

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】 特表2004-534064(P2004-534064A)

【公表日】平成16年11月11日(2004.11.11)

【年通号数】 公開・登録公報2004-044

【出願番号】 特願2003-503623(P2003-503623)

【國際特許分類】

C O 7 D 273/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/4427 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C O 7 D 413/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 273/02

A 6 1 K 31/395

A 6 1 K 31/4427

A 6 1 P 25/28

C 0 7 D 413/12

C 0 7 M 7:00

【手續補正書】

【提出日】平成17年6月8日(2005.6.8)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】 特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】 変更

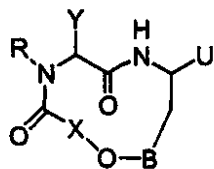
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下式の化合物及び薬剤として許容可能なその塩。

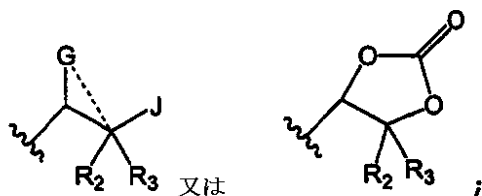
【化 1】



[式中、

U は、下式であり；

【化 2】



i

— — — は、場合により結合であり；

J は、— — — が結合でない場合には $-\text{CH}_2\text{OH}$ 若しくは $-\text{NH}-\text{R}_c$ であり、又は — — — が結合である場合には存在せず；

G は、— — — が結合でない場合には OH であり、又は — — — が結合である場合には $-\text{O}-$ であり；

R は、水素又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

B は、

$-(\text{CR}_4\text{R}_5)_m-$ ；又は

R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル；又は下式

【化 3】



(式中、

q は、0 又は 1 であり；及び

「e」環は、

アリール若しくはヘテロアリール（各々は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）；又は

3、4、5 又は 6 個の原子を有する炭素環式環（そのような原子のうち 1、2 又は 3 個は、場合により O、N、及び S から独立して選択されるヘテロ原子であり、炭素環式環は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）である）を表し、

m は、1 ～ 6 であり；

R_4 及び R_5 は独立して、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_4 \sim \text{C}_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシアルキル、又は $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキルであり；

X は、

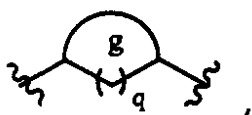
$-(\text{CR}_4\text{R}_5)_m-$ ；又は

R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ アルケニル；又は

$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NHCHR}_a-$ ；又は

下式

【化 4】



(式中、

q は、0 又は 1 であり；及び

「g」環は、3、4、5 又は 6 個の原子を有する炭素環式環（そのような原子のうち 1、2 又は 3 個は、場合により O、N、及び S から独立して選択されるヘテロ原子であり、炭素環式環は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）を表し；

R_a は、D又はLアミノ酸側鎖であり；

Yは、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

R_6 、 R_6' 及び R_6'' は独立して、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）；又は

$-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ （アルキル部分は、ハロゲンから独立して選択される1、2、3、4、又は5個の基で場合により置換されている）；又は

$-OH$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-CO_2H$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - N R_8 R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{アリール}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{ヘテロアリール}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{ヘテロシクリル}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{アリール}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{ヘテロアリール}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{ヘテロシクリル}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{10}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - O - R_{11}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - N R_8 R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - O - R_{11}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N - CS - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(-H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - R_8$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N R_8 R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{10}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - P(O) - (O - R_{アリール})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CS - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (R_{11})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (R_{11}) - COOH$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - S - (R_{11})$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(-H \text{ 若しくは } R_{11}) - SO_2 - R_7$ 、又は $-(CH_2)_{0 \sim 4} - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

R_8 及び R_9 は、同一又は異なって、 $-H$ 、 $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル}) - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - (C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキニル、又は1個の二重結合及び1個の三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖；又は

$-OH$ 若しくは $-NH_2$ で場合により置換されている $-C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $-C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2 - NH_2$ 、 $-SO_2 - NH - C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2 - N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2 - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO - NH_2$ 、 $-CO - NH - C_1 \sim C_6$ アルキル、オキソ、 $-CO - N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、

ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシ

から選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているヘテロシクリル；又は

アリール若しくはヘテロアリール（各々は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、及び $CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

1、2又は3個のハロゲンで場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）を表し；

R_{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される1、2、3又は4個の基で場合により置換されているヘテロシクリルであり；

R_{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_{\text{アリール}}$ 、又は $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_{\text{ヘテロアリール}}$ であり；

$R_{\text{アリール}}$ は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているアリールであり；

$R_{\text{ヘテロアリール}}$ は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されているヘテロアリールであり；

$R_{ヘテロシクリル}$ は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $=O$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されているヘテロシクリルであり；

R_2 は、

$-H$ ；又は $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{アリール}$ 及び $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{ヘテロアリール}$ ；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）であり；

R_3 は、 $-H$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{アリール}$ 、若しくは $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{ヘテロアリール}$ ；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

R_2 及び R_3 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、3、4、5、6、又は 7 個の炭素原子の炭素環を形成し（1 個の原子は、場合により $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、及び $-NR_8-$ からなる群から選択されるヘテロ原子である）；

R_c は、水素、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロシクリル、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール-ヘテロアリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール-ヘテロシクリル、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール-アリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリール-アリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリール-ヘテロシクリル、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリール-ヘテロアリール、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロシクリル-ヘテロシクリル、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロシクリル-アリール、 $-[C(R_{255})(R_{260})]_{1 \sim 3}-CO-N(R_{255})_2$ 、 $-CH$ （アリール） $_2$ 、 $-CH$ （ヘテロアリール） $_2$ 、 $-CH$ （ヘテロシクリル） $_2$ 、 $-CH$ （アリール）（ヘテロアリール）、 $-(C$

