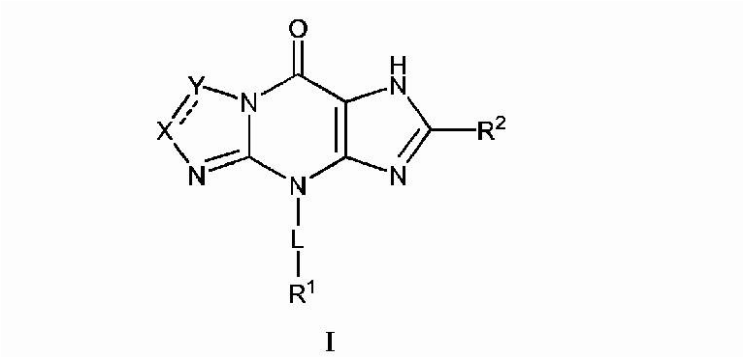
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成22年7月15日(2010.7.15)

【公表番号】特表2009-541355(P2009-541355A)
【公表日】平成21年11月26日(2009.11.26)
【年通号数】公開・登録公報2009-047
【出願番号】特願2009-516748(P2009-516748)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 487/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 5/50 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 487/14 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/519
Ａ６１Ｐ 3/06
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 5/50
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１

【手続補正書】
【提出日】平成22年5月26日(2010.5.26)
【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：
【化１】



Ｉ

（式中、
点線は場合により結合する部分を示し；
Ｘは、Ｎ、ＣＲ^{3a}、ＣＲ^{4a}Ｒ^{5a}又はＮＲ^{6a}であり；
Ｙは、Ｎ、ＣＲ^{3b}、ＣＲ^{4b}Ｒ^{5b}又はＮＲ^{6b}であり；
Ｌは、場合により１、２、３、４又は５個のＲ^{L1}で置換された、－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）－（Ｑ^{1}）$_{m}$－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）$_{p}$－（Ｑ^{2}）$_{q}$－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）$_{r}$

－（式中、ｍ及びｑがいずれも１である場合、ｐは１である）であり；
Ｒ[1]は、Ｈ、Ｃ[1－10]アルキル、Ｃ[2－10]アルケニル、Ｃ[2－10]アルキニル又はＣｙであり、前記Ｃ[1－10]アルキル、Ｃ[2－10]アルケニル又はＣ[2－10]アルキニルは、場合により１、２、３、４又は５個のＲ[L2]で置換されており；
Ｒ[2]は、ハロ、シアノ、Ｃ[1－3]ハロアルキル、Ｚ、ＳＲ[A]又は式：
【化２】



を有する部分であり；
Ｒ[3a]及びＲ[3b]は、Ｈ、ハロ、Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル、Ｃ[2－6]アルキニル、Ｃ[1－6]ハロアルキル、Ｃ[1－6]ヒドロキシアルキル、Ｃ[1－6]シアノアルキル、Ｃｙ[1]、ＣＮ、ＮＯ[2]、ＯＲ[a]、ＳＲ[a]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b]、ＮＲ[c]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c]Ｒ[d]から独立して選択され、前記Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル又はＣ[2－6]アルキニルは、場合により、Ｃｙ[1]、ＣＮ、ＮＯ[2]、ハロ、ＯＲ[a]、ＳＲ[a]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、ＮＲ[c]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c]Ｒ[d]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b]、ＮＲ[c]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c]Ｒ[d]から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
Ｒ[4a]、Ｒ[4b]、Ｒ[5a]及びＲ[5b]は、Ｈ、ハロ、Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル、Ｃ[2－6]アルキニル、Ｃ[1－6]ハロアルキル、Ｃ[1－6]ヒドロキシアルキル、Ｃ[1－6]シアノアルキル、Ｃｙ[2]、ＣＮ、ＮＯ[2]、ＯＲ[a1]、ＳＲ[a1]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c1]Ｒ[d1]から独立して選択され、前記Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル及びＣ[2－6]アルキニルは、場合により、Ｃｙ[2]、ＣＮ、ＮＯ[2]、ＯＲ[a1]、ＳＲ[a1]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c1]Ｒ[d1]から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
Ｒ[6a]及びＲ[6b]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、Ｃ[1－6]ハロアルキル、Ｃｙ[2]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c1]Ｒ[d1]から独立して選択され、前記Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル及びＣ[2－6]アルキニルは、場合により、Ｃｙ[2]、ＣＮ、ＮＯ[2]、ＯＲ[a1]、ＳＲ[a1]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、ＮＲ[c1]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a1]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b1]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c1]Ｒ[d1]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]、ＮＲ[c1]Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b1]及びＳ（Ｏ）[2]ＮＲ[c1]Ｒ[d1]から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
Ｒ[L1]及びＲ[L2]は、ハロ、Ｃ[1－6]アルキル、Ｃ[2－6]アルケニル、Ｃ[2－6]アルキニル、Ｃ[1－6]ハロアルキル、ＣＮ、ＮＯ[2]、ＯＲ[a2]、ＳＲ[a2]、Ｃ（Ｏ）Ｒ[b2]、Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c2]Ｒ[d2]、Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a2]、ＯＣ（Ｏ）Ｒ[b2]、ＯＣ（Ｏ）ＮＲ[c2]Ｒ[d2]、ＮＲ[c2]Ｒ[d2]、ＮＲ[c2]Ｃ（Ｏ）Ｒ[b2]、ＮＲ[c2]Ｃ（Ｏ）ＮＲ[c2]Ｒ[d2]、ＮＲ[c2]Ｃ（Ｏ）ＯＲ[a2]、Ｓ（Ｏ）Ｒ[b2]、Ｓ（Ｏ）ＮＲ[c2]Ｒ[d2]、Ｓ（Ｏ）[2]Ｒ[b2]、Ｎ

$R^{c2}S(O)_2R^{b2}$及び$S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$から独立して選択され；
R^{2a}は、H、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-10}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^4、CN、NO_2、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$又は$C(O)OR^{a6}$であり；
Cyは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a3}、SR^{a3}、$C(O)R^{b3}$、$C(O)NR^{c3}R^{d3}$、$C(O)OR^{a3}$、$OC(O)R^{b3}$、$OC(O)NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}C(O)R^{b3}$、$NR^{c3}C(O)OR^{a3}$、$S(O)R^{b3}$、$S(O)NR^{c3}R^{d3}$、$S(O)_2R^{b3}$及び$S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；
Cy^1及びCy^2は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル又はC_{2-4}アルキニルは、場合により、CN、NO_2、ハロ、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換されており；
Cy^3及びCy^4は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され；
Zは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；
R^Aは、H又はC_{1-4}アルキルであり；
Q^1及びQ^2は、O、S、NH、CH_2、CO、CS、SO、SO_2、OCH_2、SCH_2、$NHCH_2$、CH_2CH_2、$COCH_2$、CONH、COO、$SOCH_2$、SONH、SO_2CH_2及びSO_2NHから独立して選択され；
R^a及びR^{a1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{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^{c}

^{5}C（O）NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C（O）OR^{a5}、S（O）R^{b5}、S（O）NR^{c5}R^{d5}、S（O）$_2$R^{b5}、NR^{c5}S（O）$_2$R^{b5}及びS（O）$_2$NR^{c5}R^{d5}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されており；

