(19)日本国特許庁(JP)　　(12)公表特許公報(A)　　(11)公表番号
特表2025-517513
(P2025-517513A)
(43)公表日　令和7年6月5日(2025.6.5)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 307/84 (2006.01)		C07D	307/84	CSP　4C086
A61K 31/343 (2006.01)		A61K	31/343	
C07D 405/12 (2006.01)		C07D	405/12	
A61K 31/4525(2006.01)		A61K	31/4525	
C07D 407/12 (2006.01)		C07D	407/12	

審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全167頁）　最終頁に続く

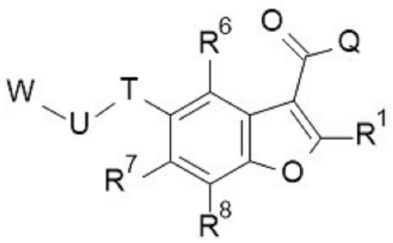
(21)出願番号　特願2024-569517(P2024-569517)
(86)(22)出願日　令和5年5月25日(2023.5.25)
(85)翻訳文提出日　令和7年1月16日(2025.1.16)
(86)国際出願番号　PCT/EP2023/063992
(87)国際公開番号　WO2023/227695
(87)国際公開日　令和5年11月30日(2023.11.30)
(31)優先権主張番号　22175494.8
(32)優先日　令和4年5月25日(2022.5.25)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV
最終頁に続く

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

(54)【発明の名称】　ＴＲＰＭ３媒介性障害を治療するための新たな誘導体

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

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



（Ｉ）

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

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

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

－Ｈ、

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

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

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

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

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

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

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

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

アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

【請求項２】

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

【請求項３】

Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表す、請求項１又は２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

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

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

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

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

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

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

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

非置換の、一置換若しくは多置換の－フェニル、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、前記５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

Ｒ^{4}が、

－Ｈ、
飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、
飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、前記３～１４員シクロアルキルが、飽和、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ

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

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換であり、前記５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、

Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

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

飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和の、非置換の、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は非置換の－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されて

おり、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、

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

非置換の－フェニル、

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、前記５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項７】

Ｗが、

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

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

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項８】

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

【請求項９】

Ｒ^{5}及びＲ^5’が、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

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

【請求項１０】

Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、

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

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

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

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、

＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１１】

化合物００１－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００２－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００３－（２Ｓ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００４－（２Ｓ）－２－｛［２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００５－（２Ｓ）－２－｛［５－（２－シクロプロピルエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００６－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００７－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物００８－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物００９－（２Ｒ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０１０－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物０１１－（２Ｓ，３Ｒ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシブタンアミド、
化合物０１２－（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２－シクロプロピルエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド、

化合物０１３－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０１４－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１５－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１６－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１７－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１８－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０１９－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２０－５－（シクロヘキシルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２１－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２２－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（オキサン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２３－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２４－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２５－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２６－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２７－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピペリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２８－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２９－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３０－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３１－５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３３－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３４－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、

化合物０３５－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３６－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３７－Ｎ－（４－カルバモイルキサン－４－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３８－（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０３９－（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０４０－（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド、
化合物０４１－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０４２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－（２－メチルプロポキシ）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４３－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４４－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４５－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０４６－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロペンアミド、
化合物０４８－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］プロペンアミド、
化合物０４９－２－（｛５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５０－シス－２－｛［５－（｛ビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル｝メトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド
化合物０５１－トランス－２－｛［５－（｛ビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル｝メトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５２－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（｛３－メチルビシクロ［１．１．１］ペンタン－１－イル｝メトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロペンアミド、
化合物０５３－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５４－２－（｛５－［（３，３－ジフルオロシクロブチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、

化合物０５５－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピペリジン－３－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０５６－Ｎ－［（２）－３－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル］－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０５７－５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０５８－シス－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（３－メチルシクロブチル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）プロペンアミド、
化合物０５９－トランス－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（３－メチルシクロブチル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）プロペンアミド、
化合物０６０－Ｎ－（１－ヒドロキシ－３－メトキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０６１－２－メチル－Ｎ－（３－メチル－２－オキソピペリジン－３－イル）－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０６２－２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
及びそれらの生理学的に許容される塩、からなる群から選択される、請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物を含む、薬学的組成物。
【請求項１３】
医薬としての使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。
【請求項１４】
疼痛又はてんかんの治療における使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。
【請求項１５】
前記疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択され、好ましくは術後疼痛である、請求項１４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、ＴＲＰＭ３媒介性障害、より具体的には、疼痛、てんかん及び炎症性過敏症から選択される障害の予防又は治療に有用な化合物に関する。本発明はまた、当該ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための方法に関する。
【背景技術】
【０００２】
ＴＲＰスーパーファミリーは、ホモ又はヘテロ四量体として組み立ててカチオン透過性イオンチャネルを形成する６つの膜貫通ドメイン（６ＴＭ）を有するタンパク質からなる。ＴＲＰという名称は、持続光への応答におけるハエ光受容体における一過性受容体電位を特徴とするＤｒｏｓｏｐｈｉｌａ　ｔｒｐ（一過性受容体電位）変異体に由来する。過去１５年間で、ｔｒｐ関連チャネルが、ヒトにおける２７個のＴＲＰを含む、酵母、寄生虫、昆虫、魚類、及び哺乳動物において確認されている。配列相同性に基づいて、ＴＲＰ

チャネルは、７つのサブファミリー：ＴＲＰＣ、ＴＲＰＶ、ＴＲＰＭ、ＴＲＰＡ、ＴＲＰＰ、ＴＲＰＭＬ、及びＴＲＰＮに分けることができる。

【０００３】

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

【０００４】

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

【０００５】

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

【０００６】

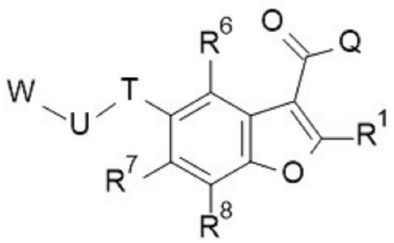
いくつかのＴＲＰＭ３アンタゴニストが知られているが、それらのいずれも、本発明の化合物を指すものではない（Ｓｔｒａｕｂ　Ｉ　ｅｔ　ａｌ．Ｍｏｌ　Ｐｈａｒｍａｃｏｌ，Ｎｏｖｅｍｂｅｒ　２０１３）。例えば、想定されたＴＲＰＭ３遮断薬であるリキリチゲニンは、ラット疼痛モデルにおける機械的及び寒冷痛覚過敏症を減少させることが記載されている（Ｃｈｅｎ　Ｌ　ｅｔ　ａｌ．Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ　ｒｅｐｏｒｔｓ，Ｊｕｌｙ　２０１４）。疼痛及びてんかんなどのＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための、より具体的にはてんかん性脳症などの炎症性疼痛又はてんかんなどの疼痛のための新規の、代替の、及び／又はより良好な治療法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

【０００７】

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

【発明の概要】

【０００８】
本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物（本発明によるベンゾフラン誘導体とも称される）、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体であって、
【化１】



（Ｉ）

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

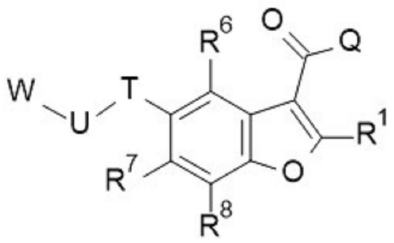
は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Ｙ１}、Ｒ^{Ｙ２}、Ｒ^{Ｙ３}、及びＲ^{Ｙ４}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、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

ン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアル

キル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する、式（Ｉ）の化合物（本発明によるベンゾフラン誘導体とも称される）、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体を提供する。

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

【化２】



（Ｉ）

式中、

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

Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、

Ｒ^{3}が、－ＯＨ又は－Ｒ^{Y1}を表し、

Ｒ^{4}が、－Ｒ^{Y2}又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^{Y3}を表し、

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

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

ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、

Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｒ^{Y4}を表し、

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

Ｗが、

飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、又は

各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表し、

式中、

Ｒ^{W}及びＲ^{X}が、互いに独立して、各場合において、独立して、

－Ｈ、

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

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

$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体を提供する。

【０００９】

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

【００１０】

第３の態様によると、本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物又は医薬としての使用のための第２の態様に記載の薬学的組成物を提供する。

【００１１】

第４の態様によると、本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物、あるいはＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／若しくは治療における使用のための、特に、疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症の予防及び／若しくは治療における使用のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するための、第２の態様に記載の薬学的組成物を包含する。特に、疼痛、てんかん性脳症及び／若しくは炎症性過敏症の予防及び／若しくは治療における使用のため、並びに／又は疼痛、てんかん性脳症及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するためである。

【００１２】

本発明はまた、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物をそれを必要としている対象に投与することによって、ＴＲＰＭ３媒介性障害を予防又は治療するための方法を提供する。より具体的には、本発明は、疼痛、てんかん及び／又は炎症性過敏症の予防及び／又は治療のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／又は炎症性過敏症に対抗するためのそのような方法に関する。より具体的には、本発明は、疼痛、てんかん性脳症及び／又は炎症性過敏症の予防及び／又は治療のための、並びに／又は疼痛、てんかん性脳症及び／又は炎症性過敏症に対抗するためのそのような方法に関する。

【００１３】

本発明は更に、以下のステップを含む、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物を調製するための方法を提供する：

－ベンゾキノンを好適なβ－ケトエステル又はエナミン誘導体と反応させて、５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレートエステル誘導体を得るステップと、

－以前に得られた５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレートエステル誘導体を、ミツノブ条件下で、離脱基を有する好適な誘導体又はアルコール誘導体で置換して、５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－カルボキシレートエステル誘導体を得るステップと、

－以前に得られた５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－カルボキシレートエステル誘導体をカ

ルボン酸に変換して、５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－カルボン酸誘導体を得るステップ、及び
－以前に得られた５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－カルボン酸誘導体を好適なアミンと結合して、本発明の所望の誘導体を得るステップ。
【発明を実施するための形態】
【００１４】
本発明を説明する前に、本発明は、説明される特定のプロセス、方法及び化合物に限定されず、そのようなプロセス、方法及び化合物は、当然のことながら変動し得ることが理解されるべきである。また、本発明の範囲は添付の特許請求の範囲によってのみ限定されるため、本明細書で使用される用語は、限定することを意図していないことも理解されたい。
【００１５】
本発明の化合物及びプロセスを説明するとき、使用される用語は、文脈から別途指示されない限り、以下の定義に従って解釈されるべきである。
【００１６】
本明細書及び添付の特許請求の範囲で使用される場合、単数形の「ａ」、「ａｎ」、及び「ｔｈｅ」は、文脈上別段明らかに指示されない限り、単数形及び複数形の両方の指示対象を含む。例えば、「化合物」は、１つの化合物又は１つより多くの化合物を意味する。
【００１７】
本明細書で使用される「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「含む（ｉｎｃｌｕｄｉｎｇ）」、「含む（ｉｎｃｌｕｄｅｓ）」、又は「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｉｎｇ）」、「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｓ）」と同義であり、包括的又は非限定的であり、列挙されていない追加の部材、要素、又は方法ステップを除外しない。「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「からなる（ｃｏｎｓｉｓｔｉｎｇ　ｏｆ）」という用語を含む。
【００１８】
本明細書で使用される「約」という用語は、パラメータ、量、時間の長さ等の測定可能な値に言及する場合、指定された値の及び該値からの＋／－１０％以下、好ましくは＋／－５％以下、より好ましくは＋／－１％以下、更により好ましくは＋／－０．１％以下の変動を包含することを意味するが、ただし、開示される発明においてそのような変動を行うことが適切であるものとする。修飾語「約」が指す値は、それ自体も具体的にかつ好ましく開示されることを理解されたい。
【００１９】
本明細書で使用される場合、「及び／又は」という用語は、２つ以上の項目のリストにおいて使用されるとき、列記された項目のうちのいずれか１つを単独で採用することができること、又は列記された項目のうちの２つ以上の任意の組み合わせを採用することができることを意味する。例えば、リストが、群Ａ、Ｂ及び／又はＣを含むと説明されている場合、リストは、Ａのみ、Ｂのみ、Ｃのみ、Ａ及びＢの組み合わせ、Ａ及びＣの組み合わせ、Ｂ及びＣの組み合わせ、又はＡ、Ｂ及びＣの組み合わせを含み得る。
【００２０】
端点による数値範囲の列挙は、全ての整数、及び必要に応じて、その範囲内に含まれる分数を含む（例えば、１～５は、例えば、いくつかの要素を参照する場合、１、２、３、４を含み得、また、例えば、測定値を参照する場合、１．５、２、２．７５、及び３．８０を含み得る）。端点の列挙はまた、端点値自体を含む（例えば、１．０～５．０は、１．０及び５．０の両方を含む）。本明細書に記載される任意の数値範囲は、その中に含まれる全ての部分的な範囲を含むことが意図される。
【００２１】

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

【００２２】

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

【００２３】

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

【００２４】

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

【００２５】

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

【００２６】

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

【００２７】

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

【００２８】

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

【００２９】

「保護基」という用語は、官能基の特性又は化合物全体の特性をマスク又は変更する化合物の部分を指す。保護基の化学的基礎構造は、大きく異なる。保護基のある機能は、親薬物物質の合成における中間体として役立つことにある。化学的保護基及び保護／脱保護のための戦略は、当該技術分野において周知である。“Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９９１を参照されたい。保護基は、所望の化学反応の効率、例えば、規則正しく計画された様式で化学結合を形成及び破壊することを補助するために、ある特定の官能基の反応性をマスクす

るためにしばしば利用されている。化合物の官能基の保護は、極性、親油性（疎水性）、及び一般的な分析ツールによって測定することができる他の特性などの、保護された官能基の反応性以外の他の物理的特性を変える。化学的に保護された中間体は、それ自体が、生物学的に活性又は不活性であり得る。

【００３０】

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

【００３１】

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

【００３２】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のアルキル」という用語は、飽和アルキル、並びにアルケニル、アルキニルなどの不飽和のアルキルを包含する。飽和又は不飽和のアルキルの好適な例としては、メチル、エチル、１－プロピル（ｎ－プロピル）、２－プロピル（ｉＰｒ）、１－ブチル、２－メチル－１－プロピル（ｉ－Ｂｕ）、２－ブチル（ｓ－Ｂｕ）、２－ジメチル－２－プロピル（ｔ－Ｂｕ）、１－ペンチル（ｎ－ペンチル）、２－ペンチル、３－ペンチル、２－メチル－２－ブチル、３－メチル－２－ブチル、３－メチル－１－ブチル、２－メチル－１－ブチル、１－ヘキシル、２－ヘキシル、３－ヘキシル、２－メチル－２－ペンチル、３－メチル－２－ペンチル、４－メチル－２－ペンチル、３－メチル－３－ペンチル、２－メチル－３－ペンチル、２，３－ジメチル－２－ブチル、及び３，３－ジメチル－２－ブチルが挙げられるが、これらに限定されない。「C_{1-6}アルキル」は、１～６個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、ヘキシル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-5}アルキル」は、１～５個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含む全てを含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、エチレン又はビニル（$-CH=CH_2$）、アリル（$-CH_2CH=CH_2$）、５－ヘキセニル（$-CH_2CH_2CH_2CH_2CH=CH_2$）、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル、エチニル、２－プロピニル、２－ブチニル、３－ブチニル、２－ペンチニル及びその鎖異性体、２－ヘキシニル及びその鎖異性体を含む。

【００３３】

本明細書で使用される「アルキル」という用語は、不飽和部位を有しない、正常な、二次又は三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例は、メチル、エチル、１－プロピル（ｎ－プロピル）、２－プロピル（ｉＰｒ）、１－ブチル、２－メチル－１－プロピル（ｉ－Ｂｕ）、２－ブチル（ｓ－Ｂｕ）、２－ジメチル－２－プロピル（ｔ－Ｂｕ）、１－ペンチル（ｎ－ペンチル）、２－ペンチル、３－ペンチル、２－メチル－２－ブチル、３－メチル－２－ブチル、３－メチル－１－ブチル、２－メチル－１－ブチル、１－ヘキシル、２－ヘキシル、３－ヘキシル、２－メチル－２－ペンチル、３－メチル－２－ペン

チル、４－メチル－２－ペンチル、３－メチル－３－ペンチル、２－メチル－３－ペンチル、２，３－ジメチル－２－ブチル、及び３，３－ジメチル－２－ブチルである。「C_{1-6}アルキル」は、１～６個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体、ヘキシル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-5}アルキル」は、１～５個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含む全てを含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）、ペンチル及びその異性体を含む。例えば、「C_{1-4}アルキル」は、１～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ブチル及びその異性体（例えば、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル）を含む。例えば、「C_{1-3}アルキル」は、１～３個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキル基を含み、したがって、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピルを含む。「置換されたC_{1-6}アルキル」は、任意の利用可能な結合点で１つ以上の置換基（例えば、１～３つの置換基、例えば、１、２、又は３つの置換基）で置換されたC_{1-6}アルキル基を指す。

【００３４】

本明細書で使用される「アルケニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、正常な、二次又は三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例としては、エチレン又はビニル（－$CH=CH_2$）、アリル（－$CH_2CH=CH_2$）、及び５－ヘキセニル（－$CH_2CH_2CH_2CH_2CH=CH_2$）が挙げられるが、これらに限定されない。二重結合は、シス又はトランス配置であり得る。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「C_{2-6}アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、C_{2-4}アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を含む。C_{2-6}アルケニル基の例は、エテニル、２－プロペニル、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル等である。

【００３５】

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

【００３６】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のアルキレン」という用語は、飽和アルキレン、並びにアルケニレン、アルキニレンなどの不飽和アルキレンを包含する。本明細書で使用される「アルキレン」という用語は、親アルカンの同じ又は２個の異なる炭素原子からの２個の水素原子の除去によって得られる２つの一価のラジカル中心を有する飽和、直鎖、又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。典型的なアルキレンラジカルとしては、メチレン（－CH_2－）、エチレン（－CH_2-CH_2－）、メチルメチレン（－CH（C

Ｈ３）－）、１－メチル－エチレン（－ＣＨ（ＣＨ３）－ＣＨ２－）、ｎ－プロピレン（－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ２－）、２－メチルプロピレン（－ＣＨ２－ＣＨ（ＣＨ３）－ＣＨ２－）、３－メチルプロピレン（－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ（ＣＨ３）－）、ｎ－ブチレン（－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ２－）、２－メチルブチレン（－ＣＨ２－ＣＨ（ＣＨ３）－ＣＨ２－ＣＨ２－）、４－メチルブチレン（－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ２－ＣＨ（ＣＨ３）－）、ペンチレン及びその鎖異性体、ヘキシレン及びその鎖異性体が挙げられるが、これらに限定されない。

本明細書で使用される「アルケニレン」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、親アルケンの同じ又は２個の異なる炭素原子から２個の水素原子を除去することによって得られる２つの一価ラジカル中心を有する、直鎖又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。「Ｃ２－６アルケニレン」は、それ自体で又は別の置換基の一部として、二価である、すなわち、２つの他の基への結合のための２つの単結合を有するＣ２－６アルケニル基を指す。

【００３７】

本明細書で使用される「アルキニレン」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ三重結合を有する、親アルキンの同じ又は２個の異なる炭素原子から２個の水素原子を除去することによって得られる２つの一価ラジカル中心を有する、直鎖又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。本明細書で使用される場合、「Ｃ２－６アルキニレン」という用語は、それ自体で又は別の置換基の一部として、二価である、すなわち、２つの他の基への結合のための２つの単結合を有するＣ２－６アルキニル基を指す。

【００３８】

基又は基の一部としての「アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「Ｃ２－６アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、Ｃ２－４アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を含む。Ｃ２－６アルケニル基の例は、エテニル、２－プロペニル、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル等である。

【００３９】

「アルキニル」という用語は、それ自体で又は別の置換基の一部として、１つ以上の炭素－炭素三重結合を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「Ｃ２－６アルキニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素三重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、Ｃ２－４アルキニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を含む。Ｃ２－６アルキニル基の非限定的な例としては、エチニル、２－プロピニル、２－ブチニル、３－ブチニル、２－ペンチニル及びその鎖異性体、２－ヘキシニル及びその鎖異性体などが挙げられる。

【００４０】

基又は基の一部としての「ハロＣ１－６アルキル」という用語は、１個、２個又は３個の水素原子が本明細書で定義されるハロゲンで各々置き換えられる、先で定義される意味を有するＣ１－６アルキル基を指す。そのようなハロＣ１－６アルキル基の非限定的な例としては、クロロメチル、１－ブロモエチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、１，１，１－トリフルオロエチルなどが挙げられる。

【００４１】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和ヘテロアルキル」という用語は、飽和ヘテロア

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

【００４２】

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

【００４３】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、シクロアルキニルなどの不飽和シクロアルキルを含む。特に、本明細書で使用される「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、及びシクロアルキニルなどの不飽和非芳香族シクロアルキルを包含する。特に、「飽和又は不飽和のシクロアルキル」及び「飽和又は非芳香族不飽和のシクロアルキル」という用語は、同義語である。「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語はまた、単環式又は二環式基を含む、１個以上の環を含有する全ての飽和及び不飽和炭化水素基を含む。多環シクロアルキルの更なる環は、１個以上

のスピロ原子を介して、融合、架橋、及び／又は接合され得る。飽和又は不飽和のシクロアルキルの好適な例としては、シクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、ビシクロ［１．１．１］ペンタン、シス－ビシクロ［３．１．０］ヘキサンが挙げられるが、これらに限定されない。本明細書で使用される「シクロアルキル」という用語は、特に明記されていない限り、単環式又は二環式基を含む飽和環式炭化水素ラジカルを意味し、多環式シクロアルキルの更なる環は、１個以上のスピロ原子を介して、縮合、架橋、及び／又は接合され得る。シクロアルキルの例としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ノルボルニル、フェンチル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニルなどが挙げられる。本明細書で使用される「シクロアルケニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、非芳香族環状炭化水素ラジカルを意味する。「シクロアルケニル」という用語はまた、単環式又は二環式基を含み、多環式シクロアルケニルの更なる環は、１個以上のスピロ原子を介して、縮合、架橋、及び／又は接合され得る。例としては、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルが挙げられるが、これらに限定されない。二重結合は、シス又はトランス配置であり得る。本明細書で使用される「シクロアルキニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ三重を有する、非芳香族環状炭化水素ラジカルを意味する。例は、シクロヘプト－１－エンである。ヘテロシクロアルキル環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。アリール環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、アリールとみなされる。ヘテロアリール環を有するシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロアリールとみなされる。

【００４４】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、飽和ヘテロシクロアルキル、並びに少なくとも１個のヘテロ原子、すなわち、環員としてＮ、Ｏ、又はＳを含む不飽和非芳香族ヘテロシクロアルキルを包含する。特に、「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」及び「飽和又は非芳香族不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、同義語である。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルケニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルケニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。飽和及び不飽和のヘテロシクロアルキルの例としては、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリ

ジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、が挙げられるが、これらに限定されない。本発明の意味における更なるヘテロシクロアルキルは、Ｐａｑｕｅｔｔｅ，Ｌｅｏ Ａ．“Ｐｒｉｎｃｉｐｌｅｓ ｏｆ Ｍｏｄｅｒｎ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｗ．Ａ．Ｂｅｎｊａｍｉｎ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９６８）、特に、１、３、４、６、７、及び９章、“Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０年から現在）、特に、１３、１４、１６、１９、及び２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ．“Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）、並びにＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．（１９６０）８２：５５６６に記載されている。ヘテロシクロアルキルが環員として窒素を含有しない場合、それは、典型的には炭素を通して結合される。ヘテロシクロアルキルが環員として窒素を含有する場合、それは、窒素又は炭素を通して結合され得る。シクロアルキル環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。アリール環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロシクロアルキルとみなされる。ヘテロアリール環を有するヘテロシクロアルキル環の縮合系は、コア構造に結合する環にかかわらず、ヘテロアリールとみなされる。

【００４５】

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

【００４６】

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

【００４７】

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

【００４８】

好ましい炭素結合複素環としては、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、５－ピリジル、６－ピリジル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、５－ピリダジニル、６－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、６－ピリミジニル、２－ピラジニル、３－ピラジニル、５－ピラジニル、６－ピラジニル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、又は５－チアゾリルが挙げられる。例として、窒素結合複素環は、アジリジン、アゼチジン、ピロール、ピロリジン、２－ピロリン、３－ピロリン、イミダゾール、イミダゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、ピラゾール、ピラゾリン、２－ピラゾリン、３－ピラゾリン、ピペリジン、ピペラジン、インドール、インドリン、１Ｈ－インダゾール、の１位、イソインドール又はイソインドリンの２位、モルホリンの４位、及びカルバゾール又はβ－カルボリンの９位に結合される。好ましい窒素結合複素環としては、１－アジリジル、１－アゼチジル、１－ピロリル、１－イミダゾリル、１－ピラゾリル、及び１－ピペリジニルが挙げられる。本発明の意味における更なるヘテロアリールは、Ｐａｑｕｅｔｔｅ，Ｌｅｏ Ａ.“Ｐｒｉｎｃｉｐｌｅｓ ｏｆ Ｍｏｄｅｒｎ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｗ．Ａ．Ｂｅｎｊａｍｉｎ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９６８）、特に、１、３、４、６、７、及び９章、“Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０年から現在）、特に、１３、１４、１６、１９、及び２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ．“Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）、並びにＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．（１９６０）８２：５５６６に記載されている。

【００４９】

置換基に関して本明細書で使用される場合、特に明記されていない限り、「一置換」、「二置換」、「三置換」、「多置換」などの用語は、本明細書で定義される化学構造を意味し、それぞれの部分は、１つ以上の置換基で置換され、当該部分の１個以上の水素原子は、各々独立して、置換基で置き換えられることを意味する。例えば、－Ｆで多置換され得る－C_{1-6}－アルキルが、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－CH_2CF_3、CF_2CF_3などに及ぶ。同様に、互いに独立して、－Ｆ及び－Ｃｌから選択される置換基で多置換され得る－C_{1-6}－アルキルは、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－CH_2CF_3、CF_2CF_3、－CH_2Cl、－$CHCl_2$、－CCl_3、－CH_2CCl_3、CCl_2CCl_3、－CHClF、－$CClF_2$、－CCl_2CF_3、－CF_2CCl_3、－CClFCCl_2Ｆなどに及ぶ。本発明の化合物中の１つを超える部位に見出される任意の置換基の指定は、独立して、選択されるものとする。

【００５０】

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

【００５１】

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

【００５２】

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

【００５３】

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

【００５４】

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

【００５５】

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

【００５６】

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

【００５７】

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

【００５８】

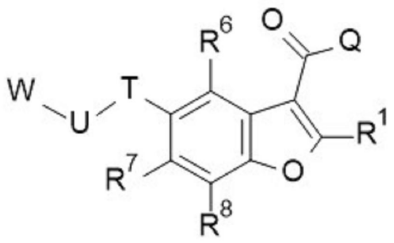
これより、本発明の化合物及び方法の好ましい陳述（特徴）及び実施形態を記載する。そのように定義された本発明の各陳述及び実施形態は、反対のことが明確に示されない限り、任意の他の陳述及び／又は実施形態と組み合わされ得る。特に、好ましい又は有利であると示される任意の特徴は、好ましい又は有利であると示される任意の他の１つ以上の特徴と組み合わせてもよい。

【００５９】

この発明の番号付けした陳述は、以下の通りである：

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

【化３】



（Ｉ）

式中、
Ｒ^{1}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ｑが、－ＮＲ^{３}Ｒ^{４}を表し、
Ｒ^{３}が、－ＯＨ又は－Ｒ^{Ｙ１}を表し、
Ｒ^{４}が、－Ｒ^{Ｙ２}又は－Ｓ（＝Ｏ）$_{２}$Ｒ^{Ｙ３}を表し、
あるいは、Ｒ^{３}及びＲ^{４}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５’}$）$_{ｎ}$－を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５’}$）$_{ｎ}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
Ｒ^{５}及びＲ$^{５’}$が、互いに独立して、－Ｒ^{Ｙ４}を表し、
Ｒ^{６}、Ｒ^{７}、及びＲ^{８}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_{２}$、－ＳＦ$_{５}$、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{２}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキル、－Ｃ$_{２}$－Ｃ$_{６}$－アルケニル、－Ｃ$_{２}$－Ｃ$_{６}$－アルキニル、を表し、
式中、
Ｒ^{Ｗ}及びＲ^{Ｘ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３

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

$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アル

キル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

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

３．Ｒ^{1}が、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、

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

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

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

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

－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、

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

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_1$－$_6$－アルキル、

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、陳述１又は２に記載の化合物。

４．Ｒ^{1}が、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、

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

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

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

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

－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、

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

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

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

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

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

非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルであって、当該３～１４員シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル又は８～１４員シクロアルキニルの各々が、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続される、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル又は８～１２員シクロアルキニルであって、当該３～１２員シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル又は８～１２員シクロアルキニルの各々が、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続される、３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル又は８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル又は８～１０員シクロアルキニルであって、当該３～１０員シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル又は８～１０員シクロアルキニルの各々が、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続される、３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル又は８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル又は８員シクロアルキニルであって、当該３～８員シクロアルキル、５～８員シ

クロアルケニル又は８員シクロアルキニルの各々が、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続される、３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル又は８員シクロアルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

５．Ｒ^{1}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキレン）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

６．Ｒ^{1}が、－Ｈ、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、又は－シクロペンチル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

７．Ｒ^{3}が、

－Ｈ、

－ＯＨ、

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

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

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

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

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

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

８．Ｒ^{3}が、

－Ｈ、

－ＯＨ、

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

９．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１０．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１１．Ｒ^{3}が、－Ｈを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１２．Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

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

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

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

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

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

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

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

－$_{6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

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

ン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

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

３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－ア

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

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

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

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$

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

１５．Ｒ^{4}が、

－Ｈ、

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

飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

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

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキ

ル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、非置換の－フェニル、オキセタニル、又はピリミジニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、

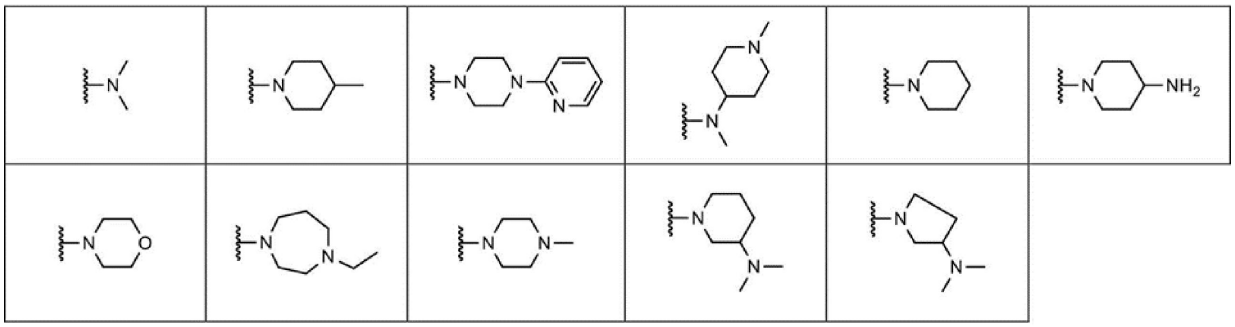
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換若しくは多置換であり、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－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

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換、又は－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨで一置換であり、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換である、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１６．R^4が、
－Ｈ、
飽和の、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和の、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、
飽和の、非置換の、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、オキセタニル、ピリミジニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、
非置換の－フェニル、
５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１７．
R^3が、－Ｈを表し、
R^4が、