$\text{H}_2)_0 \sim 1 - \text{CH}((\text{CH}_2)_0 \sim 6 - \text{OH}) - (\text{CH}_2)_0 \sim 1$ - アリール、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 1 - \text{CH}((\text{CH}_2)_0 \sim 6 - \text{OH}) - (\text{CH}_2)_0 \sim 1$ - ヘテロアリール、 $-\text{CH}(-\text{アリール}$ 若しくは $-\text{ヘテロアリール}) - \text{CO}-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CH}(-\text{CH}_2 - \text{OH}) - \text{CH}(\text{OH}) - \text{フェニル}-\text{NO}_2$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{OH}$ ； $-\text{CH}_2 - \text{NH} - \text{CH}_2 - \text{CH}(-\text{O} - \text{CH}_2 - \text{CH}_3)_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 6 - \text{C}(=\text{NR}_{235})(\text{NR}_{235}\text{R}_{240})$ 、又は

R_{205} 、 $-\text{OC}=\text{ONR}_{235}\text{R}_{240}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_0 \sim 2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{235}\text{C}=\text{ONR}_{235}\text{R}_{240}$ 、 $-\text{C}=\text{ONR}_{235}\text{R}_{240}$ 、及び $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_{235}\text{R}_{240}$ からなる群から独立して選択される1、2、又は3個の基で場合により置換されている $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、又は

$-(\text{CH}_2)_0 \sim 3 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_8)$ シクロアルキル (シクロアルキルは、 R_{205} 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、及び $-\text{CO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ からなる群から独立して選択される1、2、又は3個の基で場合により置換されている)、又は

アリール、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルと縮合しているシクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチル環 (シクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチルの1、2又は3個の炭素は、 NH 、 NR_{215} 、 O 、又は $\text{S}(=\text{O})_0 \sim 2$ から独立して選択されるヘテロ原子で場合により置換されており、シクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチル基は、独立して R_{205} 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}_{235}\text{R}_{240}$ 、若しくは $-\text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ である1又は2個の基で場合により置換されていてもよい)、又は

$\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル若しくは $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル (各々は、1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている)であり、

各アリール及びヘテロアリールは、1、2、又は3個の R_{200} で場合により置換されており、各ヘテロシクリルは、1、2、3又は4個の R_{210} で場合により置換されており；

R_{200} は、出現するごとに、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、ハロゲン、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO}-\text{NR}_{220}\text{R}_{225}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - (\text{C}_2 \sim \text{C}_{12} \text{ アルケニル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - (\text{C}_2 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキニル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{アリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{ヘテロアリール}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{ヘテロシクリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO}-\text{O}-\text{R}_{215}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - \text{NR}_{220}\text{R}_{225}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ アルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H}$ 若しくは $\text{R}_{215}) - \text{CO}-\text{O}-\text{R}_{215}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H}$ 若しくは $\text{R}_{215}) - \text{CO}-\text{N}(\text{R}_{215})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(-\text{H}$ 若しくは $\text{R}_{215}) - \text{CO}-\text{R}_{220}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{NR}_{220}\text{R}_{225}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O}-\text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O}-\text{P}(\text{O}) - (\text{OR}_{240})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O}-\text{CO}-\text{N}(\text{R}_{215})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O}-\text{CS}-\text{N}(\text{R}_{215})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{R}_{215})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{R}_{215}) - \text{COOH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{S} - (\text{R}_{215})$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (1, 2, 3, \text{又は} 5 \text{ 個の} -\text{F} \text{ で場合により置換されている} \text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H}$ 若しくは $\text{R}_{215}) - \text{SO}_2 - \text{R}_{220}$ 、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル}$ 、又は

1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、又は

$\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル若しくは $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル (各々は、1又は2個の R_{205} 基で場合により置換されている)から独立して選択され、

アリール及びヘテロアリール基は、出現するごとに、独立して R_{205} 、 R_{210} 、又

は

独立して R_{205} 、 R_{210} である 1、2、又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルである 1、2、又は 3 個の基で場合により置換されており、

ヘテロシクリル基は、出現するごとに、独立して R_{210} である 1、2、又は 3 個の基で場合により置換されており、

R_{205} は、出現するごとに、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-O-$ フェニル、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 NH_2 、 $NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 又は $N-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ から独立して選択され；

R_{210} は、出現するごとに、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-NR_{220}R_{225}$ 、 OH 、 $C \equiv N$ 、 $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2-NR_{235}R_{240}$ 、 $-CO-NR_{235}R_{240}$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $=O$ 、又は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され（各々は、1、2 又は 3 個の R_{205} 基で場合により置換されている）；

R_{215} は、出現するごとに、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}-$ （アリール）、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び $-(CH_2)_{0 \sim 2}-$ （ヘテロアリール）、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}-$ （ヘテロシクリル）から独立して選択され（アリール基は、出現するごとに、独立して R_{205} 又は R_{210} である 1、2、又は 3 個の基で場合により置換されており、

ヘテロシクリル及びヘテロアリール基は、出現するごとに、1、2、又は 3 個の R_{210} で場合により置換されている）；

R_{220} 及び R_{225} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、 $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、1 個の二重結合及び 1 個の三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、及び $-ヘテロシクリル$ 、又は

$-OH$ 、 $-NH_2$ 若しくはハロゲンで場合により置換されている $-C_1 \sim C_{10}$ アルキルから独立して選択され（アリール、ヘテロシクリル及びヘテロアリール基は、出現するごとに、1、2、又は 3 個の R_{270} 基で場合により置換されている）、

