \sim 6$ 員ヘテロアリール、 $C(O)R^b$ 、 $C(O)NR^cR^d$ 、及び $C(O)OR^a$ から選択され、前記フェニル及び $5 \sim 6$ 員ヘテロアリールはそれぞれ、1または2個の独立して選択される R^c 置換基で任意に置換されている、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 29]

R^2 は、 H 、 $C(O)OEt$ 、 $CONH_2$ 、及び $C(O)NHEt$ から選択される、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

20

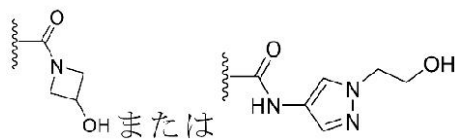
[態様 30]

R^2 は、フェニル及び $5 \sim 6$ 員ヘテロアリールから選択され、これらのそれぞれは、 $C(O)OMe$ で任意に置換されている、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 31]

R^2 は、

【化 214】



30

である、態様 1 ~ 25 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 32]

前記任意に置換された R^2 は、ピリジニルメチル、ヒドロキシ(フェニル)メチル、ヒドロキシエチルアミノ(フェニル)エチル、シクロヘキシルメチル、フルオロベンジル、ヒドロキシ(フルオロフェニル)メチル、(メチルピリジニル)メチル、(フルオロピリジニル)メチル、(トリフルオロメチルピリジニル)メチル、((ヒドロキシメチル)ピリジニル)メチル、(メトキシピリジニル)メチル、(メチルピラゾリル)ベンジル、(メチルピラゾリル)メチル、ベンゾイソオキサゾリルメチル、(メチルインダゾリル)メチル、(ヒドロキシアゼチジニル)メチル、ベンゾイル、フェニルシクロプロピル、(シアノ(フェニル)メチル)アミノ、テトラヒドロフラン、フェニル(ピリジニルオキシ)メチル、フルオロ((フルオロヒドロキシピロリジニル)メチル)ベンジル、((カルボキシピペリジニル)メチル)フルオロベンジル、フルオロ((N-メチルメチルスルホンアミド)メチル)ベンジル、((ジオキソイミダゾリジニル)メチル)フルオロベンジル、(ジフルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(ピリジニル-1H-テトラゾリル)メチル、(ピラゾリル-1H-テトラゾリル)メチル、(チアゾリル-1H-テトラゾ

40

50

リル)メチル、(メチルトリフルオロメチルピラゾリル)メチル、((1,1-ジオキシドイソチアゾリジニル)メチル)フルオロベンジル、((メチル-2,5-ジオキソイミダゾリジニル)メチル)ベンジル、及び(シアノフェノキシ)メチルから選択される、態様1~25のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様33]

前記任意に置換された R^2 は、ピリジン-2-イルメチル、ヒドロキシ(フェニル)メチル、(2-ヒドロキシエチルアミノ)(フェニル)メチル、シクロヘキシルメチル、2-フルオロベンジル、(2-フルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(6-メチルピリジン-2-イル)メチル、(3-フルオロピリジン-2-イル)メチル、(3-メトキシピリジン-2-イル)メチル、2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)ベンジル、ベンゾ[d]イソオキサゾール-3-イルメチル、(1-メチル-1H-インダゾール-3-イル)メチル、(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)メチル、ベンゾイル-1-フェニルシクロプロピル、(シアノ(フェニル)メチル)アミノ、テトラヒドロフラン-3-イル、フェニル(ピリジン-2-イルオキシ)メチル、2-フルオロ-6-((3R,4R)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピロリジン-1-イル)メチル)ベンジル、2-((4-カルボキシピペリジン-1-イル)メチル)-6-フルオロベンジル、2-フルオロ-6-((N-メチルメチルスルホンアミド)メチル)ベンジル、2-((2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)メチル)-6-フルオロベンジル、(2,6-ジフルオロフェニル)(ヒドロキシ)メチル、(5-(ピリジン-2-イル)-1H-テトラゾール-1-イル)メチル、(5-(1H-ピラゾール-1-イル)-1H-テトラゾール-1-イル)メチル、(5-(チアゾール-4-イル)-1H-テトラゾール-1-イル)メチル、(5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル)メチル、(3-メチルピリジン-2-イル)メチル、2-((1,1-ジオキシドイソチアゾリジン-2-イル)メチル)-6-フルオロベンジル、2-フルオロ-6-((3-メチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)メチル)ベンジル、(6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)メチル、(3-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)メチル、(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル、及び(2-シアノフェノキシ)メチル、(3-メチルピリジン-2-イル)メトキシ、(6-メチルピリジン-2-イル)メトキシ、ならびに((3-メチルピリジン-2-イル)メチル)アミノから選択される、態様1~25のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様34]