R^{a2}、R^{a3}、R^{a4}、R^{a5}及びR^{a6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C$_{1-6}$アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^{b}及びR^{b1}は、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$_{2-6}$アルキニル及びCy^{2}から独立して選択され、前記C$_{1-6}$アルキル、C$_{1-6}$ハロアルキル、C$_{2-6}$アルケニル又はC$_{2-6}$アルキニルは、場合により、ハロ、C$_{1-6}$アルキル、C$_{2-6}$アルケニル、C$_{2-6}$アルキニル、C$_{1-6}$ハロアルキル、C$_{1-6}$ヒドロキシアルキル、C$_{1-6}$シアノアルキル、Cy^{2}、CN、NO$_2$、OR^{a5}、SR^{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）NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C（O）OR^{a5}、S（O）R^{b5}、S（O）NR^{c5}R^{d5}、S（O）$_2$R^{b5}、NR^{c5}S（O）$_2$R^{b5}及びS（O）$_2$NR^{c5}R^{d5}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されており；

R^{b2}、R^{b3}、R^{b4}、R^{b5}及びR^{b6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C$_{1-6}$アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^{c}及びR^{d}は、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$_{2-6}$アルキニル及びCy^{2}から独立して選択され、前記C$_{1-6}$アルキル、C$_{1-6}$ハロアルキル、C$_{2-6}$アルケニル又はC$_{2-6}$アルキニルは、場合により、ハロ、C$_{1-6}$アルキル、C$_{2-6}$アルケニル、C$_{2-6}$アルキニル、C$_{1-6}$ハロアルキル、C$_{1-6}$ヒドロキシアルキル、C$_{1-6}$シアノアルキル、Cy^{2}、CN、NO$_2$、OR^{a5}、SR^{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）NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C（O）OR^{a5}、S（O）R^{b5}、S（O）NR^{c5}R^{d5}、S（O）$_2$R^{b5}、NR^{c5}S（O）$_2$R^{b5}及びS（O）$_2$NR^{c5}R^{d5}から独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されているか；或いは

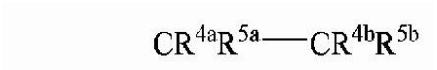
R^{c}及びR^{d}は、それらが結合しているN原子と共に、場合によりハロ、C$_{1-6}$アルキル、C$_{2-6}$アルケニル、C$_{2-6}$アルキニル、C$_{1-6}$ハロアルキル、C$_{1-6}$ヒドロキシアルキル、C$_{1-6}$シアノアルキル、Cy^{2}、CN、NO$_2$、OR^{a5}、SR^{a5}、C（O）R^{b5}、C（O）NR^{c5}R^{d5}、C（O）OR^{a5}、OC（O）R^{b5}、OC（O）NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C（O）R^{b5}、NR^{c5}C（O）NR^{c5}R^{d5}、NR^{c5}C（O）OR^{a5}、S（O）R^{b5}、S（O）NR^{c5}R^{d5}、S（O）$_2$R^{b5}、NR^{c5}S（O）$_2$R^{b5}及びS（O）$_2$NR^{c5}R^{d5}から独立し

て選択される１、２又は３個の置換基で置換された４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c1}及びR^{d1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、ＣＮ、NO_2、OR^{a5}、SR^{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）$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C$（Ｏ）OR^{a5}、Ｓ（Ｏ）R^{b5}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されているか；或いは
R^{c1}及びR^{d1}は、それらが結合しているＮ原子と共に、場合によりハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、ＣＮ、NO_2、OR^{a5}、SR^{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）$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C$（Ｏ）OR^{a5}、Ｓ（Ｏ）R^{b5}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換された４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c2}及びR^{d2}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c2}及びR^{d2}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c3}及びR^{d3}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c3}及びR^{d3}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c4}及びR^{d4}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c4}及びR^{d4}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c5}及びR^{d5}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c5}及びR^{d5}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
R^{c6}及びR^{d6}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c6}及びR^{d6}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
ｍ、ｐ、ｑ及びｒは、０及び１から独立して選択され、
但し、
（ａ）
【化３】



が
【化４】

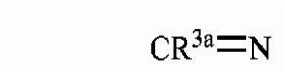


である場合、R^2は、ハロ、C_{1-3}ハロアルキル、Ｚ又はSR^A以外であり；
（ｂ）
【化５】



が

【化６】



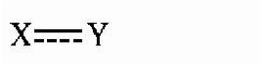
である場合、Ｒ^{2}はＺ以外であり；
（ｃ）
【化７】



が
【化８】



であり、及びＲ^{3b}がＨ又は非置換アリールである場合、Ｒ^{2}は非置換アリール以外であり；
（ｄ）
【化９】



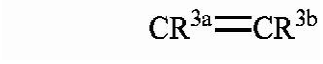
が
【化１０】



である場合、Ｒ^{2}はアリール以外であり；そして
（ｅ）
【化１１】



が
【化１２】



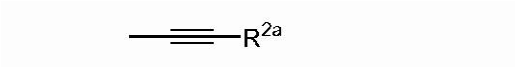
である場合、－Ｌ－Ｒ^{1}はメチル以外である
ことを条件とする）
の化合物、又は医薬的に許容されるその塩若しくはプロドラッグ。
【請求項２】
ＸがＮである、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３】
ＸがＣＨである、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項４】
ＹがＣＲ^{3b}である、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５】
ＹがＣＨである、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項６】
ＹがＣ－Ｍｅである、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項７】
ＸがＣＨであり、ＹがＮである、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項８】
R^{3a}及びR^{3b}が、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、Cy^1、OR^a、SR^a、S（O）R^b、S（O）$_2R^b$及びNR^cR^dから独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルが、場合により、Cy^1、CN、NO_2、ハロ、OR^a、SR^a、C（O）R^b、C（O）NR^cR^d、C（O）OR^a、OC（O）R^b、OC（O）NR^cR^d、NR^cR^d、NR^cC（O）R^b、NR^cC（O）NR^cR^d、NR^cC（O）OR^a、S（O）R^b、S（O）NR^cR^d、S（O）$_2R^b$、NR^cS（O）$_2R^b$及びS（O）$_2NR^cR^d$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項９】
R^{3a}及びR^{3b}が、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、Cy^1、OR^a、SR^a及びNR^cR^dから独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルが、場合により、Cy^1、CN、NO_2、OR^a、SR^a、C（O）R^b、C（O）NR^cR^d、C（O）OR^a、OC（O）R^b、OC（O）NR^cR^d、NR^cR^d、NR^cC（O）R^b、NR^cC（O）NR^cR^d、NR^cC（O）OR^a、S（O）R^b、S（O）NR^cR^d、S（O）$_2R^b$、NR^cS（O）$_2R^b$及びS（O）$_2NR^cR^d$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１０】
R^{3a}及びR^{3b}が、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、Cy^1、OR^a、SR^a及びNR^cR^dから独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルが、場合により、Cy^1、C（O）NR^cR^d、C（O）OR^a及びNR^cC（O）R^bから独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１１】
R^{3a}及びR^{3b}が、H、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、Cy^1、ハロ、OR^a、SR^a、S（O）R^b、S（O）$_2R^b$及びNR^cR^dから独立して選択され、前記C_{1-6}アルキルが、場合により、Cy^1、C（O）NR^cR^d、C（O）OR^a、ハロ、OR^a、NR^cR^d、NR^cC（O）NR^cR^d及びNR^cC（O）R^bから独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１２】
R^{3a}及びR^{3b}の少なくとも１つがCy^1から選択され；
Cy^1が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、OR^{a4}、SR^{a4}、C（O）R^{b4}、C（O）$NR^{c4}R^{d4}$、C（O）OR^{a4}及びCy^3から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル及びC_{2-4}アルキニルが、場合により、ハロ、OR^{a4}及びCy^3から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして
Cy^3が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、CN、NO_2、$NR^{c6}R^{d6}$、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、
請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項１３】
R^{3a}及びR^{3b}の少なくとも１つがC_{1-6}アルキル及びC_{1-6}ハロアルキルから選択され、前記C_{1-6}アルキルが、場合により$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、NR^cR^d、$NR^cC(O)NR^cR^d$及び$NR^cC(O)R^b$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１４】
R^{3a}及びR^{3b}の少なくとも１つがC_{1-3}アルキルから選択され、前記C_{1-3}アルキルが、Cy^1で置換され、及び場合によりハロ、OR^a及びSR^aから独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；
Cy^1が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル及びC_{2-4}アルキニルが、場合により、OR^{a4}及びCy^3から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして
Cy^3が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、
請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１５】
R^{3a}及びR^{3b}の少なくとも１つがC_{1-3}アルキルから選択され、前記C_{1-3}アルキルが、Cy^1で置換され、及び場合によりハロ、OR^a及びSR^aから独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；
Cy^1が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$及びCy^3から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル及びC_{2-4}アルキニルが、場合により、OR^{a4}及びCy^3から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして
Cy^3が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、CN、NO_2、$NR^{c6}R^{d6}$、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、
請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１６】
R^{3a}及びR^{3b}の少なくとも１つがC_{1-3}アルキルから選択され、前記C_{1-3}アルキルが、Cy^1で置換され、及び場合によりハロ、OR^a及びSR^aから独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；
Cy^1が、各々が１又は２個のR^7で置換され、及び場合により１、２又は３個のR^8で