R_{235} 及び R_{240} は、出現するごとに、独立して H 、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R_{245} 及び R_{250} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアリール、 $C_1 \sim C_4$ アルキルヘテロアリール、 $C_1 \sim C_4$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、及びフェニルから独立して選択され；又は

R_{245} 及び R_{250} は、それらが結合する炭素と一緒に、3、4、5、6、又は 7 個の炭素原子の炭素環を形成し（1 個の炭素原子は、場合により $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、及び $-NR_{220}-$ から選択されるヘテロ原子によって場合により置換されている）；

R_{255} 及び R_{260} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 2}-S(O)_{0 \sim 2}-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-アリール$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-ヘテロアリール$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-ヘテロシクリル$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-ヘテロシクリル$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 4}-R_{265}-(CH_2)_{0 \sim 4}-アリール$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 4}-R_{265}-(CH_2)_{0 \sim 4}-ヘテロアリール$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 4}-R_{265}-(CH_2)_{0 \sim 4}-ヘテロシクリル$ 、又は

$C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、若しくは $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（各々は、1、2、又は 3 個の R_{205} 基で場合により置換されている）から独立して選択され（各アリール又はフェニルは、独立して

R_{205} 、 R_{210} 、又は

独立して R_{205} 、 R_{210} である1、2、又は3個の基で場合により置換されている
 $C_1 \sim C_6$ アルキルである1、2、又は3個の基で場合により置換され、

各ヘテロシクリルは、1、2、3又は4個の R_{210} で場合により置換されている)；

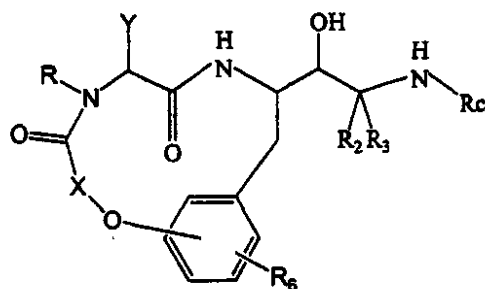
R_{265} は、出現するごとに、独立して $-O-$ 、 $-S-$ 、又は $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ であり；

R_{270} は、出現するごとに、独立して R_{205} 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $NR_{235}R_{240}$ 、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CO-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-SO_2-NR_{235}R_{240}$ 、 $-CO-NR_{235}R_{240}$ 、 $-SO_2-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $=O$ 、又は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは $-(CH_2)_0 \sim 4-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル (各々は、1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている)である]

【請求項2】

下式を有する請求項1に記載の化合物。

【化5】



【請求項3】

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{245}R_{250})_0 \sim 4$ -アリール又は $-(CR_{245}R_{250})_0 \sim 4$ -ヘテロアリールである (各々は、1又は2個の R_{200} で場合により置換されている) 請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

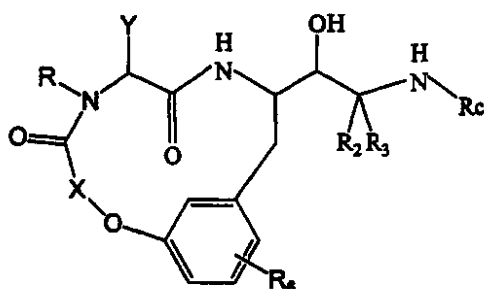
Yは、水素、アルキニル、 $-CH(CH_3)CH_3$ 又は $-CH_2CH_2SCH_3$ であり；及び

R_c は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又はトリフルオロメチルで場合により置換されているフェニルメチル、ピリジン-3-イルメチル、フェニルシクロプロピル又はピリジン-3-イルシクロプロピルである請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

下式を有する請求項2に記載の化合物。

【化6】



【請求項 6】

Y は、アルキニルであり、又は

Y は、それが結合する炭素と一緒にあって D 又は L アミノ酸側鎖であり；

X は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

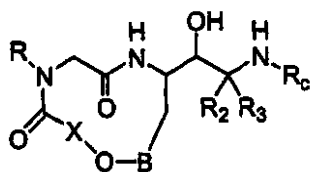
R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の $R_{2,0,0}$ で場合により置換されている）請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 7】



【請求項 8】

X は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

B は、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

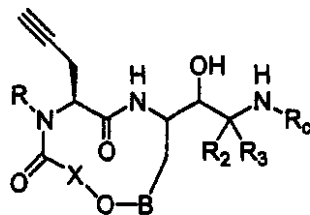
R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の $R_{2,0,0}$ で場合により置換されている）請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 8】



【請求項 10】

X は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

B は、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の $R_{2,0,0}$ で場合により置換されている）請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

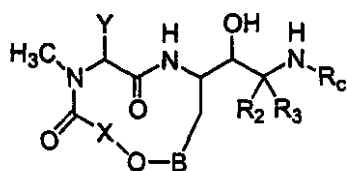
下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

CSCC[C@@H](C(=O)N[C@@H](CO)[C@H](N)Rc)C(=O)N1C(=O)XO[C@H]1BCC(C)C1C(=O)N(R)C(=O)N1C(O)C(R2)(R3)N(Rc)C1OC(B)OC1X=O*N[C@@H](C(=O)NC(=O)*OC(B)(*)*)C(O)CN(*)

【請求項 17】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 2】



【請求項 1 8】

X は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Y は、アルキニルであり、又は

Y は、それが結合する炭素と一緒にあって D 又は L アミノ酸側鎖であり；

B は、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

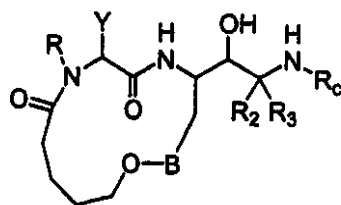
R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の R_{200} で場合により置換されている）請求項 1 7 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 3】