それぞれの R^C は、独立して、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、5~14員ヘテロアリール、(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-、 OR^{a-4} 、 $C(O)OR^{a-4}$ 、及び $NR^{c-4}R^{d-4}$ から選択され、前記 C_{1-6} アルキル、5~14員ヘテロアリール、及び(4~14員ヘテロシクロアルキル)- C_{1-6} アルキル-は、1、2、または3個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されている、態様1~28のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様35]

それぞれの R^H は、独立して、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 OR^{a-5} 、 $C(O)OR^{a-5}$ 、及び $NR^{c-5}S(O)_2R^{b-5}$ から選択される、態様1~28及び34のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様36]

R^3 は、H、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、5~14員ヘテロアリール、CN、及び OR^{a-3} から選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、及び5~14員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または3個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されている、態様1及び3~35のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様37]

R^3 は、H、 C_{1-3} アルキル、ハロ、CN、モルホリノメチル、4-エトキシフェニ

10

20

30

40

50

ル、2-ヒドロキシエトキシ、及びピリジニルから選択される、態様1及び3～35のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様38]

R^3 は、H、メチル、プロモ、CN、ホルホルノメチル、4-エトキシフェニル、2-ヒドロキシエトキシ、及びピリジニルから選択される、態様1及び3～35のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様39]

式中：

R^1 は、H及び C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 は、H、D、 C_{6-14} アリール、5～14員ヘテロアリール、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、及び $C(O)OR^{a2}$ から選択され、 R^2 の前記 C_{6-14} アリール及び5～14員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されており；

R^3 は、H、D、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{6-14} アリール、5～14員ヘテロアリール、CN、及び OR^{a3} から選択され、 R^3 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、及び5～14員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されており；

Cy^1 は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^M 置換基で任意に置換されたフェニル、または C_{10-14} アリールもしくは5～14員ヘテロアリールであり、 Cy^1 の前記 C_{10-14} アリール及び5～14員ヘテロアリールは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されており；

Cy^2 は、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキルであり、 Cy^2 の前記 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、

C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^Mは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、4~1₄員ヘテロシクロアルキル、2-CN、3-CN、NO₂、OR^{a4}、SR^{a4}、NHOR^{a4}、C(O)R^{b4}、C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(O)OR^{a4}、OC(O)R^{b4}、OC(O)NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(O)R^{b4}、NR^{c4}C(O)OR^{a4}、NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}、C(=NR^{e4})R^{b4}、C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}、NR^{c4}S(O)R^{b4}、NR^{c4}S(O)₂R^{b4}、及びNR^{c4}S(O)₂NR^{c4}R^{d4}から選択され、R^Mの前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}は、独立して、H、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルから選択され、R^{a4}、R^{c4}、及びR^{d4}の前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{b4}は、独立して、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^H置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{e4}は、独立して、H、OH、CN、C₁-6アルキル、C₁-6アルコキシ、C₁-6ハロアルキル、及びC₁-6ハロアルコキシから選択され；