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

又は６員の複素環を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１９．R^3及びR^4が、一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、各場合において、非置換の、又は－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHCH$_3$、－N（CH$_3$）$_2$、－C（＝O）NH－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、非置換の－ピリジル、及び非置換若しくは－C_{1-6}－アルキルで一置換されている１，２，４－オキサジアゾールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２０．R^3及びR^4が、一緒になって、
非置換、又は－N（CH$_3$）$_2$で一置換されている、ピロリジン環、
非置換、又は－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－N（CH$_3$）$_2$、－C（＝O）NH－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、－NHC（＝O）O－C_{1-6}－アルキル、及び非置換若しくは－C_{1-6}－アルキルで一置換されている１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換されている、ピペリジン環、
非置換のモルホリン環、あるいは
非置換、又は－C_{1-6}－アルキル及び非置換の－ピリジルからなる群から選択される置換基でN置換されている、ピペリジン環、を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２１．R^3及びR^4が、これらが結合している窒素原子と一緒になって、以下のものからなる群から選択される残基を形成する、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
【化４】



２２．Wが、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員シクロアルキル、
各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－C_1－C_6－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、を表し、
特に、Wが、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員シクロアルキル、
各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－C_1－C_6－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２３．Wが、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－F、－Cl、－Br、－I、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C（＝O）－C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）OH、－C（＝O）－OC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）O－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－OH、＝O、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}

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

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

２４．Ｗが、

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

Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１０員シクロアルキル、又は

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

２５．Ｗが、

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

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

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２６．Ｗが、

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

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２７．Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

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

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

２８．ｎが、１、２、又は３から選択される整数であり、

Ｒ^{5}及びＲ^{5}’が、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２９．Ｒ^{5}及びＲ^{5}’が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル）$_{2}$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３０．Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、

－Ｈ、

－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_{5}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、

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

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

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

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

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３１．Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_{5}$、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、

－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、

－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、

非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、ＳＦ$_{5}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$から

選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３２．Ｒ^{6}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３３．Ｒ^{6}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３４．Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３５．Ｒ^{7}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３６．Ｒ^{8}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３７．Ｒ^{8}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３８．
（ｉ）Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が各々、－Ｈを表すか、又は
（ｉｉ）Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの２つが、－Ｈを表し、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの他方が、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_3$を表すか、又は
（ｉｉｉ）Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの１つが、－Ｈを表し、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの他方は、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_3$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

３９．本明細書で述べられている化合物００１～化合物０４４及びそれらの生理学的に許容される塩からなる群から選択される、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

４０．本明細書で述べられている化合物００１～化合物０６２及びそれらの生理学的に許容される塩からなる群から選択される、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

４１．
Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、又は－ＣＦ$_3$を表し、及び／又は
Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、
Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員

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

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

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

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

あるいは、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有し、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５又は６員の複素環を形成し、

Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表し、

Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、

Ｗが、

飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

４２．先行陳述のいずれか１つに記載の化合物を含む、薬学的組成物又は医薬。

４３．医薬としての使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述４２に記載の薬学的組成物。

４４．疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛及びてんかん性脳症の治療における使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述４２に記載の薬学的組成物。

４５．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述４４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。

４６．疼痛が、術後疼痛である、陳述４４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。

４７．有効量の陳述１～４１のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項４２に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／又は治療の方法

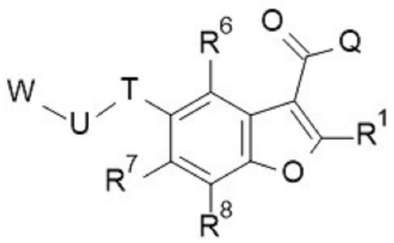
４８．有効量の先行陳述１～４１のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項４２に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、疼痛、又はてんかん性脳症などのてんかんの予防及び／又は治療の方法。

４９．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述４８に記載の方法。

【００６０】

本発明の第１の態様は、好ましくは、疼痛の治療における使用のための、式（Ｉ）の化合物（本発明によるベンゾフラン誘導体とも称される）、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体を提供し、

【化５】



（Ｉ）

式中、

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

Ｑが、$-NR^3R^4$を表し、

R^3が、－ＯＨ又は$-R^{Y1}$を表し、

R^4が、$-R^{Y2}$又は$-S(=O)_2R^{Y3}$を表し、

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

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

ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、

R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^{Y4}$を表し、

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

Ｗが、

飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、又は

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

式中、

R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、

－Ｈ、

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、$-C_1-C_6-$アルキレン－又は$-C_1-C_6-$ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和

の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
Ｒ^{Ｙ１}、Ｒ^{Ｙ２}、Ｒ^{Ｙ３}、及びＲ^{Ｙ４}が、互いに独立して、各場合において、独立して、－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、

「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ

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

【００６１】

いくつかの実施形態において、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－を表し、ｎは、１、２、又は３から選択される整数である。

【００６２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、

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

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

－ＯＨ、

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

－ＮＨ$_2$、

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

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

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

アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す。

【００６３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキ

レン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ２－Ｃ６－アルケニル、－Ｃ２－Ｃ６－アルキニル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ２－Ｃ６－アルケニル、－Ｏ－Ｃ２－Ｃ６－アルキニル、
－ＮＨ２、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２

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

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

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

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

－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、

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

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

１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキル、、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す。
【００６４】
いくつかの実施形態において、Ｒ１は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ２－Ｃ６－アルケニル、－Ｃ２－Ｃ６－アルキニル、－ＯＨ、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＳＨ、－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６

－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の３～１４員シクロアルキル、又は非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、－ＯＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。

【００６５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、－Ｈ、ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－ＣＮ、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－ＣＨＦ$_2$、非置換の－シクロプロピル、非置換のシクロブチル、非置換のシクロペンチル、又は非置換のシクロヘキシルを表す。

【００６６】

好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、又は－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、より好ましくは、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、又は－ＣＦ$_2$Ｈを表す。

【００６７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{3}は、

－Ｈ、

－ＯＨ、

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

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

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

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

【００６８】

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

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

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

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

－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールあって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００６９】

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

【００７０】

好ましくは、Ｒ^{3}は、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ

１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、又は－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３を表す。より好ましくは、Ｒ３は、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、又は－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３を表す。好ましくは、Ｒ３は、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和の、非置換の、若しくは－ＯＨで一置換されている－Ｃ１－６－アルキルを表す。好ましくは、Ｒ３は、－Ｈを表す。

【００７１】

いくつかの実施形態において、Ｒ３及びＲ４は、両方とも－Ｈを表さない。いくつかの実施形態において、Ｒ３は、－Ｈを表し、Ｒ４は、－Ｈを表さない。

【００７２】

いくつかの実施形態において、Ｒ４は、

－Ｈ、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ１－６－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ１－Ｃ６－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ１－Ｃ６－アルキレン－又は－Ｃ１－Ｃ６－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換

の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。
【００７３】
好ましくは、Ｒ^{4}は、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員

ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、C_{1-6}－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、
３～１４員シクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員シクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、特に、３～１４員シクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和若しくは非芳香族不飽和の、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－N（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員シクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、
３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルフォリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾジオキソール、ジヒド

ロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－C_{1-6}－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、－フェニル、
５～１４員ヘテロアリール又は－C_{1-6}－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－C_{1-6}－アルキレン－が、非置換又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル

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

【００７４】

好ましくは、Ｒ^{4}は、

－Ｈ、

－Ｆで一置換又は多置換の、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、

非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）、

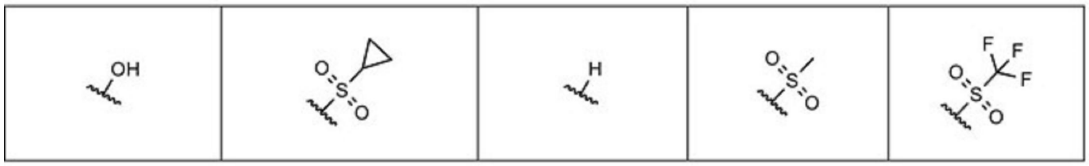
－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は非置換の－フェニルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和の、非置換の、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は二置換の、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、

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

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

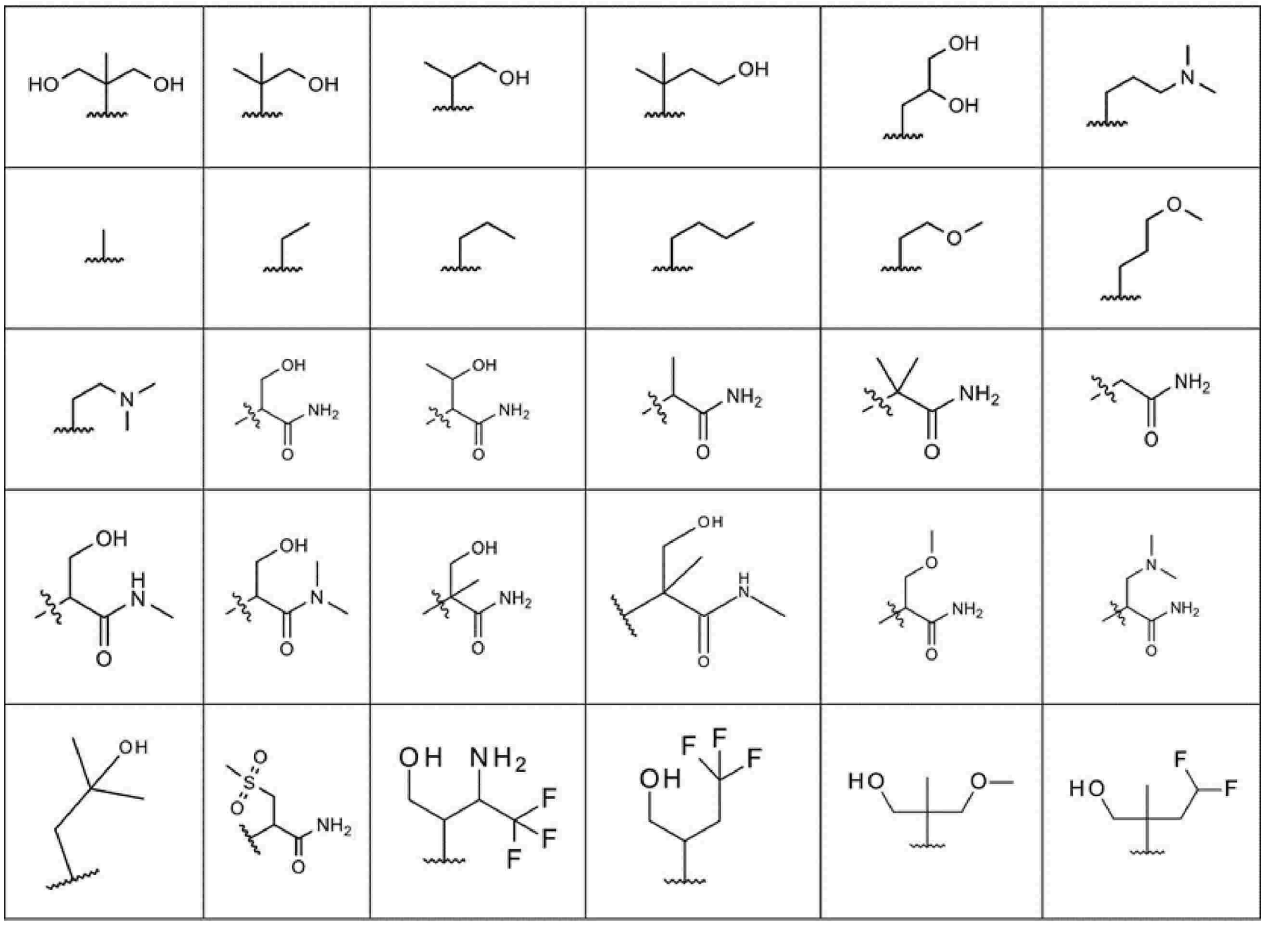
【００７５】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、
以下のもの：
【化６】



からなる群から選択される残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換のＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表し、好ましくは、残基－ＣＲ’Ｒ’’－（Ｃ$_{n}$Ｈ$_{m}$－ＯＨを表し、ｍが、１、２、３、４、５、又は６から選択される、好ましくは、１、２、又は３から選択される整数であり、Ｒ’及びＲ’’が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$；－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$；好ましくは、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、ＯＨで置換された－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$；好ましくは、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、ＯＨで置換された－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$；－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレ

ン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$；好ましくは、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$；好ましくは、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、ＯＨで置換された－ＣＨ$_3$ＣＨ$_2$（ＯＨ）－　－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（ＣＦ$_3$）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－ＣＨ$_3$、Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$を表し、好ましくは、少なくともＲ’又はＲ’’が、－Ｈを表さず、好ましくは、Ｒ’又はＲ’’のいずれも－Ｈを表さず、好ましくは、以下のもの：

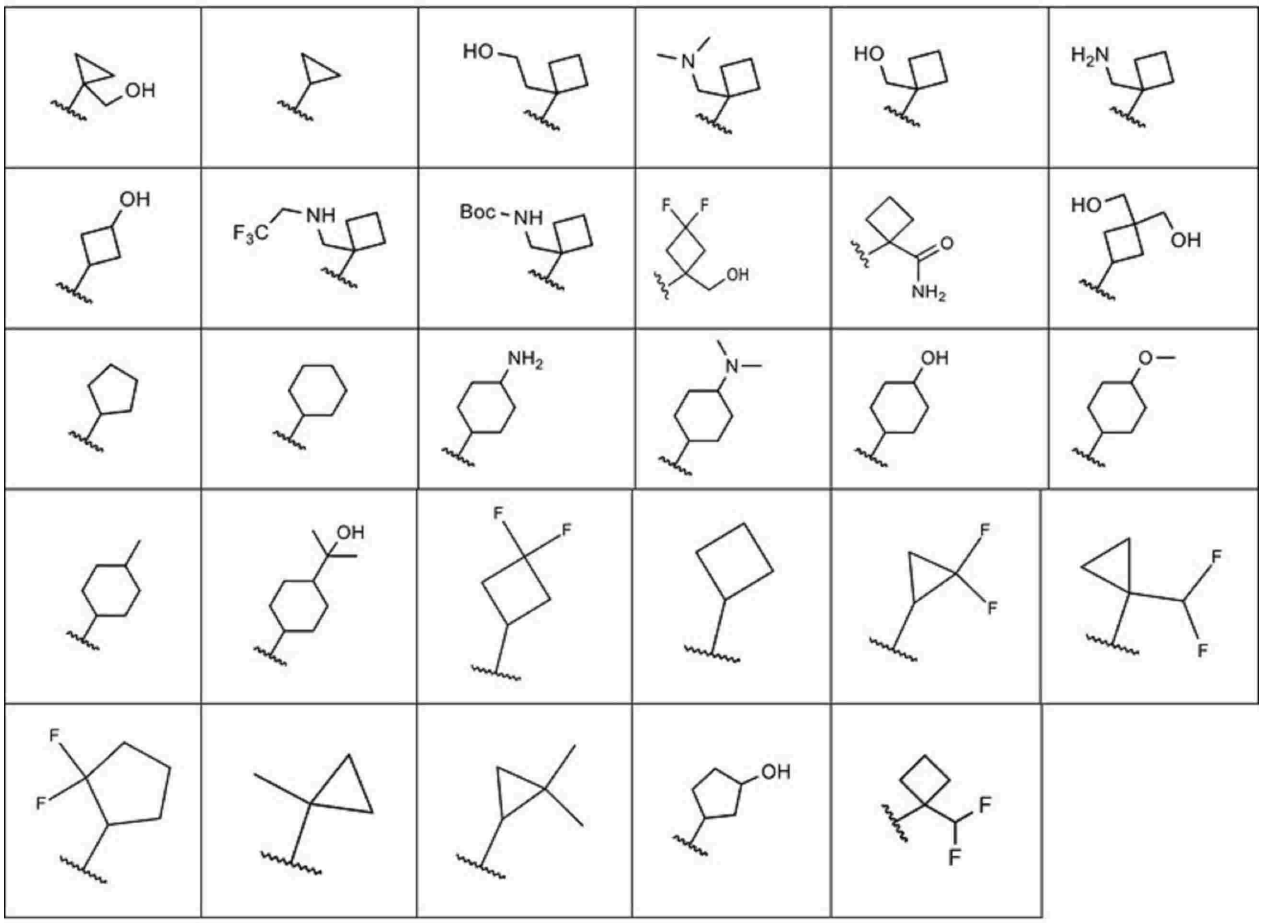
【化７】



からなる群から選択される残基、又は、

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

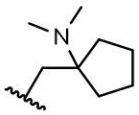
【化８】



又は、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキルであって、当該３～１２員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルであって、当該３～１０員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキルであって、当該３～８員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～８員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキルであって、当該３～１２員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルであって、当該３～１０員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不

飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキルであって、当該３～８員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－を介して接続される、３～８員シクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

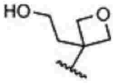
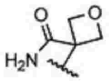
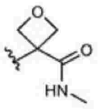
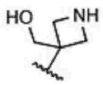
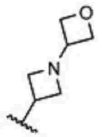
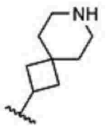
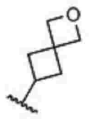
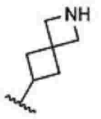
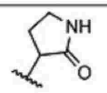
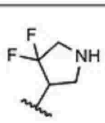
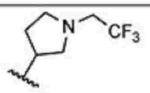
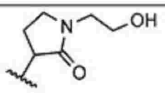
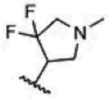
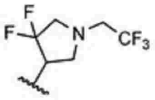
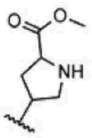
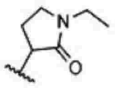
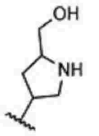
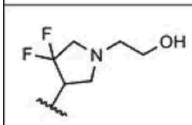
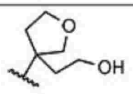
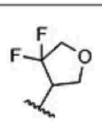
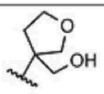
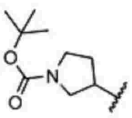
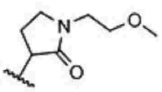
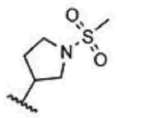
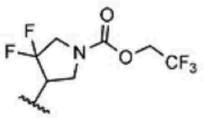
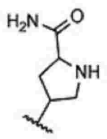
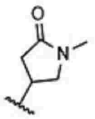
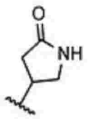
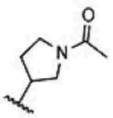
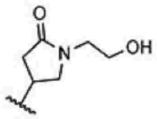
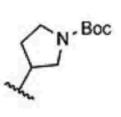
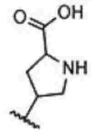
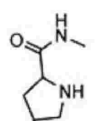
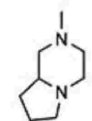
【化９】



からなる群から選択される残基、又は

飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和の、非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１３員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１１員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【化１０－１】

10

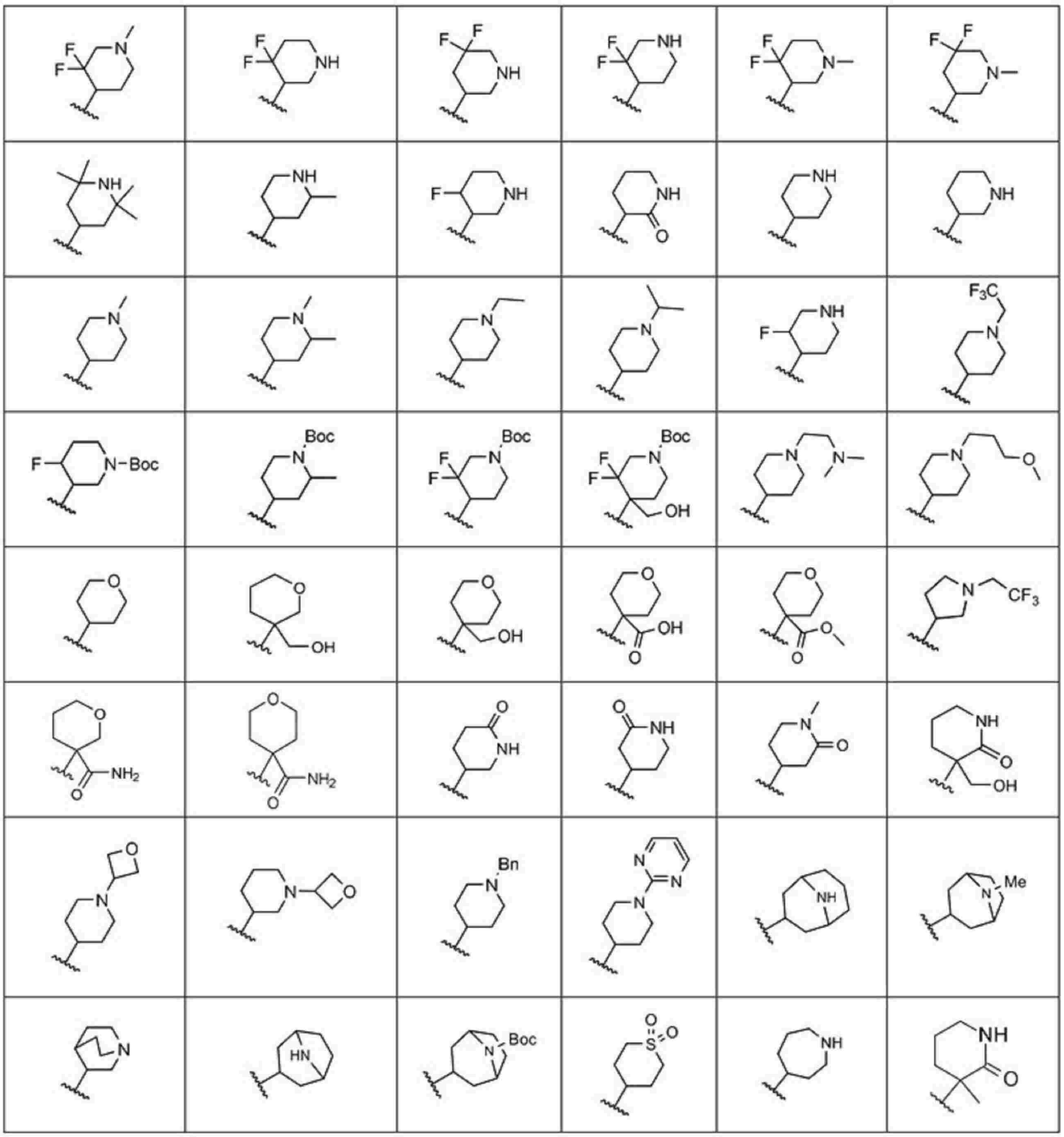
20

30

40

50

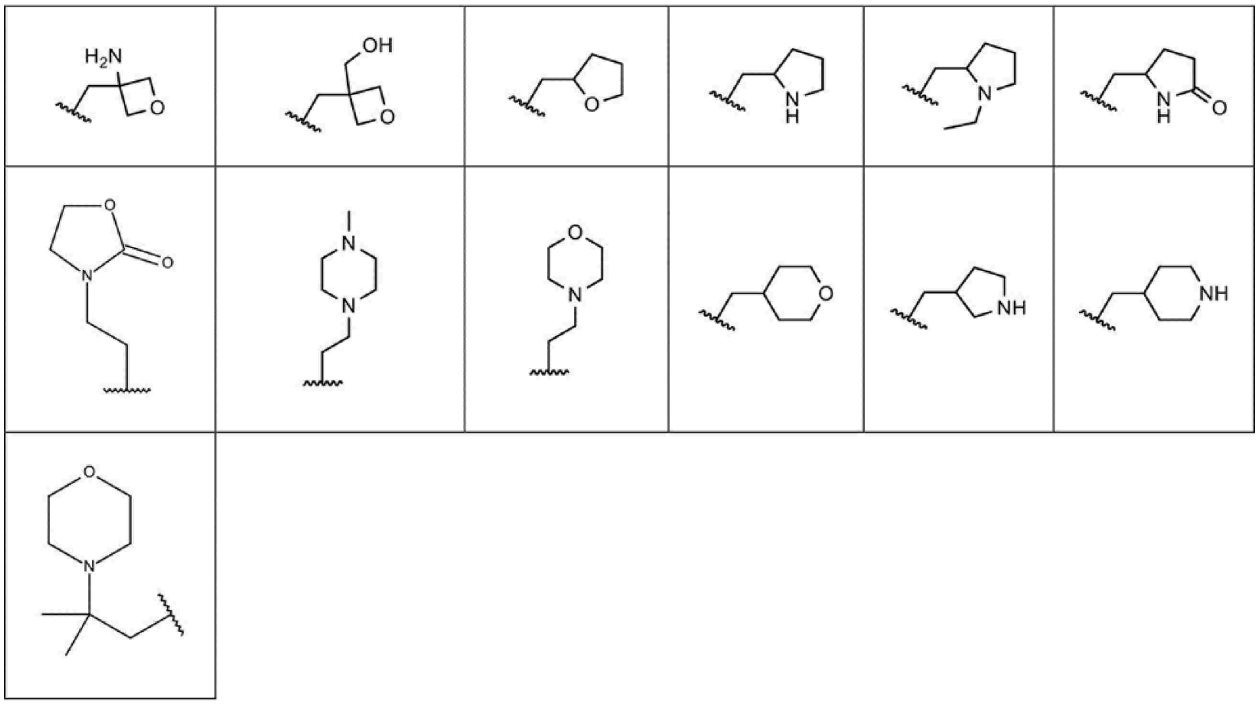
【化１０－２】



からなる群から選択されるヘテロシクロアルキル残基、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１２員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１０員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続される、３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロ３～８員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介

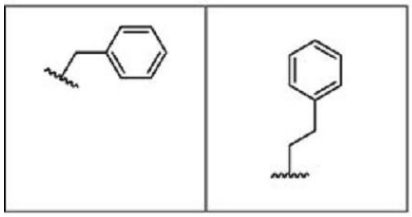
して接続される、３～８員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１２員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１０員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～８員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、３～８員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のもの：

【化１１】



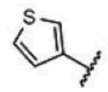
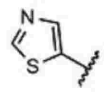
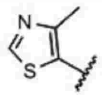
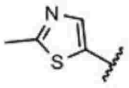
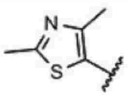
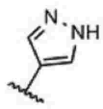
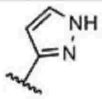
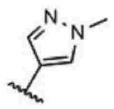
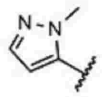
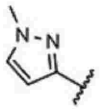
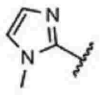
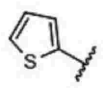
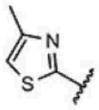
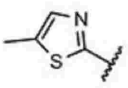
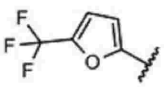
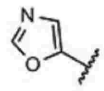
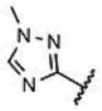
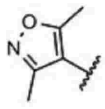
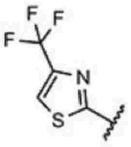
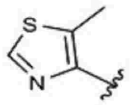
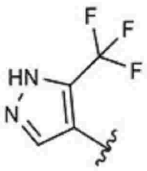
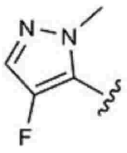
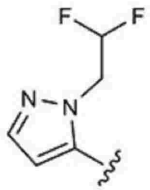
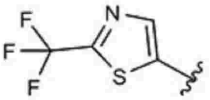
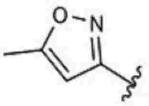
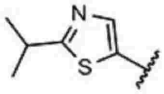
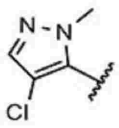
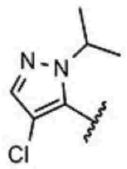
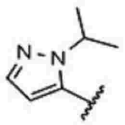
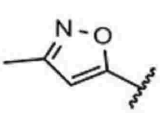
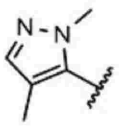
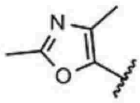
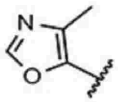
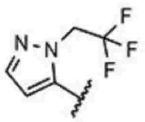
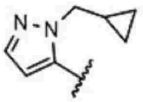
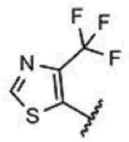
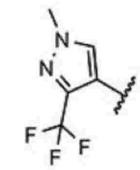
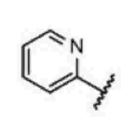
からなる群から選択される残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～８員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリールであって、当該６～１２員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該６～１０員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、６～１０員アリールを表し、好ましくは、以下のもの：

【化１２】

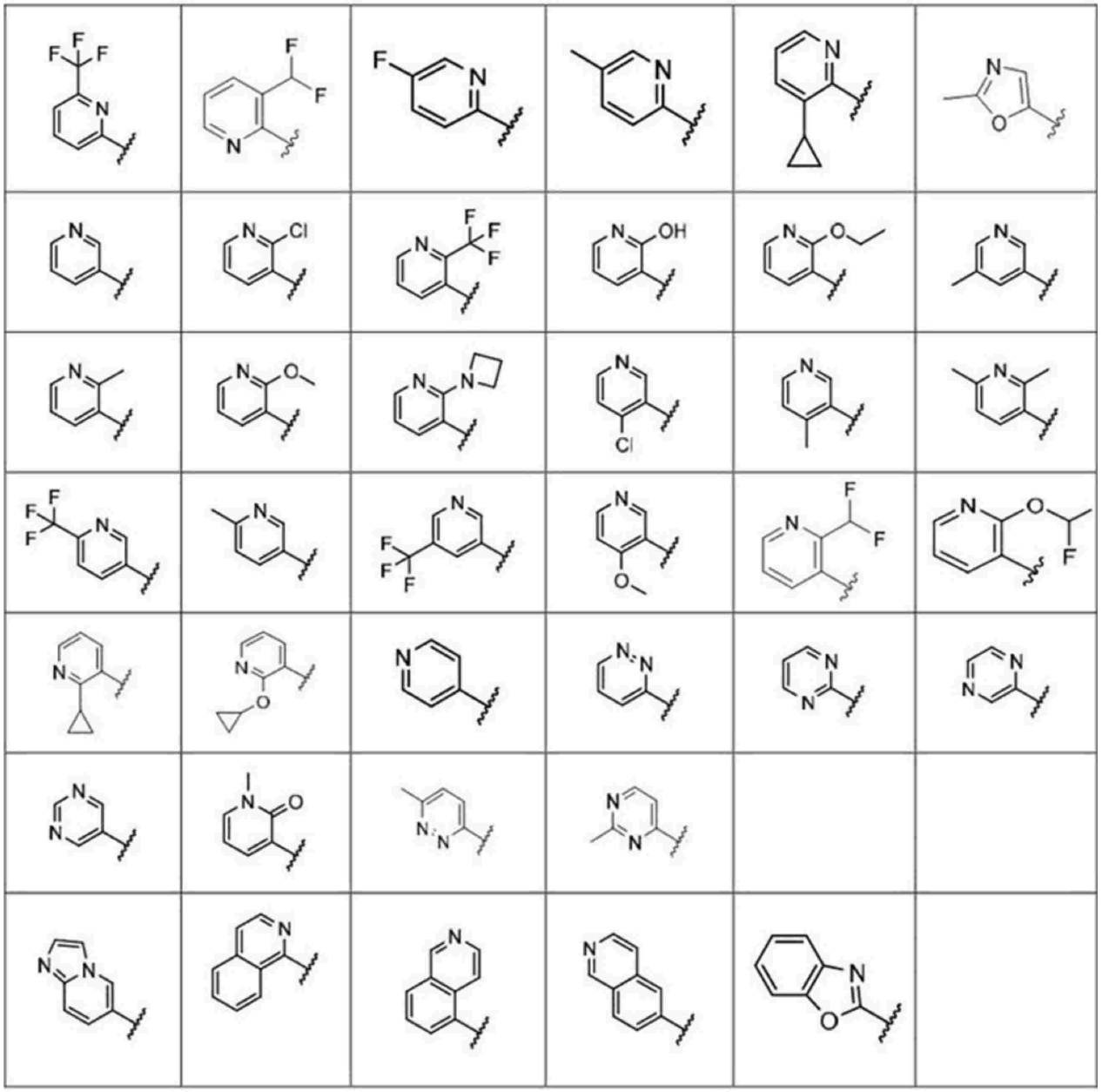


からなる群から選択される残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下のもの：

【化１３－１】

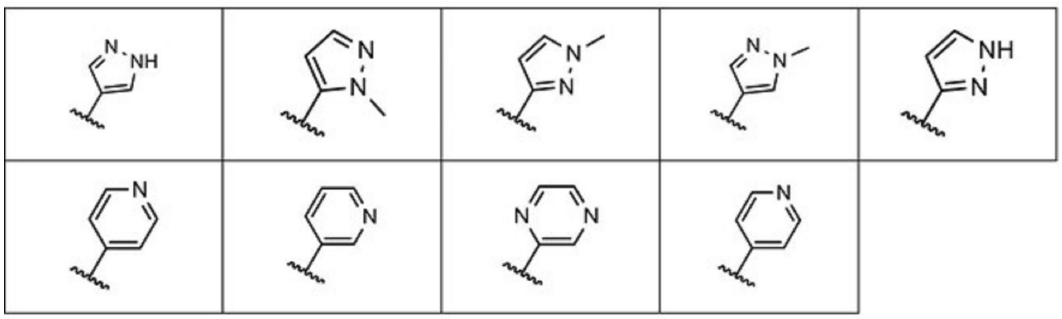
					
					
					