置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され；
R^7が、各々が存在する場合には、Cy^3及びC_{1-4}アルキルから独立して選択され、前記C_{1-4}アルキルが、１又は２個のCy^3で置換され、及び場合によりハロ及びOR^{a4}から独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；
R^8が、各々が存在する場合には、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$及び$C(O)OR^{a4}$から独立して選択され；そして
Cy^3が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、CN、NO_2、$NR^{c6}R^{d6}$、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、
請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１７】
R^{3a}及びR^{3b}が、H、ハロ、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}ハロアルキルから独立して選択される、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１８】
R^{3a}及びR^{3b}が、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択される、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項１９】
R^{3b}が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換された、アリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換されたヘテロアリールである、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２０】
R^{3b}が、場合によりフェニルで置換されたチアゾリルであり、前記フェニルが、場合によりOH及びハロから独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されている、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２１】
Cy^1が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル及びC_{2-4}アルキニルが、場合によりOR^{a4}及びCy^3から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項１～２０のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２２】
m及びqが０である、請求項１～２１のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２３】
R^1がH又はC_{1-10}アルキルである、請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項２４】
－Ｌ－Ｒ^{1}がＣ$_{1-10}$アルキルである、請求項１～２３のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２５】
－Ｌ－Ｒ^{1}が、場合によりハロ、ＯＨ及びＣＮから各々独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されたＣ$_{4-7}$アルキルである、請求項１～２４のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２６】
－Ｌ－Ｒ^{1}がブチル又はペンチルである、請求項１～２５のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２７】
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1}$ハロアルキル、Ｚ、ＳＲ^{A}、又は式：
【化１３】

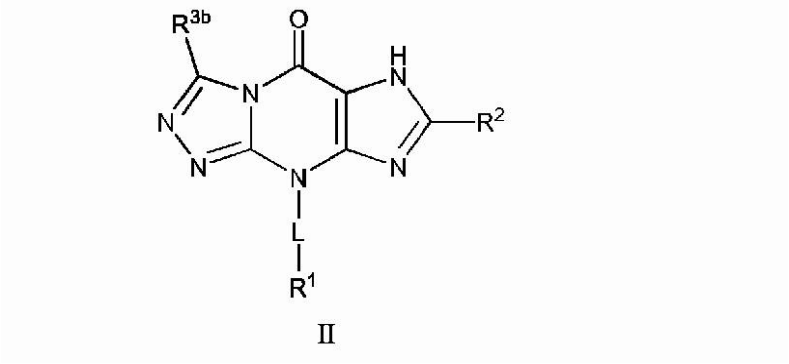


を有する部分である、請求項１～２６のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２８】
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1}$ハロアルキル、Ｚ又はＳＲ^{A}である、請求項１～２７のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項２９】
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ又はＣ$_{1}$ハロアルキルである、請求項１～２８のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３０】
Ｒ^{2}がハロ又はＣ$_{1}$ハロアルキルである、請求項１～２９のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３１】
Ｒ^{2}が、Ｃｌ、Ｂｒ又はＣＦ$_{3}$である、請求項１～３０のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３２】
Ｒ^{2}がＣｌ又はＢｒである、請求項１～３１のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３３】
Ｒ^{2}がＢｒである、請求項１～３２のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３４】
Ｒ^{2}が、式：
【化１４】



を有する部分である、請求項１～３１のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３５】
Ｒ^{2}がＳ－Ｍｅである、請求項１～２８のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３６】
Ｒ^{2}が、各々が、ハロ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、Ｃ$_{2-4}$アルケニル、Ｃ$_{2-4}$アルキニル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル及びＯＲ^{a4}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、請求項１～２６のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容

されるその塩。
【請求項３７】
下記式ＩＩ：
【化１５】



Ｉｉ

を有する、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３８】
R^{3b}が、Ｈ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、Cy^1、OR^a、SR^a、$S(O)R^b$、$S(O)_2R^b$及びNR^cR^dから選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルが、場合により、Cy^1、ＣＮ、NO_2、ハロ、OR^a、SR^a、$C(O)R^b$、$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、$OC(O)R^b$、$OC(O)NR^cR^d$、NR^cR^d、$NR^cC(O)R^b$、$NR^cC(O)NR^cR^d$、$NR^cC(O)OR^a$、$S(O)R^b$、$S(O)NR^cR^d$、$S(O)_2R^b$、$NR^cS(O)_2R^b$及び$S(O)_2NR^cR^d$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項３９】
R^{3b}が、Ｈ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、Cy^1、OR^a、SR^a、$S(O)R^b$、$S(O)_2R^b$及びNR^cR^dから選択され、前記C_{1-6}アルキルが、場合により、Cy^1、$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、ハロ、OR^a、NR^cR^d、$NR^cC(O)NR^cR^d$及び$NR^cC(O)R^b$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項４０】
R^{3b}がCy^1であり；
Cy^1が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$及びCy^3から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル及びC_{2-4}アルキニルが、場合により、ハロ、OR^{a4}及びCy^3から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして
Cy^3が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ＣＮ、NO_2、$NR^{c6}R^{d6}$、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、
請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項４１】
R^{3b}が、C_{1-6}アルキル又はC_{1-6}ハロアルキルであり、前記C_{1-6}アルキルが、場合により、$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、NR^cR^d、$NR^cC(O)N$

$R^{c}R^{d}$及び$NR^{c}C(O)R^{b}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されている、請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４２】

R^{3b}がC_{1-3}アルキルから選択され、前記C_{1-3}アルキルが、Cy^{1}で置換され、及び場合によりハロ、OR^{a}及びSR^{a}から独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；