それぞれのR^Hは、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、4~1₄員ヘテロシクロアルキル、CN、NO₂、OR^{a5}、SR^{a5}、NHOR^{a5}、C(O)R^{b5}、C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(O)OR^{a5}、OC(O)R^{b5}、OC(O)NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(O)R^{b5}、NR^{c5}C(O)OR^{a5}、NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}、C(=NR^{e5})R^{b5}、C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}S(O)R^{b5}、NR^{c5}S(O)₂R^{b5}、及びNR^{c5}S(O)₂NR^{c5}R^{d5}から選択され、R^Hの前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

それぞれのR^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}は、独立して、H、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルから選択され、R^{a5}、R^{c5}、及びR^{d5}の前記C₁-6アルキル、C₂-6アルケニル、C₂-6アルキニル、C₆-1₄アリール、C₃-1₄シクロアルキル、5~1₄員ヘテロアリール、及び4~1₄員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択されるR^I置換基で任意に置換されており；

10

20

30

40

50

それぞれの R^{b5} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^I 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e5} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^I は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a6} 、 SR^{a6} 、 $NHOR^{a6}$ 、 $C(O)R^{b6}$ 、 $C(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $C(O)OR^{a6}$ 、 $OC(O)R^{b6}$ 、 $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$ 、 $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$ 、 $C(=NR^{e6})R^{b6}$ 、 $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$ 、 $NR^{c6}S(O)R^{b6}$ 、 $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$ 、及び $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a6} 、 R^{c6} 、及び R^{d6} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b6} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^J 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e6} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^J は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a7} 、 SR^{a7} 、 $NHOR^{a7}$ 、 $C(O)R^{b7}$ 、 $C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(O)OR^{a7}$ 、 $OC(O)R^{b7}$ 、 $OC(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}C(O)OR^{a7}$ 、 $NR^{c7}C(O)NR^{c7}R^{d7}$ 、 $C(=NR^{e7})R^{b7}$ 、 $C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}C(=NR^{e7})NR^{c7}R^{d7}$ 、 $NR^{c7}S(O)R^{b7}$ 、 $NR^{c7}S(O)_2R^{b7}$ 、及び $NR^{c7}S(O)_2NR^{c7}R^{d7}$ から選択され、 R^H の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6}

ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a7} 、 R^{c7} 、及び R^{d7} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b7} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^K 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e7} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^K は、独立して、H、D、OH、ハロ、オキソ、CN、 $C(O)OH$ 、 NH_2 、 NO_2 、 SF_5 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

上記置換基のいずれかの任意のヘテロアリール基は、任意の環形成窒素上にN-オキシドを任意に含む、態様1に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様40]

式中；

R^1 は、H及び C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 は、H、D、 C_{6-14} アリール、5～14員ヘテロアリール、 $C(O)R^{b2}$ 、 $C(O)NR^{c2}$ 、 R^{d2} 、及び $C(O)OR^{a2}$ から選択され、 R^2 の前記 C_{6-14} アリール及び5～14員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されており；

R^3 は、H、D、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、5～14員ヘテロアリール、CN、及び OR^{a3} から選択され、 R^3 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、及び5～14員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^D 置換基で任意に置換されており；

Cy^1 は、1、2、3、または4個の独立して選択される R^M 置換基で任意に置換されたフェニル、または C_{10-14} アリールもしくは5～14員ヘテロアリールであり、 Cy^1 の前記 C_{10-14} アリール及び5～14員ヘテロアリールは、1、2、3、または4個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されており；

Cy^2 は、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリールまたは4～14員ヘテロシクロアルキルであり、 Cy^2 の前記 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a2} 、 R^{c2} 、 R^{d2} 、及び R^{a3} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b2} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アル