【請求項 2 0】

Y は、アルキニルであり、又は

Y は、それが結合する炭素と一緒にあって D 又は L アミノ酸側鎖であり；

B は、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

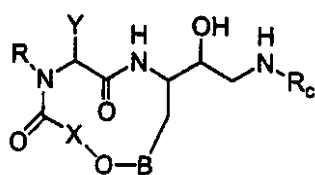
R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_c は、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の R_{200} で場合により置換されている）請求項 1 9 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 4】



【請求項 2 2】

X は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Y は、アルキニルであり、又は

Y は、それが結合する炭素と一緒にあって D 又は L アミノ酸側鎖であり；

B は、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

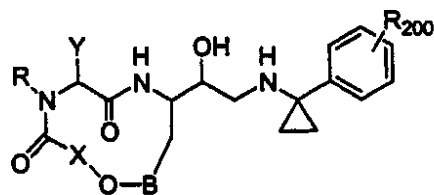
R_c は、 $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -アリール又は $-(CR_{245}R_{250})_{0 \sim 4}$ -ヘテロアリールである（各々は、1 又は 2 個の R_{200} で場合により置換されている）請求項 1 9 に記載の化合物。

～ 4 -ヘテロアリールである（各々は、1又は2個の R_{200} で場合により置換されている）請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 5】



【請求項 2 4】

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

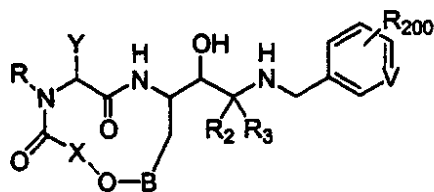
Bは、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

R_{200} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、トリフルオロメチル、又はハロゲンである請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 6】



[式中、Vは、CH又はNである]

【請求項 2 6】

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

Bは、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；

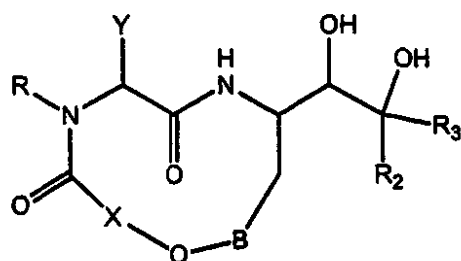
R_2 及び R_3 は、水素であり；及び

R_{200} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、トリフルオロメチル、又はハロゲンである請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 7】



【請求項 28】

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

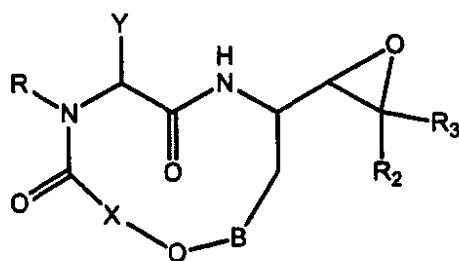
Bは、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；及び

R_2 及び R_3 は、水素である請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

下式である請求項 1 に記載の化合物。

【化 18】



【請求項 30】

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

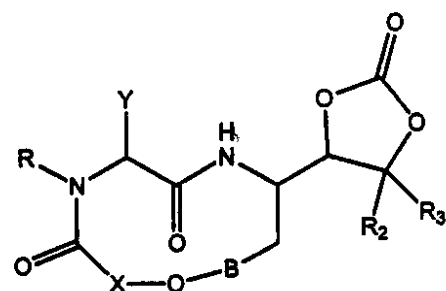
Bは、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；及び

R_2 及び R_3 は、水素である請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

下式を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 19】



【請求項 32】

Xは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

Yは、アルキニルであり、又は

Yは、それが結合する炭素と一緒にあってD又はLアミノ酸側鎖であり；

Bは、 R_6 で場合により置換されているアリールであり；及び

R_2 及び R_3 は、水素である請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

12-〔2-〔3-エチル-ベンジルアミノ〕-1-ヒドロキシ-エチル〕-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ〔12. 3. 1〕オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン；

12-〔2-〔1-〔3-エチル-フェニル〕-シクロプロピルアミノ〕-1-ヒドロキシ-エチル〕-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ〔12. 3. 1〕オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン；

12-〔2-〔1-〔3-エチニル-フェニル〕-シクロプロピルアミノ〕-1-ヒドロキシ-エチル〕-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ〔12. 3. 1〕オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン；

3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジル
 アミノ)-エチル]-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタ
 デカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキ
 シ-エチル}-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3.
 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フ
 ルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタ
 デカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロ
 キシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシク
 ロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10
 -ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒド
 ロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシ
 クロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 1
 0-ジオン;
 16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジル
 アミノ)-エチル]-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3
 . 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキ
 シ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ
 [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-
 ジオン;
 12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フ
 ルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (1
 7), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロ
 キシ-エチル}-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2
 . 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒド
 ロキシ-エチル}-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12.
 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジル
 アミノ)-エチル]-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタ
 デカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキ
 シ-エチル}-16-フルオロ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2.
 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フ
 ルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタ
 デカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロ
 キシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシク
 ロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10
 -ジオン;
 12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒド
 ロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシ
 クロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 1

0-ジオン；

16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン；

12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン；

13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

17-フルオロ-13-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-9-メチル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

17-フルオロ-13-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-9-メチル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

13-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン；

2-{12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-7, 10-ジオキサ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル}-アセトアミド；