Cy^{1}が、各々が１又は２個のR^{7}で置換され、及び場合により１、２又は３個のR^{8}で置換されている、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択され；

R^{7}が、各々が存在する場合には、Cy^{3}及びC_{1-4}アルキルから独立して選択され、前記C_{1-4}アルキルが、１又は２個のCy^{3}で置換され、及び場合によりハロ及びOR^{a4}から独立して選択される１又は２個の置換基で置換されており；

R^{8}が、各々が存在する場合には、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_{2}、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$及び$C(O)OR^{a4}$から独立して選択され；そして

Cy^{3}が、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、CN、NO_{2}、$NR^{c6}R^{d6}$、OR^{a6}及びSR^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから選択される、

請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４３】

LがC_{1-6}アルキレンであり；

R^{1}がH又はC_{1-3}アルキルであり、前記C_{1-3}アルキルが、場合により１、２、３、４又は５個のR^{L2}で置換されており；そして

R^{L2}が、各々が存在する場合には、ハロ、CN、NO_{2}及びOR^{a2}から独立して選択される、

請求項３７～４２のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４４】

R^{2}がハロ又はC_{1-3}ハロアルキルである、請求項３７～４３のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４５】

R^{2}がBrである、請求項３７～４４のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４６】

LがC_{1-18}アルキレンであり；

R^{3b}が、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、Cy^{1}、OR^{a}、SR^{a}又は$NR^{c}R^{d}$であり、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルが、場合により、Cy^{1}、CN、NO_{2}、OR^{a}、SR^{a}、$C(O)R^{b}$、$C(O)NR^{c}R^{d}$、$C(O)OR^{a}$、$OC(O)R^{b}$、$OC(O)NR^{c}R^{d}$、$NR^{c}R^{d}$、$NR^{c}C(O)R^{b}$、$NR^{c}C(O)NR^{c}R^{d}$、$NR^{c}C(O)OR^{a}$、$S(O)R^{b}$、$S(O)NR^{c}R^{d}$、$S(O)_{2}R^{b}$、$NR^{c}S(O)_{2}R^{b}$及び$S(O)_{2}NR^{c}R^{d}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして

R^{2}が、ハロ、シアノ、C_{1}　ハロアルキル、Z、SR^{A}又は式：

【化１６】



を有する部分である、

請求項３７～４５のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項４７】
ＬがＣ$_{1-18}$アルキレンであり；
Ｒ^{3b}が、Ｈ、ハロ、Ｃ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{2-6}$アルケニル、Ｃ$_{2-6}$アルキニル、Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1-6}$ヒドロキシアルキル、Ｃｙ^{1}、ＯＲ^{a}、ＳＲ^{a}又はＮＲ^{c}Ｒ^{d}であり、前記Ｃ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{2-6}$アルケニル及びＣ$_{2-6}$アルキニルが、場合により、Ｃｙ^{1}、Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{c}Ｒ^{d}、Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{a}及びＮＲ^{c}Ｃ（Ｏ）Ｒ^{b}から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；そして
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1}$ハロアルキル、Ｚ又はＳＲ^{A}である、
請求項３７～４６のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項４８】
ＬがＣ$_{1-18}$アルキレンであり；
Ｒ^{3b}が、各々が、ハロ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、Ｃ$_{2-4}$アルケニル、Ｃ$_{2-4}$アルキニル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＯＲ^{a6}、ＳＲ^{a6}から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換された、アリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で場合により置換されたヘテロアリールであり；そして
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1}$ハロアルキル、Ｚ、ＳＲ^{A}、又は式：
【化１７】

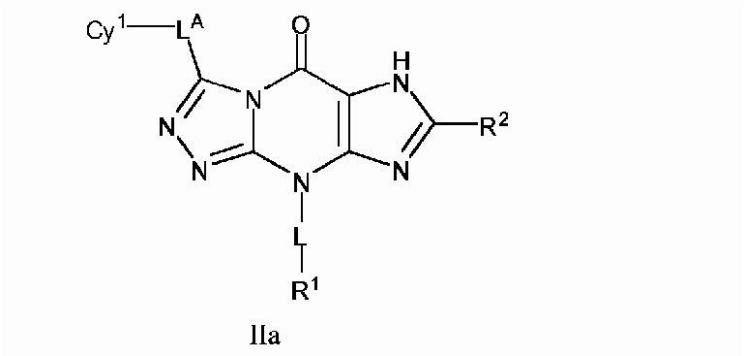


を有する部分である、
請求項３７～４７のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項４９】
ＬがＣ$_{1-18}$アルキレンであり；
Ｒ^{3b}が、場合によりフェニルで置換されたチアゾリルであり、前記フェニルが、場合により、ＯＨ及びハロから独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されており；
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1}$ハロアルキル、Ｚ、ＳＲ^{A}、又は式：
【化１８】



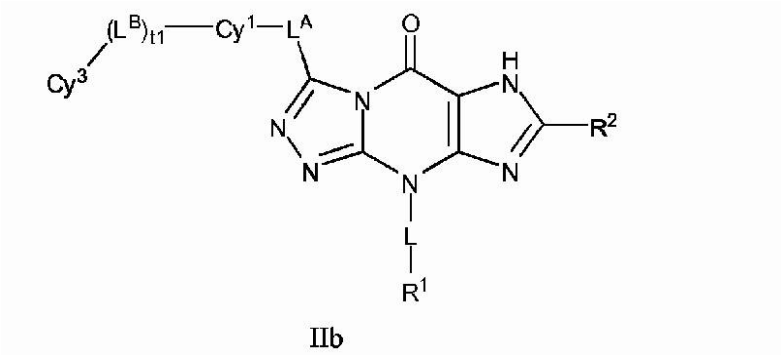
を有する部分である、
請求項３７～４８のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５０】
ＬがＣ$_{1-18}$アルキレンであり；
Ｒ^{3b}が、Ｈ、ハロ、Ｃ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{2-6}$アルケニル、Ｃ$_{2-6}$アルキニル又はＣ$_{1-6}$ハロアルキルであり；そして
Ｒ^{2}が、ハロ、シアノ又はＣ$_{1}$ハロアルキルである、
請求項３７～４９のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５１】
Ｒ^{3b}が、Ｃ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル又はＣｙ^{1}であり、前記Ｃ$_{1-6}$アルキルが、場合により、Ｃｙ^{1}、Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{c}Ｒ^{d}、Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{a}、ハロ、ＯＲ^{a}、ＳＲ^{a}、ＮＲ^{c}Ｒ^{d}、ＮＲ^{c}Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{c}Ｒ^{d}及びＮＲ^{c}Ｃ（Ｏ）Ｒ^{b}から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
Ｌが、場合により１、２、３、４又は５個のＲ^{L1}で置換されたＣ$_{1-6}$アルキレンであり；
Ｒ^{1}が、Ｈ又はＣ$_{1-3}$アルキルであり、前記Ｃ$_{1-3}$アルキルが、場合により１、２、３、４又は５個のＲ^{L2}で置換されており；
Ｒ^{L1}及びＲ^{L2}が、各々が存在する場合には、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$及びＯＲ^{a2}から独

立して選択され；そして
R^2が、ハロ又はC_{1-3}ハロアルキルである、
請求項３７～５０のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５２】
－Ｌ－R^1が、場合により１、２、３、４又は５個のハロで置換されたC_{2-7}アルキルであり；
R^2がハロである、
請求項３７～５１のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項５３】
化合物が、式ＩＩａ：
【化１９】