10

20

30

40

50

キニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^C 、 R^D 、 R^E 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^M は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、2-CN、3-CN、 NO_2 、 OR^{a4} 、 SR^{a4} 、 $NHOR^{a4}$ 、 $C(O)R^{b4}$ 、 $C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(O)OR^{a4}$ 、 $OC(O)R^{b4}$ 、 $OC(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}C(O)OR^{a4}$ 、 $NR^{c4}C(O)NR^{c4}R^{d4}$ 、 $C(=NR^{e4})R^{b4}$ 、 $C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}C(=NR^{e4})NR^{c4}R^{d4}$ 、 $NR^{c4}S(O)R^{b4}$ 、 $NR^{c4}S(O)_2R^{b4}$ 、及び $NR^{c4}S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$ から選択され、 R^M の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^{a4} 、 R^{c4} 、及び R^{d4} の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b4} は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{e4} は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、CN、 NO_2 、 OR^{a5} 、 SR^{a5} 、 $NHOR^{a5}$ 、 $C(O)R^{b5}$ 、 $C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(O)OR^{a5}$ 、 $OC(O)R^{b5}$ 、 $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$ 、 $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$ 、 $C(=NR^{e5})R^{b5}$ 、 $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$ 、 $NR^{c5}S(O)R^{b5}$ 、 $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$ 、及び $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$ から選択され；

10

20

30

40

50

d⁵ から選択され；

それぞれの R^{a 5}、R^{c 5}、及び R^{d 5} は、独立して、H、及び C₁₋₆ アルキルから選択され；

それぞれの R^{b 5} は、独立して、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれの R^{e 5} は、独立して、H 及び C₁₋₆ アルキルから選択される、態様 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 4 1]

式中；

R¹ は、H、C₁₋₆ アルキル、及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールから選択され、前記 C₁₋₆ アルキル及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールはそれぞれ、1、2、または 3 個の独立して選択される R^B 置換基で任意に置換されており；

R² は、H、D、C₁₋₆ アルキル、C₆₋₁₄ アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル -、NR^{c 2}R^{d 2}、C(O)R^{b 2}、C(O)NR^{c 2}R^{d 2}、及び C(O)OR^{a 2} から選択され、R² の前記 C₁₋₆ アルキル、C₆₋₁₄ アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、(5 ~ 14 員ヘテロアリール) - C₁₋₆ アルキル -、(4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル) - C₁₋₆ アルキル - はそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^C 置換基で任意に置換されており；

C_{y 1}¹ は、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^M 置換基で任意に置換されたフェニル、または C₁₀₋₁₄ アリールもしくは 5 ~ 14 員ヘテロアリールであり、C_{y 1}¹ の前記 C₁₀₋₁₄ アリール及び 5 ~ 14 員ヘテロアリールは、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^E 置換基で任意に置換されており；

C_{y 2}² は、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリールまたは 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルであり、C_{y 2}² の前記 C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^F 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{a 2}、R^{c 2}、及び R^{d 2} は、独立して、H、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され、R^{a 2}、R^{c 2}、及び R^{d 2} の前記 C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₆₋₁₄ アリール - C₁₋₆ アルキル -、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^{b 2} は、独立して、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または 4 個の独立して選択される R^G 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^B、R^C、R^E、R^F、及び R^G は、独立して、D、ハロ、オキソ、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₆₋₁₄ アリール、C₃₋₁₄ シクロアルキル、5 ~ 14 員ヘテロアリール、4 ~ 14 員ヘテロシクロアルキル、CN、NO₂、OR^{a 4}、SR^{a 4}、NHOR^{a 4}、C(O)R^{b 4}、C(O)NR^{c 4}R^{d 4}、C(O)OR^{a 4}、OC(O)R^{b 4}、OC(O)NR^{c 4}R^{d 4}、NR^{c 4}R^{d 4}、NR