					
					
					
					
					

【化１３－２】



からなる群から選択される残基を表し、より好ましくは、以下のもの：

【化１４】

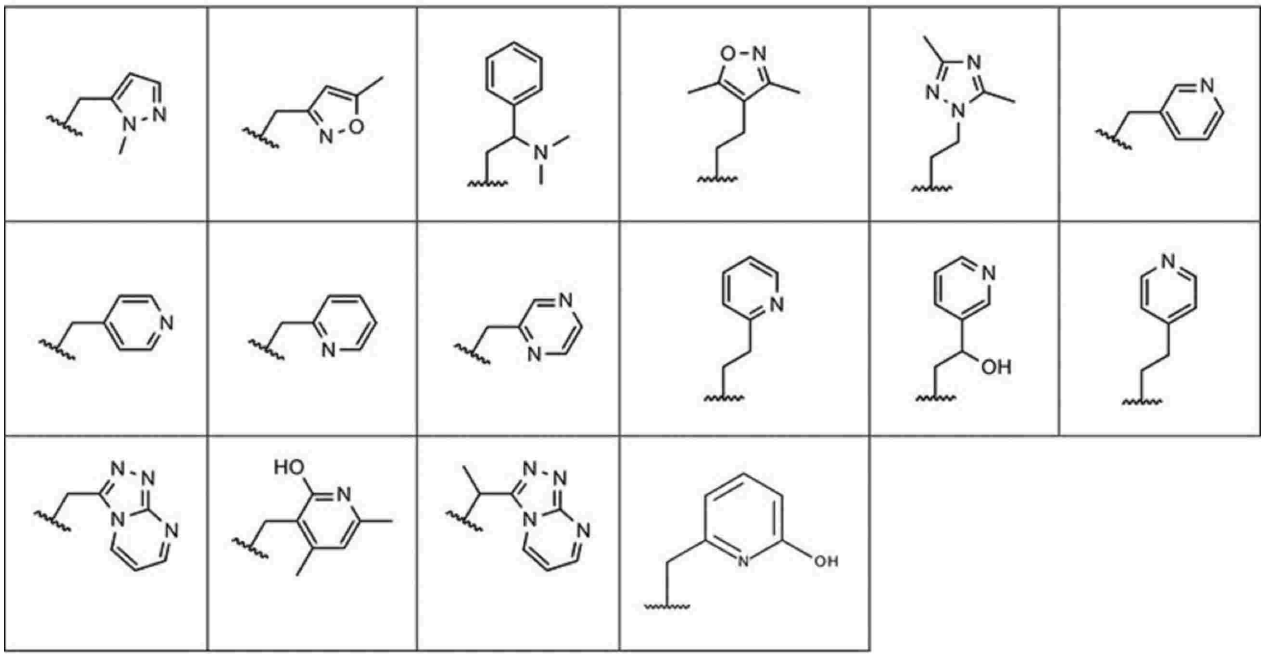


からなる群から選択される残基、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続される、５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置

換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリールであって、当該５～１２員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－を介して接続される、５～１２員ヘテロアリール、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリールであって、当該５～１０員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－を介して接続される、５～１０員ヘテロアリール、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該５～８員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－を介して接続される、５～８員ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択される残基を表す：

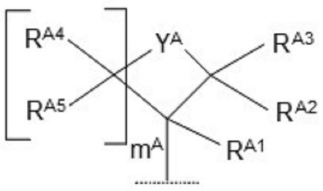
【化１５】



【００７６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ａ）による残基を表し、

【化１６】



（Ａ）

式中、

ｍ^{A}が、０又は１であり、

Ｙ^{A}が、－Ｏ－、－ＮＲ^{A6}－、及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、

Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A6}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-4}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－

Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－３－アルキル）２、又は－３－オキセタニルを表すか、あるいはＲＡ７及びＲＡ８は、これたが結合している炭素原子と一緒になって、環を形成し、－ＣＨ２ＯＣＨ２－、－ＣＨ２ＯＣＨ２ＣＨ２－又は－ＣＨ２ＣＨ２ＯＣＨ２ＣＨ２－、－ＣＨ２ＮＨＣＨ２－、－ＣＨ２ＮＨＣＨ２ＣＨ２－又は－ＣＨ２ＣＨ２ＮＨＣＨ２ＣＨ２－を表す。

【００７７】

いくつかの実施形態において、Ｒ４は、先に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、

ｍＡが、０又は１であり、

ＹＡが、－Ｏ－及び－ＣＲＡ７ＲＡ８－から選択され、

ＲＡ１、ＲＡ２、ＲＡ３、ＲＡ４、ＲＡ５、ＲＡ７、及びＲＡ８は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ１－３－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－３－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－３－アルキル）２、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２を表し、好ましくは、ＲＡ１、ＲＡ２、ＲＡ３、ＲＡ４、ＲＡ５、ＲＡ７、及びＲＡ８のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【００７８】

いくつかの実施形態において、Ｒ４は、先に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、

ｍＡが、０又は１であり、

ＹＡが、－Ｏ－及び－ＣＲＡ７ＲＡ８－から選択され、

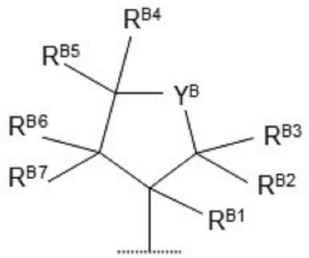
ＲＡ１が、－Ｃ１－３－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－３－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－３－アルキル）２、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２を表し、

ＲＡ２、ＲＡ３、ＲＡ４、ＲＡ５、ＲＡ７、及びＲＡ８が、－Ｈを表す。

【００７９】

いくつかの実施形態において、Ｒ４は、一般式（Ｂ）による残基を表し、

【化１７】



（Ｂ）

式中、

ＹＢが、－Ｏ－、－ＮＲＢ８－、及び－ＣＲＢ９ＲＢ１０－から選択され、

ＲＢ１、ＲＢ２、ＲＢ３、ＲＢ４、ＲＢ５、ＲＢ６、ＲＢ７、ＲＢ８、ＲＢ９、及びＲＢ１０が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－３－アルキル）２、－Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ１－３－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－３－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ１－３－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－３－アルキレン－ＣＯ２Ｈ、若しくは－Ｃ１－３－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－３－アルキルを表すか、又はＲＢ２及びＲＢ３が、一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲＢ４及びＲＢ５が、一緒になって、＝Ｏを表す。

【００８０】

いくつかの実施形態において、Ｒ４は、先に定義される一般式（Ｂ）による残基を表し、

ＹＢが、－Ｏ－及び－ＮＲＢ８－から選択され、

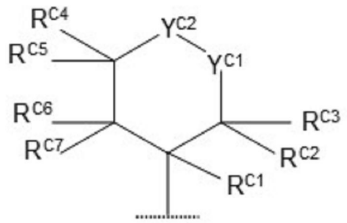
ＲＢ１、ＲＢ２、ＲＢ３、ＲＢ４、ＲＢ５、ＲＢ６、ＲＢ７、ＲＢ８が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ１－３－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－３－アルキレ

ン－ＣＦ$_3$、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$を表すか、又はＲ^{Ｂ２}及びＲ^{Ｂ３}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はＲ^{Ｂ４}及びＲ^{Ｂ５}が一緒になって、＝Ｏを表すか、好ましくは、Ｒ^{Ａ１}、Ｒ^{Ａ２}、Ｒ^{Ａ３}、Ｒ^{Ａ４}、Ｒ^{Ａ５}、Ｒ^{Ａ７}、及びＲ^{Ａ８}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とし、好ましくは、Ｒ^{Ａ１}、Ｒ^{Ａ２}、Ｒ^{Ａ３}、Ｒ^{Ａ４}、Ｒ^{Ａ５}、Ｒ^{Ａ７}、及びＲ^{Ａ８}のうちの少なくとも１つが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【００８１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、一般式（Ｃ）による残基を表し、

【化１８】



（Ｃ）

式中、

Ｙ^{Ｃ１}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、－ＮＲ^{Ｃ８}－、及び－ＣＲ^{Ｃ９}Ｒ^{Ｃ１０}－から選択されるか、又はＹ^{Ｃ２}が、－ＣＲ^{Ｃ１１}Ｒ^{Ｃ１２}－を表すか、又はＹ^{Ｃ１}が、－ＣＲ^{Ｃ９}Ｒ^{Ｃ１０}－を表し、Ｙ^{Ｃ２}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、及び－ＮＲ^{Ｃ８}－から選択され、Ｒ^{Ｃ１}、Ｒ^{Ｃ２}、Ｒ^{Ｃ３}、Ｒ^{Ｃ４}、Ｒ^{Ｃ５}、Ｒ^{Ｃ６}、Ｒ^{Ｃ７}、Ｒ^{Ｃ８}、Ｒ^{Ｃ９}、Ｒ^{Ｃ１０}、Ｒ^{Ｃ１１}、及びＲ^{Ｃ１２}が、互いに独立して、

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

【００８２】

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

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

Ｒ^{Ｃ１}、Ｒ^{Ｃ２}、Ｒ^{Ｃ３}、Ｒ^{Ｃ４}、Ｒ^{Ｃ５}、Ｒ^{Ｃ６}、Ｒ^{Ｃ７}、Ｒ^{Ｃ８}、Ｒ^{Ｃ９}、Ｒ^{Ｃ１０}、Ｒ^{Ｃ１１}、及びＲ^{Ｃ１２}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$を表すか、好ましくは、Ｒ^{Ｃ１}、Ｒ^{Ｃ２}、Ｒ^{Ｃ３}、Ｒ^{Ｃ４}、Ｒ^{Ｃ５}、Ｒ^{Ｃ６}、Ｒ^{Ｃ７}、Ｒ^{Ｃ８}、Ｒ^{Ｃ９}、Ｒ^{Ｃ１０}、Ｒ^{Ｃ１１}、及びＲ^{Ｃ１２}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とし、好ましくは、Ｒ^{Ｃ１}、Ｒ^{Ｃ２}、Ｒ^{Ｃ３}、Ｒ^{Ｃ４}、Ｒ^{Ｃ５}、Ｒ^{Ｃ６}、Ｒ^{Ｃ７}、Ｒ^{Ｃ８}、Ｒ^{Ｃ９}、Ｒ^{Ｃ１０}、Ｒ^{Ｃ１１}、及びＲ^{Ｃ１２}のうちの少なくとも１つが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【００８３】

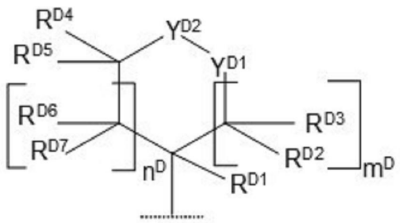
いくつかの実施形態において、Ｒ^{4}は、

（ｉ）残基－ＣＲ’Ｒ’’－（Ｃ$_6$Ｈ$_m$－ＯＨであって、式中、ｍが、１～６の整数であり、好ましくは１～３の整数であり、Ｒ’及びＲ’’が、互いに独立して、－Ｈ、ＩＣ$_3$－

アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、又は－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨを表し、好ましくは、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、又は－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨを表す、残基－ＣＲ’Ｒ’’－（Ｃ$_2$Ｈ）$_m$－ＯＨを表す。好ましい実施形態において、少なくともＲ’又はＲ’’は、－Ｈを表さない。好ましい実施形態において、Ｒ’又はＲ’’のいずれも、－Ｈを表さず、又は

（ｉｉ）一般式（Ｄ）による残基、

【化１９】



（Ｄ）

式中、

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

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

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

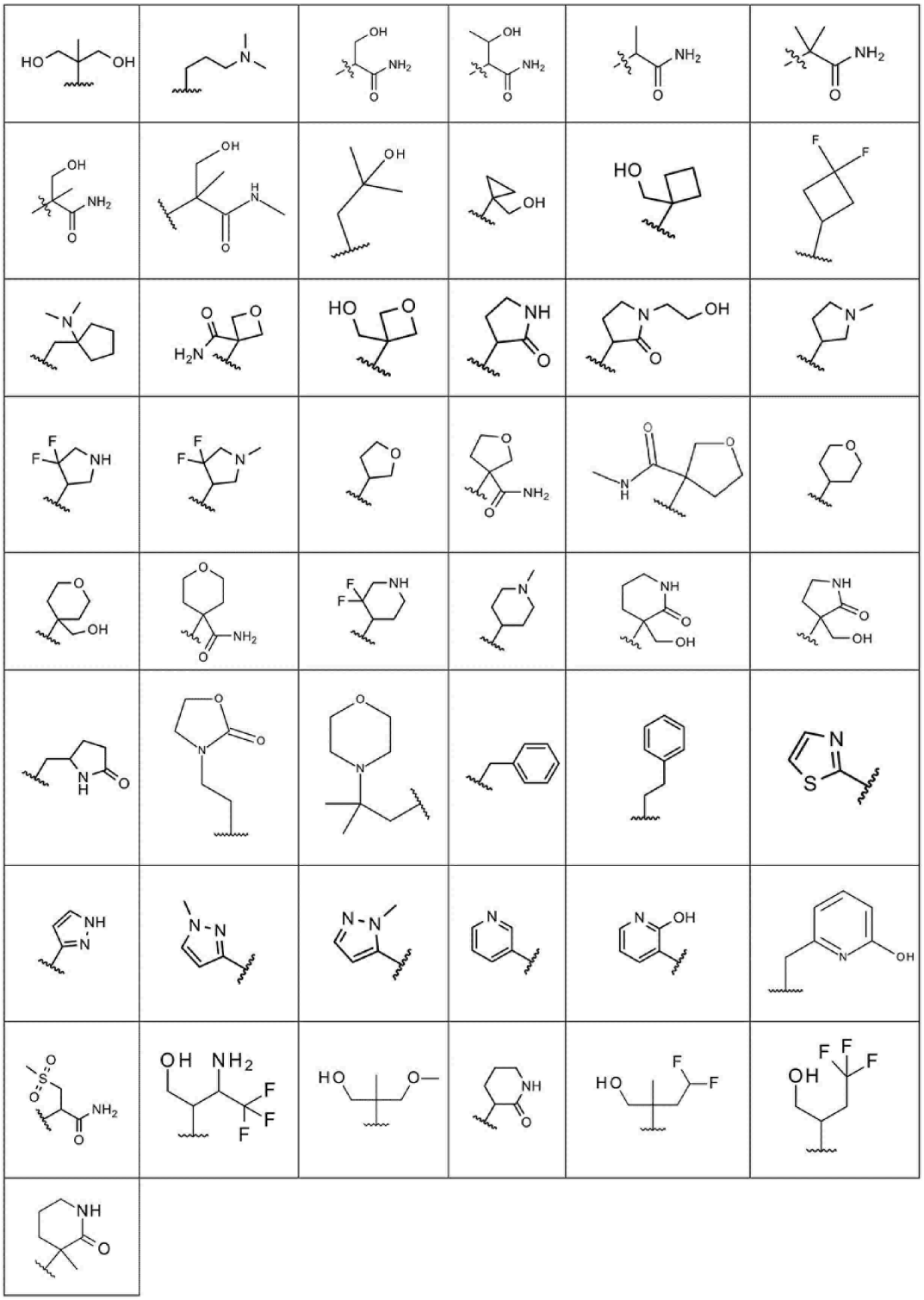
好ましくは、

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

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

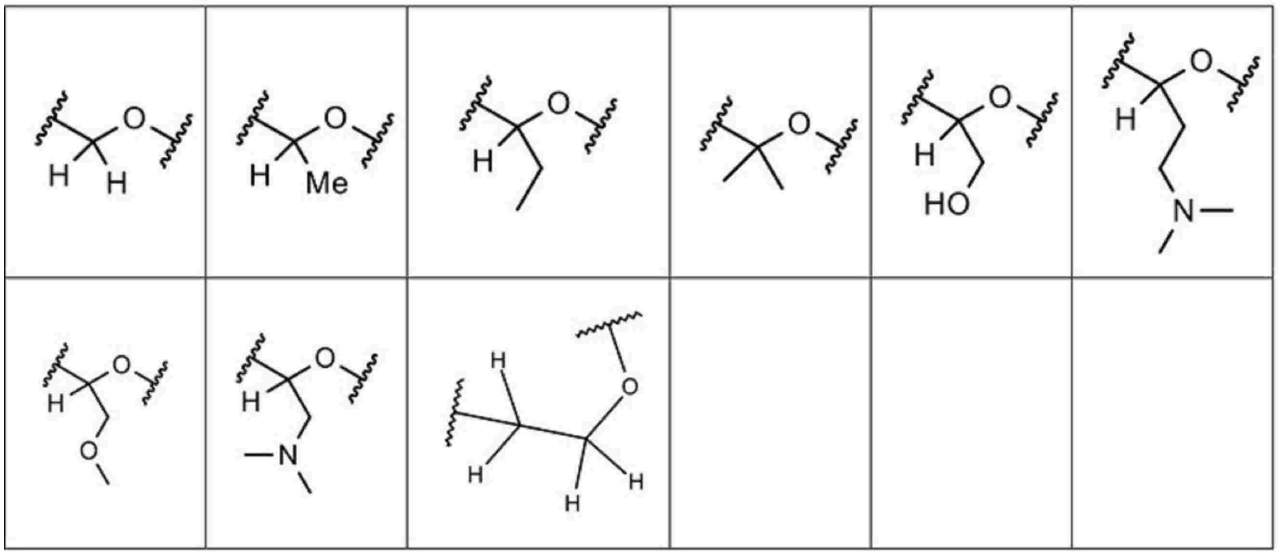
R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}、及びR^{D12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－ＣＨ$_2$ＮＨ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－ＮＨＣＨ$_2$ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、若しくは－ＣＨ$_2$ＣＦ$_3$を表すか、又はR^{D2}及びR^{D3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D4}及びR^{D5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D9}及びR^{D10}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

【００８４】
いくつかの実施形態において、R^4は、一般式（Ａ）、（Ｂ）、（Ｃ）、（Ｄ）による残基、又は本明細書に記載の式－ＣＲ’Ｒ’’－（C_nH_m－ＯＨの残基を表す。
【００８５】
いくつかの実施形態において、R^4は、以下のものからなる群から選択される残基を表す：－CH_3、
【化２０】



【００８６】
いくつかの実施形態において、R^3は、Ｈであり、R^4は、本明細書で先に記載の実施形態のいずれかである。

【００８７】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$は、互いに独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す。
【００８８】
好ましくは、R^5及び$R^{5'}$は、互いに独立して、－Ｈ、－C_1－C_6－アルキル、又は－C_1－C_6－アルキレン－Ｎ（C_1－C_6－アルキル）$_2$を示す。
【００８９】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$のうちの少なくとも１つは、－Ｈではない。
【００９０】
いくつかの実施形態において、R^5及び$R^{5'}$は、両方とも－Ｈである。
【００９１】
好ましい実施形態において、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－（$CR^5R^{5'}$）$_n$を表し、得られる部分－Ｏ－（$CR^5R^{5'}$）$_n$－は、以下のものからなる群から選択される残基を表す：
【化２１】



【００９２】
いくつかの実施形態において、R^5は、－Ｈを表し、$R^{5'}$は、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、及び－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｈ又はC_{1-3}－アルキルからなる群から選択される残基を表

す。
【００９３】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－ヘテロアルキル、を表す。
【００９４】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－C_{1-6}－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－$C_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の、５～１４員ヘテロアリール

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

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

【００９５】

好ましくは、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、
－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、
－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは

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

【００９６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、及び－ＣＦＨ$_2$、好ましくは－Ｈ又は－Ｆからなる群から選択される残基を表す。

【００９７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{6}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【００９８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{6}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－ＣＨ$_3$、好ましくは、－Ｈ、－Ｆ、－ＣＮ、又は－ＣＨ$_3$からなる群から選択される残基を表す。

【００９９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{6}は、－Ｈを表さない。

【０１００】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{7}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【０１０１】

本発明によるベンゾフラン誘導体の好ましい実施形態において、Ｒ^{7}は、－Ｈを表さない。

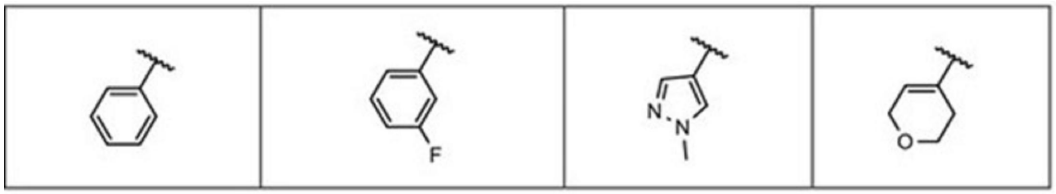
【０１０２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{7}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－ＣＨ$_3$、好ましくは、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、又は－ＣＨ$_3$からなる群から選択される残基を表す。

【０１０３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、又は以下のものからなる群から選択される残基を表す。

【化２２】



【０１０４】

本発明によるベンゾフラン誘導体のいくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【０１０５】

本発明によるベンゾフラン誘導体のいくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈを表さない。

【０１０６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又はＣＨ$_3$、好ましくは、－Ｆからなる群から選択される残基を表す。

【０１０７】

本発明によるベンゾフラン誘導体のいくつかの実施形態において、

（ｉ）Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は各々、－Ｈを表すか、又は

（ｉｉ）Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの２つは、－Ｈを表し、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}のうちの他方は、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_3$を表すか、又は

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

【０１０８】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員シクロアルキル、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１２員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１２員シクロアルキル、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～８員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～８員シクロアルキル、又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは四置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～６員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは四置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは三置換の、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～６員シクロアルキル、

置換基は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－NHC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキ

ル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、からなる群から互いに独立して選択される。

【０１０９】

いくつかの実施形態において、Ｗは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、又は非置換の、一置換若しくは二置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、又は非置換の、一置換若しくは二置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルを表し、好ましくは、Ｗは、各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換のシクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクル［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニルからなる群から選択される、飽和若しくは不飽和の３～１０員シクロアルキル、又は各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルからなる群から選択される飽和若しくは不飽和の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、Ｗは、各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換のシクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、ビシクロ［１．１．１］ペンタン、シス－ビシクロ［３．１．０］ヘキサン、又は各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルからなる群から選択される飽和若しくは非芳香族不飽和の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、Ｗは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル及びｔ－ブチル、ペンチル、ヘキシル－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＣＣｌ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＣｌ$_3$又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表し、好ましくは、Ｗは、各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換のシクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクル［２．２．１］ヘプタン－２

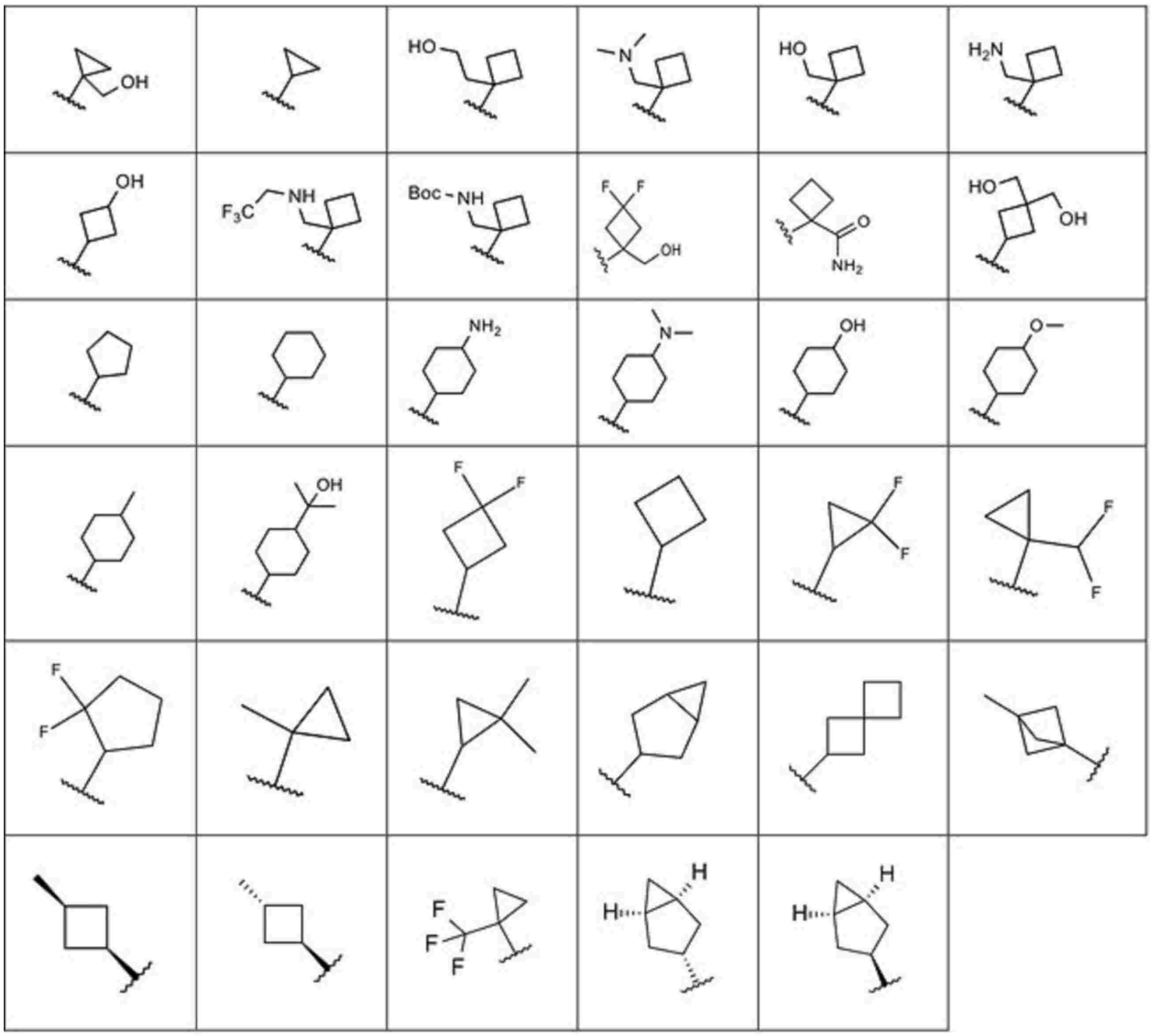
イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニル；メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル；ペンチル、ヘキシル－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－CCl_3、－C_{1-6}－アルキレン－CCl_3、又は－C_{1-6}－アルキレン－CF_3からなる群から選択される飽和若しくは不飽和の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、Ｗは、各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換のシクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクル［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－３－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチル、スピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、３－ビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、ビシクロ［１．１．１］ペンタン、シス－ビシクロ［３．１．０］ヘキサン；メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、及びｔ－ブチル；ペンチル、ヘキシル－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－CCl_3、－C_{1-6}－アルキレン－CCl_3、又は－C_{1-6}－アルキレン－CF_3からなる群から選択される飽和若しくは不飽和の３～１０員シクロアルキルを表す。

【０１１０】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

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

【化２３】



からなる群から選択されるシクロアルキル残基、又は
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す。

【０１１１】

いくつかの実施形態において、「一置換若しくは多置換」という用語は、各場合におい

て、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－

Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ５、－ＳＣＦ３、－ＳＣＦ２Ｈ、－ＳＣＦＨ２、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ１－６－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ１－６－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ２、－ＮＯ、－ＮＯ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１

－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ５、－ＳＣＦ３、－ＳＣＦ２Ｈ、－ＳＣＦＨ２、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ１－６－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ１－６－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ

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

$_{6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$

－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１０員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員シクロアルキル）、３～１０員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－フェニル、５～１０員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（５～１０員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する。

【０１１２】

本発明の好ましい実施形態において、ベンゾフラン誘導体は、以下からなる群から選択される：

化合物００１－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００２－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００３－（２Ｓ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００４－（２Ｓ）－２－｛［２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００５－（２Ｓ）－２－｛［５－（２－シクロプロピルエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００６－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００７－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、

化合物００８－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物００９－（２Ｒ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物０１０－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、

化合物０１１－（２Ｓ，３Ｒ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシブタンアミド、

化合物０１２－（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２－シクロプロピルエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド、

化合物０１３－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、

化合物０１４－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、

化合物０１５－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、

化合物０１６－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１７－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０１８－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０１９－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２０－５－（シクロヘキシルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２１－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２２－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（オキサン－４－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２３－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２４－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２５－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２６－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２７－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピペリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２８－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０２９－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３０－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３１－５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（１－メチルシクロプロピル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３３－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３４－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３５－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３６－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３７－Ｎ－（４－カルバモイルキサン－４－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０３８－（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－

１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０３９－（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物０４０－（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド、
化合物０４１－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０４２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－（２－メチルプロポキシ）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４３－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４４－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４５－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０４６－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０４７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロペンアミド、
化合物０４８－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］プロペンアミド、
化合物０４９－２－（｛５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５０－シス－２－｛［５－（｛ビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル｝メトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５１－トランス－２－｛［５－（｛ビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル｝メトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５２－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（｛３－メチルビシクロ［１．１．１］ペンタン－１－イル｝メトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロペンアミド、
化合物０５３－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５４－２－（｛５－［（３，３－ジフルオロシクロブチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物０５５－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピペリジン－３－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０５６－Ｎ－［（２）－３－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル］－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０５７－５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、

化合物０５８－シス－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（３－メチルシクロブチル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）プロペンアミド、
化合物０５９－トランス－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（３－メチルシクロブチル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）プロペンアミド、
化合物０６０－Ｎ－（１－ヒドロキシ－３－メトキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０６１－２－メチル－Ｎ－（３－メチル－２－オキソピペリジン－３－イル）－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド、
化合物０６２－２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
及びそれらの生理学的に許容される塩。

【０１１３】

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

【０１１４】

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

【０１１５】

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

【０１１６】

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

【０１１７】

本発明の好ましい実施形態において、ベンゾフラン誘導体は、上述の化合物００１～化合物０４４と、それらの生理学的に許容される塩と、からなる群から選択される。本発明の好ましい実施形態において、ベンゾフラン誘導体は、上述の化合物００１～化合物０６２と、それらの生理学的に許容される塩と、からなる群から選択される。