2-(12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-7, 10-ジオキサ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル)-アセトアミド；

2-(12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1

ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー {16フルオロー12ー [1ーヒドロキシー2ー (3ートリフルオロメチルーベンジルアミノ)ーエチル]ー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル}ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [(5ーエチルーピリジンー3ーイルメチル)ーアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー {12ー [2ー (3ーエチルーベンジルアミノ)ー1ーヒドロキシエチル]ー16フルオロー8ーメチルー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル}ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [1ー (3ーエチルーフェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー8ーメチルー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [1ー (3ーエチルーフェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー8ーメチルー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー {16フルオロー12ー [1ーヒドロキシー2ー (3ートリフルオロメチルーベンジルアミノ)ーエチル]ー8ーメチルー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル}ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [(5ーエチルーピリジンー3ーイルメチル)ーアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー8ーメチルー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 3. 1] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー {12ー [2ー (3ーエチルーベンジルアミノ)ー1ーヒドロキシエチル]ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 2. 2] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル}ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [1ー (3ーエチルーフェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 2. 2] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [1ー (3ーエチルーフェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 2. 2] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

2ー {16フルオロー12ー [1ーヒドロキシー2ー (3ートリフルオロメチルーベンジルアミノ)ーエチル]ー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 2. 2] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル}ーアセトアミド;

2ー (12ー {2ー [(5ーエチルーピリジンー3ーイルメチル)ーアミノ]ー1ーヒドロキシエチル}ー16フルオロー7, 10ージオキソー2ーオキサー8, 11ージアザービシクロ [12. 2. 2] オクタデカー1 (17), 14 (18), 15ートリエンー9ーイル)ーアセトアミド;

ン-9-イル)-アセトアミド；

2-[12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-8-メチル-7, 10-ジオキソ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル]-アセトアミド；

2-(12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-16-フルオロ-8-メチル-7, 10-ジオキソ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル)-アセトアミド；

2-(12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-16-フルオロ-8-メチル-7, 10-ジオキソ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル)-アセトアミド；

2-{16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-8-メチル-7, 10-ジオキソ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル}-アセトアミド；

2-(12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-16-フルオロ-8-メチル-7, 10-ジオキソ-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-9-イル)-アセトアミド；

2-{13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル}-アセトアミド；

2-(13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-17-フルオロ-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)-アセトアミド；

2-(13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-17-フルオロ-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)-アセトアミド；

2-{17-フルオロ-13-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル}-アセトアミド；

2-(13-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-17-フルオロ-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)-アセトアミド；

2-{13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-9-メチル-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル}-アセトアミド；

2-(13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1-ヒドロキシ-エチル)-17-フルオロ-9-メチル-8, 11-ジオキソ-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)-アセトアミド；

2-(13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]}-1

ーヒドロキシエチル}ー17-フルオロ-9-メチル-8, 11-ジオキソ-2-オキサー9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)ーアセトアミド;

2-{17-フルオロ-13-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)ーエチル]ー9-メチル-8, 11-ジオキソ-2-オキサー9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル}ーアセトアミド;

2-(13-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)ーアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー17-フルオロ-9-メチル-8, 11-ジオキソ-2-オキサー9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-10-イル)ーアセトアミド;

12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)ー1-ヒドロキシエチル]ー16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)ーエチル]ー9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)ーアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)ー1-ヒドロキシエチル]ー16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)ーシクロプロピルアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)ーエチル]ー8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)ーアミノ]ー1-ヒドロキシエチル}ー16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサー8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.3.1]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ) -1-ヒドロキシ-エチル] -16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチニル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル) -アミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ) -1-ヒドロキシ-エチル] -16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチニル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル) -アミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9-プロプ-2-イニル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

13- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ) -1-ヒドロキシ-エチル] -17-フルオロ-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -17-フルオロ-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

17-フルオロ-13- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-9-メチル-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- {2- [1- (3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- {2- [1- (3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

17-フルオロ-13- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-9-メチル-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-10-プロプ-2-イニル-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ [13. 3. 1] ノナデカ-1 (18), 15 (19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-9-イソプロピル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-9-イソプロピル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-9-イソプロピル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-9-イソプロピル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-9-イソプロピル-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒド

ロキシ-エチル} - 16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) - 2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル) -アミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ) -1-ヒドロキシ-エチル] -16-フルオロ-8-メチル-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -8-メチル-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル) -アミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-8-メチル-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 3. 1] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- [2- (3-エチル-ベンジルアミノ) -1-ヒドロキシ-エチル] -16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [1- (3-エチル-フェニル) -シクロプロピルアミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12- [1-ヒドロキシ-2- (3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ) -エチル] -9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12- {2- [(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル) -アミノ] -1-ヒドロキシ-エチル} -16-フルオロ-9- (2-メチルスルファニル-エチル) -2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ [12. 2. 2] オクタデカ-1 (17), 14 (18)

, 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-16-フルオロ-8-メチル-9-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-9-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-9-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

16-フルオロ-12-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-8-メチル-9-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

12-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-16-フルオロ-8-メチル-9-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-8, 11-ジアザ-ビシクロ[12.2.2]オクタデカ-1(17), 14(18), 15-トリエン-7, 10-ジオン;

13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

17-フルオロ-13-[1-ヒドロキシ-2-(3-トリフルオロメチル-ベンジルアミノ)-エチル]-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-{2-[(5-エチル-ピリジン-3-イルメチル)-アミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-[2-(3-エチル-ベンジルアミノ)-1-ヒドロキシ-エチル]-17-フルオロ-9-メチル-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-{2-[1-(3-エチル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル}-17-フルオロ-9-メチル-10-(2-メチルスルファニル-エチル)-2-オキサ-9, 12-ジアザ-ビシクロ[13.3.1]ノナデカ-1(18), 15(19), 16-トリエン-8, 11-ジオン;