10

20

30

40

50

C^4 、 $C(O)R^b4$ 、 NR^c4 、 $C(O)OR^a4$ 、 NR^c4 、 $C(O)NR^c4$ 、 R^d4 、 $C(=NR^e4)R^b4$ 、 $C(=NR^e4)NR^c4$ 、 R^d4 、 NR^c4 、 $C(=NR^e4)NR^c4$ 、 R^d4 、 NR^c4 、 $S(O)R^b4$ 、 NR^c4 、 $S(O)_2R^b4$ 、及び NR^c4 、 $S(O)_2NR^c4$ 、 R^d4 から選択され、 R^B 、 R^C 、 R^E 、 R^F 、及び R^G の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^M は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、4～14員ヘテロシクロアルキル、2-CN、3-CN、 NO_2 、 OR^a4 、 SR^a4 、 $NHOR^a4$ 、 $C(O)R^b4$ 、 $C(O)NR^c4$ 、 R^d4 、 $C(O)OR^a4$ 、 $OC(O)R^b4$ 、 $OC(O)NR^c4$ 、 R^d4 、 NR^c4 、 R^d4 、 NR^c4 、 $C(O)R^b4$ 、 NR^c4 、 $C(O)OR^a4$ 、 NR^c4 、 $C(O)NR^c4$ 、 R^d4 、 $C(=NR^e4)R^b4$ 、 $C(=NR^e4)NR^c4$ 、 R^d4 、 NR^c4 、 $C(=NR^e4)NR^c4$ 、 R^d4 、 NR^c4 、 $S(O)R^b4$ 、 NR^c4 、 $S(O)_2R^b4$ 、及び NR^c4 、 $S(O)_2NR^c4$ 、 R^d4 から選択され、 R^M の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^a4 、 R^c4 、及び R^d4 は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、 R^a4 、 R^c4 、及び R^d4 の前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^b4 は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され、前記 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、1、2、3、または4個の独立して選択される R^H 置換基で任意に置換されており；

それぞれの R^e4 は、独立して、H、OH、CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、及び C_{1-6} ハロアルコキシから選択され；

それぞれの R^H は、独立して、D、ハロ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、CN、 NO_2 、 OR^a5 、 SR^a5 、 $NHOR^a5$ 、 $C(O)R^b5$ 、 $C(O)NR^c5$ 、 R^d5 、 $C(O)OR^a5$ 、 $OC(O)R^b5$ 、 $OC(O)NR^c5$ 、 R^d5 、 NR^c5 、 R^d5 、 NR^c5 、 $C(O)R^b5$ 、 NR^c5 、 $C(O)OR^a5$ 、 NR^c5 、 $C(O)NR^c5$ 、 R^d5 、 $C(=NR^e5)R^b5$ 、 $C(=NR^e5)NR^c5$ 、 R^d5 、 NR^c5 、 $C(=NR^e5)NR^c5$ 、 R^d5 、 NR^c5 、 $S(O)R^b5$ 、 NR^c5 、 $S(O)_2R^b5$ 、及び NR^c5 、 $S(O)_2NR^c5$ 、 R^d5 から選択され；

それぞれの R^a5 、 R^c5 、及び R^d5 は、独立して、H、及び C_{1-6} アルキルから選択され；

それぞれの R^b5 は、独立して、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-14} アリール、 C_{3-14} シクロアルキル、5～14員ヘテロアリール、及び4～14員ヘテロシクロアルキルから選択され；

それぞれの R^e5 は、独立して、H及び C_{1-6} アルキルから選択される、態様2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

[態様 4 2]