IIa

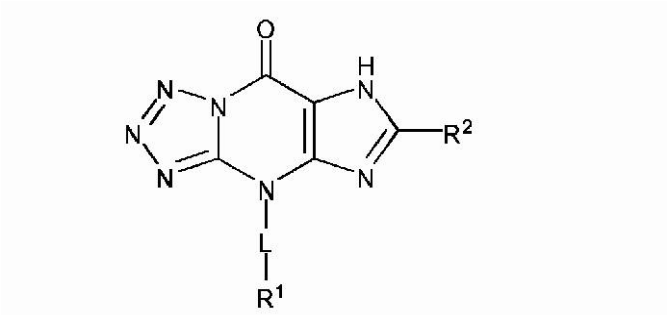
を有し；そして
L^Aが、場合によりハロ、OR^a及びSR^aから独立して選択される１又は２個の置換基で置換されたC_{1-3}アルキレンである、
請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５４】
化合物が、式ＩＩｂ：
【化２０】



IIb

を有し；
L^Aが、場合によりハロ、OR^a及びSR^aから独立して選択される１又は２個の置換基で置換されたC_{1-3}アルキレンであり；
L^Bが、ハロ及びOR^{a4}から独立して選択される１又は２個の置換基で置換されたC_{1-4}アルキレンであり；そして
ｔ１が０又は１である、
請求項３７に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５５】
式ＩＩＩ：

【化２１】



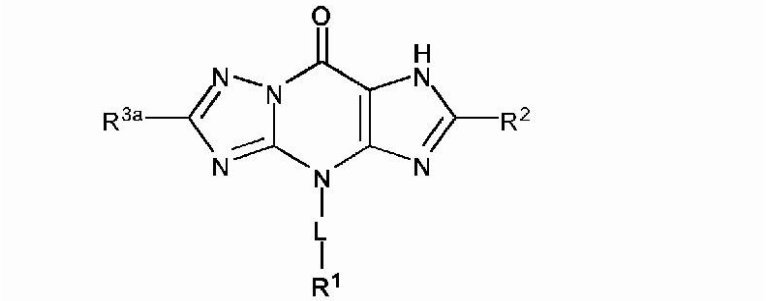
Ｉｉｉ

を有する、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項５６】

式ＩＶ：

【化２２】



Ｉｖ

を有する、請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項５７】

３－メチル－９－ペンチル－７－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

９－ブチル－３－メチル－７－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

９－ペンチル－７－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

９－ブチル－７－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－３－メチル－９－ブチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－クロロ－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；そして

７－クロロ－３－メチル－９－ブチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン

から選択される請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

【請求項５８】

７－ブロモ－３－（メチルチオ）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－３－（メチルスルフィニル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－３－（メチルスルホニル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１

，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－ヒドロキシ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ブチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ブチル－３－（メトキシメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－フェニル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリジン－３－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリジン－４－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリジン－２－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（１，３－チアゾール－２－イル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－プロピル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－［（ジメチルアミノ）メチル］－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－（１，３－チアゾール－２－イル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－７－（メチルチオ）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－フェニル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－ピリジン－４－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－（３，５－ジメチルイソオキサゾール－４－イル）－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－シクロプロピル－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－（４Ｈ－１，２，４－トリアゾール－４－イル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－シクロブチル－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（４－メトキシフェニル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（４－（トリフルオロメチル）フェニル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（４－メトキシベンジル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（３－ブロモベンジル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［

１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（３－ピリミジン－５－イルベンジル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリミジン－４－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピラジン－２－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－シクロプロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（ジメチルアミノ）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（３，３，３－トリフルオロプロピル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（２－フェニルエチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（ピリジン－４－イルメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（２－ピリジン－３－イルエチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（１－フェニルシクロプロピル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（２－メチルピリジン－４－イル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（３－フルオロピリジン－４－イル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（３－フルオロベンジル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（３－メトキシベンジル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（１，３－オキサゾール－４－イル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－イソオキサゾール－３－イル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（３－ピリジン－４－イルベンジル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（２－メトキシベンジル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
１－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）シクロプロパンカルボキサミド；
１－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）シクロプロパンカルボン酸；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（２，３－ジヒドロ－１，４－ベンゾジオキシン－６－イルメチル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－３－［（３－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－１，４－ベンゾオキサジン－６－イル）メチル］）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－ベンジル７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
６－ブロモ－４－ペンチル－４，７－ジヒドロ－８Ｈ－テトラゾロ［１，５－ａ］プリン－８－オン；
３－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）プロパン酸；
７－ブロモ－３－（３－モルホリン－４－イル－３－オキソプロピル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
Ｎ－ベンジル－３－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）プロパンアミド；
７－ブロモ－３－（３－オキソ－３－ピロリジン－１－イルプロピル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
３－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－３－イル）－Ｎ－メチルプロパンアミド；
３－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）－Ｎ－（２－フェニルエチル）プロパンアミド；
３－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）－Ｎ－（ピリジン－４－イルメチル）プロパンアミド；
３－［２－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（２－チエニルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（２－｛３－［４－（トリフルオロメチル）ベンジル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝エチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（４－フルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（４－メトキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（ピリジン－４－イルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（２－｛３－［３－（トリフルオロメチル）ベンジル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝エチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（２－｛３－［２－（トリフルオロメチル）ベンジル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝エチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロ

ロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（ピリジン－３－イルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（２－フェニルエチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－（３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－フルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（４－クロロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［２－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－７－クロロ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－フルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－メトキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－［２－（３－エチル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－メトキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－メチルベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２，４－ジフルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３，５－ジフルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（３－チエニルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（１－フェニルシクロプロピル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｄ］［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（ピリジン－２－イルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［（２Ｒ）－２－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロ

ピル］－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（２－｛３－［（４－メチル－１，３－チアゾール－２－イル）メチル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝エチル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－メチルベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－（２－｛３－［ヒドロキシ（フェニル）メチル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝エチル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２，５－ジフルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（ピリミジン－５－イルメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ブチル－３－｛２－［３－（２－フルオロベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［２－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－９－ペンチル－７－（トリフルオロメチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［２－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－７－シクロプロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－（２，２－ジフルオロシクロプロピル）－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－３－メチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（５－フェニル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［２－（５－ベンジル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）エチル］－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
Ｎ－［（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）メチル］ベンズアミド；
Ｎ－［（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）メチル］アセトアミド；
３－（１－ベンゾイルピペリジン－４－イル）－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［３－（３－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
２－ブロモ－４－ペンチル－１，４－ジヒドロ－９Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］プリン－９－オン；
３－メチル－９－ペンチル－７－（１，３－チアゾール－４－イル）－６，９－ジヒドロ

－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピラジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オントリフルオロアセテート；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピリジン－３－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オントリフルオロアセテート；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピリジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オントリフルオロアセテート；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピリジン－４－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オントリフルオロアセテート；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（２－チエニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－（１，３－ベンゾジオキソール－５－イルメチル）－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；そして
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリミジン－５－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン
から選択される請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。
【請求項５９】
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピリジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（３－ピリジン－４－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛２－［３－（２－チエニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－（１，３－ベンゾジオキソール－５－イルメチル）－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－ピリミジン－５－イル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－ピリジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－ピリジン－３－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－ピリジン－４－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾ

ロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－ピラジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛３－［３－（２－チエニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－｛３－［３－（３－チエニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－（３－｛３－［３－（トリフルオロメチル）フェニル］－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル｝プロピル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（４－フルオロフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（３－ピリミジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（２－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（３－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（４－エチニルフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（１Ｈ－インドール－５－イル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（１Ｈ－インドール－３－イル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（６－メトキシピリジン－３－イル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－｛３－［３－（４－アミノピリミジン－５－イル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－３－［３－（４－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－３－［３－（２－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－３－［３－（３－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾー

ル－５－イル］プロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（４－ヒドロキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－ヒドロキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－ヒドロキシベンジル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（４－フェニル－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［３－（４－フェニル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロピル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－３－［４－（５－フルオロ－２－ヒドロキシフェニル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル］プロピル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（４－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（３－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（３－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（２－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（２－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－２－［５－（２－クロロ－４－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］エチル－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（５－ピリジン－４－イル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（５－ピリジン－３－イル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；

７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（５－ピリジン－２－イル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（４－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（３－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛２－［３－（２－クロロ－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］エチル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
３－［２－（５－ベンジル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）エチル］－７－ブロモ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－｛３－［３－（２－クロロ－４－ヒドロキシフェニル）－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル］プロピル｝－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］－４－メトキシベンズアミド；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］ベンズアミド；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］イソニコチンアミド；
７－ブロモ－９－ペンチル－３－［２－（ピリミジン－２－イルアミノ）エチル］－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］ニコチンアミド；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］ピリジン－２－カルボキサミド；

３－アミノ－Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］イソニコチンアミド；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］－２－メチルイソニコチンアミド；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］－Ｎ'－フェニル尿素；
Ｎ－［２－（７－ブロモ－５－オキソ－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－３－イル）エチル］－４－ヒドロキシベンズアミド；
３－メチル－７－（ペンタフルオロエチル）－９－ペンチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－メチル－９－（４，４，４－トリフルオロブチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－３－メチル－９－（５，５，５－トリフルオロペンチル）－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；
７－ブロモ－９－（４－フルオロブチル）－３－メチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン；そして
７－ブロモ－９－（４－フルオロペンチル）－３－メチル－６，９－ジヒドロ－５Ｈ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］プリン－５－オン
から選択される請求項１に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩。

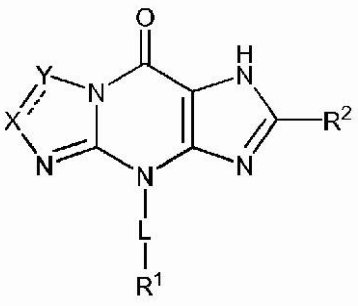
【請求項６０】

請求項１～５９のいずれか一項に記載の化合物又は医薬的に許容されるその塩、及び少なくとも１つの医薬的に許容される担体を含有する組成物。

【請求項６１】

ＨＭ７４ａ受容体を調節する方法であって、式Ｉ：

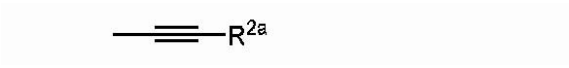
【化２３】



Ｉ

（式中、
点線は場合により結合する部分を示し；
Ｘは、Ｎ、ＣＲ^{3a}、ＣＲ^{4a}Ｒ^{5a}又はＮＲ^{6a}であり；
Ｙは、Ｎ、ＣＲ^{3b}、ＣＲ^{4b}Ｒ^{5b}又はＮＲ^{6b}であり；
Ｌは、場合により１、２、３、４又は５個のＲ^{L1}で置換された、－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）－（Ｑ^{1}）$_{m}$－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）$_{p}$－（Ｑ^{2}）$_{q}$－（Ｃ$_{1-6}$アルキレン）$_{r}$－（式中、ｍ及びｑがいずれも１である場合、ｐは１である）であり；
Ｒ^{1}は、Ｈ、Ｃ$_{1-10}$アルキル、Ｃ$_{2-10}$アルケニル、Ｃ$_{2-10}$アルキニル又はＣｙであり、前記Ｃ$_{1-10}$アルキル、Ｃ$_{2-10}$アルケニル又はＣ$_{2-10}$アルキニルは、場合により１、２、３、４又は５個のＲ^{L2}で置換されており；
Ｒ^{2}は、ハロ、シアノ、Ｃ$_{1-3}$ハロアルキル、Ｚ、ＳＲ^{A}又は式：

【化２４】



を有する部分であり；
R^{3a}及びR^{3b}は、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^1、CN、NO_2、OR^a、SR^a、$C(O)R^b$、$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、$OC(O)R^b$、$OC(O)NR^cR^d$、NR^cR^d、$NR^cC(O)R^b$、$NR^cC(O)NR^cR^d$、$NR^cC(O)OR^a$、$S(O)R^b$、$S(O)NR^cR^d$、$S(O)_2R^b$、$NR^cS(O)_2R^b$及び$S(O)_2NR^cR^d$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^1、CN、NO_2、ハロ、OR^a、SR^a、$C(O)R^b$、$C(O)NR^cR^d$、$C(O)OR^a$、$OC(O)R^b$、$OC(O)NR^cR^d$、NR^cR^d、$NR^cC(O)R^b$、$NR^cC(O)NR^cR^d$、$NR^cC(O)OR^a$、$S(O)R^b$、$S(O)NR^cR^d$、$S(O)_2R^b$、$NR^cS(O)_2R^b$及び$S(O)_2NR^cR^d$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{4a}、R^{4b}、R^{5a}及びR^{5b}は、H、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、$C(O)R^{b1}$、$C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$C(O)OR^{a1}$、$OC(O)R^{b1}$、$OC(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)R^{b1}$、$NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)OR^{a1}$、$S(O)R^{b1}$、$S(O)NR^{c1}R^{d1}$、$S(O)_2R^{b1}$、$NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$及び$S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、$C(O)R^{b1}$、$C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$C(O)OR^{a1}$、$OC(O)R^{b1}$、$OC(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)R^{b1}$、$NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)OR^{a1}$、$S(O)R^{b1}$、$S(O)NR^{c1}R^{d1}$、$S(O)_2R^{b1}$、$NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$及び$S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{6a}及びR^{6b}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、C_{1-6}ハロアルキル、Cy^2、$C(O)R^{b1}$、$C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$C(O)OR^{a1}$、$S(O)R^{b1}$、$S(O)NR^{c1}R^{d1}$、$S(O)_2R^{b1}$、$NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$及び$S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、$C(O)R^{b1}$、$C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$C(O)OR^{a1}$、$OC(O)R^{b1}$、$OC(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)R^{b1}$、$NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C(O)OR^{a1}$、$S(O)R^{b1}$、$S(O)NR^{c1}R^{d1}$、$S(O)_2R^{b1}$、$NR^{c1}S(O)_2R^{b1}$及び$S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{L1}及びR^{L2}は、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a2}、SR^{a2}、$C(O)R^{b2}$、$C(O)NR^{c2}R^{d2}$、$C(O)OR^{a2}$、$OC(O)R^{b2}$、$OC(O)NR^{c2}R^{d2}$、$NR^{c2}R^{d2}$、$NR^{c2}C(O)R^{b2}$、$NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}$、$NR^{c2}C(O)OR^{a2}$、$S(O)R^{b2}$、$S(O)NR^{c2}R^{d2}$、$S(O)_2R^{b2}$、$NR^{c2}S(O)_2R^{b2}$及び$S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$から独立して選択され；
R^{2a}は、H、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-10}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^4、CN、NO_2、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$又は$C(O)OR^{a6}$であり；
Cyは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、