13-{2-[1-(3-エチニル-フェニル)-シクロプロピルアミノ]-1-ヒド

ロキシ－エチル}－１７－フルオロ－９－メチル－１０－（２－メチルスルファニル－エチル）－２－オキサ－９，１２－ジアザ－ピシクロ〔１３．３．１〕ノナデカ－１（１８），１５（１９），１６－トリエン－８，１１－ジオン；

１７－フルオロ－１３－〔１－ヒドロキシ－２－（３－トリフルオロメチル－ベンジルアミノ）－エチル〕－９－メチル－１０－（２－メチルスルファニル－エチル）－２－オキサ－９，１２－ジアザ－ピシクロ〔１３．３．１〕ノナデカ－１（１８），１５（１９），１６－トリエン－８，１１－ジオン；及び

１３－〔２－〔（５－エチル－ピリジン－３－イルメチル）－アミノ〕－１－ヒドロキシ－エチル}－１７－フルオロ－９－メチル－１０－（２－メチルスルファニル－エチル）－２－オキサ－９，１２－ジアザ－ピシクロ〔１３．３．１〕ノナデカ－１（１８），１５（１９），１６－トリエン－８，１１－ジオンである請求項１に記載の化合物。

【請求項３４】

請求項１に記載の化合物を有効成分として含有する医薬組成物。

【請求項３５】

アルツハイマー病の発症の予防又は遅延を促進するため、軽度認知障害（ＭＣＩ）の患者を治療するため、ダウン症候群を治療するため、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血を有するヒトを治療するため、脳アミロイド血管障害を治療するため、他の変性痴呆、びまん性レヴィー小体型アルツハイマー病を治療するために、アルツハイマー病からなる群から選択される疾患若しくは状態を有する患者、及びそのような治療を必要とする患者を治療するための、又は患者がそのような疾患若しくは状態にならないようにするための、請求項３４に記載の医薬組成物。

【請求項３６】

請求項１に記載の化合物の治療有効量は、経口投与の場合には約０．１ｍｇ／日から約１，０００ｍｇ／日、非経口、舌下、鼻腔内、くも膜下腔内投与の場合には約０．５から約１００ｍｇ／日、デポ投与及び埋込錠の場合には約０．５ｍｇ／日から約５０ｍｇ／日、局所投与の場合には約０．５ｍｇ／日から約２００ｍｇ／日、直腸投与の場合には約０．５ｍｇから約５００ｍｇである請求項３５に記載の医薬組成物。

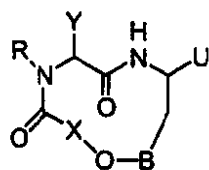
【請求項３７】

アルツハイマー病の発症の予防又は遅延を促進するため、軽度認知障害（ＭＣＩ）の患者を治療するため、ダウン症候群を治療するため、オランダ型遺伝性アミロイド性脳出血を有するヒトを治療するため、脳アミロイド血管障害を治療するため、他の変性痴呆、びまん性レヴィー小体型アルツハイマー病を治療するために、アルツハイマー病からなる群から選択される疾患若しくは状態を有する患者を治療する際、又は患者がそのような疾患若しくは状態にならないようにする際に使用する薬物を製造するための、請求項１に記載の化合物の使用。

【請求項３８】

下式の化合物の製造方法。

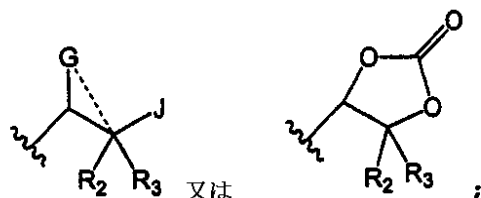
【化２０】



〔式中、

Uは、下式であり；

【化 2 1】



— — — は、場合により結合であり；

J は、— — — が結合でない場合には $-\text{CH}_2\text{OH}$ 若しくは $-\text{NH}-\text{R}_c$ であり、又は— — — が結合である場合には存在せず；

G は、— — — が結合でない場合には OH であり、又は— — — が結合である場合には $-\text{O}-$ であり；

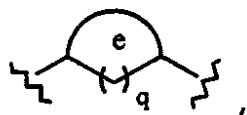
R は、水素又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

B は、

$-(\text{C R}_4 \text{ R}_5)_m-$ ；又は

R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル；又は下式

【化 2 2】



(式中、

q は、0 又は 1 であり；及び

「e」環は、

アリール若しくはヘテロアリール（各々は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）；又は

3、4、5 又は 6 個の原子を有する炭素環式環（そのような原子のうち 1、2 又は 3 個は、場合により O、N、及び S から独立して選択されるヘテロ原子であり、炭素環式環は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）である）を表し、

m は、1 ～ 6 であり；

R_4 及び R_5 は独立して、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、 $\text{C}_4 \sim \text{C}_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシアルキル、又は $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキルであり；

X は、

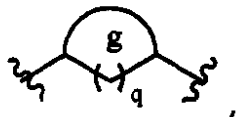
$-(\text{C R}_4 \text{ R}_5)_m-$ ；又は

R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ アルケニル；又は

$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NHCHR}_a-$ ；又は

下式

【化 2 3】



(式中、

q は、0 又は 1 であり；及び

「 g 」環は、3、4、5 又は 6 個の原子を有する炭素環式環（そのような原子のうち 1、2 又は 3 個は、場合により O、N、及び S から独立して選択されるヘテロ原子であり、炭素環式環は、 R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・から独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）を表し；