3 - (5 - アミノ - 8 - (2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 -

10

20

30

40

50

- c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;
7 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 5 - イル) - 8 - (
2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン
;
8 - (2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - 3 - (モルホリノメチル) - 7 - フェ
ニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (3 - メトキシフェニル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c]
ピリミジン - 5 - アミン ;
7 , 8 - ジ (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (2 - メチルフラン - 3 - イル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2
- c] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (2 - フルオロフェニル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c]
ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (ベンゾフラン - 2 - イル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c
] ピリミジン - 5 - アミン ;
7 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 -
イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2 , 7 - ジフェニルイミダゾ [1 , 2 - c]
ピリミジン - 5 - アミン ;
エチル 5 - アミノ - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェニルイミダゾ [
1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキシレート ;
メチル 5 - (5 - アミノ - 7 - フェニル - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 ,
2 - c] ピリミジン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - カルボキシレート ;
3 - (4 - エトキシフェニル) - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェ
ニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 5 - アミン ;
5 - アミノ - 8 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) - 7 - フェニルイミダゾ [1 , 2
- c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
5 - アミノ - 8 - (1 - カルバモイル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリジン - 4 -
イル) - N - エチル - 7 - フェニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサ
ミド ;
5 - アミノ - 8 - (1 - カルバモイルピペリジン - 4 - イル) - N - エチル - 7 - フェ
ニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 3 - (2 - ヒドロキシエトキ
シ) - 8 - (2 - メトキシピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2
- カルボキサミド ;
5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (2 - メトキシピリジン
- 4 - イル) - 3 - メチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (2 - メトキシピリジン
- 4 - イル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カ
ルボキサミド ;
5 - アミノ - 3 - ブロモ - 8 - (2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル
- 7 - フェニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
5 - アミノ - 3 - シアノ - 8 - (2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル
- 7 - フェニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
8 - (2 , 6 - ジメチルピリジン - 4 - イル) - N - エチル - 5 - (エチルアミノ) -
7 - フェニルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;
4 - (5 - アミノ - 2 - (エチルカルバモイル) - 7 - フェニルイミダゾ [1 , 2 - c
] ピリミジン - 8 - イル) - 2 , 6 - ジメチルピリジン 1 - オキシド ;
3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 -
イル) - 2 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - カルボニル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピ

10

20

30

40

50

リミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (1 - エチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - メチルピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - クロロピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - メトキシピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (3 - シアノピリジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 8 - (4 - カルバモイルフェニル) - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - N - エチル - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (2 , 3 - ジヒドロ - [1 , 4] ジオキシノ [2 , 3 - b] ピリジン - 8 - イル) - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ; 及び

5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - シクロプロピル - N - エチルイミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 2 - カルボキサミド ;

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、態様 1 に記載の化合物。

[態様 4 3]

3 - (5 - アミノ - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - 8 - (キノリン - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (5 - フルオロピリミジン - 4 - イル) - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

10

20

30

40

50

3 - (5 - アミノ - 8 - (5 - フルオロピリミジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((2 - ヒドロキシエチルアミノ) (フェニル) メチル) - 8 - (ピリジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (シクロヘキシルメチル) - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((2 - フルオロフェニル) (ヒドロキシ) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((6 - メチルピリジン - 2 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - メトキシピリジン - 2 - イル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (ベンゾ [d] イソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - ((1 - メチル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) メチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (3 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (2 - メトキシ - 6 - メチルピリジン - 4 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (ピラゾロ [1 , 5 - b] ピリダジン - 3 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

10

20

30

40

50

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - (メトキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

(S) - 3 - (5 - アミノ - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

(R) - 3 - (5 - アミノ - 2 - (ヒドロキシ (フェニル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ベンゾイル - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

10

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 2 - (1 - フェニルシクロプロピル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((シアノ (フェニル) メチル) アミノ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (ピリジン - 4 - イル) - 2 - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ; 及び

20

3 - (5 - アミノ - 2 - (フェニル (ピリジン - 2 - イルオキシ) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、態様 2 に記載の化合物。

[態様 4 4]

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロ - 6 - ((3R, 4R) - 3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) メチル) ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

1 - (2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) メチル) - 3 - フルオロベンジル) ピペリジン - 4 - カルボン酸 ;

30

N - (2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 2 - イル) メチル) - 3 - フルオロベンジル) - N - メチルメタンスルホンアミド ;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - ((2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) メチル) - 6 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ; 及び

3 - (5 - アミノ - 2 - ((2, 6 - ジフルオロフェニル) (ヒドロキシ) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

40

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、態様 2 に記載の化合物。

[態様 4 5]

3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - (ピリジン - 2 - イル) - 1H - テトラゾール - 1 - イル) メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (2 - ((5 - (1H - ピラゾール - 1 - イル) - 1H - テトラゾール - 1 - イル) メチル) - 5 - アミノ - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

3 - (5 - アミノ - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - 2 - ((5 - (チアゾール - 4 - イル) - 1H - テトラゾール - 1 - イル) メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5