【０１１８】

本発明の別の態様は、上記の本発明によるベンゾフラン誘導体を含む薬学的組成物又は医薬に関する。

【０１１９】

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

【０１２０】
本発明の好ましい実施形態において、本発明のベンゾフラン誘導体は、治療のために投与される唯一の薬理学的に活性な化合物である。本発明の別の好ましい実施形態において、本発明のベンゾフラン誘導体は、ＴＲＰＭ３媒介性障害の治療又は予防のために他の治療剤と組み合わせて使用され得る。したがって、本発明はまた、
－本明細書の式及び実施形態のうちの１つ以上の化合物、及び
－ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のために、同時、別個又は連続的使用のための複合調製物の形態で生物学的に活性な薬剤として使用される１つ以上の更なる治療剤又は予防剤、を含む組成物の使用に関する。
【０１２１】
本発明による薬学的組成物又は複合調製物は、企図される使用及び調製物の期待される効果に応じて、広い含有量範囲にわたって本発明のベンゾフラン誘導体を含有し得る。一般に、複合調製物の本発明のベンゾフラン誘導体の含有量は、０．１～９９．９重量％、好ましくは１～９９重量％、より好ましくは５～９５重量％の範囲内である。
【０１２２】
いくつかの活性成分が組み合わせて使用される場合、それらが治療される哺乳動物において必ずしも同時にそれらの関節治療効果を直接発揮するとは限らないという事実を考慮して、対応する組成物はまた、別個であるが、隣接する保管庫又は区画内の２つの成分を含有する医療キット又はパッケージの形態であり得る。したがって、後者の文脈では、各活性成分は、他の成分の投与経路とは異なる投与経路に好適な方法で製剤化され得、例えば、それらのうちの一方は、経口又は非経口製剤の形態であり得るのに対して、他方は、静脈内注射用のアンプル又はエアロゾルの形態であり得る。
【０１２３】
当業者はまた、本発明のベンゾフラン誘導体が、とりわけそれらの環境のｐＨに応じて、多くの異なるプロトン化状態で存在し得ることを認識するであろう。本明細書に提供される構造式は、いくつかの可能なプロトン化状態のうちの１つのみの化合物を示すが、これらの構造は、例示的なものであり、本発明は、任意の特定のプロトン化状態に限定されず、化合物の任意の及び全てのプロトン化形態は、本発明の範囲内に入ることが意図されることが理解されるであろう。
【０１２４】
本明細書で使用される「薬学的に許容される塩」という用語は、本明細書の式の化合物が形成することができる治療活性の非毒性塩形態を意味する。したがって、本発明の化合物は、任意に、本明細書の化合物の塩、特に、例えば、Na^+、Li^+、K^+、Ca^{2+}、及びMg^{2+}を含有する薬学的に許容される非毒性塩を含む。かかる塩は、適切なカチオン、例えば、アルカリ及びアルカリ土類金属イオン、又はアンモニウム及び四級アミノイオンと、酸性アニオン部分、典型的にはカルボン酸との組み合わせによって誘導されるものを含み得る。本発明のベンゾフラン誘導体は、複数の正電荷又は負電荷を有し得る。本発明のベンゾフラン誘導体の正味電荷は、正又は負のいずれかであり得る。任意の関連する対イオンは、典型的には、化合物が得られる合成方法及び／又は単離方法によって決定される。典型的な対イオンには、アンモニウム、ナトリウム、カリウム、リチウム、ハロゲン化物、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩など、及びそれらの混合物が含まれるが、これらに限定されない。任意の関連する対イオンの同一性は、本発明の重要な特徴ではなく、本発明は、任意のタイプの対イオンと会合する化合物を包含することが理解されるであろう。更に、化合物は、様々な異なる形態で存在し得るため、本発明は、対イオンと会合する化合物の形態（例えば、乾燥塩）だけでなく、対イオンと会合しない形態（例えば、水溶液又は有機溶液）も包含することが意図される。金属塩は、典型的には、金属水酸化物を本発明の化合物と反応させることによって調製される。このような方法で調製される金属塩の例は、Li^+、Na^+、及びK^+を含有する塩である。より可溶性の低い金属塩は、好適な金属化合物の添加によって、より可溶性の高い塩の溶液から沈殿し得る。加えて、塩は、塩基の中心、典型的にはアミン、又は酸性基へのある特定の有機酸及び無機酸の

酸付加から形成され得る。かかる適切な酸の例としては、例えば、ヒドロハロゲン酸、例えば、塩酸若しくは臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸などの無機酸、又は例えば、酢酸、プロパン酸、ヒドロキシ酢酸、２－ヒドロキシプロパン酸、２－オキソプロパン酸、乳酸、ピルビン酸、シュウ酸（すなわち、エタンジオ酸）、マロン酸、コハク酸（すなわち、ブタンジオ酸）、マレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、シクロヘキサンスルファミン酸、サリチル（すなわち、２－ヒドロキシベンゾ）酸、ｐ－アミノサリチル酸などの有機酸が挙げられる。更に、この用語はまた、本明細書の式の化合物並びにそれらの塩が形成することができる溶媒和物、例えば、水和物、アルコラートなども含む。最後に、本明細書の組成物は、それらの非イオン化された本発明のベンゾフラン誘導体、並びに両性イオン形態、及び水和物の場合には化学量論量の水との組み合わせを含むことを理解されたい。

【０１２５】

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

【０１２６】

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

【０１２７】

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

【０１２８】

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

はＳ配座のいずれかを有してもよく、複数の結合は、シス配座又はトランス配座のいずれかを有してもよい。

【０１２９】

当該化合物の純粋な異性体形態は、同じ塩基性分子構造の他のエナンチオマー又はジアステレオマー形態を実質的に含まない異性体として定義される。具体的には、「立体異性的に純粋な」又は「キラル純粋な」という用語は、少なくとも約８０％（すなわち、１つの異性体の少なくとも９０％、及び他の可能な異性体の最大１０％）、好ましくは少なくとも９０％、より好ましくは少なくとも９４％、及び最も好ましくは少なくとも９７％の立体異性体過剰を有する化合物に関する。「鏡像異性的に純粋な」及び「ジアステレオ選択的に純粋な」という用語は、問題の混合物の鏡像異性体過剰、それぞれジアステレオマー過剰を考慮して、同様の方法で理解されるべきである。

【０１３０】

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

al Liquid Chromatography”（１９８９）W．J．Lough，Ed．Chapman and Hall，New York、Okamoto，（１９９０）“Optical resolution of dihydropyridine enantiomers by High－performance liquid chromatography using phenylcarbamates of polysaccharides as a chiral stationary phase”，J．of Chromatogr．５１３：３７５－３７８）。

【０１３１】

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

【０１３２】

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

【０１３３】

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

【０１３４】

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

【０１３５】

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

【０１３６】

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

【０１３７】

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

る。

【０１３８】

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

【０１３９】

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

【０１４０】

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

【０１４１】

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

【０１４２】

錠剤は、任意に１種以上の副成分とともに、圧縮又は成形によって製造することができる。圧縮錠剤は、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、保存剤、表面活性剤、又は分散剤と任意に混合された、粉末又は顆粒などの自由流動形態で、活性成分を、好適な機械において圧縮することによって調製され得る。成形錠剤は、不活性液体希釈剤で湿らせた粉末化合物の混合物を好適な機械で成形することにより作製することができる。錠剤は、任意に、コーティング又はスコアリングされ得、その中に、活性成分の徐放又は制御放出を提供するように製剤化され得る。眼又は他の外部組織、例えば、口及び皮膚の感染症の場合、製剤は、例えば、０．０７５～２０ｗ／ｗ％（０．６ｗ／ｗ％、０．７ｗ／ｗ％などの０．１ｗ／ｗ％の増分で０．１％～２０％の範囲の活性成分（複数可）を含む）、好ましくは

０．２～１５ｗ／ｗ％、最も好ましくは０．５～１０ｗ／ｗ％の量で、活性成分（複数可）を含有する局所軟膏又はクリームとして、任意に適用される。軟膏に製剤化される場合、活性成分は、パラフィン系又は水混和性軟膏基剤のいずれかとともに使用され得る。代替的に、活性成分は、水中油性クリーム基剤を有するクリーム中で製剤化され得る。所望される場合、クリーム基剤の水相は、例えば、少なくとも３０ｗ／ｗ％の多価アルコール、すなわち、プロピレングリコール、ブタン１，３－ジオール、マンニトール、ソルビトール、グリセロール、及びポリエチレングリコール（ＰＥＧ４００を含む）などの２つ以上のヒドロキシル基を有するアルコール、及びこれらの混合物を含み得る。局所製剤は、皮膚又は他の患部を通る活性成分の吸収又は浸透を増強する化合物を含むことが望ましい場合がある。そのような皮膚浸透増強剤の例としては、ジメチルスルホキシド及び関連する類似体が挙げられる。

【０１４３】

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

【０１４４】

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

【０１４５】

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

【０１４６】

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

【０１４７】
膣投与に好適な製剤は、活性成分に加えて、適切であることが当該技術分野で知られているような担体を含有するペッサリー、タンポン、クリーム、ゲル、ペースト、フォーム、又はスプレー製剤として提示され得る。
【０１４８】
非経口投与に好適な製剤には、酸化防止剤、緩衝剤、静菌剤、及び意図するレシピエントの血液と等張性にする溶質を含有し得る水性及び非水性の滅菌注射液、並びに懸濁剤及び増粘剤を含み得る水性及び非水性の滅菌懸濁液が挙げられる。製剤は、単位用量又は複数用量の容器（例えば、密封されたアンプル及びバイアル）で提示され得、使用直前に滅菌液体担体（例えば、水）の添加のみを必要とするフリーズドライ（すなわち、凍結乾燥）状態で保存され得る。即時注射溶液及び懸濁液は、前述の種類の滅菌粉末、顆粒及び錠剤から調製され得る。
【０１４９】
好ましい単位用量製剤は、本明細書に記載されているように、活性成分の１日用量若しくは１日単位サブ用量、又はその適切な画分を含有するものである。
【０１５０】
特に上述の成分に加えて、本発明の製剤は、問題の製剤の種類を考慮して当該技術分野の従来の他の薬剤を含み得ること（例えば、経口投与に好適なものが香味剤を含み得ること）を理解されたい。
【０１５１】
本発明のベンゾフラン誘導体を使用して、活性成分として本発明の１つ以上のベンゾフラン誘導体を含有する制御放出薬学的製剤（「制御放出製剤」）を提供することができ、活性成分の放出は、より少ない頻度の投与を可能にするか、又は所与の本発明の化合物の薬物動態又は毒性プロファイルを改善するように制御及び調節され得る。別個の単位が本発明の１つ以上のベンゾフラン誘導体を含む経口投与に適合された制御放出製剤が、従来の方法に従って調製され得る。
【０１５２】
本発明の別の実施形態は、本発明のベンゾフラン誘導体の様々な前駆体又は「プロドラッグ」形態に関する。本発明のベンゾフラン誘導体を、それ自体が有意に生物活性ではないが、動物、哺乳動物、又はヒトに送達されるときに、体の正常な機能によって触媒される化学反応、とりわけ、胃又は血清中に存在する酵素によって触媒される化学反応を受ける化学種の形態で製剤化することが望ましくあり得、当該化学反応は、本明細書に定義される化合物を放出する効果を有する。したがって、「プロドラッグ」という用語は、インビボで活性薬学的成分に変換されるこれらの種に関する。
【０１５３】
本発明のベンゾフラン誘導体のプロドラッグは、製剤化剤に好適な任意の形態を有し得、例えば、エステルは、非限定的な一般的なプロドラッグ形態である。しかしながら、この場合において、プロドラッグは、必然的に、標的遺伝子座に存在する酵素の作用により共有結合が切断される形態で存在し得る。例えば、Ｃ－Ｃ共有結合は、当該標的遺伝子座における１つ以上の酵素によって選択的に切断され得、したがって、容易に加水分解可能な前駆体、とりわけ、エステル、アミドなど以外の形態のプロドラッグが使用され得る。プロドラッグ中の活性薬学的成分の対応物は、当該技術分野で知られているアミノ酸又はペプチド構造、アルキル鎖、糖部分などの異なる構造を有することができる。
【０１５４】
本発明の目的のために、「治療的に好適なプロドラッグ」という用語は、「単一又は複数の生物学的変換によって、プロドラッグが投与された動物、哺乳動物、又はヒトの組織と接触した際に、過度の毒性、刺激、又はアレルギー反応なしに、インビボで治療活性形態に変換されるように修飾され、意図された治療成果を達成する化合物」として本明細書で定義される。
【０１５５】

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

【０１５６】

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

【実施例】

【０１５７】

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

【０１５８】

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

【０１５９】

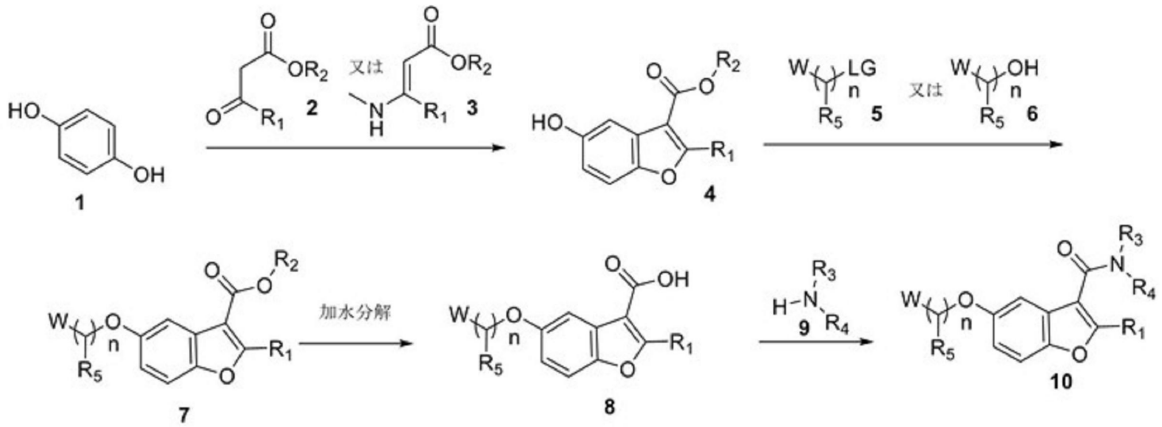
本明細書において、特にスキーム及び実施例において使用される略語は、以下の通りである。ＡＢＣ－重炭酸アンモニウムの水溶液、ＡＣＮ－アセトニトリル、ＡｃＯＨ－酢酸、ＡＤＤＰ－１，１’－（アゾジカルボニル）ジピペリジド、ａｑ．－水性、ＡＩＢＮ－アゾビスイソブチロニトリル、ＣＡＮ－硝酸セリウムアンモニウム、ＣＯＭＵ－（１－シアノ－２－エトキシ－２－オキソエチリデンアミノオキシ）ジメチルアミノ－モルホリノ－カルベニウム、ヘキサフルオロホスフェート、ＤＡＢＣＯ－１，４－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン、ＤＡＳＴ－ジエチルアミノサルファートリフルオリド、ＤＢＵ－１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン、ＤＣＣ－Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミド、ＤＣＭ－ジクロロメタン、ＤＥＡＤ－ジエチルアゾジカルボキシレート、ＤＩＡ－ジアステレオマー、ＤＩＡＤ－アゾジカルボン酸ジイソプロピル、ＤＥＡ－ジエチルアミン、ＤＩＰＥＡ－ジイソプロピル－エチルアミン、ＤＭＥ－１，２－ジメトキシエタン、ＤＭＦ－Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ＤＭＳＯ－ジメチルスルホキシド、ＤＴＢＡＤ－ｔｅｒｔ－ブチルアゾジカルボキシレート、ＥＤＣＩ又はＥＤＣ－１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド、Ｅｎ－エナンチオマー、Et_2O－ジエチルエーテル、ＥｔＯＨ－エタノール、ＥｔＯＡｃ－酢酸エチル、Ｅｑ．－当量、ＦＡ－ギ酸、ＦＣＣ－フラッシュカラムクロマトグラフィー、ｈ－時間、ＨＡＴＵ－Ｏ－（７－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、ＨＰＬＣ－高性能液体クロマトグラフィー、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＬＡＨ－水素化アルミニウムリチウム、ＬＧ－離脱基、ＭｅＯＨ－メタノール、$MgSO_4$－硫酸マグネシウム、ｍｉｎ．－分、Na_2SO_4－硫酸ナトリウム、ＮＢＳ－Ｎ－ブロモスクシンイミド、ＮＭＰ－１－メチル－２－ピロリジノン、$Pd(PPh_3)_4$－テトラキス－（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）、$Pd_2(dba)_3$－トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム、Ｐｅｔエーテル－石油エーテル、ＰＰｈ３－トリフェニルホスフィン、ＰＳ－ＤＩＥＡ－

ポリスチレン担持ジイソプロピル－エチルアミン、ＰＳ－ＰＰｈ３－ポリスチレン担持トリフェニルホスフィン、ＰｙＢｏｐ－ベンゾトリアゾール－１－イル－オキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ＰＴＳＡ－ｐ－トルエンスルホン酸、ＲＦ：フロンティア比、ＲＭ－反応混合物、ＲＰ－逆相、ＲＴ－室温、ｓａｔ．－飽和、ＳＥＭ－［２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチルアセタール、ＳＦＣ－超臨界流体クロマトグラフィー、ＳＰＥ－固相抽出、ＴＢＤＭＳ－Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル、ＴＢＡＦ－フッ化テトラブチルアンモニウム、ＴＢＡＩ－ヨウ化テトラブチルアンモニウム、ＴＥＡ－トリエチルアミン、ＴＨＦ－テトラヒドロフラン、ＴＦＡ－トリフルオロ酢酸、ＴＬＣ－薄膜クロマトグラフィー、ＴＰＰ－トリフェニルホスフィン、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＴＭＳ－トリメチルシリル、Ｔ３Ｐ－プロピルホスホン酸無水物。

【０１６０】

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

【化２４】



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

【０１６１】

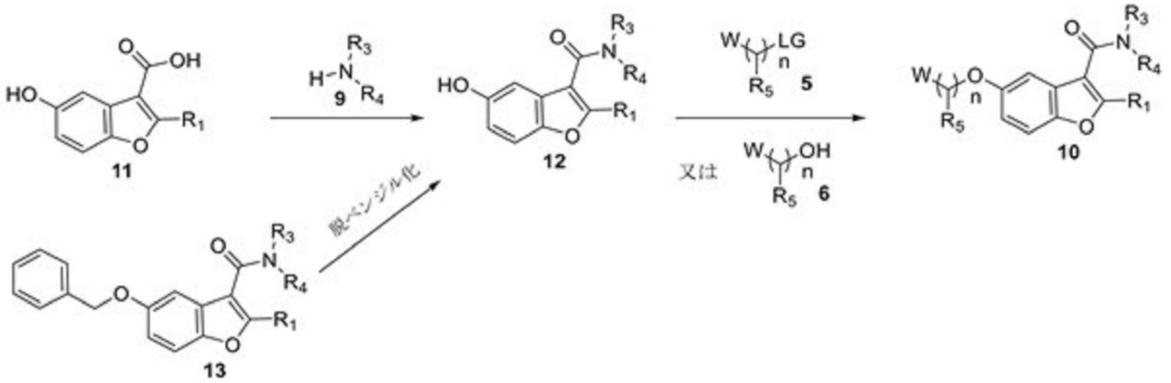
式１のパラ－ベンゾキノンは、式２のケトエステル（市販されているか、又は当業者に既知の手順によって合成されている）（式中、R_2は、０～１００℃の温度範囲で、極性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＭｅＯＨ、ＥｔＯＨなど）中のルイス酸（例えば、塩化チタン（ＩＶ）、塩化亜鉛（ＩＩ）など）の存在下で、エステル保護基（例えば、メチル、エチル、ｔ－Ｂｕなど）である）と縮合され、式４の中間体を得ることができる。より詳細な情報は、以下の参考文献（Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２０１２，２０，４２３７－４２４４及びＦＲ１３１９５９４）に見出され得る。代替的に、式１のパラ－ベンゾキノンは、０～１００℃の範囲の温度で、極性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＭｅＯＨ、ＥｔＯＨなど）中のプロトン酸（例えば、トリフルオロ酢酸、パラ－トルエンスルホン酸など）の存在下で、式３のエナミン（市販されているか、又は当業者に既知の手順によって合成される）と反応させて、式４の中間体を得ることができる。より詳細な情報は、以下の参考文献（Ｊ．Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ　Ｃｈｅｍ．２００６，４３，８７３）に見出され得る。次いで、式４の中間体は、式５の中間体（市販されているか、又は合成されている）を使用して、求核置換を介して、０～１００℃の温度範囲で、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）の有無にかかわらず、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中の基剤（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下で、式７の所望の化合物（式中、ＬＧは、離脱基である）に変換させることができる。代替的に、式４の中間体はまた、０～１００℃の温度範囲で、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中のアゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下

で、式６の中間体（市販されているか、又は合成されている）と反応させて、式７の所望の化合物を得ることもできる。次いで、エステル誘導体７は、標準的な鹸化反応によって式８の所望の化合物に変換され得る。式１０の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中の標準的なペプチド結合条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で、式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）による反応によって、式８の酸誘導体から得ることができる。代替的に、式８のカルボン酸誘導体は、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、酸塩化物誘導体に変換され、次いで、式９のアミンと反応させて、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載されるように、式１０の所望の化合物を得ることができる。

【０１６２】

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

【化２５】



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

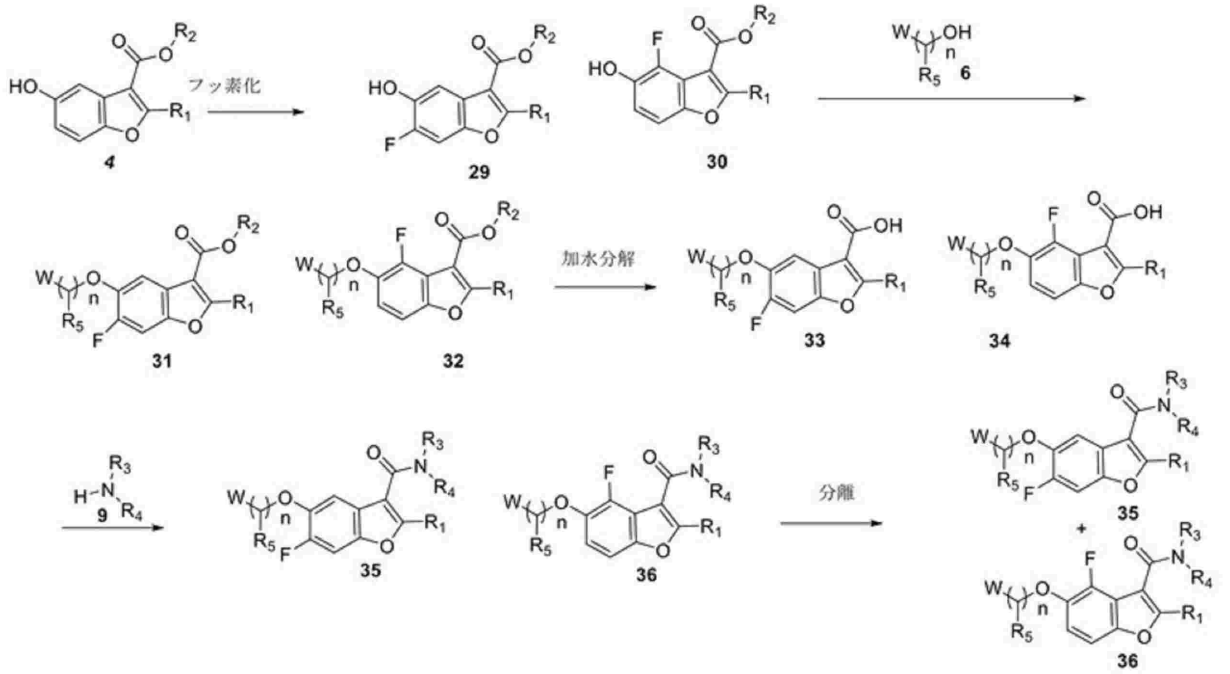
【０１６３】

５－ヒドロキシ－ベンゾフラン－３－カルボン酸誘導体１１（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中の標準的なペプチド結合条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で、式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）と反応させて、式１２の中間体を得ることができる。代替的に、式１３の化合物（スキーム１に記載されるように合成されている）は、溶媒（例えば、ＴＨＦ、ＥｔＯＨなど）中の触媒（より好ましくはＰｄ又はＰｔ）を使用して、還元剤（例えば、水素ガス、ギ酸アンモニウム、シクロヘキサジエンなど）との水素化反応により、式１２の中間体に変換することができる。次いで、式１２の中間体は、式５の中間体（市販されているか、又は合成されている）を使用して、求核置換を介して、０～１００℃の温度範囲で、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）の有無にかかわらず、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中の基剤（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下で、式１０の所望の化合物（式中、ＬＧは、離脱基である）に変換させることができる。代替的に、式１２の化合物はまた、０～１００℃の温度範囲で、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中のアゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＡＤＤＰ、ＤＩＡＤ、ｔｅｒｔ－ブチルアゾジカルボキシレートなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下で、式６の中間体（市販されているか、又は合成されている）と反応させて、式１０の所望の化合物を得ることもできる。

【０１６４】

より特定の実施形態において、本発明の化合物は、スキーム３に示されるように、合成することができる。

【化２６】



スキーム３：全てのW、Ｒ１、Ｒ３、Ｒ４、及びＲ５は、本発明の化合物について記載される通りである。

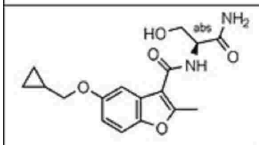
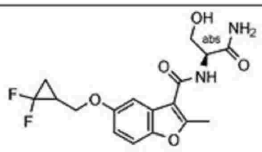
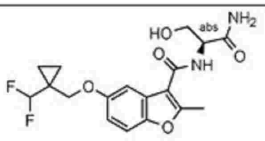
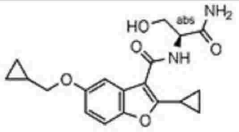
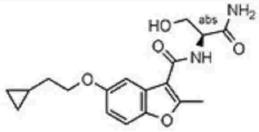
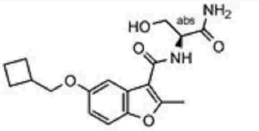
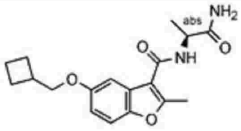
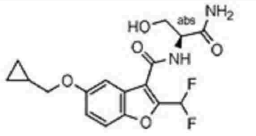
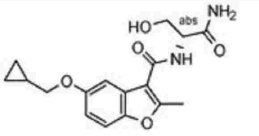
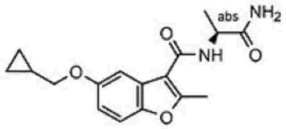
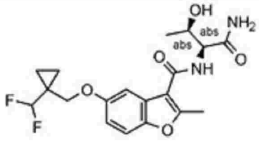
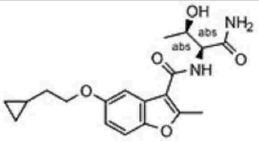
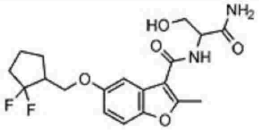
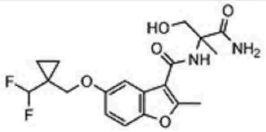
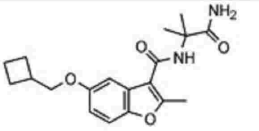
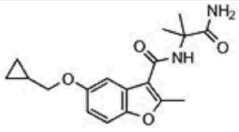
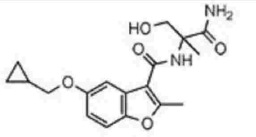
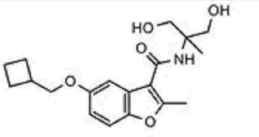
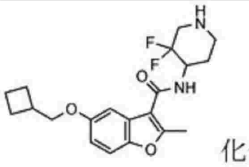
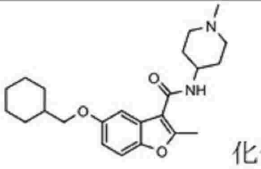
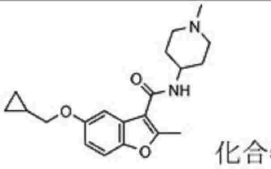
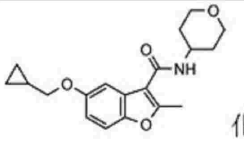
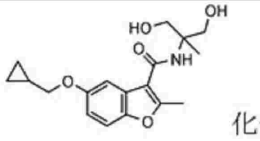
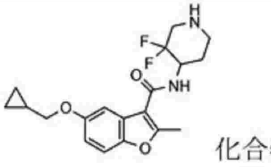
【０１６５】

式４の中間体は、溶媒（例えば、クロロホルム、水など）中の好適なハロゲン化剤（例えば、臭素、Ｎ－ブロモスクシンイミドなど）でハロゲン化して、所望の中間体２３を得ることができる。式２６の所望の化合物は、ＣｕＣＮによるＵｌｌｍａｎｎ型反応、続いて式６の中間体によるＭｉｔｓｕｎｏｂｕ型反応（市販されているか、又は合成されている）によって得ることができる。代替的に、式２６の所望の化合物は、式６の中間体（市販されているか、又は合成されている）によるＭｉｔｓｕｎｏｂｕ型反応、続いてＳｕｚｕｋｉ反応によって得ることができる。次いで、エステル誘導体２６は、標準的な鹸化反応によって式２７の所望の化合物に変換され得る。式２８の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中の標準的なペプチド結合条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で、式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）による反応によって、式２７の酸誘導体から得ることができる。

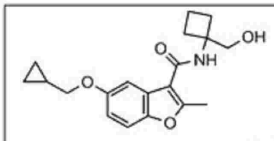
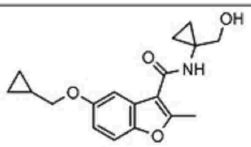
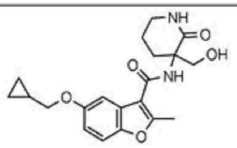
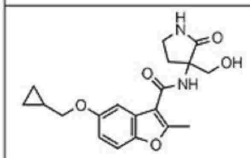
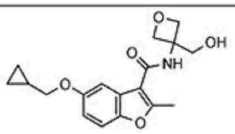
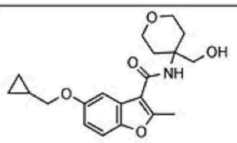
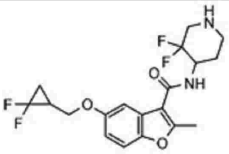
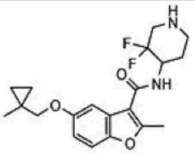
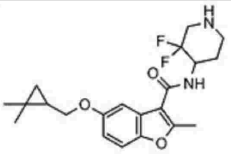
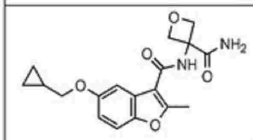
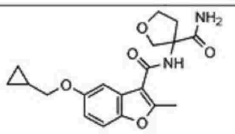
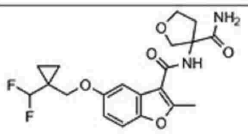
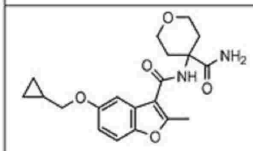
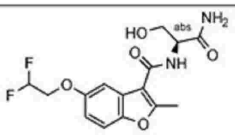
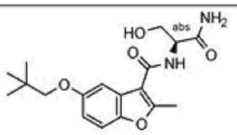
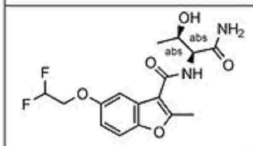
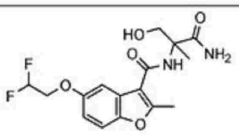
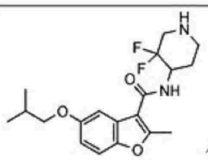
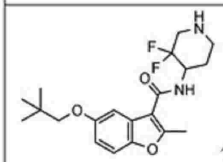
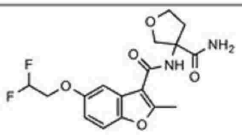
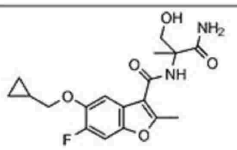
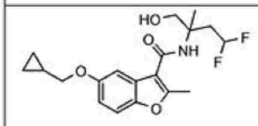
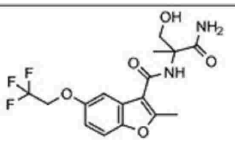
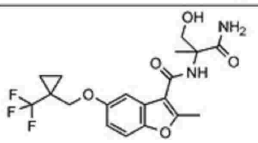
【０１６６】