R_a は、D 又は L アミノ酸側鎖であり；

Y は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、又は

Y は、それが結合する炭素と一緒にあって D 又は L アミノ酸側鎖であり；

R_6 、 R_6 ・及び R_6 ・は独立して、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている）；又は

$-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ （アルキル部分は、ハロゲンから独立して選択される 1、2、3、4、又は 5 個の基で場合により置換されている）；又は

$-OH$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-CO_2H$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_8R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{\text{アリール}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{\text{ヘテロアリール}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{\text{ヘテロシクリル}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{\text{アリール}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{\text{ヘテロアリール}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{\text{ヘテロシクリル}}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{10}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - O - R_{11}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_8R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - O - R_{11}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N - CS - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(-H \text{ 若しくは } R_{11}) - CO - R_8$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - NR_8R_9$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{10}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - P(O) - (O - R_{\text{アリール}})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CS - N(R_{11})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (R_{11})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - (R_{11}) - COOH$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - S - (R_{11})$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(-H \text{ 若しくは } R_{11}) - SO_2 - R_7$ 、又は $-(CH_2)_{0 \sim 4} - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

R_8 及び R_9 は、同一又は異なって、 $-H$ 、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル}) - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - (C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキニル、又は 1 個の二重結合及び 1 個の三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖；又は

$-OH$ 若しくは $-NH_2$ で場合により置換されている $-C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

ハロゲンから独立して選択される 1、2 又は 3 個の基で場合により置換されている $-C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2 - N$

H_2 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、オキソ、 $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシ

から選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているヘテロシクリル；又は

アリール若しくはヘテロアリール（各々は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、及び $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

2、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

1、2又は3個のハロゲンで場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）を表し；

R_{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される1、2、3又は4個の基で場合により置換されているヘテロシクリルであり；

R_{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 2-R_{アリール}$ 、又は $-(CH_2)_0 \sim 2-R_{ヘテロアリール}$ であり；

$R_{アリール}$ は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているアリールであり；

$R_{ヘテロアリール}$ は、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているヘテロアリールであり；

R ヘテロシクリルは、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、 $-OH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-SO_2-NH_2$ 、 $-SO_2-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $=O$ 、 $-CO-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル、

$C_2 \sim C_6$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_6$ アルキニル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）、及び

ハロゲンから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されているヘテロシクリルであり；

R_2 は、

$-H$ ；又は $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R$ アリール 及び $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R$ ヘテロアリール；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（各々は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている）であり；

R_3 は、 $-H$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R$ アリール、若しくは $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R$ ヘテロアリール；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル；又は

$C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、アミノ、及びモノ若しくはジアルキルアミノから独立して選択される1、2又は3個の基で場合により置換されている $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

R_2 及び R_3 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、3、4、5、6、又は7個の炭素原子の炭素環を形成し（1個の原子は、場合により $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、及び $-NR_8-$ からなる群から選択されるヘテロ原子である）；

R_c は、水素、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ アリール、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ ヘテロアリール、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ ヘテロシクリル、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ アリール-ヘテロアリール、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ アリール-ヘテロシクリル、 $-(CR_{2,4,5}R_{2,5,0})_{0 \sim 4}$ アリール-アリール

、 $-(C R_{245} R_{250})_{0 \sim 4}$ —ヘテロアリール—アリール、 $-(C R_{245} R_{250})_{0 \sim 4}$ —ヘテロアリール—ヘテロシクリル、 $-(C R_{245} R_{250})_{0 \sim 4}$ —ヘテロシクリル—ヘテロシクリル、 $-(C R_{245} R_{250})_{0 \sim 4}$ —ヘテロシクリル—アリール、 $-[C(R_{255})(R_{260})]_{1 \sim 3}-CO-N(R_{255})_2$ 、 $-CH$ (アリール) $_2$ 、 $-CH$ (ヘテロアリール) $_2$ 、 $-CH$ (ヘテロシクリル) $_2$ 、 $-CH$ (アリール)(ヘテロアリール)、 $-(CH_2)_{0 \sim 1}-CH((CH_2)_{0 \sim 6}-OH)-(CH_2)_{0 \sim 1}$ —アリール、 $-(CH_2)_{0 \sim 1}-CH((CH_2)_{0 \sim 6}-OH)-(CH_2)_{0 \sim 1}$ —ヘテロアリール、 $-CH$ (—アリール若しくは—ヘテロアリール)— $CO-O(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-CH(-CH_2-OH)-CH(OH)-フェニル-NO_2$ 、 $(C_1 \sim C_6$ アルキル)— $O-(C_1 \sim C_6$ アルキル)— OH ； $-CH_2-NH-CH_2-CH(-O-CH_2-CH_3)_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 6}-C(=NR_{235})(NR_{235} R_{240})$ 、又は

R_{205} 、 $-OC=ONR_{235} R_{240}$ 、 $-S(=O)_{0 \sim 2}(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-SH$ 、 $-NR_{235} C=ONR_{235} R_{240}$ 、 $-C=ONR_{235} R_{240}$ 、及び $-S(=O)_2 NR_{235} R_{240}$ からなる群から独立して選択される1、2、又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、又は

$-(CH_2)_{0 \sim 3}-(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル(シクロアルキルは、 R_{205} 、 $-CO_2H$ 、及び $-CO_2-(C_1 \sim C_4$ アルキル)からなる群から独立して選択される1、2、又は3個の基で場合により置換されている)、又は