C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a3}、SR^{a3}、$C(O)R^{b3}$、$C(O)NR^{c3}R^{d3}$、$C(O)OR^{a3}$、$OC(O)R^{b3}$、$OC(O)NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}C(O)R^{b3}$、$NR^{c3}C(O)OR^{a3}$、$S(O)R^{b3}$、$S(O)NR^{c3}R^{d3}$、$S(O)_2R^{b3}$及び$S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；

Cy^1及びCy^2は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル又はC_{2-4}アルキニルは、場合により、CN、NO_2、ハロ、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換されており；

Cy^3及びCy^4は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され；

Zは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；

R^Aは、H又はC_{1-4}アルキルであり；

Q^1及びQ^2は、O、S、NH、CH_2、CO、CS、SO、SO_2、OCH_2、SCH_2、$NHCH_2$、CH_2CH_2、$COCH_2$、CONH、COO、$SOCH_2$、SONH、SO_2CH_2及びSO_2NHから独立して選択され；

R^a及びR^{a1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されており；

R^{a2}、R^{a3}、R^{a4}、R^{a5}及びR^{a6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロ

アリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^b及びR^{b1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されており；

R^{b2}、R^{b3}、R^{b4}、R^{b5}及びR^{b6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^c及びR^dは、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されているか；或いは

R^c及びR^dは、それらが結合しているN原子と共に、場合によりハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換された4員、5員、6員又は7員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c1}及びR^{d1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、

C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、C(O)R^{b5}、C(O)$NR^{c5}R^{d5}$、C(O)OR^{a5}、OC(O)R^{b5}、OC(O)$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、S(O)R^{b5}、S(O)$NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されているか；或いは

R^{c1}及びR^{d1}は、それらが結合しているN原子と共に、場合によりハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、C(O)R^{b5}、C(O)$NR^{c5}R^{d5}$、C(O)OR^{a5}、OC(O)R^{b5}、OC(O)$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、S(O)R^{b5}、S(O)$NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換された4員、5員、6員又は7員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c2}及びR^{d2}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは

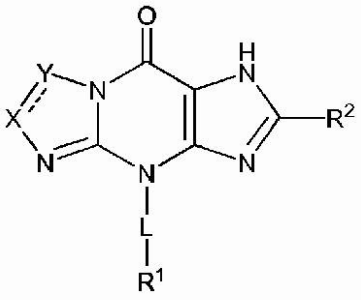
R^{c2}及びR^{d2}は、それらが結合しているN原子と共に4員、5員、6員又は7員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c3}及びR^{d3}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは

R^{c3}及びR^{d3}は、それらが結合しているN原子と共に4員、5員、6員又は7員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c4}及びR^{d4}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換

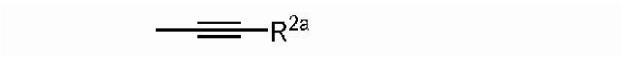
されているか；或いは
R^{c4}及びR^{d4}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c5}及びR^{d5}は、Ｈ、C_{1-10}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c5}及びR^{d5}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
R^{c6}及びR^{d6}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c6}及びR^{d6}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
ｍ、ｐ、ｑ及びｒは、０及び１から独立して選択される）
の化合物、又は医薬的に許容されるその塩若しくはプロドラッグと、前記ＨＭ７４ａ受容体とを接触させることを含む、
前記方法。
【請求項６２】
前記調節が作動することである、請求項６１に記載の方法。
【請求項６３】
式Ｉ：
【化２５】



I

（式中、
点線は場合により結合する部分を示し；
Ｘは、Ｎ、CR^{3a}、$CR^{4a}R^{5a}$又はNR^{6a}であり；
Ｙは、Ｎ、CR^{3b}、$CR^{4b}R^{5b}$又はNR^{6b}であり；

Lは、場合により１、２、３、４又は５個のR^{L1}で置換された、－（C_{1-6}アルキレン）－（Q^1）$_m$－（C_{1-6}アルキレン）$_p$－（Q^2）$_q$－（C_{1-6}アルキレン）$_r$－（式中、ｍ及びｑがいずれも１である場合、ｐは１である）であり；
R^1は、Ｈ、C_{1-10}アルキル、C_{2-10}アルケニル、C_{2-10}アルキニル又はＣｙであり、前記C_{1-10}アルキル、C_{2-10}アルケニル又はC_{2-10}アルキニルは、場合により１、２、３、４又は５個のR^{L2}で置換されており；
R^2は、ハロ、シアノ、C_{1-3}ハロアルキル、Ｚ、SR^A又は式：
【化２６】



を有する部分であり；
R^{3a}及びR^{3b}は、Ｈ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^1、ＣＮ、NO_2、OR^a、SR^a、Ｃ（Ｏ）R^b、Ｃ（Ｏ）NR^cR^d、Ｃ（Ｏ）OR^a、ＯＣ（Ｏ）R^b、ＯＣ（Ｏ）NR^cR^d、NR^cR^d、NR^cC（Ｏ）R^b、NR^cC（Ｏ）NR^cR^d、NR^cC（Ｏ）OR^a、Ｓ（Ｏ）R^b、Ｓ（Ｏ）NR^cR^d、Ｓ（Ｏ）$_2R^b$、NR^cS（Ｏ）$_2R^b$及びＳ（Ｏ）$_2NR^cR^d$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^1、ＣＮ、NO_2、ハロ、OR^a、SR^a、Ｃ（Ｏ）R^b、Ｃ（Ｏ）NR^cR^d、Ｃ（Ｏ）OR^a、ＯＣ（Ｏ）R^b、ＯＣ（Ｏ）NR^cR^d、NR^cR^d、NR^cC（Ｏ）R^b、NR^cC（Ｏ）NR^cR^d、NR^cC（Ｏ）OR^a、Ｓ（Ｏ）R^b、Ｓ（Ｏ）NR^cR^d、Ｓ（Ｏ）$_2R^b$、NR^cS（Ｏ）$_2R^b$及びＳ（Ｏ）$_2NR^cR^d$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{4a}、R^{4b}、R^{5a}及びR^{5b}は、Ｈ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、ＣＮ、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、Ｃ（Ｏ）R^{b1}、Ｃ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｃ（Ｏ）OR^{a1}、ＯＣ（Ｏ）R^{b1}、ＯＣ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）R^{b1}、$NR^{c1}C$（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）OR^{a1}、Ｓ（Ｏ）R^{b1}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｓ（Ｏ）$_2R^{b1}$、$NR^{c1}S$（Ｏ）$_2R^{b1}$及びＳ（Ｏ）$_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^2、ＣＮ、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、Ｃ（Ｏ）R^{b1}、Ｃ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｃ（Ｏ）OR^{a1}、ＯＣ（Ｏ）R^{b1}、ＯＣ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）R^{b1}、$NR^{c1}C$（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）OR^{a1}、Ｓ（Ｏ）R^{b1}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｓ（Ｏ）$_2R^{b1}$、$NR^{c1}S$（Ｏ）$_2R^{b1}$及びＳ（Ｏ）$_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{6a}及びR^{6b}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、C_{1-6}ハロアルキル、Cy^2、Ｃ（Ｏ）R^{b1}、Ｃ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｃ（Ｏ）OR^{a1}、Ｓ（Ｏ）R^{b1}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｓ（Ｏ）$_2R^{b1}$、$NR^{c1}S$（Ｏ）$_2R^{b1}$及びＳ（Ｏ）$_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル及びC_{2-6}アルキニルは、場合により、Cy^2、ＣＮ、NO_2、OR^{a1}、SR^{a1}、Ｃ（Ｏ）R^{b1}、Ｃ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｃ（Ｏ）OR^{a1}、ＯＣ（Ｏ）R^{b1}、ＯＣ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）R^{b1}、$NR^{c1}C$（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、$NR^{c1}C$（Ｏ）OR^{a1}、Ｓ（Ｏ）R^{b1}、Ｓ（Ｏ）$NR^{c1}R^{d1}$、Ｓ（Ｏ）$_2R^{b1}$、$NR^{c1}S$（Ｏ）$_2R^{b1}$及びＳ（Ｏ）$_2NR^{c1}R^{d1}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換されており；
R^{L1}及びR^{L2}は、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、ＣＮ、NO_2、OR^{a2}、SR^{a2}、Ｃ（Ｏ）R^{b2}、Ｃ（Ｏ）$NR^{c2}R^{d2}$、Ｃ（Ｏ）OR^{a2}、ＯＣ（Ｏ）R^{b2}、ＯＣ（Ｏ）$NR^{c2}R^{d2}$