実施例

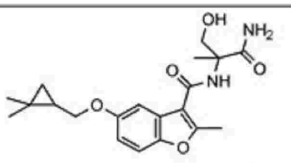
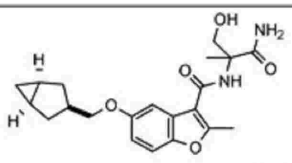
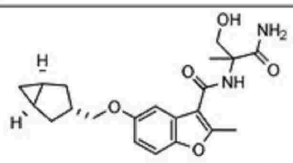
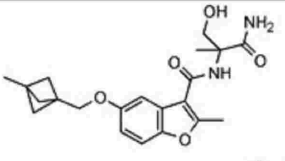
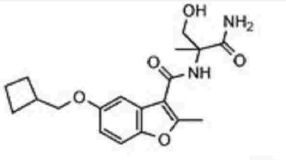
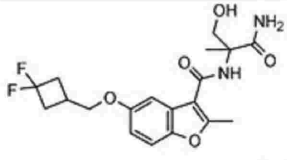
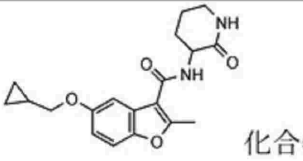
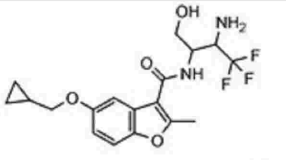
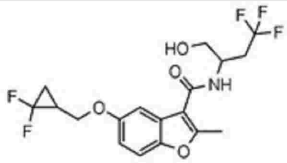
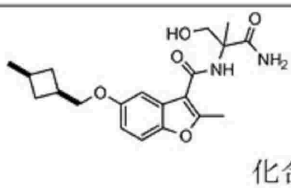
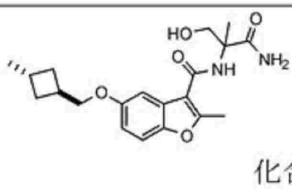
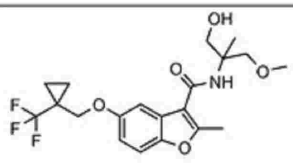
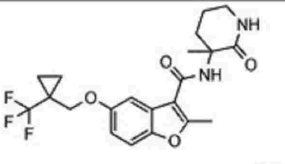
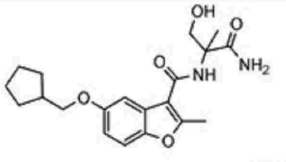
【表１－１】

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

【表１－２】

 化合物 025	 化合物 026	 化合物 027
 化合物 028	 化合物 029	 化合物 030
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036
 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042
 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045
 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048

【表１－３】

 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051
 化合物 052	 化合物 053	 化合物 054
 化合物 055	 化合物 056	 化合物 057
 化合物 058	 化合物 059	 化合物 060
 化合物 061	 化合物 062	

【０１６７】

上記の実施例は、本発明を例示する目的で提供され、決して本発明の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。

【０１６８】

パートＡは、化合物の調製を表し、パートＢは、薬理学的実施例を表す。

【０１６９】

パートＡ

明示的に記載されていない全ての出発物質は、市販されている（例えば、ＡＢＣＲ、Ａｐｏｌｌｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ Ｃｏｍｂｉ－Ｂｌｏｃｋｓ、Ｅｎａｍｉｎｅ、ＦｌｕｏｒｏＣｈｅｍ、ＭａｔｒｉｘＳｃｉｅｎｔｉｆｉｃ、Ｍａｙｂｒｉｄｇｅ、Ｍｅｒｃｋ、ＴＣＩなどの供給業者の詳細は、例えば、ＳｃｉＦｉｎｄｅｒ（登録商標）データベースに見出され得る）、又はそれらの合成は、既に専門文献に正確に記載されている（例えば、実験ガイドラインは、それぞれ、Ｒｅａｘｙｓ（登録商標）データベース又はＳｃｉＦｉｎｄｅｒ（登録商標）データベースに見出され得る）、又は当業者に既知の従来の方法を使用して調製され得る。

【０１７０】

反応は、必要に応じて、不活性雰囲気（主にアルゴン及びN_2）下で行われた。試薬の当量の数、使用される溶媒の量、並びに反応温度及び時間は、類似の方法によって実行される異なる反応の間でわずかに変わり得る。加工方法及び精製方法は、各化合物の特徴的な特性に従って適合させ、類似の方法のためにわずかに変わり得る。調製された化合物の収率は、最適化されていない。

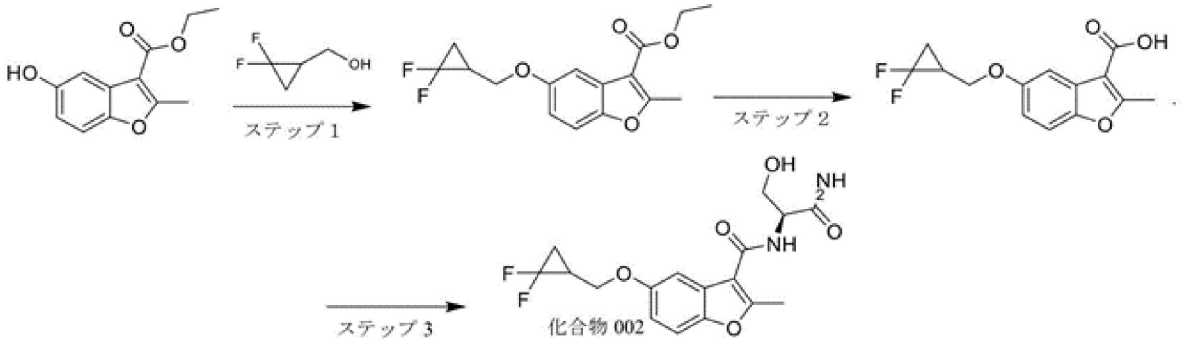
【０１７１】
「当量」（「ｅｑ．」又は「ｅｑ」又は「ｅｑｕｉｖ．」）という表示は、モル当量を意味し、「ＲＴ」又は「ｒｔ」は、室温Ｔ（２３±７℃）を意味し、「Ｍ」は、ｍｏｌ／ｌにおける濃度の表示であり、「ｓｏｌ．」は、溶液を意味し、「ｃｏｎｃ．」は、濃度を意味する。溶媒の混合比は、通常、体積／体積比で表される。
【０１７２】
主要な分析的特徴付けは、全ての例示的な化合物及び選択された中間生成物について、^{1}Ｈ－ＮＭＲ分光法及び／又は質量分析（ＭＳ、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$及び／又は［Ｍ－Ｈ］$^{-}$におけるｍ／ｚ）によって実施された。ある特定の場合において、例えば、位置異性体及び／又はジアステレオマーが形成され得る場合において、例えば、^{13}Ｃ　ＮＭＲ及びＮＯＥ（核オーバーハウザー効果）ＮＭＲ実験などの追加の分析が、いくつかの場合において行われた。
【０１７３】
使用された分析機器は、例えば、ＮＭＲ分析のために、ＢＲＵＫＥＲ　４００ＭＨｚ又はＢＲＵＫＥＲ　５００ＭＨｚ機械（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｔｏｐｓｐｉｎ）であり、代替的に、ＢＲＵＫＥＲ　ＡＶＡＮＣＥ　３００ＭＨｚ及び４００Ｍｈｚを使用した。ＬＣ／ＭＳ分析のために、例えば、Ａｇｉｌｅｎｔ　１２９０　ｉｎｆｉｎｉｔｙ，Ｍａｓｓ：６１５０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）又はＡｇｉｌｅｎｔ　１２００　ＳＥＲＩＥＳ，Ｍａｓｓ：６１３０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）を用いた。分析用ＨＰＬＣは、例えば、Ｗａｔｅｒｓ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｅｍｐｏｗｅｒ）、Ａｇｉｌｅｎｔ－１２００－ＥＬＳＤ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）、又はＡｇｉｌｅｎｔ－１２６０（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　ＯｐｅｎＬＡＢ）で測定した。分析的ＳＦＣを、例えば、ＰＩＣ溶液（Ｓｏｆｔｗａｒｅ：ＳＦＣ　ＰＩＣＬＡＢ　ＯＮＬＩＮＥ）、ＷＡＴＥＲＳ－Ｘ５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　ＭＡＳＳＬＹＮＸ）、又はＷＡＴＥＲＳ－ＵＰＣ２（Ｅｍｐｏｗｅｒ）で実施した。
【０１７４】
分取ＨＰＬＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ　２９９８（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｅｍｐｏｗｅｒ）又はＹＭＣ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｋ－Ｐｒｅｐ）で実施した。分取ＳＦＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－２００（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｒｏｍｓｃｏｐｅ若しくはＳｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－８０（Ｓｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、又はＰＩＣ、ＰＩＣ－１７５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｓ１０－１００）で実施した。
【０１７５】
立体中心を含む例示的な化合物の構造は、既知の場合、絶対立体化学で描き表され、命名される。未知の絶対立体化学の場合、化合物は、ラセミ、ジアステレオマーの混合物、未知の立体化学の純粋なジアステレオマー、又は未知の立体化学の純粋なエナンチオマーのいずれかであり得る。Ｄｉａ１及びＤｉａ２は、ジアステレオソマーが分離されたが、立体化学が不明であることを意味する。Ｅｎ１及びＥｎ２は、両方のエナンチオマーが分離されたが、絶対配置が不明であることを意味する。化合物の化学名が正確な立体化学を特定しない限り、化合物コードの後に接尾辞が付されていない場合は、それぞれ、立体中心を含む化合物がラセミ混合物又はジアステレオマーの混合物として得られたことを意味する
【０１７６】
実験部分で言及したＬＣ／ＭＳ分析は、ＥＳＩモードの質量分析計Ｗａｔｅｒｓ　３１００質量検出器に接続されたＡｌｌｉａｎｃｅ　Ｗａｔｅｒｓ　ＨＰＬＣ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計ｍａｓｓ　ＳＱＤ　２検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計ｍａｓｓ　Ｘｅｖｏ　ＴＱＳ検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で実施した。Ｃｏｌｕｍｎ　Ａｃｑｕｉｔｙ　ＢＥＨ（５０ｍｍ×２．１ｍｍ）１．７μｍを、水中の０．０５％ギ酸又は水中の０．０５％ＴＦＡの移動相Ａ、及びＭｅＣＮ中の０．０５％ギ酸又はＭｅＣＮ中の０．０５％ＴＦＡ

の移動相Ｂとともに使用した。又は、カラムＸｂｒｉｄｇｅ　Ｃ１８（７５ｍｍ×４．６ｍｍ）３．５μｍを、水中の５ｍＭの重炭酸アンモニウムの移動相Ａ及びＭｅＣＮの移動相Ｂとともに使用した。

【０１７７】

（２Ｓ）－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００２）の合成。

【化２７】



ステップ１：ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（５００ｍｇ、２．３ｍｍｏｌ）及び（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メタノール（３４３ｍｇ、３．２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＡＤＤＰ（８０１ｍｇ、３．２ｍｍｏｌ）、続いて、Bu_3P（０．７ｍＬ、３．１８１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×８０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（４０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、粗物を与えた。粗物を、溶離液としてＰｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを使用するＧｒａｃｅフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、エチル５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２００ｍｇ）を無色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル；ＲＦ：０．７４。

【０１７８】

ステップ２：ＭｅＯＨ及びＴＨＦ（１：１、４０ｍＬ）中のエチル５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．０ｇ、３．３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２Ｎの水性ＮａＯＨ（４ｍＬ）を０℃で添加した。ＲＭを３時間還流した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、１ＮのＨＣｌでｐＨ約２に酸性化し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（１．０ｇ）をオフホワイト色の固体として得た。粗物を更に精製することなく次のステップで直接的に使用した。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の８０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２８。

【０１７９】

ステップ３：ＤＣＭ（３０ｍＬ）中の５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（５００ｍｇ、１．８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＣＭ中の、ＤＩＰＥＡ（１．２ｍＬ、７．１ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（９４３ｍｇ、２．５ｍｍｏｌ）及び（Ｓ）－２－アミノ－３－ヒドロキシプロパンアミド（３５０ｍｇ、２．５ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（３０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗物を得た。粗物を分取ＨＰ

ＬＣによって精製して、（２Ｓ）－２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００２）（１３０ｍｇ、２５％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｒエーテル中の６０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．３１。

【０１８０】

分取キラルＳＦＣを、化合物００２のラセミ混合物上で行い、化合物００２－Ｅｎ１及び化合物００２－Ｅｎ２を得た。

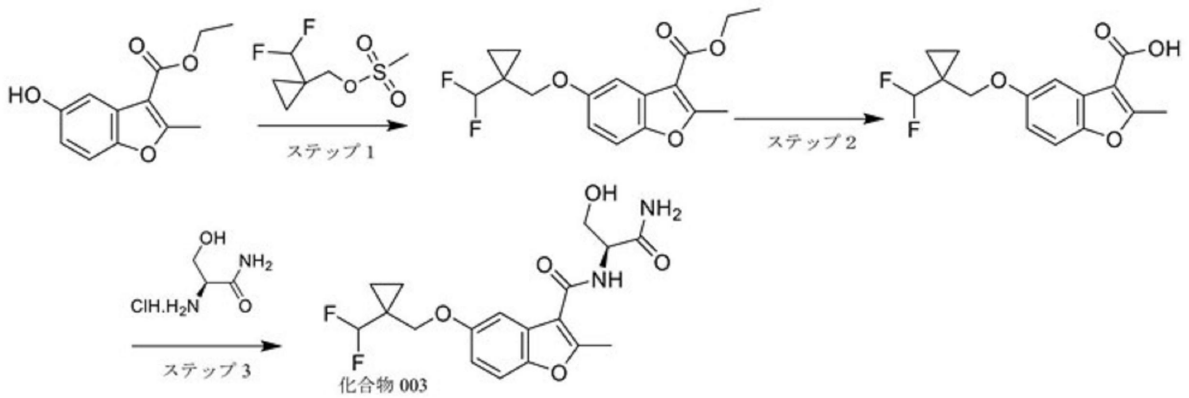
【０１８１】

以下の化合物を、化合物００２について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０５７－Ｅｎ１、化合物０５７－Ｅｎ２、化合物０５７－Ｅｎ３、化合物０５７－Ｅｎ４。

【０１８２】

（２Ｓ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００３）の合成。

【化２８】



ステップ１：炭酸セシウム（１．７７ｇ、５．４ｍｍｏｌ）を、ＡＣＮ（２５ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（０．６ｇ、４．０ｍｍｏｌ）及び（１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メチルメタンスルホネート（０．７１ｇ、３．５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを７０℃に１６時間加熱した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを室温まで冷却し、濾過した。濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の５％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、エチル５－（（１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（０．６５ｇ、７４％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．６。

【０１８３】

ステップ２：水（１０ｍＬ）中の２ＮのＮａＯＨを、ＭｅＯＨ（１０ｍＬ）及びＴＨＦ（１０ｍＬ）中の５－（（１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（０．６５ｇ、３．０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加し、ＲＭを１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（２０ｍＬ）で希釈し、１Ｎの水性ＨＣｌ溶液（２０ｍＬ）で酸性化し、沈殿した固体を、濾過し、減圧下で乾燥させて、５－（（１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（０．４ｇ、６７％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．１。

【０１８４】

ステップ３：Ｌ－セリンアミド。ＨＣｌ（１４２ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の５－（（１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．６７ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（５１３ｍｇ、１．３５ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（０．３７ｍＬ、２．０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを２時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（２５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×２５ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を与えた。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びアセトニトリルを使用するＦＣＣ逆相によって精製して、（２Ｓ）－２－［（５－｛［１－（ジフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００３）（６０ｍｇ、２３％）を白色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．２０。

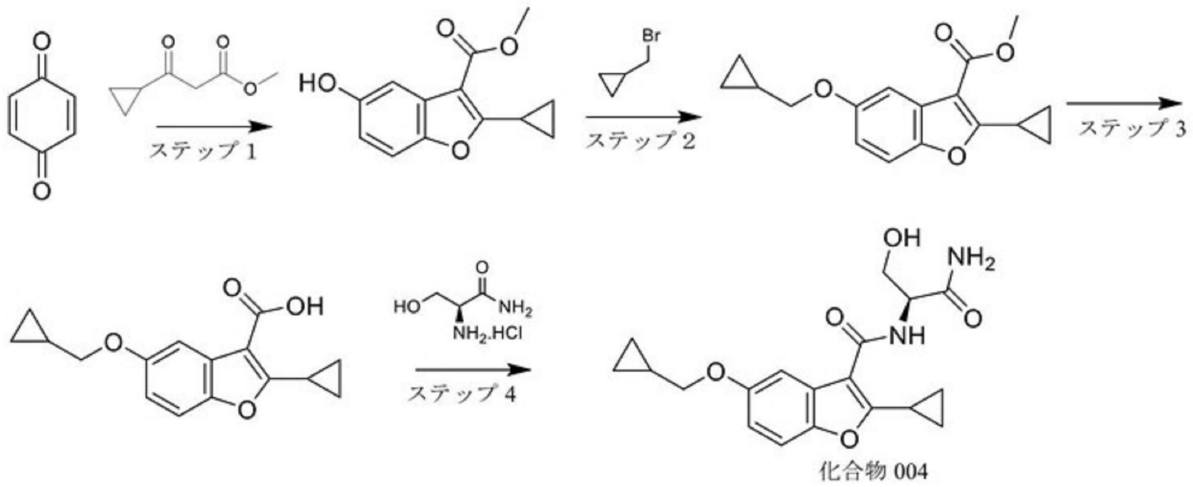
【０１８５】

以下の化合物を、化合物００３について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００５、化合物０１１、化合物０１２、化合物０１４－Ｅｎ１、化合物０１４－Ｅｎ２、化合物０３６－Ｅｎ１、化合物０３６－Ｅｎ２、化合物０６０－Ｅｎ１、化合物０６０－Ｅｎ２、化合物０６１－Ｅｎ１、化合物０６１－Ｅｎ２。

【０１８６】

（２Ｓ）－２－｛［２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００４）の合成。

【化２９】



化合物 004

ステップ１：ＩＰＡ（５０ｍｌ）中のベンゾキノン（１．５ｇ、１３．８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$ZnCl_2$（９．４ｇ、６９．４ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、メチル３－シクロプロピル－３－オキソプロノエート（７．８ｇ、５５．５ｍｍｏｌ）を室温で添加し、ＲＭを還流しながら６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。氷冷水をＲＭに添加し、ＥｔＯＡｃ（２×３００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、シリカゲル及び溶離液としてのｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃを使用するカラムクロマトグラフィーによって精製して、メチル２－シクロプロピル－５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレート（８００ｍｇ、７４％）を褐色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６３。

【０１８７】

ステップ２：ＡＣＮ（２０ｍＬ）中のメチル２－シクロプロピル－５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレート（５００ｍｇ、２．２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Cs_2

CO_3（０．５４ｇ、６．５ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、（ブロモメチル）シクロプロパン（ブロモメチル）シクロプロパン（４０７ｍｇ、３．０１７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（４０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を水（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲルでのカラムクロマトグラフィーによって精製して、メチル２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（３００ｍｇ、５１％）を白色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６８。

【０１８８】

ステップ３：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１、２０ｍＬ）中のメチル２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（３００ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２Ｎの水性ＮａＯＨ（４ｍＬ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、１Ｎの水性ＨＣｌ溶液でｐＨ約２に酸性化した。沈殿した固体を、濾過し、真空下で乾燥させて、２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（２００ｍｇ、粗物）をオフホワイト色の固体として得た。粗物を更に精製することなく次のステップで使用した。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％のＭｅＯＨ；ＲＦ：０．２８。

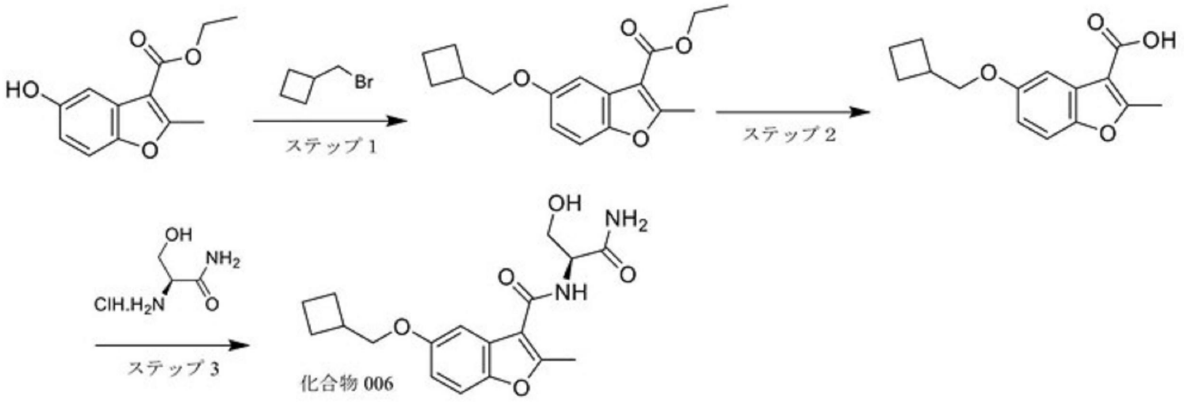
【０１８９】

ステップ４：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．５ｍＬ、２．９ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（３９１ｇ、１．０ｍｍｏｌ）を室温で添加し、続いて、（Ｓ）－２－アミノ－３－ヒドロキシプロパンアミドヒドロクロリド（１４４ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を水（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としての０．１％水性ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰクロマトグラフィーによって精製して、（２Ｓ）－２－｛［２－シクロプロピル－５－（シクロプロピルメトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００４）（４０ｍｇ、２つのステップで１６％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２１。

【０１９０】

（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００６）の合成。

【化３０】



ステップ１：ＡＣＮ（３０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン

－３－カルボキシレート（５００ｍｇ、２．３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、CS_2CO_3（２．２ｇ、６．８ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、（ブロモメチル）シクロブタン（６７７ｍｇ、４．５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを、水（４０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗化合物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを使用するＦＣＣによって精製して、エチル５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（３２０ｍｇ、４８％）を黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６４。

【０１９１】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１、４０ｍＬ）中のエチル５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（３００ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２Ｎの水性ＮａＯＨ（４ｍＬ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、１ＮのＨＣｌでｐＨ約２に酸性化し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（２００ｍｇ、粗物）を黄色の固体として得た。粗物を更に精製することなく次のステップで使用した。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の１０％ＭｅＯＨ；ＲＦ：０．２５。

【０１９２】

ステップ３：ＤＭＦ（２０ｍＬ）中の５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．７６９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．５ｍＬ、３．０７６ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（７８７ｍｇ、１．０７６ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、続いて、（Ｓ）－２－アミノ－３－ヒドロキシプロパンアミド－ＨＣｌ（１５０ｍｇ、１．０７６ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（５００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×８０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗化合物を、溶離液としてのＡＣＮ中の０．１％水性ＦＡを使用するＲＰクロマトグラフィーによって精製して、（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００６）（１００ｍｇ、２つのステップで４１％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．３４。

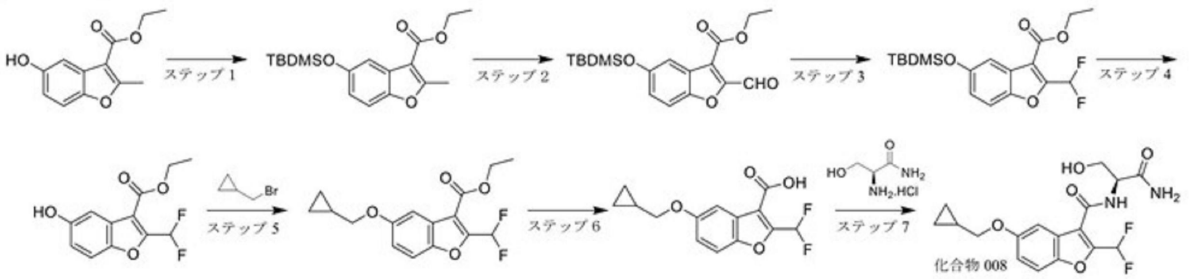
【０１９３】

以下の化合物を、化合物００６について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００１、化合物００７、化合物００９、化合物０１０、化合物０１５、化合物０１６、化合物０１７－Ｅｎ１、化合物０１７－Ｅｎ２、化合物０１８、化合物０２０、化合物０２１、化合物０２２、化合物０２３、化合物０２５、化合物０２６、化合物０２９、化合物０３０、化合物０３４、化合物０３５－Ｅｎ１、化合物０３５－Ｅｎ２、化合物０３７、化合物０４６－Ｅｎ１、化合物０４６－Ｅｎ２。

【０１９４】

（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００８）の合成。

【化３１】



ステップ１：ＤＣＭ（１００ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（５．０ｇ、２２．７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ａｒ雰囲気下で、イミダゾール（３．０９ｇ、４５．４ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、ＴＢＤＭＳ－Ｃｌ（４．１０ｇ、２７．２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを、室温に温め、１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを水（１００ｍＬ）に注ぎ入れ、ＤＣＭ（３×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２×１００ｍＬ）、続いて、ブライン（２００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗生成物を、溶離剤としてのｐｅｔエーテル中の５％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、エチル５－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（５．１ｇ、６８％）を淡黄色の液体として得た。。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．７。

【０１９５】

ステップ２：１，４－ジオキサン（２５０ｍＬ）中のエチル５－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（６．０ｇ、１７．９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ａｒ雰囲気下で、SeO_2（３９．８ｇ、３５８ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを１２０℃に加熱し、撹拌を４８時間維持した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを室温まで冷却し、濾過した。濾液を減圧下で濃縮した。粗生成物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の２％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、エチル５－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ホルミルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．６ｇ、４２％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．６。

【０１９６】

ステップ３：ＤＣＭ（１００ｍＬ）中のエチル５－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ホルミルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．６ｇ、７．７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ａｒ雰囲気下で、ＤＡＳＴ（３．０ｍＬ、２３．３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温まで加温し、３時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、ＤＣＭ（１００ｍＬ）で希釈し、飽和$NaHCO_3$溶液（１００ｍＬ）、水（１００ｍＬ）、ブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、エチル５－（（ｔｅｒｔ）－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．４ｇ、粗物）を褐色の固体として得た。この粗物を更に精製することなく次のステップに使用した。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．７。

【０１９７】

ステップ４：ＴＨＦ（５０ｍＬ）中のエチル５－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．４ｇ、６．４８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ａｒ雰囲気下で、ＴＢＡＦ（ＴＨＦ中で１Ｍ）（１２．９ｍＬ、１２．９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温まで加温し、１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（１００ｍＬ）に注ぎ、ＥｔＯ

Ａｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（１００ｍＬ）、ブライン（２００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、エチル２－（ジフルオロメチル）－５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．８ｇ）を褐色の粘稠な塊として得た。この粗物を更に精製することなく次のステップに使用した。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．３。^{1}Ｈ ＮＭＲ（５００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）：δ（ｐｐｍ）：９．６５（ｓ，１Ｈ），７．６４－７．５４（ｍ，２Ｈ），７．３６（ｓ，１Ｈ），６．９９（ｄ，１Ｈ），４．３７（ｑ，２Ｈ），１．３８（ｔ，３Ｈ）。

【０１９８】

ステップ５：ＡＣＮ（２０ｍＬ）中のエチル２－（ジフルオロメチル）－５－ヒドロキシベンゾフラン－３－カルボキシレート（５００ｍｇ、１．９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Cs_2CO_3（１．９ｇ、５．８ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、（ブロモメチル）シクロプロパン（５２７ｍｇ、３．９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（４０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を水（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲルでのカラムクロマトグラフィーによって精製して、メチル５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、６６％）を淡黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．７２。

【０１９９】

ステップ６：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１、１５ｍＬ）中のエチル５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、１．２９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２ＮのＮａＯＨ（３ｍｌ）を０℃で添加した。ＲＭを８０℃で４時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、１Ｎの水性ＨＣｌ溶液でｐＨ約２に酸性化し、ＤＣＭ（２×２０ｍＬ）中の５％のＭｅＯＨで抽出した。組み合わせた抽出物を、無水Na_2SO_4で乾燥させ、真空下で濃縮して、５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボン酸（３００ｍｇ、粗物）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２５。

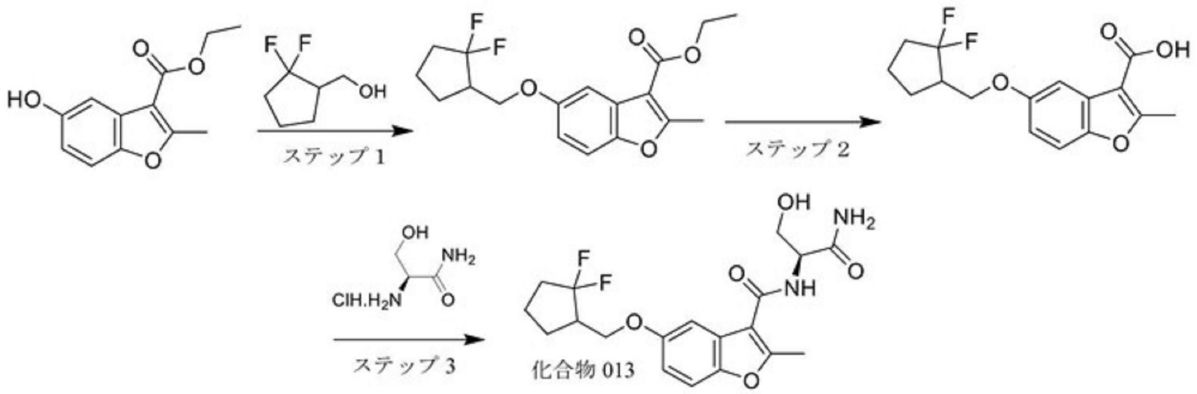
【０２００】

ＤＭＦ（１５ｍＬ）中の５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）ベンゾフラン－３－カルボン酸（３００ｍｇ、１．１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．７ｍＬ、４．２ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（５６５ｍｇ、１．５ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、（Ｓ）－２－アミノ－３－ヒドロキシプロパンアミドヒドロクロリド（２０８ｍｇ、１．５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×４０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としての０．１％水性ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰカラムクロマトグラフィーによって精製して、（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－（ジフルオロメチル）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物００８）（１１５ｍｇ、２つのステップで３２％）を白色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２１。

【０２０１】

２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物０１３）の合成。

【化３２】



ステップ１：塩化メタンスルホニル（１４０．８ｍｇ、１．２ｍｍｏｌ）を、ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メタノール（１４０ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（３１２ｍｇ、３．１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加し、ＲＭを室温で１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、ＤＣＭ（１５０ｍＬ）で希釈し、水（７５ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。ＡＣＮ（１０ｍＬ）中の粗生成物に、エチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２５０ｍｇ、１．１３６ｍｍｏｌ）及びCs_2CO_3（１．３ｇ、３．４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃に１６時間加熱した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを濾過し、濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、エチル－５－（（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（６０ｍｇ、１５％）を無色の液体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６。

【０２０２】

ステップ２：ＮａＯＨ（２．５Ｎ）の水溶液を、ＭｅＯＨ（１ｍＬ）及びＴＨＦ（１ｍＬ）中のエチル－５－（（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（６０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、真空下で蒸発させ、水（１５ｍＬ）で希釈し、ｐＨを、１ＮのＨＣｌ水溶液で約５に調整した。沈殿した固体をＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出し、組み合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、５－（（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（６０ｍｇ）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の６０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２。

【０２０３】

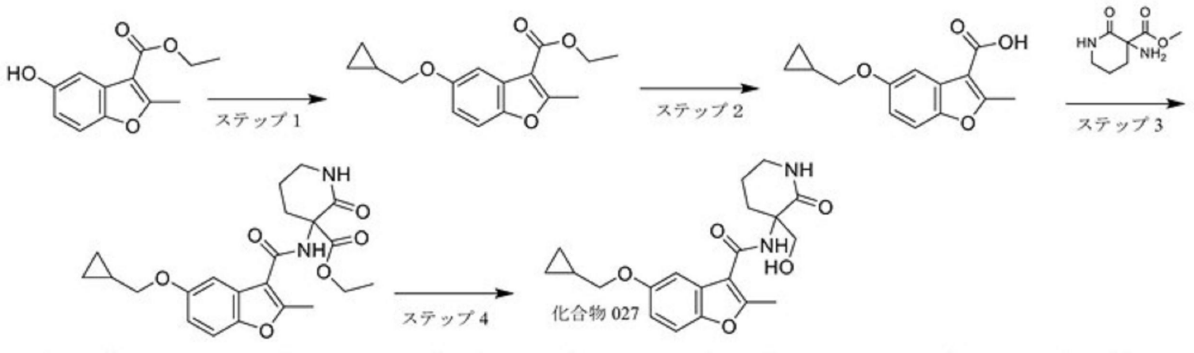
ステップ３：ＤＭＦ（２ｍＬ）中の５－（（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（６０ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１１０ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（７５ｍｇ、０．５８ｍｍｏｌ）の溶液に、Ａｒ雰囲気下で、Ｌ－セリンアミド．ＨＣｌ（４０．８ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、氷水（５０ｍＬ）に注ぎ、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２×５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＧｒａｃｅフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、２－（｛５－［（２，２－ジフルオロシクロペンチル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド（化