アリール、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルと縮合しているシクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチル環(シクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチルの1、2又は3個の炭素は、 NH 、 NR_{215} 、 O 、又は $S(=O)_{0 \sim 2}$ から独立して選択されるヘテロ原子で場合により置換されており、シクロペンチル、シクロヘキシル、若しくはシクロヘプチル基は、独立して R_{205} 、 $=O$ 、 $-CO-NR_{235} R_{240}$ 、若しくは $-SO_2(C_1 \sim C_4$ アルキル)である1又は2個の基で場合により置換されていてもよい)、又は

$C_2 \sim C_{10}$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル(各々は、1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている)であり、

各アリール及びヘテロアリールは、1、2、又は3個の R_{200} で場合により置換されており、各ヘテロシクリルは、1、2、3又は4個の R_{210} で場合により置換されており；

R_{200} は、出現するごとに、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-CO_2H$ 、 $C \equiv N$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{220} R_{225}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12}$ アルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12}$ アルケニル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12}$ アルキニル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO$ —アリール、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO$ —ヘテロアリール、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO$ —ヘテロシクリル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{215}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{220} R_{225}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8$ アルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12}$ アルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H$ 若しくは $R_{215})-CO-O-R_{215}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H$ 若しくは $R_{215})-CO-N(R_{215})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H$ 若しくは $R_{215})-CO-R_{220}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{220} R_{225}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{240})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{215})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{215})_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{215})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{215})-COOH$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{215})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1, 2, 3$ 、又は5個の $-F$ で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C_3 \sim C_7$ シクロ

アルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 若しくは } R_{215})-SO_2-R_{220}$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、又は

1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、又は

$C_2 \sim C_{10}$ アルケニル若しくは $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル（各々は、1又は2個の R_{205} 基で場合により置換されている）から独立して選択され、

アリール及びヘテロアリール基は、出現するごとに、独立して R_{205} 、 R_{210} 、又は

独立して R_{205} 、 R_{210} である1、2、又は3個の基で場合により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルである1、2、又は3個の基で場合により置換されており、

ヘテロシクリル基は、出現するごとに、独立して R_{210} である1、2、又は3個の基で場合により置換されており、

R_{205} は、出現するごとに、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-O-$ フェニル、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 NH_2 、 $NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 又は $N-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ ($C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$) から独立して選択され；

R_{210} は、出現するごとに、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-NR_{220}R_{225}$ 、 OH 、 $C \equiv N$ 、 $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2-NR_{235}R_{240}$ 、 $-CO-NR_{235}R_{240}$ 、 $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $=O$ 、又は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され（各々は、1、2又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている）；

R_{215} は、出現するごとに、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(\text{アリール})$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び（ $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(\text{ヘテロシクリル})$ から独立して選択され（アリール基は、出現するごとに、独立して R_{205} 又は R_{210} である1、2、又は3個の基で場合により置換されており、

ヘテロシクリル及びヘテロアリール基は、出現するごとに、1、2、又は3個の R_{210} で場合により置換されている）；

R_{220} 及び R_{225} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、 $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、1個の二重結合及び1個の三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-$ ヘテロシクリル、又は

$-OH$ 、 $-NH_2$ 若しくはハロゲンで場合により置換されている $-C_1 \sim C_{10}$ アルキルから独立して選択され（アリール、ヘテロシクリル及びヘテロアリール基は、出現するごとに、1、2、又は3個の R_{270} 基で場合により置換されている）、

R_{235} 及び R_{240} は、出現するごとに、独立して H 、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R_{245} 及び R_{250} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアリール、 $C_1 \sim C_4$ アルキルヘテロアリール、 $C_1 \sim C_4$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、及びフェニルから独立して選択され；又は

R_{245} 及び R_{250} は、それらが結合する炭素と一緒に、3、4、5、6、又は7個の炭素原子の炭素環を形成し（1個の炭素原子は、場合により $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、及び $-NR_{220}-$ から選択されるヘテロ原子によって場合により置換されている）；

R_{255} 及び R_{260} は、出現するごとに、 $-H$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 2}-S(O)_{0 \sim 2}-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-アリール$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ ア$

ルキル) -ヘテロアリール、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -ヘテロシクリル、-アリール、
 -ヘテロアリール、-ヘテロシクリル、- (CH_2)_{1~4} - R_{265} - (CH_2)_{0~4} -アリール、- (CH_2)_{1~4} - R_{265} - (CH_2)_{0~4} -ヘテロアリール、- (CH_2)_{1~4} - R_{265} - (CH_2)_{0~4} -ヘテロシクリル、又は

$C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、若しくは- (CH_2)_{0~4} - $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル (各々は、1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている) から独立して選択され (各アリール又はフェニルは、独立して R_{205} 、 R_{210} 、又は

独立して R_{205} 、 R_{210} である1、2、又は3個の基で場合により置換されている
 $C_1 \sim C_6$ アルキルである1、2、又は3個の基で場合により置換され、

各ヘテロシクリルは、1、2、3又は4個の R_{210} で場合により置換されている) ;

R_{265} は、出現するごとに、独立して-O-、-S-、又は-N ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -であり ;

R_{270} は、出現するごとに、独立して R_{205} 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、
 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $NR_{235} R_{240}$ 、-OH、-C $\equiv$ N、-CO- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、
 -SO₂- $NR_{235} R_{240}$ 、-CO-N $R_{235} R_{240}$ 、-SO₂- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、=O、又は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、
 $C_2 \sim C_6$ アルキニル若しくは- (CH_2)_{0~4} - $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル (各々は、1、2、又は3個の R_{205} 基で場合により置換されている) である]