、$NR^{c2}R^{d2}$、$NR^{c2}C(O)R^{b2}$、$NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}$、$NR^{c2}C(O)OR^{a2}$、$S(O)R^{b2}$、$S(O)NR^{c2}R^{d2}$、$S(O)_2R^{b2}$、$NR^{c2}S(O)_2R^{b2}$及び$S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$から独立して選択され；

R^{2a}は、H、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-10}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^4、CN、NO_2、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$又は$C(O)OR^{a6}$であり；

Cyは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a3}、SR^{a3}、$C(O)R^{b3}$、$C(O)NR^{c3}R^{d3}$、$C(O)OR^{a3}$、$OC(O)R^{b3}$、$OC(O)NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}R^{d3}$、$NR^{c3}C(O)R^{b3}$、$NR^{c3}C(O)OR^{a3}$、$S(O)R^{b3}$、$S(O)NR^{c3}R^{d3}$、$S(O)_2R^{b3}$及び$S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；

Cy^1及びCy^2は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され、前記C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル又はC_{2-4}アルキニルは、場合により、CN、NO_2、ハロ、OR^{a4}、SR^{a4}、$C(O)R^{b4}$、$C(O)NR^{c4}R^{d4}$、$C(O)OR^{a4}$、$OC(O)R^{b4}$、$OC(O)NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}R^{d4}$、$NR^{c4}C(O)R^{b4}$、$NR^{c4}C(O)OR^{a4}$、$S(O)R^{b4}$、$S(O)NR^{c4}R^{d4}$、$S(O)_2R^{b4}$、$S(O)_2NR^{c4}R^{d4}$及びCy^3から独立して選択される1、2又は3個の置換基で置換されており；

Cy^3及びCy^4は、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルから独立して選択され；

Zは、各々が、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{2-4}アルケニル、C_{2-4}アルキニル、C_{1-4}ハロアルキル、CN、NO_2、OR^{a6}、SR^{a6}、$C(O)R^{b6}$、$C(O)NR^{c6}R^{d6}$、$C(O)OR^{a6}$、$OC(O)R^{b6}$、$OC(O)NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}R^{d6}$、$NR^{c6}C(O)R^{b6}$、$NR^{c6}C(O)OR^{a6}$、$S(O)R^{b6}$、$S(O)NR^{c6}R^{d6}$、$S(O)_2R^{b6}$及び$S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合により置換された、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルであり；

R^Aは、H又はC_{1-4}アルキルであり；

Q^1及びQ^2は、O、S、NH、CH_2、CO、CS、SO、SO_2、OCH_2、SCH_2、$NHCH_2$、CH_2CH_2、$COCH_2$、CONH、COO、$SOCH_2$、SONH、SO_2CH_2及びSO_2NHから独立して選択され；

R^a及びR^{a1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}

、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されており；

R^{a2}、R^{a3}、R^{a4}、R^{a5}及びR^{a6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^{b}及びR^{b1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されており；

R^{b2}、R^{b3}、R^{b4}、R^{b5}及びR^{b6}は、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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記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、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、シアノ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されており；

R^{c}及びR^{d}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されているか；或いは

R^{c}及びR^{d}は、それらが結合しているN原子と共に、場合によりハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)N$

$R^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換された４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c1}及びR^{d1}は、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}アルキニル及びCy^2から独立して選択され、前記C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{2-6}アルケニル又はC_{2-6}アルキニルは、場合により、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２、３、４又は５個の置換基で置換されているか；或いは

R^{c1}及びR^{d1}は、それらが結合しているN原子と共に、場合によりハロ、C_{1-6}アルキル、C_{2-6}アルケニル、C_{2-6}アルキニル、C_{1-6}ハロアルキル、C_{1-6}ヒドロキシアルキル、C_{1-6}シアノアルキル、Cy^2、CN、NO_2、OR^{a5}、SR^{a5}、$C(O)R^{b5}$、$C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$C(O)OR^{a5}$、$OC(O)R^{b5}$、$OC(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)R^{b5}$、$NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$、$NR^{c5}C(O)OR^{a5}$、$S(O)R^{b5}$、$S(O)NR^{c5}R^{d5}$、$S(O)_2R^{b5}$、$NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$及び$S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$から独立して選択される１、２又は３個の置換基で置換された４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c2}及びR^{d2}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは

R^{c2}及びR^{d2}は、それらが結合しているN原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c3}及びR^{d3}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりOH、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは

R^{c3}及びR^{d3}は、それらが結合しているN原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；

R^{c4}及びR^{d4}は、H、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロ

アルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c4}及びR^{d4}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；
R^{c5}及びR^{d5}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c5}及びR^{d5}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
R^{c6}及びR^{d6}は、Ｈ、C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル及びヘテロシクロアルキルアルキルから独立して選択され、前記C_{1-10}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、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル又はヘテロシクロアルキルアルキルは、場合によりＯＨ、アミノ、ハロ、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}ハロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル又はヘテロシクロアルキルで置換されているか；或いは
R^{c6}及びR^{d6}は、それらが結合しているＮ原子と共に４員、５員、６員又は７員ヘテロシクロアルキル基を形成し；そして
ｍ、ｐ、ｑ及びｒは、０及び１から独立して選択される）
の化合物、又は医薬的に許容されるその塩若しくはプロドラッグを含む、ＨＭ７４ａ受容体に関連する疾患の治療用医薬組成物。

【請求項６４】

前記疾患が、血漿ＦＦＡ上昇に関連するものである、請求項６３に記載の組成物。

【請求項６５】

前記疾患が、異脂肪血症、高活性抗レトロウイルス剤療法（ＨＡＡＲＴ）関連脂肪異栄養症、インスリン抵抗性、糖尿病、代謝症候群、アテローム性動脈硬化症、冠動脈心疾患、卒中発作、肥満、体格指数高値（ＢＭＩ）、胴周囲長増大、非アルコール性脂肪性肝疾患、脂肪肝又は高血圧である、請求項６３に記載の組成物。