合物０１３）（１６ｍｇ、２２％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル　ＲＦ：０．２。

【０２０４】

５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピペリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０２７）の合成。

【化３３】



ステップ１：ＡＣＮ（２００ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（８．０ｇ、３６．３２ｍｍｏｌ）及び（ブロモメチル）シクロプロパン（９．８ｇ、７２．６５ｍｍｏｌ）の溶液をCs_2CO_3（３５．５ｇ、１０８．９ｍｍｏｌ）で処理した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。完了後に、ＲＭを、室温に冷却し、水（１００ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて、エチル５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレートを淡黄色の粘性物質（９．０ｇ、９０％）として得た。これを何ら更に精製することなく次のステップで直接的に使用した。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：７．４４（ｓ，１Ｈ），７．２６－７．３０（ｍ，１Ｈ），６．８７－６．９０（ｍ，１Ｈ），４．４０（ｑ，２Ｈ），３．８５（ｄ，２Ｈ），２．７３（ｓ，３Ｈ），１．３２－１．４５（ｔ，３Ｈ），１．２８－１．２９（ｍ，１Ｈ），０．６４－０．６７（ｍ，３Ｈ），０．３８－０．６１（ｍ，３Ｈ）。

【０２０５】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ（１：１：１）（３０ｍＬ）中のエチル５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（９ｇ、３２．８０９ｍｍｏｌ）の溶液を、ＮａＯＨ（３．９ｇ、９８．４２７ｍｍｏｌ）で室温で処理した。ＲＭを５５℃で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。室温への冷却後に、ＲＭを減圧下で濃縮し、残渣を、水（２００ｍＬ）で希釈し、ジエチルエーテル（２×２００ｍＬ）で抽出した。次いで、水層を１ＮのＨＣｌ（ｐＨ＝２に調整）で酸性化し、沈殿した固体を、濾過し、真空下で乾燥させて、５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（７．１ｍｇ、８８％）を淡褐色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　ｐｐｍ：１２．８９（ｓ，１Ｈ），７．４６（ｄ，１Ｈ），７．３３（ｄ，１Ｈ），６．９１－６．８８（ｍ，１Ｈ），３．８２（ｄ，２Ｈ），２．６９（ｓ，３Ｈ），１．２３－１．２０（ｍ，１Ｈ），０．５９－０．５７（ｍ，２Ｈ），０．５６－０．５５（ｍ，２Ｈ）。

【０２０６】

ステップ３：ＤＣＭ（３０ｍＬ）中の５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（３５０ｍｇ、１．４２２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．１ｍＬ、５．６９１ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（７５６ｍｇ、１．９９ｍｍｏｌ）、及びメチル３－アミノ－２－オキソピペリジン－３－カルボキシレート（３７０ｍｇ、１．９９ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬ

Ｃによって監視した。ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×４０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液としてｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを使用するＧｒａｃｅフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、エチル３－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－２－オキソピペリジン－３－カルボキシレート（２００ｍｇ、４８％）を淡黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｒエーテル中の４０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．７２。

【０２０７】

ステップ４：ＭｅＯＨ（２５ｍＬ）中のエチル３－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－２－オキソピペリジン－３－カルボキシレート（２００ｍｇ、０．４８３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$NaBH_4$（９１ｍｇ、２．４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、水（４０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、粗物を得た。粗物をジエチルエーテル（１０ｍＬ）で粉砕して、５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピペリジン－３－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０２７）（１２０ｍｇ、６７％）を淡黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の８０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．３８。

【０２０８】

分取キラルＳＦＣを、化合物０２７のラセミ混合物上で行い、化合物０２７－Ｅｎ１及び化合物０２７－Ｅｎ２を得た。

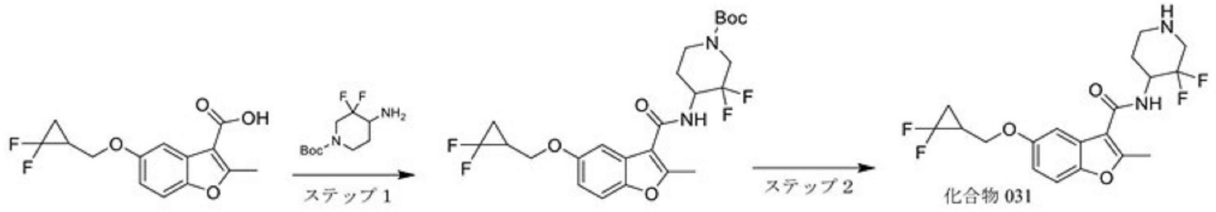
【０２０９】

以下の化合物を、化合物０２７について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０２８－Ｅｎ１及び化合物０２８－Ｅｎ２。

【０２１０】

５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０３１）の合成。

【化３４】



ステップ１：ＤＣＭ（４０ｍＬ）中の５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（１．０ｇ、３．５ｍｍｏｌ）［化合物００２に記載の合成手順］の撹拌溶液に、ＤＣＭ中のＤＩＰＥＡ（２．４ｍＬ、１４．２ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１．８ｇ、４．９ｍｍｏｌ）、及びｔｅｒｔ－ブチル４－アミノ－３，３－ジフルオロピペリジン－１－カルボキシレート（１．１ｇ、４．９ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（４０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗生成物を得た。粗物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを使用するＦＣＣによって精製して、ｔｅｒｔ－ブチル４－（５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－

カルボキサミド）－３，３－ジフルオロピペリジン－１－カルボキシレート（７００ｍｇ、２つのステップで５２％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｒエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６１。

【０２１１】

ステップ２：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル４－（５－（（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－３，３－ジフルオロピペリジン－１－カルボキシレート（７００ｍｇ、１．２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１，４－ジオキサン（３．５ｍＬ）中の４ＭのＨＣｌを０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを氷水で希釈し、ｐＨを飽和$NaHCO_3$溶液で約８．０に調整し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、水（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗生成物を得て、これをジエチルエーテルで粉砕して、５－［（２，２－ジフルオロシクロプロピル）メトキシ］－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０３１）（４８０ｍｇ、８５％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の５％ＭｅＯＨ；ＲＦ：０．２４。

【０２１２】

分取キラルＳＦＣを、化合物０３１のラセミ混合物上で行い、化合物０３１－Ｅｎ１、化合物０３１－Ｅｎ２、化合物０３１－Ｅｎ３、及び化合物０３１－Ｅｎ４を得た。

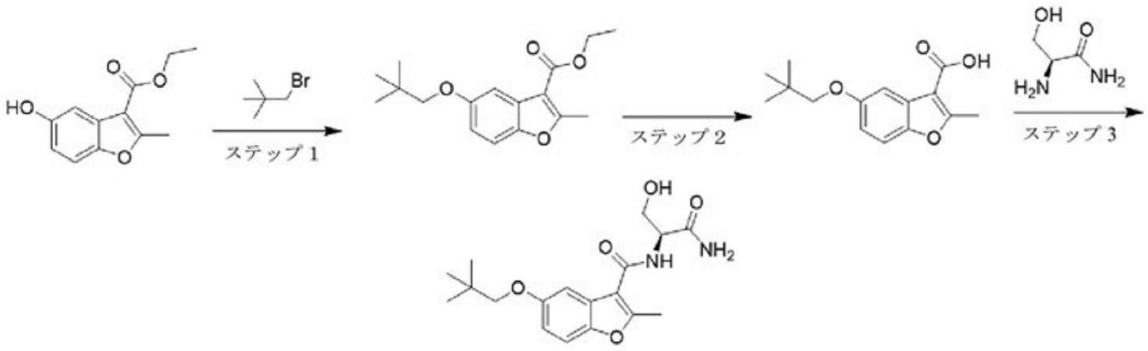
【０２１３】

以下の化合物を、化合物０３１について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０１９－Ｅｎ１、化合物０１９－Ｅｎ２、化合物０２４－Ｅｎ１、化合物０２４－Ｅｎ２、化合物０３２－Ｅｎ１、化合物０３２－Ｅｎ２、化合物０３３－Ｅｎ１、化合物０３３－Ｅｎ２、化合物０３３－Ｅｎ３、化合物０３３－Ｅｎ４。

【０２１４】

（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物０３９）の合成。

【化３５】



ステップ１：ジグリム（２０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．０ｇ、９．０９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Cs_2CO_3（１１．８ｇ、３６．３６ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、１－ブロモ－２，２－ジメチルプロパン　（５．４ｇ、３６．３６ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１５０℃で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×８０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、粗物を与えた。粗物を、溶離液としてｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを使用するＧｒａｃｅフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、エチル２－メチル－５－（ネオペ

ンチルオキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、１５％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の４０％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．６８。

【０２１５】

ステップ２：ＭｅＯＨ及びＴＨＦ（１：１、３０ｍＬ）中のエチル２－メチル－５－（ネオペンチルオキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、１．３７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＯＨ（２Ｎ、３．５ｍＬ）の水溶液を０℃で添加した。ＲＭを３時間還流した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、濃縮し、１ＮのＨＣｌでｐＨ約２に酸性化し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、２－メチル－５－（ネオペンチルオキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（２５０ｍｇ）の粗物を淡黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．２８。粗物を更に精製することなく次のステップで直接的に使用した。

【０２１６】

ステップ３：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（ネオペンチルオキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（８０ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．２ｍＬ、１．２２ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１５９ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）、及び（Ｒ）－２－アミノ－３－ヒドロキシプロパンアミドヒドロクロリド（５９ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを、室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×４０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物（１２０ｍｇ）を得た。粗化合物を分取ＨＰＬＣによって精製して、（（２Ｓ）－２－｛［５－（２，２－ジメチルプロポキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド（化合物０３９）（３５ｍｇ、３３％）をオフホワイト色の固体として得た；ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；ＲＦ：０．３４。

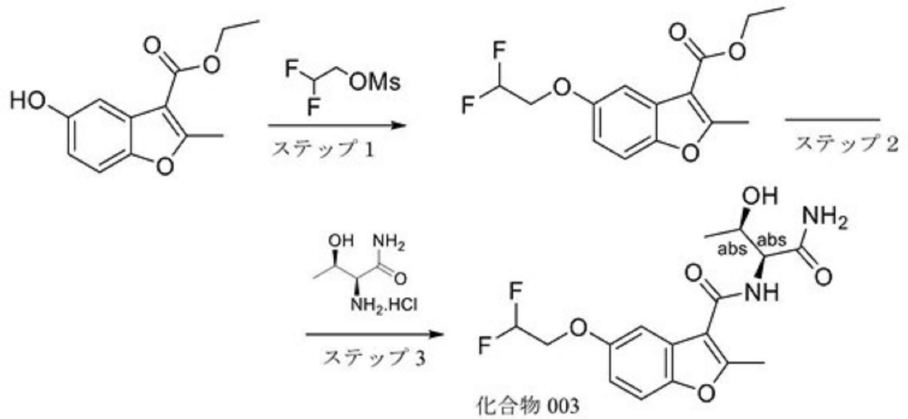
【０２１７】

以下の化合物を、化合物０３９について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０５５－Ｅｎ１、化合物０５５－Ｅｎ２、

【０２１８】

（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド（化合物０４０）の合成。

【化３６】



ステップ１：炭酸セシウム（１７．６８ｇ、５４ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（３０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（６．０ｇ、２７．２ｍｍｏｌ）及び（２，２－ジフルオロエチルメタンスルホネート（５．２３ｇ、

３２．６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを、８０℃で撹拌し、１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×２００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（５０ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、エチル５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレートル（１２．０ｇ、粗物）を褐色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．６。

【０２１９】

ステップ２：ＮａＯＨ（２Ｎ、１５ｍＬ）の水溶液を、ＭｅＯＨ（２０ｍＬ）及びＴＨＦ（２０ｍＬ）中の５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸エチルエステル（１．０ｇ、３．５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加し、ＲＴを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（３０ｍＬ）で希釈し、１ＮのＨＣｌ（２０ｍＬ）溶液でｐＨ＝約２に酸性化した。沈殿した固体を、濾過し、真空下で乾燥させて、５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（０．８０ｇ、３つのステップ全体で４８％）を黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．３。

【０２２０】

ステップ３：（２Ｓ，３Ｒ）－２－アミノ－３－ヒドロキシブタンアミドヒドロクロリド（１２６ｍｇ、０．８２ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（５ｍＬ）中の５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（１５０ｍｇ、０．５８ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（５５６ｍｇ、１．４６ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（０．３ｍＬ、１．７５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを室温で１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを水（２５ｍＬ）で希釈し、沈殿した固体を濾過した。固体を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド（化合物０４０）（８０．１ｍｇ、３８％）を白色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．２０。

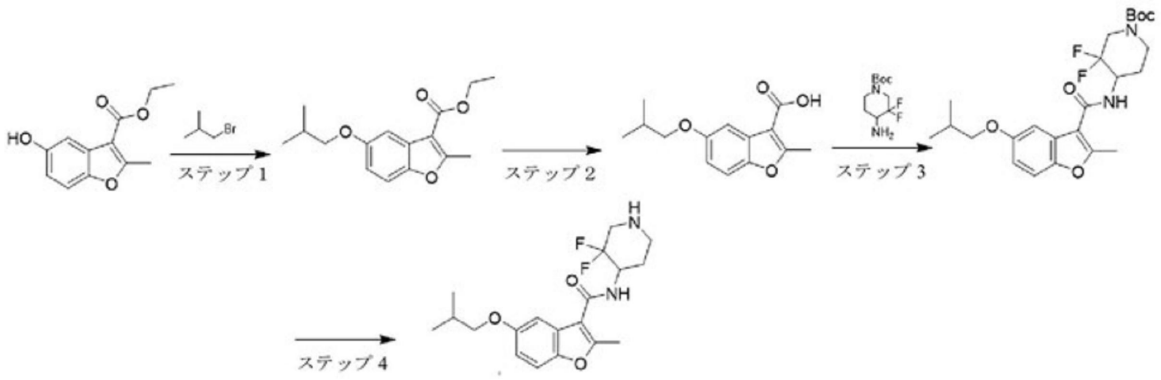
【０２２１】

以下の化合物を、化合物０４０について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０３８、化合物０４１－Ｅｎ１、化合物０４１－Ｅｎ２、化合物０４４－Ｅｎ１、及び化合物０４４－Ｅｎ２。

【０２２２】

Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－（２－メチルプロポキシ）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０４２）の合成。

【化３７】



ステップ１：０℃のＡＣＮ（２０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．０ｇ、４．５４ｍｍｏｌ）の溶液に、Cs_2CO_3

（４．４４ｇ、１３．６２ｍｍｏｌ）を添加し、次いで、Ａｒ雰囲気下で、１－ブロモ－２－メチルプロパン（１．０ｍＬ、９．０９ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを最大５０℃で１８時間加熱した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（１×５０ｍＬ）、ブライン（１×５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を与えた。粗物を、溶離液としてのｐｅｔエーテル中の０～２０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製して、エチル５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（０．８ｇ、６６％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．４。

【０２２３】

ステップ２：ＴＨＦ：ＭｅＯＨ：H_2O（１：１：１）（３０ｍｌ）中のエチル５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（０．８ｇ、２．８９ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＯＨ（０．３４ｇ、８．６９ｍｍｏｌ）を室温で添加し、次いで、ＲＭを５０℃で１８時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを濃縮して、残渣を与えた。残渣を氷水で希釈し、ｐＨを１ＮのＨＣｌ水溶液で約２に調整して、固体を与えた。固体を、濾過し、減圧下で乾燥させて、５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（０．５５ｇ、７６％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％のＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．３。

【０２２４】

ステップ３：ＤＣＭ（５０ｍＬ）中の５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（０．５ｇ、２．０１ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチル４－アミノ－３，３－ジフルオロピペリジン－１－カルボキシレート（０．７１ｇ、３．０２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＤＩＰＥＡ（１．８５ｍＬ、１０．０５ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、Ａｒ雰囲気下で、ＨＡＴＵ（１．１４ｇ、３．０２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（１００ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ（２×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（１×１００ｍＬ）、ブライン（１×５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得て、これを、溶離液としてのＤＣＭ中の２％ＭｅＯＨを使用するｇｒａｃｅカラムクロマトグラフィーによって精製して、ｔｅｒｔ－ブチル３，３－ジフルオロ－４－（５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボキシレート（０．７００ｇ、７４％）をオフホワイトとして得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％のＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．５。

【０２２５】

ステップ４：０℃のＤＣＭ（５０ｍｌ）中のｔｅｒｔ－ブチル３，３－ジフルオロ－４－（５－イソブトキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボキシレート（０．６５ｇ、１．３９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＦＡ（１．１３ｍｌ、１３．９０ｍｍｏｌ）を０℃で滴加した。ＲＭを、室温で１８時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを氷水で希釈し、ｐＨを水性飽和$NaHCO_3$溶液で約８に調整した。有機層を、ブライン溶液で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗物を得て、これをジエチルエーテルで粉砕して、Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－（２－メチルプロポキシ）－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０４２）（０．３５ｇ、６８％）を白色の固体として得た。ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．２。

【０２２６】

分取キラルＳＦＣを、化合物０４２のラセミ混合物上で行い、化合物０４２－Ｅｎ１及び化合物０４２－Ｅｎ２を得た。

【０２２７】

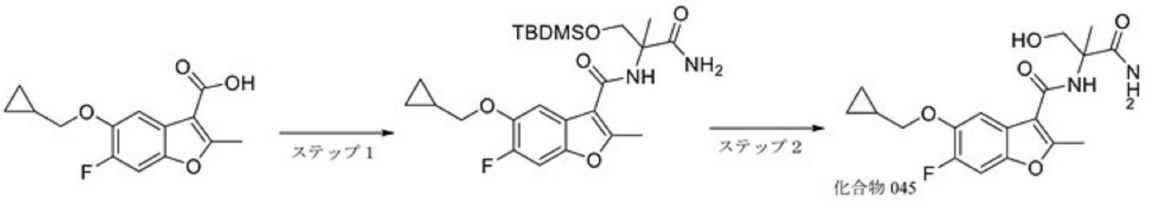
以下の化合物を、化合物０４２について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）

の使用）で調製した：化合物０４３－Ｅｎ１及び化合物０４３－Ｅｎ２。

【０２２８】

２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０４５）の合成。

【化３８】

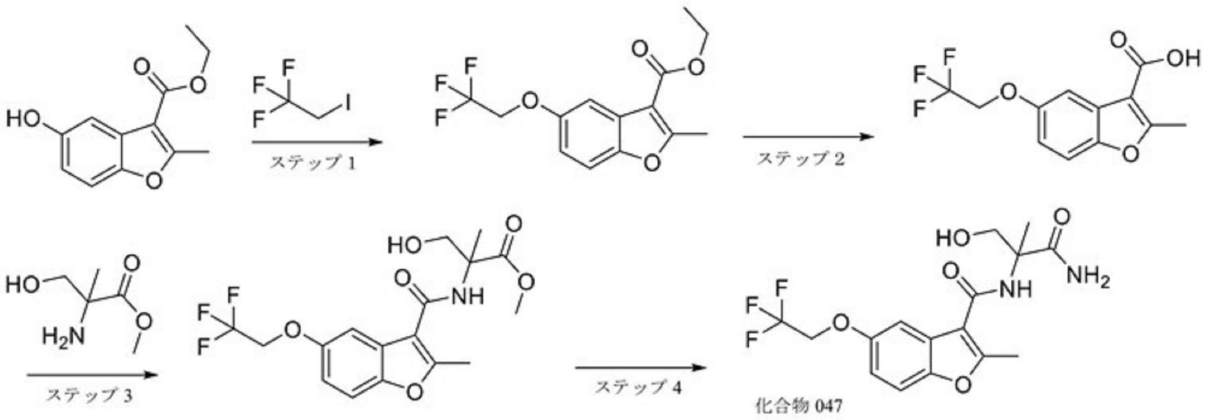


ステップ１：ＨＡＴＵ（７４８ｍｇ、１．９６ｍｍｏｌ）及びＤＩＰＥＡ（１．３１ｍＬ、７．５７ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（１５ｍＬ）中の５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（４００ｍｇ、１．５１ｍｍｏｌ）の溶液に０℃で添加した。１０分後に、２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（４０４ｍｇ、１．７４ｍｍｏｌ）をＲＭに０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）で抽出し、飽和重炭酸ナトリウム溶液（３０ｍＬ）、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、Ｎ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミドを淡黄色の固体（６００ｍｇ、８２％）として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ ｐｐｍ：７．６８（ｓ，１Ｈ），７．６３（ｄ，１Ｈ），７．５３（ｂｒｓ，１Ｈ），７．４６（ｔ，２Ｈ），４．２５（ｄ，１Ｈ），４．０４（ｑ，１Ｈ），２．６５（ｓ，３Ｈ），１．９９（ｓ，２Ｈ），１．５３（ｓ，３Ｈ），１．２６（ｔ，１Ｈ），１．１８（ｔ，１Ｈ），０．７９（ｓ，９Ｈ），０．６１－０．５８（ｍ，２Ｈ），０．３５－０．３２（ｍ，２Ｈ），０．０９（ｓ，６Ｈ）。ＬＣＭＳ：Ｒｔ＝２．４６分（９２．７０％），ｍ／ｚ：４７９．３１［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０２２９】

ステップ２：ＴＨＦ（３０ｍＬ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド（５５０ｍｇ、１．１５ｍｍｏｌ）の溶液を、ＴＢＡＦ（ＴＨＦ中で１Ｍ）（３．４５ｍＬ、３．４５ｍｍｏｌ）で室温で６時間処理した。次いで、ＲＭを、水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、飽和塩化アンモニウム溶液（３０ｍＬ）、重炭酸ナトリウム溶液（３０ｍＬ）、及びブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、溶離液としてのＤＣＭ中の５％ＭｅＯＨを使用するＦＣＣによって精製し、残渣を、分取ＨＰＬＣによって再精製した［分取ＨＰＬＣ条件：移動相Ａ：１０ｍＭの酢酸アンモニウム（Ａｑ）、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：Ｘ－ＳＥＬＥＣＴ Ｃ１８（２０×２５０）５μｍ、流量：１５ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／２５、２／２５、１０／５０、１２／５０、１２．１／１００、２５／１００、２５．１／２５、３０／２５、溶解度：ＡＣＮ＋ＴＨＦ＋水、温度：周囲］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－６－フルオロ－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０４５）（２２０ｍｇ、５２％）を得た。

【０２３０】
分取キラルＳＦＣを、化合物０４５のラセミ混合物上で行い、化合物０４５－Ｅｎ１及び化合物０４５－Ｅｎ２を得た。
【０２３１】
３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド（化合物０４７）の合成。
【化３９】



ステップ１：ＡＣＮ（４０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２．０ｇ、９．０８１ｍｍｏｌ）の溶液に、Cs_2CO_3（８．８７ｇ、２７．２４ｍｍｏｌ）及び１，１，１－トリフルオロ－２－ヨードエタン（１．９８ｍＬ、１８．１６ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。反応の完了後に、溶媒を減圧下で蒸発させ、得られた残渣を、ＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）で希釈し、水（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、還元下で濃縮した。粗物を、ｐｅｔエーテル中の５％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、エチル２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．０ｇ、３６％）を得た。
【０２３２】
ステップ２：ＴＨＦ／ＭｅＯＨ／H_2O（１：１：１）（３０．０ｍＬ）中のエチル２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．０ｇ、３．３１１ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＯＨ（１．３２５ｇ、３３．１１ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを３時間撹拌した。次いで、揮発物を減圧下で除去し、残渣を、水（１０ｍＬ）で希釈し、０℃に冷却し、１ＮのＨＣｌ（ｐＨ約４）で酸性化した。固体を、濾過し、水（１０ｍＬ）及びヘキサン（１５ｍＬ）で洗浄した。固体を真空下で乾燥させて、２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸をオフホワイト色の固体（５００ｍｇ、５５．１１％）として得た。
【０２３３】
ステップ３：ＤＭＦ（３０ｍＬ）中の２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（５００ｍｇ、１．８２５ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（１．０４ｇ、２．７３７ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．５２ｍＬ、９．１２７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。次いで、２－アミノ－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパン酸ヒドロクロリド（４２４．２ｍｇ、２．７３７ｍｍｏｌ）を、ＲＭに添加し、室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、氷冷水（３０ｍＬ）で処理し、ＥｔＯＡｃ（２×４０ｍＬ）で抽出し、飽和重炭酸ナトリウム溶液（４０ｍＬ）、ブライン（４０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、ＤＣＭ中の２％ＭｅＯＨの勾配を使用するシリカゲル上でのＦＣＣによって精製して、メチル３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－

３－カルボキサミド）プロパノエートを淡黄色の液体（４００ｍｇ、５６％）として得た。

【０２３４】

ステップ４：ＭｅＯＨ（５０ｍＬ）中のメチル３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキサミド）プロパノエート（４００ｍｇ、１．０２７ｍｍｏｌ）と７Ｎのアンモニアとの混合物を、密封チューブ内で、７０℃で２４時間撹拌した。次いで、ＲＭを室温に冷却した。揮発物を減圧下で蒸発させた。化合物を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相Ａ：１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：Ｘ－ｓｅｌｅｃｔ　Ｃ１８（１９×２５０）ｍｍ、５μｍ、流量：１６ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／３０、２／３０、８／６０、１２／６０、１２．１／９８、１６／９８、１６．１／３０、１９／３０、溶解度：ＡＣＮ＋ＴＨＦ－水、温度：周囲。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、３－ヒドロキシ－２－メチル－２－｛［２－メチル－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド（化合物０４７）（７５ｍｇ、１９．５０％）を得た。

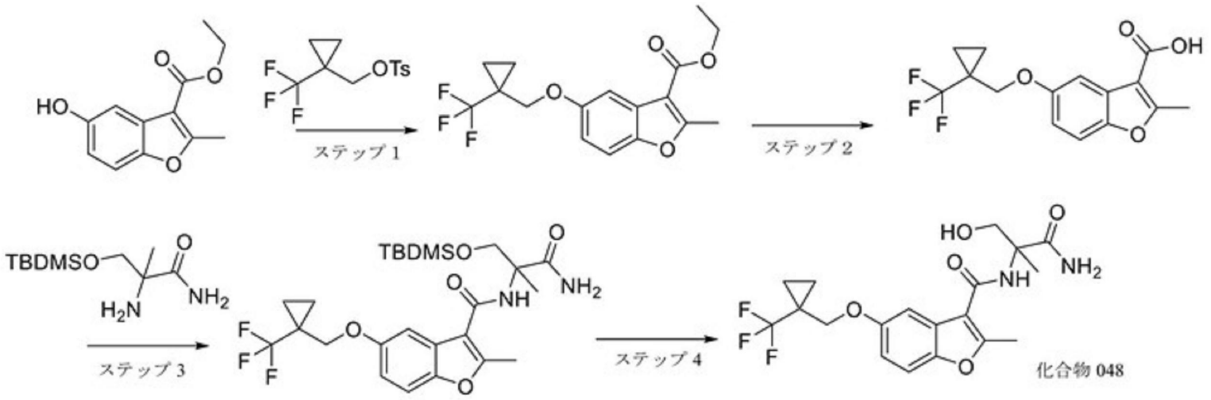
【０２３５】

分取キラルＳＦＣを、化合物０４７のラセミ混合物上で行い、化合物０４７－Ｅｎ１及び化合物０４７－Ｅｎ２を得た。

【０２３６】

３－ヒドロキシ－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド（化合物０４８）の合成。

【化４０】



ステップ１：ＡＣＮ（２５ｍＬ）中の（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メチル４－メチルベンゼンスルホネート（１．２ｇ、４．０７８ｍｍｏｌ）の溶液に、エチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（８９７．９９４ｍｇ、４．０７８ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（３．９８６ｇ、１２．２３３ｍｍｏｌ）、及びヨウ化ナトリウム（３０５．５９ｍｇ、２．０３９ｍｍｏｌ）を室温で添加した。N_2下で、ＲＭを６０℃で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＤＣＭ（２×２０ｍＬ）で洗浄した。組み合わせた有機層を真空下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の５％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレートを淡黄色の粘性物質（１．３ｇ、９３．１３％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ　ｐｐｍ：７．４４（ｄ，１Ｈ），７．３０（ｄ，１Ｈ），６．８６－６．８９（ｄｄ，１Ｈ），４．３８－４．４３（ｑ，２Ｈ），４．１４（ｓ，２Ｈ），２．７４（ｓ，３Ｈ），１．４２（ｔ，２Ｈ），１．２５（ｓ，２Ｈ），１．１２－１．１５（ｍ，２Ｈ），０．９４－０．９６（ｍ，２Ｈ）。

【０２３７】
ステップ２：ＴＨＦ／ＭｅＯＨ／H_2O（１５ｍＬ／１０ｍＬ／５ｍＬ）中の２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．３ｇ、３．７９８ｍｍｏｌ）の溶液に、水酸化リチウム一水和物（１．５９３ｇ、３７．９７７ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、揮発物を減圧下で除去した。残渣を、氷水（１０ｍＬ）で希釈し、１ＮのＨＣｌ溶液（ｐＨ約４）で酸性化した。沈殿した固体を、濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸をオフホワイト色の固体（１．１ｇ、９２％）として得た。これを次のステップで直接的に使用した。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：１２．９５（ｂｒ　ｓ，１Ｈ），７．４８（ｄ，１Ｈ），７．３７（ｄ，１Ｈ），６．９０－６．９３（ｄｄ，１Ｈ），４．１３（ｓ，２Ｈ），２．７０（ｓ，３Ｈ），１．０７－１．１０（ｍ，２Ｈ），１．０１－１．０４（ｍ，２Ｈ）。

【０２３８】
ステップ３：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（１．１ｇ、３．５００ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（２．６６２ｇ、７．００１ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．８６２ｍＬ、１０．５０１ｍｍｏｌ）、及び２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（１．０５８ｇ、４．５５０ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、室温で２時間撹拌した。次いで、ＲＭを、冷水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和$NaHCO_3$（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、Ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、Ｎ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキサミドを淡黄色の粘性物質（１．０ｇ、５４．０４％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：６．８９（ｂｒ　ｓ，１Ｈ），６．８７－６．８９（ｍ，１Ｈ），５．４０（ｂｒ　ｓ，１Ｈ），４．４７（ｄ，１Ｈ），４．１１－４．１５（ｍ，２Ｈ），３．７９（ｄ，１Ｈ），１．７７（ｓ，３Ｈ），１．２４－１．２７（ｍ，３Ｈ），０．９３（ｓ，９Ｈ），０．１６（ｄ，６Ｈ）。

【０２３９】
ステップ４：ＴＨＦ（１０ｍＬ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－２－メチル－５－（（１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキサミド（１ｇ、１．８９２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＢＡＦ（ＴＨＦ中で１Ｍ）（５．６ｍＬ、５．６７５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で３時間撹拌した。次いで、ＲＭを、水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。化合物を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相Ａ：１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＹＭＣ　Ｔｒｉａｎｔ　Ｃ１８（１５０×２５）ｍｍ、５μｍ、流量：１６ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／３５、２／３５、８／６５、１２／６５、１２．１／９８、１４／９８、１４．１／３５、１７／３５、溶解度：ＡＣＮ＋ＴＨＦ＋水、温度：周囲。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、３－ヒドロキシ－２－メチル－２－［（２－メチル－５－｛［１－（トリフルオロメチル）シクロプロピル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド（化合物０４８）（７００ｍｇ、９９．０％）を得た。