50

- c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - プラゾール - 1 - イル)メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - エチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 8 - (1 - エチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル)メチル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル)メチル) - 8 - (4 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - ((1 , 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル)メチル) - 6 - フルオロベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - フルオロ - 6 - ((3 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル)メチル)ベンジル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - フルオロピリジン - 2 - イル)メチル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - ((6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - 2 - (ピリジン - 2 - イルメチル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル) - 2 - フルオロベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - (ヒドロキシメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル) - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((1 - メチル - 1 H - プラゾール - 3 - イル)メチル) - 8 - (4 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((1 - メチル - 1 H - プラゾール - 3 - イル)メチル) - 8 - (オキサゾール - 5 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル)メトキシ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

3 - (5 - アミノ - 2 - ((6 - メチルピリジン - 2 - イル)メトキシ) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 7 - イル)ベンゾニトリル;

2 - ((5 - アミノ - 7 - (3 - シアノフェニル) - 8 - (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4]トリアゾロ [1 , 5 - c]ピリミジン - 2 - イル)メトキシ)ベンゾニトリル; 及び

3 - (5 - アミノ - 2 - (((3 - メチルピリジン - 2 - イル)メチル)アミノ) - 8

10

20

30

40

50

- (ピリミジン - 4 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - c] ピリミジン - 7 - イル) ベンゾニトリル ;

またはそれらの薬学的に許容可能な塩から選択される、態様 2 に記載の化合物。

[態様 4 6]

態様 1 ~ 4 5 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、及び薬学的に許容可能な賦形剤または担体を含む薬学的組成物。

[態様 4 7]

アデノシン受容体の活性を阻害する方法であって、前記受容体を態様 1 ~ 4 5 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩と接触させることを含む、前記方法。

[態様 4 8]

患者における疾患または障害を治療する方法であって、前記疾患または障害は、A 2 A または A 2 B 受容体の異常発現に関連しており、態様 1 ~ 4 5 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩の治療的有効量を前記患者に投与することを含む、前記方法。

[態様 4 9]

前記疾患または障害は、がん、炎症性疾患、心血管疾患、または神経変性疾患である、態様 4 8 に記載の方法。

[態様 5 0]

前記がんは、膀胱癌、肺癌、黒色腫、乳癌、子宮頸癌、卵巣癌、大腸癌、膵臓癌、食道癌、前立腺癌、腎臓癌、皮膚癌、甲状腺癌、肝臓癌、子宮癌、または腎細胞癌である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 5 1]

前記炎症性疾患は、肺炎である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 5 2]

前記肺炎は、ブレオマイシン誘発性肺線維症である、態様 5 1 に記載の方法。

[態様 5 3]

前記炎症性疾患は、アデノシン受容体依存性アレルギー反応またはアデノシン受容体免疫反応である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 5 4]

前記アデノシン受容体依存性アレルギー反応は、A 2 B 受容体依存性である、態様 5 3 に記載の方法。

[態様 5 5]

前記炎症性疾患は、呼吸器障害、敗血症、再灌流傷害、または血栓症である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 5 6]

前記心血管疾患は、冠動脈疾患、脳血管疾患、末梢動脈疾患、アテローム性大動脈硬化症、または動脈瘤である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 5 7]

前記冠動脈疾患は、心筋梗塞、狭心症、または心不全である、態様 5 6 に記載の方法。

[態様 5 8]

前記脳血管疾患は、脳卒中または一過性虚血発作である、態様 5 6 に記載の方法。

[態様 5 9]

前記神経変性疾患は、パーキンソン病である、態様 4 9 に記載の方法。

[態様 6 0]

前記疾患または障害は、糖尿病またはインスリン抵抗性である、態様 4 8 に記載の方法。

[態様 6 1]

アテローム動脈硬化性プラークの形成の治療または予防をそれを必要とする患者において行う方法であって、態様 1 ~ 4 5 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩の治療的有効量を前記患者に投与することを含む、前記方法。

10

20

30

40

50