【０２４０】
分取キラルＳＦＣを、化合物０４８のラセミ混合物上で行い、化合物０４８－Ｅｎ１及

び化合物０４８－Ｅｎ２を得た。

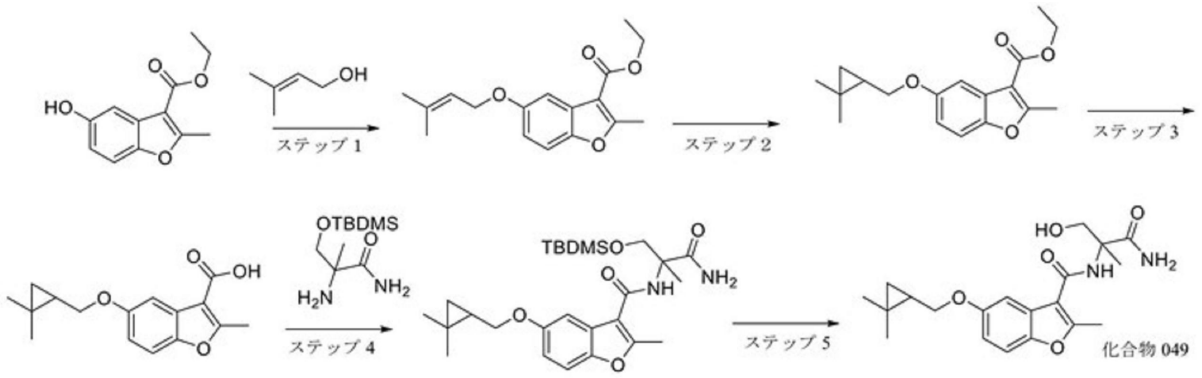
【０２４１】

以下の化合物を、化合物０４８について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０５０－Ｅｎ１、化合物０５０－Ｅｎ２、化合物０５１－Ｅｎ１、化合物０５１－Ｅｎ２、化合物０５２－Ｅｎ１、化合物０５２－Ｅｎ２、化合物０５３－Ｅｎ１、化合物０５３－Ｅｎ２、化合物０５４－Ｅｎ１、化合物０５４－Ｅｎ２、化合物０５８－Ｅｎ１、化合物０５８－Ｅｎ２、化合物０５９－Ｅｎ１、化合物０５９－Ｅｎ２。

【０２４２】

２－（｛５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０４９）の合成。

【化４１】



ステップ１：乾燥ＴＨＦ（３０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２ｇ、９．０８ｍｍｏｌ）、３－メチル－２－ブテン－１－オール（１．１７４ｍｇ、１３．６３ｍｍｏｌ）の溶液に、ＡＤＤＰ（４．５８ｇ、１８．１７ｍｍｏｌ）及びＴＰＰ（３．６７ｍＬ、１８．１７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２４時間撹拌した。次いで、ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機抽出物を、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル２－メチル－５－（（３－メチルブタ－２－エン－１－イル）オキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレートを黄色の油（１．６ｇ、６１％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ　ｐｐｍ：７．４７（ｄ，１Ｈ），７．２９（ｄ，１Ｈ），６．６８（ｄｄ，１Ｈ），５．５３（ｑ，１Ｈ），４．５６（ｄ，２Ｈ），４．４０（ｑ，２Ｈ），３．８０（ｓ，３Ｈ），１．８０（ｄ，３Ｈ），１．７６（ｓ，３Ｈ），１．４３（ｔ，３Ｈ）。

【０２４３】

ステップ２：乾燥ＤＣＭ（２０ｍＬ）中のエチル２－メチル－５－（（３－メチルブタ－２－エン－１－イル）オキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（１．５ｇ、５．２０ｍｍｏｌ）の溶液に、ヘキサン（２０ｍＬ、２０．８２ｍｍｏｌ）中のジエチル亜鉛の１．０Ｍ溶液を０℃で添加した。次いで、ジヨードメタン（２．１ｍＬ、２６．０２ｍｍｏｌ）を２０分の期間にわたってゆっくりと添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、飽和塩化アンモニウム溶液（５０ｍＬ）でクエンチし、ＤＣＭ（３×４０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル５－（（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレートを黄色の油（１ｇ、６３．５８％）

として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ　ｐｐｍ：７．４７（ｄ，１Ｈ），７．２９（ｄ，１Ｈ），６．８９（ｄｄ，１Ｈ），４．４０（ｑ，２Ｈ），４．１２（ｑ，１Ｈ），３．８８（ｑ，１Ｈ），２．７４（ｓ，３Ｈ），１．４４（ｔ，３Ｈ），１．１１（ｓ，３Ｈ），１．０９（ｓ，３Ｈ），０．９２（ｑ，１Ｈ），０．６０（ｑ，１Ｈ），０．２６（ｔ，１Ｈ）。

【０２４４】

ステップ３：ＴＨＦ及びメタノール（４：１）（２５ｍＬ）中のエチル５－（（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（１ｇ、３．３１ｍｍｏｌ）の溶液に、水（５ｍＬ）中の水酸化リチウム一水和物（０．８３ｇ、１９．８５ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で添加した。ＲＭを室温で２４時間撹拌した。次いで、溶媒を減圧下で除去した。残渣を、水（２０ｍＬ）で希釈し、１０％クエン酸（ＰＨ約４）で酸性化し、ＤＣＭ（３×４０ｍＬ）中の１０％ＭｅＯＨで抽出した。組み合わせた有機層を、無水Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、５－（（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸をオフホワイト色の固体（５５０ｍｇ、６０％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ　ｐｐｍ：７．５０（ｄ，１Ｈ），７．３２（ｄ，１Ｈ），６．９０（ｄｄ，１Ｈ），４．１６（ｑ，１Ｈ），３．９０（ｑ，１Ｈ），２．７９（ｓ，３Ｈ），１．１５－１．０９（ｍ，７Ｈ），０．６０（ｓ，１Ｈ），０．２９（ｓ，１Ｈ）。

【０２４５】

ステップ４：ＤＭＦ（１５ｍＬ）中の５－（（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（５５０ｍｇ、２．０ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（９９１ｍｇ、２．６０ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．７４ｍＬ、１０．０３ｍｍｏｌ）、及び２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（５５８ｍｇ、２．４０ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２０時間撹拌した。次いで、ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和ＮａＨＣＯ$_{3}$（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、Ｎ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（（２，２ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミドを黄色の粘性物質（７００ｍｇ、７１％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ　ｐｐｍ：７．３３（ｄ，１Ｈ），７．３１（ｄ，１Ｈ），７．０２（ｂｓ，１Ｈ），６．８８（ｄｄ，１Ｈ），５．２９（ｓ，１Ｈ），４．４５（ｄ，１Ｈ），４．１３（ｑ，１Ｈ），３．７９（ｄ，１Ｈ），２．７２（ｑ，３Ｈ），２．０４（ｔ，２Ｈ），１．７６（ｓ，３Ｈ），１．１２（ｔ，１Ｈ），１．１１（ｓ，３Ｈ），１．０９（ｓ，３Ｈ），０．９２（２，９Ｈ），０．５８（ｑ，１Ｈ），０．２６（ｔ，１Ｈ），０．１６（ｄ，６Ｈ）。

【０２４６】

ステップ５：ＴＨＦ（３０．０ｍＬ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド（６５０ｍｇ、１．３３ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＢＡＦ（ＴＨＦ中で１Ｍ）（３．３２ｍＬ、３．３２ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを３時間撹拌した。次いで、ＲＭを、水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、飽和塩化アンモニウム溶液（１００ｍＬ）、ＮａＨＣＯ$_{3}$飽和溶液（１００ｍＬ）、ブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。化合物を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相：水中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＹＭＣ　ＴＲＩＡＲＴ　Ｃ１８（１

５０×２５ｍｍ）、１０μｍ、流量：２０ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／２５、２／２５、１０／５５、１６／５５、１６．１０／９８、１９／９８、１９．１０／２５、２２／２５、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、２－（｛５－［（２，２－ジメチルシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０４９）（３５０ｍｇ、７２％）を得た。

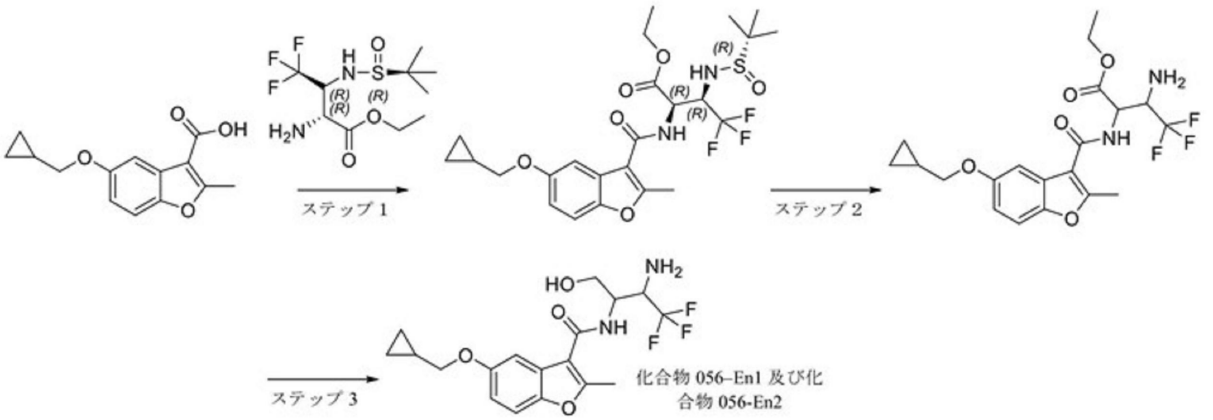
【０２４７】

分取キラルＳＦＣを、化合物０４９のラセミ混合物上で行い、化合物０４８－Ｅｎ１、化合物０４８－Ｅｎ２、化合物０４８－Ｅｎ３、及び化合物０４８－Ｅｎ４を得た。

【０２４８】

Ｎ－［（２）－３－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル］－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０５６－Ｅｎ１）及び（化合物０５６－Ｅｎ２）の合成。

【化４２】



ステップ１：０℃で、ＤＭＦ（７．０ｍＬ）中の５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（６５０ｍｇ、２．６３９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＰｙＢＯＰ（２．０６０ｇ、３．９５９ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．３８ｍＬ、７．９１８ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを１５分間撹拌し、次いで、エチル（２Ｒ，３Ｒ）－２－アミノ－３－（（（Ｒ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（１．２０５ｇ、３．９５９ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。。次いで、ＲＭを、氷冷水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和ＮａＨＣＯ$_3$溶液（１５ｍＬ）、ブライン（１５ｍＬ）で洗浄し、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２５％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル（２Ｒ，３Ｒ）－３－（（（Ｒ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエートを淡褐色の粘性物質（８６０ｍｇ、６１％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_6$）δ　ｐｐｍ：７．３４（ｄ，１Ｈ），６．９４（ｄｄ，１Ｈ），６．８０（ｄ，１Ｈ），５．３４（ｄ，１Ｈ），４．３３－４．２９（ｍ，１Ｈ），４．１５－４．１１（ｍ，２Ｈ），３．８５（ｄ，２Ｈ），２．７１（ｄ，３Ｈ），２．０４（ｓ，１Ｈ），１．３７－１．３１（ｍ，１Ｈ），１．２９－１．２４（ｓ，１２Ｈ），１．９２（ｔ，１Ｈ），０．６５－０．６３（ｍ，２Ｈ），０．３６－０．３４（ｍ，２Ｈ）。

【０２４９】

ステップ２：１，４－ジオキサン（７．０ｍＬ）中のエチル（２Ｒ，３Ｒ）－３－（（（Ｒ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（７６０ｍｇ，０．１４２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ジオキサン（１．４ｍＬ）

中の４ＭのＨＣｌを０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。完了後に、ＲＭを濃縮した。残渣を、氷冷水（５ｍＬ）で希釈し、水性$NaHCO_3$溶液（ｐＨ約８）で塩基化し、ＤＣＭ（２×３０ｍＬ）中の１０％ＭｅＯＨで抽出し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で蒸発させて、エチル－３－アミノ－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエートを淡褐色の粘性物質（４７０ｍｇ、７６．９２％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．３３（ｄ，１Ｈ），７．２８（ｄ，１Ｈ），６．９１－６．８９（ｄｄ，１Ｈ），６．７３（ｄ，１Ｈ），５．２４－５．２１（ｄｄ，１Ｈ），４．３４－４．２５（ｍ，２Ｈ），３．９８－３．９２（ｍ，１Ｈ），３．８５（ｄ，２Ｈ），２．７１（ｓ，３Ｈ），１．３２－１．２１（ｍ，４Ｈ），０．６７－０．６２（ｍ，２Ｈ），０．３８－０．３４（ｍ，２Ｈ）。

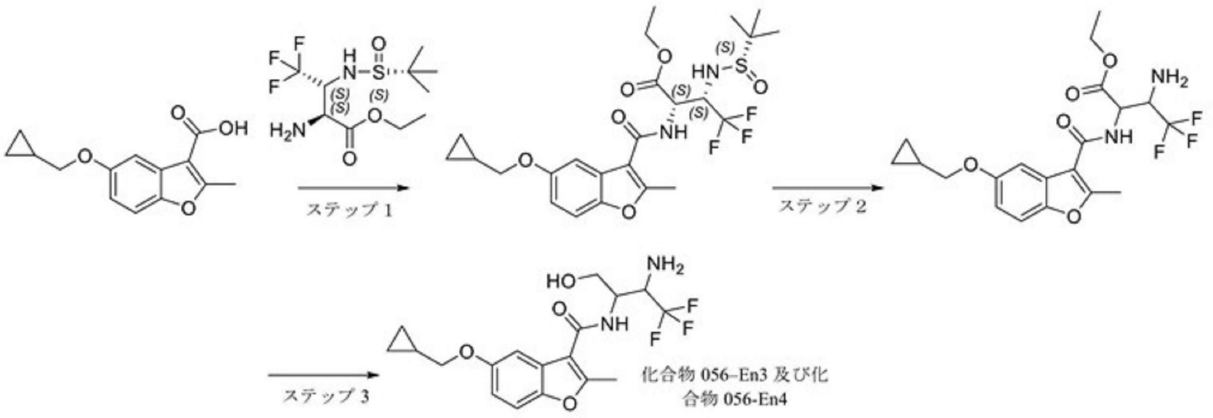
【０２５０】

ステップ３：ＭｅＯＨ（６．０ｍＬ）中のエチル－３－アミノ－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（４７０ｍｇ、１．０９７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$NaBH_4$（１２１．８７５ｍｇ、３．２９１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。次いで、ＲＭを濃縮した。残渣を氷冷水（１０ｍＬ）で希釈し、沈殿した固体を、濾過し、乾燥させた。残渣を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相：水中の０．１％ＦＡ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＰＲＩＮＣＥＴＯＮ　ＳＰＨＥＲＥ　Ｃ１８（２５０×２１．２）ｍｍ、５μｍ、流量：１７ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／３０、２／３０、１０／５０、１６／５０、１６．１／１００、１９／１００、１９．１／３０、２２／３０、溶解度：ＡＣＮ＋水、温度：室温。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、オフホワイト色の固体としての（化合物０５６－Ｅｎ１）（４５ｍｇ、６４％）及びオフホワイト色の固体としての（化合物０５６－Ｅｎ２）（８．１ｍｇ、１５％）を得た。

【０２５１】

Ｎ－［（２）－３－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル］－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－カルボキサミド（化合物０５６－Ｅｎ３）及び（化合物０５６－Ｅｎ４）の合成。

【化４３】



ステップ１：ＤＭＦ（７．０ｍＬ）中の５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（６５０ｍｇ、２．６３９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＰｙＢＯＰ（２．０６０ｇ、３．９５９ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．３８３ｍＬ、７．９１８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１５分間撹拌した。次いで、エチル（２Ｓ，３Ｓ）－２－アミノ－３－（（（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（１．２０ｇ、３．９５９ｍｍｏｌ）をＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、氷冷水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和$NaHCO_3$溶液（１５

ｍＬ）、ブライン（１５ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１８％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル（２Ｓ，３Ｓ）－３－（（（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエートを淡黄色の固体（８５０ｍｇ、収率：６０％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．４８（ｄ，１Ｈ），７．２０（ｄ，１Ｈ），６．９３－６．９０（ｄｄ，１Ｈ），６．０７（ｄ，１Ｈ），５．３１－５．２７（ｍ，１Ｈ），４．６９－４．６３（ｍ，１Ｈ），４．２１－４．０２（ｍ，２Ｈ），３．８２（ｄ，２Ｈ），２．５８（ｓ，３Ｈ），１．２７－１．２１（ｍ，３Ｈ），１．１９（ｓ，９Ｈ），０．５９－０．５６（ｍ，２Ｈ），０．３３（ｓ，２Ｈ）。

【０２５２】

ステップ２：１，４－ジオキサン（８．０ｍＬ）中のエチル（２Ｓ，３Ｓ）－３－（（（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル）アミノ）－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（７３０ｍｇ、１．３７１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１，４－ジオキサン（１．３７ｍＬ、５．４８３ｍｍｏｌ）中の４ＭのＨＣｌを０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。次いで、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、氷冷水（１０ｍＬ）で希釈し、飽和$NaHCO_3$溶液（ｐＨ約８）で塩基化し、ＤＣＭ（２×１０ｍＬ）中の１０％ＭｅＯＨで抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で蒸発させて、エチル－３－アミノ－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエートを淡褐色の粘性物質（４５０ｍｇ、７６％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．３５（ｄ，１Ｈ），７．３０－７．２８（ｍ，１Ｈ），６．９４－６．９１（ｄｄ，１Ｈ），６．７４（ｄ，１Ｈ），５．２６－５．２３（ｄｄ，１Ｈ），４．３６－４．３１（ｍ，２Ｈ），３．９８－３．９６（ｍ，１Ｈ），３．８７（ｄ，２Ｈ），３．７２（ｓ，１Ｈ），２．７３（ｄ，３Ｈ），１．３７－１．３１（ｔ，３Ｈ），０．６８－０．６４（ｍ，２Ｈ），０．４０－０．３７（ｍ，２Ｈ）。

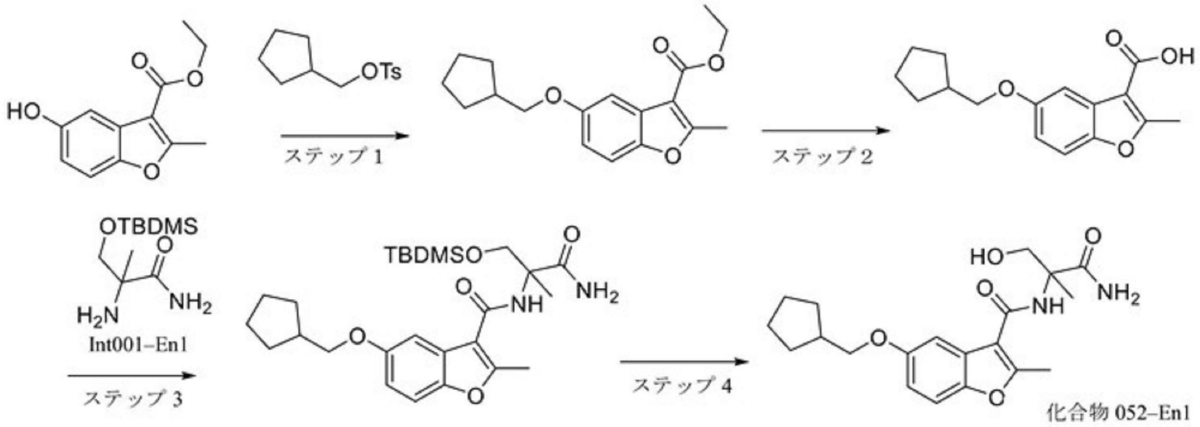
【０２５３】

ステップ３：ＭｅＯＨ（５．０ｍＬ）中のエチル－３－アミノ－２－（５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド）－４，４，４－トリフルオロブタノエート（４５０ｍｇ、１．０５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$NaBH_4$（１１６．９ｍｇ、３．２９１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。次いで、ＲＭを濃縮した。残渣を氷冷水（１０．０ｍＬ）で希釈し、沈殿した固体を、濾過し、乾燥させた。残渣を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相：水中の０．１％ＦＡ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＰＲＩＮＣＥＴＯＮ　ＳＰＨＥＲＥＣ１８（２５０×２１．２）ｍｍ、５μｍ、流量：１７ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／３０、２／３０、１０／５０、１３／５０、１３．１／９８、１８／９８、１８．１／３０、２２／３０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＤＭＳＯ＋ＴＨＦ、温度：室温。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、オフホワイト色の固体としての（化合物０５６－Ｅｎ３）（６０ｍｇ、５９％）及びオフホワイト色の固体としての（化合物０５６－Ｅｎ４）（４．５ｍｇ、７％）を得た。

【０２５４】

２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０６２－Ｅｎ１）の合成。

【化４４】



ステップ１：ＡＣＮ（６０ｍＬ）中のエチル５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（３ｇ、１３．６２２ｍｍｏｌ）の溶液に、Cs_2CO_3（１３．３１５ｇ、４０．８６７ｍｍｏｌ）及びシクロペンチルメチル４－メチルベンゼンスルホネート（５．１９７ｇ、２０．４３４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、ＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）で希釈し、飽和$NaHCO_3$溶液（５０ｍＬ）、ブライン溶液（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、エチル５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（３．５ｇ、８５％）を得た。

【０２５５】

ステップ２：ＭｅＯＨ／ＴＨＦ／H_2O（１：１：１）（６０ｍＬ）中のエチル５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（３．５ｇ、１１．５７５ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＯＨ（４．６３０ｇ、１１５．７５２ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、揮発物を減圧下で除去した。残渣を１ＮのＨＣｌ（ｐＨ約４）の水溶液で酸性化した。固体を、濾過し、水（５０ｍＬ）で洗浄し、乾燥させて、５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸をオフホワイト色の固体（２．２ｇ、６９％）として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ ｐｐｍ：７．４９（ｄ，１Ｈ），７．３３（ｄ，１Ｈ），６．９１－６．８８（ｍ，１Ｈ），３．９１（ｄ，２Ｈ），２．７９（ｓ，３Ｈ），２．４１－２．３７（ｍ，１Ｈ），１．８９－１．６６（ｄ，２Ｈ），１．６６－１．５８（ｍ，４Ｈ），１．４５－１．３８（ｍ，３Ｈ）。

【０２５６】

ステップ３：ＤＭＦ（５ｍＬ）中の５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸（３００ｍｇ、１．０９４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（６２３．３６９ｍｇ、１．６４０ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（０．５３６ｍＬ、３．２８１ｍｍｏｌ）、及び２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ００１－Ｅｎ１）（２７９．５７４ｍｇ、１．２０３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、氷冷水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、飽和$NaHCO_3$溶液（２０ｍＬ）、ブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて、Ｎ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミドを淡黄色の粘性物質（４７０ｍｇ、８８％）として得た。

【０２５７】

ステップ４：ＴＨＦ（１０ｍＬ）中のフッ化水素ピリジン（１．６８１ｍＬ、９．６１

７ｍｍｏｌ）の溶液に、ピリジン（２．１８１ｍＬ、９．６１７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１０分間撹拌した。１０分後に、ＴＨＦ（５．０ｍＬ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド（４７０ｍｇ、０．９６２ｍｍｏｌ）の溶液をＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、冷水（１０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（１０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和$NaHCO_3$溶液（１０ｍＬ）、ブライン（５ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。化合物を分取ＨＰＬＣによって精製した。［分取ＨＰＬＣ条件：移動相：水中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：Ｘ－Ｓｅｌｅｃｔ　ＣＳＨ　Ｃ１８（２５０×１９）ｍｍ、５μｍ、流量：１７ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／５０、２／５０、９／８０、９．０２／１００、１８／１００、１８．０２／５０、２１／５０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温。］所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物０６２－Ｅｎ１）をオフホワイト色の固体（２４５ｍｇ、６７％）として得た。

【０２５８】

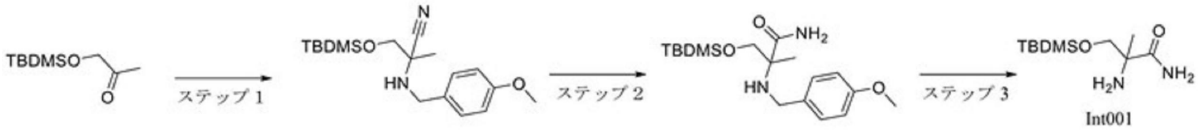
以下の化合物を、化合物０６２－Ｅｎ１について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０６２－Ｅｎ２。

【０２５９】

化合物の合成に使用される小さな合成中間体の合成

２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ００１）の合成。

【化４５】



ステップ１：ＥｔＯＨ（１００ｍＬ）中の１－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）プロパン－２－オン（２０ｇ、１０６．１９ｍｍｏｌ）の溶液に、（４－メトキシフェニル）メタンアミン（１５．２６１ｍＬ、１１６．８１ｍｍｏｌ）、ＴＭＳＣＮ（１５．９４ｍＬ、１２７．４２ｍｍｏｌ）、及びNH_4Cl（１．７０４ｇ、３１．８５７ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。次いで、揮発物を減圧下で蒸発させた。残渣を、ＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）で希釈し、飽和$NaHCO_3$（１００ｍｌ）、ブライン溶液（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（（４－メトキシベンジル）アミノ）－２－メチルプロパンニトリルを淡黄色の液体（２０ｇ、５６．３０％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．２５（ｄ，２Ｈ），６．８８（ｄ，２Ｈ），３．７２（ｓ，５Ｈ），３．６５－３．７５（ｍ，１Ｈ），３．４５－３．５１（ｍ，１Ｈ），２．７４－２．７７（ｍ，１Ｈ），１．３６（ｓ，３Ｈ），０．８７（ｓ，９Ｈ），０．７７（ｍ，６Ｈ）。

【０２６０】

ステップ２：ＤＭＳＯ（７０ｍＬ）中の３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（（４－メトキシベンジル）アミノ）－２－メチルプロパンニトリル（１０ｇ、２９．９４０ｍｍｏｌ）の溶液に、K_2CO_3（２８．９６６ｇ、２０９．５８１ｍｍｏｌ）及びH_2O_2（１４．０４１ｍＬ、５９８．８０２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した

。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、室温に冷却し、氷冷水（１００ｍＬ）でクエンチした。水層をジエチルエーテル（３×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の４０～５０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（（４－メトキシベンジル）アミノ）－２－メチルプロパンアミドを淡黄色の液体（３．８ｇ、３６％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．２５（ｄ，２Ｈ），７．２４（ｂｒｓ，１Ｈ），７．０７（ｂｒｓ，１Ｈ），６．８６（ｄ，２Ｈ），３．７２（ｓ，３Ｈ），３．６８－３．７１（ｍ，１Ｈ），３．５６－３．５９（ｍ，１Ｈ），３．５１（ｄ，２Ｈ），２．０５（ｂｒｓ，１Ｈ），１．１５（ｓ，３Ｈ），０．８５（ｓ，９Ｈ），０．０３（ｓ，６Ｈ）。

【０２６１】

ステップ３：ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）中の３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－（（４－メトキシベンジル）アミノ）－２－メチルプロパンアミド（１０ｇ、２８．３６５ｍｍｏｌ）の溶液に、１０％水酸化パラジウム（５．１７８ｇ、３６．８７４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを、H_2圧力（７０ｐｓｉ）下、室温で４８時間撹拌した。次いで、ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＤＣＭ（２００ｍＬ）中の１０％ＭｅＯＨで洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、Ｐｅｔエーテル中の８０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ００１）をオフホワイト色の固体（５．５ｇ）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．２５（ｓ，１Ｈ），６．９５（ｓ，１Ｈ），３．７６（ｄ，１Ｈ），３．２５（ｄ，１Ｈ），１．７７（ｓ，２Ｈ），１．０４（ｓ，３Ｈ），０．８５（ｓ，９Ｈ），０．０２（ｓ，６Ｈ）。

【０２６２】

分取キラルＳＦＣを、Ｉｎｔ００１のラセミ混合物上で行い、Ｉｎｔ００１－Ｅｎ１及びＩｎｔ００１－Ｅｎ２を得た。

【表２－１】

分析データ

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 001	333.3	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 7.58 (d, 1 H), 7.47-7.44 (m, 2 H), 7.28 (d, 1 H), 7.25 (d, 1 H), 6.90-6.88 (m, 1 H), 5.00 (t, 1 H), 4.47-4.45 (m, 1 H), 3.84-3.75 (d, 2 H), 3.75 - 3.72 (m, 2 H), 2.63 (s, 3 H), 1.28-1.24 (m, 2 H), 0.58-0.56 (m, 2 H), 0.33 - 0.32 (m, 2 H).
化合物 002-En1	369.1	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.63 (d, 1H), 7.49 - 7.46 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 6.94 (m, 1H), 5.02 (s, 1H), 4.49 - 4.44 (m, 1H), 4.21 - 4.15 (m, 1H), 4.01 - 3.97 (m, 1H), 3.74 (s, 2H), 2.63 (s, 3H), 2.28 - 2.22 (m, 1H), 1.75 - 1.70 (m,1H), 1.51 - 1.46 (m, 1H).
化合物 002-En2	369.1	(400 MHz, DMSO-d_6): δ 7.64 (d, 1H), 7.50 - 7.45 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 6.94 (dd, 1H), 5.03 (s, 1H), 4.50 - 4.43 (m, 1H), 4.21 - 4.14 (m, 1H), 4.02 - 3.96 (m, 1H), 3.76 - 3.72 (m, 2H), 2.63 (s, 3H), 2.30 - 2.20 (m, 1H), 1.76 -1.70 (m, 1H), 1.52 - 1.45 (m, 1H).
化合物 003	383.1	(400 MHz, DMSO-d_6): δ 7.62 (d, 1H), 7.50 - 7.43 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 5.00 (t, 1H), 4.50 - 4.42 (m, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.79 - 3.70 (m, 2H), 2.63 (s, 3H), 0.91 - 0.78 (m, 4H).
化合物 004	359.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.56 (d, 1H), 7.50 (bs, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.29(d, 1H), 7.20 (bs, 1H), 6.88 -6.83 (dd, 1H), 5.03 (s, 1H), 4.50 - 4.46 (m, 1H), 3.86 - 3.77 (d, 2H), 3.75 - 3.74 (m, 2H), 2.75 - 2.53 (m, 1H), 1.25 - 1.21 (m, 1H),1.15 - 1.05 (m, 4H), 0.61 - 0.51 (m, 2H), 0.35 - 0.30 (m, 2H).
化合物 005	347.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.60 (d, 1H), 7.48 - 7.43 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 6.90 (dd, 1H), 5.00 (t, 1H), 4.49 - 4.44 (m, 1H), 4.05 (t, 2H), 3.76 - 3.72 (m, 2H), 2.63 (s, 3H), 1.67 - 1.61 (m, 2H), 0.89 - 0.82 (m, 1H), 0.47 - 0.41 (m, 2H), 0.25-0.22 (m, 2H).
化合物 006	347.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.60 (d, 1H), 7.50 - 7.43 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.89 (dd, 1H), 5.01 (t, 1H), 4.49 - 4.45 (m, 1H), 3.97 - 3.92 (m, 2H), 3.80 - 3.45 (m, 2H), 2.78 - 2.70 (m, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.12 - 2.05 (m, 2H), 1.95 - 1.80 (m, 4H).
化合物 007	330.2	(600 MHz, DMSO-d_6) d 7.820 (d, 1H), 7.456 (s, 1H), 7.425 (d, 1H), 7.244 (d, 1H), 7.065 (s, 1H), 6.878 (dd, 1H), 4.471 (p, 1H), 4.013 - 3.927 (m, 2H), 2.776 - 2.675 (m, 1H), 2.611 (s, 3H), 2.130 - 2.033 (m, 2H), 1.977 - 1.787 (m, 4H), 1.359 (d, 3H).
化合物 008	369.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 8.28 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.53 -7.31 (m, 3H), 7.23 (bs, 1H), 7.17 - 7.14 (dd, 1H), 5.03 (t, 1H), 4.51 -4.47 (m, 1H),3.88 (d, 2H), 3.80 - 3.71 (m, 2H),1.30 - 1.21 (m, 1H), 0.50 (d, 2H),0.35 (d, 2H).
化合物 009	333.3	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm: 7.59 (d, 1 H), 7.48-7.44 (m, 2 H), 7.28 (d, 1 H), 7.05 (s, 1 H), 6.91-6.88 (dd, 1 H), 5.07 (s, 1 H), 4.47-4.45 (m, 1 H), 3.84-3.75 (d, 2 H), 3.74 - 3.73 (m, 2 H), 2.65 (s, 3 H), 1.26-1.23 (m, 2 H), 0.58-0.55 (m, 2 H), 0.34 - 0.31 (m, 2 H).
化合物 010	316.2	(600 MHz, DMSO-d_6) δ ppm 7.806 (d, 1H), 7.455 (s, 1H), 7.426 (d, 1H), 7.229 (d, 1H), 7.064 (s, 1H), 6.880 (dd, 1H), 4.467 (p, 1H), 3.837 (d, 2H), 2.608 (s, 3H), 1.356 (d, 3H), 1.236 (tt, 1H), 0.648 - 0.484 (m, 2H), 0.328 (dt, 2H).

【表２－２】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 011	397.2	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm 7.51-7.43 (m, 2H), 7.40 - 7.32 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 6.92 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 5.05 (d, 1H), 4.36 (dd, 1H), 4.20 - 4.10 (m, 1H), 4.05 (s, 2H), 2.64 (s, 3H), 1.13 (d, 3H), 0.91 - 0.79 (m, 4H).
化合物 012	*361.2*	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.49 - 7.43 (m, 2H), 7.37 - 7.32 (m, 2H), 7.16 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 5.06 (d, 1H), 4.37 - 4.35 (m, 1H), 4.16 - 4.11 (m, 1H), 4.05 (t, 2H), 2.64 (s, 3H), 1.67 - 1.61 (m, 2H), 1.16 - 1.12 (m, 3H), 0.90 - 0.83 (m, 1H), 0.46 - 0.41 (m, 2H), 0.15 - 0.11 (m, 2H),
化合物 013	397.2	(400 MHz, DMSO-d_6): δ 7.63 (d, 1H), 7.48 - 7.44 (d, 2H), 7.31 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 5.00 (t, 1H), 4.48 - 4.45 (d, 1H), 4.18 - 4.10 (m, 1H), 4.05 - 3.97 (m, 1H), 3.78 - 3.71 (s, 2H), 2.71 - 2.60 (m, 4H), 2.19 - 2.01 (m, 3H),1.81 - 1.60 (m, 3H).
化合物 014-En1	397.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.61 (s, 1H), 7.49 - 7.42 (m, 2H), 7.35 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 5.10 (t, 1H), 4.06 (s, 2H), 4.00 - 3.92 (m, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 1H), 2.65 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 0.90 - 0.88 (m, 2H), 0.85 - 0.80 (m, 2H).
化合物 014-En2	397.2	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.61 (s, 1H), 7.49 - 7.42 (m, 2H), 7.35 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 5.10 (t, 1H), 4.06 (s, 2H), 3.99 - 3.92 (m, 1H), 3.80-3.72 (m, 1H), 2.65 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 0.90 - 0.88 (m, 2H), 0.85 - 0.80 (m, 2H)
化合物 015	344.2	(600 MHz DMSO-d_6): δ 7.790 (s, 1H), 7.436 (d, 1H), 7.341 (s, 1H), 7.284 (d, 1H), 7.128 (s, 1H), 6.888 (dd, 1H), 3.978 (d, 2H), 2.735 (h, 1H), 2.631 (s, 3H), 2.130 - 2.034 (m, 2H), 1.978 - 1.792 (m, 4H), 1.563 (s, 6H).
化合物 016	330.2	(600 MHz, DMSO-d_6): δ 7.782 (s, 1H), 7.439 (d, 1H), 7.343 (s, 1H), 7.278 (d, 1H), 7.138 (s, 1H), 6.892 (dd, 1H), 3.851 (d, 2H), 2.631 (s, 3H), 1.564 (s, 6H), 1.302 - 1.189 (m, 1H), 0.617 - 0.536 (m, 2H), 0.363 - 0.309 (m, 2H).
化合物 017-En1	347.1	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.61 (s, 1H), 7.47 - 7.43 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.90 (dd, 1H), 5.12 (bs, 1H), 3.97 - 3.74 (m, 4H), 2.64 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.27 - 1.22 (m, 1H), 0.58 - 0.56 (m, 2H), 0.34 - 0.32 (m, 2H).
化合物 017-En2	347.1	(500 MHz, DMSO-d_6): δ 7.61 (s, 1H), 7.47 - 7.43 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.28 (bs, 1H), 6.90 (m, 1H), 5.15 - 5.10 (m, 1H), 3.97 - 3.91 (m, 1H), 3.85 - 3.83 (m, 2H), 3.77 - 3.73 (m, 1H), 2.64 (s, 3H), 1.53 (s, 3H), 1.28 - 1.21 (m, 1H), 0.60 - 0.55 (m, 2H), 0.35 - 0.31 (m, 2H).
化合物 018	347.2	(600 MHz, DMSO-d_6): δ) d 7.424 (d, 1H), 7.195 (d, 1H), 7.001 (s, 1H), 6.872 (dd, 1H), 4.948 (dd, 2H), 3.956 (d, 2H), 3.644 (dd, 2H), 3.548 (dd, 2H), 2.727 (h, 1H), 2.590 (s, 3H), 2.131 - 2.036 (m, 2H), 1.975 - 1.794 (m, 4H), 1.318 (s, 3H).
化合物 019-En1	379.2	(400MHz, DMSO-d_6): δ :8.19 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 4.4 - 4.6 (m, 1H), 3.95 (d, 2H), 2.90 (t, 1H), 2.44 - 2.73 (m, 7H), 2.11 (bs, 1H), 2.06 - 2.10 (m, 2H), 1.72 - 1.83 (m, 6H).
化合物 019-En2	379.2	(400MHz, DMSO-d_6): δ = 8.19 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 4.4 - 4.6 (m, 1H), 3.95 (d, 2H), 2.90 (t, 1H), 2.56 - 2.73 (m, 7H), 2.49 (bs, 1H), 2.06 - 2.10 (m, 2H),1.70 - 1.84 (m, 6H).

【表２－３】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 020	385.0	(DMSO d6, 300 MHz) d ppm 7.32 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 6.86 (dd, 1H); 5.75 (br d; 1H);5.12 (s, 2H); 4.15-4.00 (m, 1H); 3.78 (d, 2H); 2.95 (br d, 2H); 2.68 (s, 3H); 2.41 (s, 3H); 2.40-2.27 (m, 2H); 1.95-1.65 (m, 8H); 1.40-1.15 (m, 4H); 1.15-1.00 (m, 2H).
化合物 021	342.2	
化合物 022	329.2	
化合物 023	333.2	(600 MHz, DMSO-d_6) d 7.428 (d, 1H), 7.175 (d, 1H), 6.986 (s, 1H), 6.878 (dd, 1H), 4.942 (td, 2H), 3.823 (d, 2H), 3.640 (dd, 2H), 3.541 (dd, 1H), 2.589 (s, 3H), 1.315 (s, 3H), 0.604 - 0.540 (m, 2H), 0.373 - 0.266 (m, 2H).
化合物 025	329.2	
化合物 026	315.1	
化合物 027-En1	373.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.57 (d, 1H), 7.43-7.46 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 5.22 (t, 1H), 3.81 - 3.84 (m, 2H), 3.71 - 3.75 (m, 1H), 3.60 - 3.63 (m, 1H), 3.26 - 3.28 (m, 1H), 3.10 - 3.14 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.17 - 2.22 (m, 2H), 1.72 - 1.82 (m, 2H), 1.20 - 1.26 (m, 1H), 0.55 - 0.59 (m, 2H), 0.32 - 0.35 (m, 2H);
化合物 027-En2	373.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.58 (d, 1H), 7.43 - 7.47 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 6.89 (m, 1H), 5.23 (s, 1H), 3.81 - 3.83 (m, 2H), 3.72 - 3.74 (m, 1H), 3.61 - 3.63 (m, 1H), 3.24 - 3.29 (m, 1H), 3.10 - 3.13 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.17 - 2.22(m, 2H), 1.74 - 1.80 (m, 2H), 1.22 -1.26 (m, 1H), 0.56 - 0.58 (m, 2H), 0.33 - 0.34 (m, 2H)
化合物 028-En1	359.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.78 (s, 1H), 7.46 -7.42 (m, 2H), 7.12 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 5.22 (bs,1H), 3.85 - 3.81 (m, 2H), 3.64 - 3.54 (m, 2H), 3.35 - 3.30 (m, 1H), 3.24 - 3.18 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.49 - 2.36 (m, 2H), 1.27 - 1.21 (m, 1H), 0.59 - 0.55 (m, 2H), 0.35 - 0.32 (m, 2H).
化合物 028-En2	359.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.78 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 5.27 (bs, 1H), 3.83 - 3.81 (m, 2H), 3.64 - 3.55 (m, 2H), 3.34 - 3.28 (m, 1H), 3.25 - 3.18 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.49 - 2.35 (m, 2H), 1.28 - 1.20 (m, 1H), 0.60 - 0.55 (m, 2H), 0.35 - 0.32 (m, 2H).
化合物 029	331.1	
化合物 031-En1	401.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 4.42 - 4.51 (m, 1H), 4.13 - 4.17 (m, 1H), 3.95 - 3.99 (m, 1H), 3.10 - 3.15 (m, 1H), 2.80 - 2.93 (m, 2H), 2.56 - 2.64 (m, 4H), 2.43 - 2.49 (m, 1H), 2.20 - 2.28 (m, 1H), 1.68 -1.80 (m, 3H), 1.46 -1.50 (m, 1H).
化合物 031-En2	401.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 4.43 - 4.51 (m, 1H), 4.15 - 4.18 (m, 1H), 3.94 - 3.99 (m, 1H), 3.10 - 3.15 (m, 1H), 2.79 - 2.93 (m, 2H), 2.53 - 2.63 (m, 4H), 2.44 - 2.49 (m, 1H), 2.20 - 2.29 (m, 1H), 1.69 -1.78 (m, 3H),1.46 -1.51 (m, 1H).
化合物 031-En3	401.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 6.92 (dd, 1H), 4.43 - 4.50 (m, 1H), 4.15 - 4.18 (m, 1H), 3.94 - 3.99 (m, 1H), 3.10 - 3.16 (m, 1H), 2.70 - 2.96 (m, 2H), 2.52 - 2.64 (m, 4H), 2.43 - 2.49 (m, 1H), 2.21 - 2.30 (m, 1H),1.68 -1.81 (m, 3H), 1.45 -1.53 (m, 1H)

【表２－４】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 031-En4	401.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 4.43 - 4.51 (m, 1H), 4.13 - 4.16 (m, 1H), 3.95 - 3.99 (m, 1H), 3.10 - 3.15 (m, 1H), 2.80 - 2.95 (m, 2H), 2.53 - 2.64 (m, 4H), 2.42-2.48 (s, 1H), 2.20 - 2.29 (m, 1H), 1.69 -1.81 (m, 3H),1.45 -1.52 (m, 1H).
化合物 032-En1	*379.2*	(400 MHz, DMSO-d6): δ 8.17 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.09 (d,1H), 6.87 - 6.89 (m, 1H), 4.44 - 4.49 (m,1H), 3.72 - 3.77 (m, 2H), 3.26 - 3.30 (m, 1H), 2.66 - 2.93 (m, 2H), 2.50 - 2.56 (m, 4H), 2.49 (s, 1H), 1.69 - 1.79 (m, 2H), 1.175 (s, 3H), 0.50 - 0.52 (m, 2H), 0.38 - 0.39 (m, 2H).
化合物 032-En2	*379.2*	(400 MHz, DMSO-d6): δ 8.17 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.09 (d,1H), 6.87 - 6.89 (m, 1H),4.44 - 4.49 (m,1H), 3.72 - 3.72 (m, 2H), 3.26- 3.3.30 (m, 1H), 2.93 - 2.66 (m, 2H), 2.50 - 2.56 (m, 3H), 2.49 (s, 1H), 1.69 - 1.79 (m, 2H) 1.75 (s, 3H), 0.50 - 0.52 (m, 2H), 0.38 - 0.39 (m, 2H).
化合物 033-En1	393.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.19 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.88 - 6.90 (m, 1H), 4.44 (bs, 1H), 4.06 - 4.09 (m, 1H), 3.83 - 3.87 (m, 1H), 3.09 - 3.11 (m, 1H), 2.80 - 2.93 (m, 2H), 2.50 - 2.59 (s, 4H), 2.47 - 2.50 (m, 1H), 1.70 - 1.77 (m, 2H), 1.03 - 1.09 (m, 7H), 0.53 - 0.55 (m, 1H), 0.26 - 0.28 (m, 1H)
化合物 033-En2	393.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.19 (d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.46(s, 1H), 4.06 - 4.11 (m, 1H), 3.82 - 3.87 (m, 1H), 3.09 - 3.11 (m, 1H), 2.68 - 2.93. (m, 2H), 2.50 - 2.58 (m, 4H), 2.42 - 2.48 (m, 1H), 1.69 - 1.79 (m, 2H), 1.03 - 1.09 (m, 7H), 0.52 - 0.55 (m, 1H), 0.26 - 0.28 (m, 1H)
化合物 033-En3	393.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.19 (d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.46 (s, 1H), 4.06 - 4.06 (m, 1H), 3.83 - 3.87 (m, 1H), 3.09 - 3.12 (m, 1H), 2.78 - 2.93. (m, 2H), 2.50 - 2.56 (m, 4H), 2.49 (s, 1H), 1.68 - 1.79 (m, 2H), 1.02 - 1.09 (m, 7H), 0.53 - 0.55 (m, 1H), 0.26 - 0.28 (m, 1H)
化合物 033-En4	393.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.19 (d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.46 (s, 1H), 4.06 - 4.11 (m, 1H), 3.82 - 3.87 (m, 1H), 3.09 - 3.15 (m, 1H), 2.78 - 2.93 (m, 2H), 2.50 - 2.62 (m, 4H), 2.45 - 2.49 (m, 1H), 1.69 - 1.77 (m, 2H), 1.02 - 1.09 (m, 7H), 0.53 - 0.55 (m, 1H), 0.26 - 0.28 (m, 1H)
化合物 034	344.1	
化合物 035-En1	359.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.23 (s, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.19 (d,1H), 7.12 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.17 (d, 1H), 3.93 (d, 1H), 3.86 - 3.82 (m, 4H), 2.60 (s, 3H), 2.38 - 2.31 (m, 2H), 1.26 - 1.21 (m, 1H), 0.60 - 0.54 (m,2H), 0.35 -0.32 (m, 2H).
化合物 035-En2	359.2	(400 MHz, DMSO-d6): δ 8.24 (s, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.89 (dd, 1H), 4.18 - 4.16 (m, 1H), 3.94 - 3.92 (m, 2H), 3.87 - 3.82 (m, 4H), 2.60 (s, 3H), 2.37 - 2.32 (m, 2H), 1.25 - 1.22 (m, 1H), 0.59 - 0.55 (m, 2H), 0.35 -0.32 (m, 2H).
化合物 036-En1	409.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.23 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.09 (bd, 2H), 6.90 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 4.18 (d, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.93 (d, 1H), 3.85 (t, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.40 - 2.30 (m, 2H), 0.90 - 0.78 (m, 4h).

【表２－５】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 036-En2	409.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.23 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.09 (bd, 2H), 6.91 (dd, 1H), 6.05 (t, 1H), 4.18 (d,1H), 4.05 (s, 2H), 3.93 (d, 1H), 3.85 (t, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.40 - 2.30 (m, 2H), 0.90 - 0.78 (m, 4h).
化合物 037	372.2	
化合物 038	343.1	(400 MHz, DMSO-d6): δ 7.64 (d, 1H), 7.53 - 7.45 (m, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.99 (dd, 1H), 6.41(tt, 1H), 5.00 (t, 1H), 4.52 - 4.45 (m, 1H), 4.38 - 4.28 (m, 2H), 3.74 (t, 2H), 2.64 (s, 3H).
化合物 039	349.2	(400 MHz, DMSO-d6): δ 7.62 (d, 1H), 7.43 - 7.48 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.18(bs, 1H), 6.88 - 6.91 (m, 1H), 5.01 (bs, 1H), 4.44 - 4.49 (m, 1H), 3.73 (d, 2H), 3.65 (s, 2H), 2.63 (s, 3H), 1.01 (s, 9H).
化合物 040	357.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.52 (d, 1H), 7.45 - 7.39 (m, 3H), 7.16 (s, 1H), 7.00 (dd, 1H), 6.41(tt, 1H), 5.03 (bs, 1H), 4.40 - 4.29 (m, 3H), 4.15 - 4.10 (m, 1H), 2.65 (s, 3H), 1.14 (d, 3H).
化合物 041-En1	357.1	(400 MHz, DMSO-d6): δ 7.62 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.46 - 7.39 (m, 2H), 7.29 (brs, 1H), 6.99 (dd, 1H), 6.42 (tt, 1H), 5.10 (t, 1H), 4.32 (td, 2H), 4.00 - 3.92 (m, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 1H), 2.65 (s, 3H), 1.52 (s, 3H).
化合物 041-En2	357.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 7.62 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.46 - 7.39 (m, 2H), 7.29 (brs, 1H), 6.99 (dd, 1H), 6.42 (tt, 1H), 5.10 (t, 1H), 4.32 (td, 2H), 4.00 - 3.92 (m, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 1H), 2.65 (s, 3H), 1.52 (s, 3H).
化合物 042-En2	367.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 4.44 - 4.49 (m, 1H), 3.72 - 3.75 (m, 2H), 3.31 (t, 1H), 2.60 - 2.93 (m, 2H), 2.54 - 2.63 (m, 4H), 2.43 - 2.50 (m, 1H), 2.00 - 2.06 (m, 1H), 1.69 - 1.79 (m, 2H), 0.99 (s, 6H).
化合物 042-En1	367.2	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 4.44 - 4.49 (m, 1H), 3.72 -3.75 (m, 2H), 3.31 (t, 1H), 2.60 - 2.93 (m, 2H), 2.56 - 2.63 (m, 4H), 2.36 - 2.44 (m, 1H), 2.00 - 2.06 (m, 1H), 1.69 - 1.79 (m, 2H), 0.99 (s, 6H)
化合物 043-En1	381.3	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.87 - 6.89 (m, 1H), 4.44 - 4.49 (m,1H), 3.61 - 3.65 (m, 2H), 3.09 - 3.15 (m, 1H), 2.79 - 2.93 (m, 2H), 2.54 - 2.63 (m, 4H), 2.44 - 2.49 (m, 1H), 1.68 - 1.80 (m, 2H), 1.01 (s, 9H)
化合物 043-En2	381.3	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.21 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.87 - 6.89 (m, 1H), 4.42 - 4.51 (m, 1H), 3.61 - 3.65 (m, 2H), 3.09 - 3.16 (m, 1H), 2.79 - 2.93 (m, 2H), 2.56 - 2.63 (m, 4H), 2.43- 2.48 (m, 1H), 1.69 - 1.77 (m, 2H), 1.01 (s, 9H),
化合物 044-En2	369.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.25 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.10 (d, 2H), 6.99 (dd,1H), 6.41 (tt,1H), 4.40 - 4.31 (m, 2H), 4.18 (d,1H), 3.94 (d, 1H), 3.85 (t, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.38 - 2.32 (d, 2H).
化合物 044-En1	369.1	(500 MHz, DMSO-d6): δ 8.25 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.10 (d, 2H), 6.98 (dd, 1H), 6.41 (tt,1H), 4.40 - 4.31 (m, 2H), 4.18 (d,1H), 3.94 (d, 1H), 3.85 (t, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.38 - 2.32 (d, 2H).

【表２－６】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 045-En1	365.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (m, 2 H), 7.49 (d, 1 H), 7.43 (s, 1 H), 7.3 (s, 1 H), 5.10 (s, 1 H), 3.93 (m, 3 H), 3.75 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.51 (s, 3H), 1.29 - 1.25 (m, 1 H), 0.61 - 0.56 (m, 2 H), 0.36 - 0.35 (m, 2 H).
化合物 045-En2	365.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (t, 2H), 7.49 (d, 1 H), 7.43 (s, 1 H), 7.29 (s, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 3.93 (q, 3 H), 3.75 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.51 (s, 3H), 1.29-1.25 (m, 1H), 0.61-0.56 (m, 2H), 0.36-0.34 (m, 2H).
化合物 046-En1	368.26	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.42 (d, 1 H), 7.35 (s, 1 H), 7.12 (d, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 6.37 - 6.07 (m, 1 H), 5.18 (t, 1 H), 3.81 (d, 2 H), 3.64 - 3.54 (m, 2 H), 2.56 - 2.49 (m, 4 H), 2.34-2.29 (m, 1 H), 1.38 (s, 3 H), 1.24 - 1.21 (m, 1 H), 0.59 - 0.55 (m, 2 H) 0.35 - 0.31(m, 2 H).
化合物 046-En2	368.26	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.42 (d, 1 H), 7.35 (s, 1 H), 7.12 (d, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 6.37 - 6.07 (m, 1 H), 5.18 (s, 1 H), 3.81 (d, 2 H), 3.64 - 3.54 (m, 2 H), 2.56 - 2.49 (m, 4 H), 2.34-2.29(m, 1 H), 1.38 (s, 3 H), 1.24 - 1.21 (m, 1 H), 0.59 - 0.55 (m, 2 H) 0.35 - 0.31(m, 2 H)
化合物 047-En1	375.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.54 (d, 1 H), 7.44 (d, 1 H),7.43 (bs, 1 H), 7.28 (bs, 1 H), 7.02-7.05 (dd, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 4.75 (t, 2 H), 3.94 (d, 1H), 3.76 (d, 1 H), 2.66 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H).
化合物 047-En2	375.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.54 (d, 1 H), 7.44 (d, 1 H),7.43 (bs, 1 H), 7.28 (bs, 1 H), 7.02-7.05 (dd, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 4.75 (t, 2 H), 3.94 (d, 1H), 3.76 (d, 1 H), 2.66 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H).
化合物 048-En1	415.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.47 (d, 1 H), 7.42 (br s, 1 H), 7.36 (d, 1 H), 7.29 (br s, 1 H), 6.90 - 6.93 (dd, 1 H), 5.09 (s, 1 H), 4.14 (s, 2 H), 3.94 - 3.97 (dd, 1 H), 3.74 - 3.78 (m, 1 H), 2.65 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H).1.09 - 1.12 (m, 2 H), 1.02 (s, 2 H).
化合物 048-En2	415.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.47 (d, 1 H), 7.42 (br s, 1 H), 7.36 (d, 1 H), 7.29 (br s, 1 H), 6.90 - 6.93 (dd, 1 H), 5.10 (s, 1 H), 4.14 (s, 2 H), 3.94 - 3.97 (dd, 1 H), 3.74 - 3.78 (m, 1 H), 2.66 (s, 3H), 1.52 (s, 3 H).1.05 - 1.12 (m, 2 H), 1.02 (s, 2 H).
化合物 049-En1	375.3	(400 MHz, DMSO-d6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.45 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.27 (s, 1 H), 6.91 (q, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 4.13 (q, 1 H), 3.96 (d, 1 H), 3.86 (t, 1 H), 3.76 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.10 (s, 3 H), 1.06 (s, 3 H), 1.04 (q, 1 H), 0.54 (q, 1 H), 0.28 (t, 1 H).
化合物 049-En2	375.3	(400 MHz, DMSO-d6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.45 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.27 (s, 1 H), 6.91 (q, 1 H), 5.10 (s, 1 H), 4.13 (q, 1 H), 3.95 (d, 1 H), 3.86 (t, 1 H), 3.75 (t, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.10 (s, 3 H), 1.06 (s, 3 H), 1.04 (d, 1 H), 0.54 (q,1 H), 0.28 (t, 1 H)
化合物 049-En3	375.3	(400 MHz, DMSO-d6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.45 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.27 (s, 1 H), 6.91 (q, 1 H), 5.09 (t, 1 H), 4.13 (q, 1 H), 3.97 (q, 1 H), 3.86 (t, 1 H), 3.75 (t, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.10 (s, 3 H), 1.06 (s, 3 H), 1.04 (q, 1 H), 0.54 (q, 1 H), 0.28 (t, 1 H).
化合物 049-En4	375.3	(400 MHz, DMSO-d6) δ ppm: 7.62 (s, 1 H), 7.45 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.91 (q, 1 H), 5.14 (s, 1 H), 4.13 (q, 1 H), 3.96 (d, 1 H), 3.85 (t, 1 H), 3.76 (t, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.10 (s, 3 H), 1.06 (s, 3 H), 1.04 (d, 1 H), 0.54 (q, 1 H), 0.29 (t, 1 H).

【表２－７】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 050-En1	387.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.60 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.37 - 7.31 (m, 2 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.09 (t, 1 H), 3.94 - 3.98 (m, 1 H), 3.73 - 3.77 (m, 3 H), 2. 67 - 2.74 (m, 1 H), 2.66 (s, 3 H), 2.12 - 2.19 (m, 2 H), 1.48 - 1.55 (m, 5 H), 1.30 - 1.32 (m, 2 H), 0.57 - 0.62 (m, 1 H), 0.75 - 0.86 (m, 1 H)
化合物 050-En2	387.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 77.60 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.37 - 7.31 (m, 2 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.09 (t, 1 H), 3.94 - 3.98 (m, 1 H), 3.73 - 3.77 (m, 3 H), 2. 67 - 2.74 (m, 1 H), 2.66 (s, 3 H), 2.12 - 2.19 (m, 2 H), 1.48 - 1.55 (m, 5 H), 1.30 - 1.32 (m, 2 H), 0.57 - 0.62 (m, 1 H), 0.75 - 0.86 (m, 1 H).
化合物 051-En1	387.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.60 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.32 (d, 1 H), 7.28 (brs, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.09 (t, 1 H), 3.89 - 3.98 (m, 3 H), 3.73 - 3.77 (m, 1 H), 2. 64 - 2.67 (m, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 2.00 - 2.05 (m, 1 H), 1.86 - 1.91 (m, 2 H), 1.52 - 1.58 (m, 5 H), 1.23 - 1.28 (m, 2 H), 0.28 - 0.33 (m, 1 H), 0.22 - 0.25 (m, 1 H).
化合物 051-En2	387.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 77.60 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.32 (d, 1 H), 7.28 (brs, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.09 (t, 1 H), 3.89 - 3.98 (m, 3 H), 3.73 - 3.77 (m, 1 H), 2. 64 - 2.67 (m, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 2.00 - 2.05 (m, 1 H), 1.86 - 1.91 (m, 2 H), 1.52 - 1.58 (m, 5 H), 1.23 - 1.28 (m, 2 H), 0.28 - 0.33 (m, 1 H), 0.22 - 0.25 (m, 1 H).
化合物 052−En1	387.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.613 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.32 (d, 1 H),7.30 (s, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.08 - 5.11 (m, 1 H), 3.99 (s, 2 H), 3.95 (d, 1 H), 3.74 - 3.78 (m, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.64 (s, 6 H), 1.52 (s, 3 H),1.16 (s, 3 H).
化合物 052-En2	387.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.613 (s, 1 H), 7.44 (d, 2 H), 7.32 (d, 1 H),7.30 (s, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.08 - 5.11 (m, 1 H), 3.99 (s, 2 H), 3.95 (d, 1 H), 3.74 - 3.78 (m, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 1.64 (s, 6 H), 1.52 (s, 3 H), 1.16 (s, 3 H).
化合物 053-En1	361.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.46 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.29 (s, 1 H), 6.91 - 6.88 (dd, 1 H), 5.10 (d, 1 H), 3.96 (d, 3 H), 3.78 - 3.73 (m, 1 H), 2.77 - 2.64 (m, 1 H), 2.50 (s, 3 H), 2.10 - 2.05 (m, 2 H), 1.93 - 1.88 (m, 4 H), 1.87 (s, 3 H).
化合物 053-En2	361.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.62 (s, 1 H), 7.46 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H) 7.29 (s, 1 H), 6.91 - 6.88 (m, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 3.96 (t, 3 H), 3.77 (d, 1 H), 2.74 (t, 1 H), 2.64 (d, 3 H), 2.09 - 2.05 (m, 2 H), 1.91 - 1.81 (m, 4 H), 1.52 (s, 3 H), 1.23 (s, 1 H), 1.77 (d, 2 H), 1.23 (s, 1 H).
化合物 054-En1	397.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm 5.11 (s, 1 H), 4.06 - 4.07 (d, 2 H), 3.94 - 3.97 (d, 1 H), 3.74 - 3.77 (d, 1 H), 2.32 - 2.76 (m, 8 H), 1.52 (s, 3 H), 7.61 (s, 1 H), 7.46 - 7.48 (dd, 2 H), 7.36 - 7.37 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.90 - 6.93 (dd, 1 H).
化合物 054-En2	397.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 5.11 (s, 1 H), 4.06 - 4.07 (d, 2 H), 3.94 - 3.97 (d, 1 H), 3.74 - 3.77 (d, 1 H), 2.32 - 2.76 (m, 8 H), 1.52 (s, 3 H), 7.61 (s, 1 H), 7.46 - 7.48 (dd, 2 H), 7.36 - 7.37 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.90 - 6.93 (dd, 1 H).

【表２－８】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 055-En1	343.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.98 (d, 1H), 7.66 (s, 1 H), 7.42 (d, 1 H), 7.29 (d, 1 H), 6.86 - 6.89 (dd, 1 H), 4.35 - 4.41 (q, 1 H), 3.83 (d, 2 H), 3.18 (s, 2 H), 2.60 (s, 3 H), 2.07 - 2.11 (m, 1 H), 1.77 - 1.85 (m, 3 H), 1.20 - 1.26 (m, 1 H), 0.55 - 0.59 (d, 2 H), 0.34 (d, 2 H).
化合物 055-En2	343.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.98 (d, 1H), 7.66 (s, 1 H), 7.42 (d, 1 H), 7.29 (d, 1 H), 6.86 - 6.89 (dd, 1 H), 4.35 - 4.41 (q, 1 H), 3.83 (d, 2 H), 3.18 (s, 2 H), 2.60 (s, 3 H), 2.07 - 2.11 (m, 1 H), 1.77 - 1.85 (m, 3 H), 1.20 - 1.26 (m, 1 H), 0.55 - 0.59 (d, 2 H), 0.34 (d, 2 H).
化合物 056-En1	387.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.67 (d, 1 H), 7.44 - 7.39 (dd, 1 H), 7.12 (d, 1 H), 6.89 - 6.84 (dd, 1 H), 5.05 (s, 1 H), 4.85 - 4.43 (m, 1 H), 3.81 (d, 2 H), 3.62 - 3.54 (m, 2 H), 3.48 - 3.44 (m, 1 H), 2.55 (s, 3 H), 2.16 (s, 2 H), 1.29 - 1.21 (m, 1 H), 0.59 - 0.58 (m, 2 H), 0.34 - 0.30 (m, 2 H).
化合物 056-En2	387.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.89 (d, 1 H), 7.45 (d, 1 H), 7.21 (d, 1 H), 6.91 - 6.88 (dd, 1 H), 4.43 (d, 1 H), 4.11 (s, 1 H), 3.82 (d, 2 H), 3.72 (d, 2 H), 2.60 (s, 3 H), 1.26 - 1.22 (m, 1 H), 0.60 - 0.55 (m, 2 H), 0.34 - 0.32 (m, 2 H).
化合物 056-En3	387.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.67 (d, 1 H), 7.43 (d, 1 H), 7.12 (d, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 5.04 (t, 1 H), 4.46 - 4.44 (m, 1 H), 3.82 - 3.80 (m, 2 H), 3.60 - 3.55 (m, 2 H), 3.47 - 3.45 (m, 1 H), 2.55 (s, 3 H), 2.16 (d, 2 H), 1.23 (d, 1 H), 0.59 - 0.55 (m, 2 H), 0.34 - 0.30 (m, 2 H).
化合物 056-En4	387.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 8.53 (s, 1 H), 7.75 (d, 1 H), 7.43 (d, 1 H), 7.20 (d, 1 H), 6.87 (dd, 1 H), 4.95 - 4.91 (m, 1 H), 4.26 - 4.23 (t, 1 H), 3.82 (d, 2 H), 3.76 - 3.73 (m, 1 H), 3.69 - 3.66 (m, 1 H), 3.58 - 3.54 (m, 1 H), 2.56 (s, 3 H), 2.17 (s, 1 H), 1.25 - 1.21 (m, 1 H), 0.59 - 0.55 (m, 2 H), 0.34 - 0.30 (m, 2 H).
化合物 057-En1	408.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.91 (d, 1 H), 7.46 (d, 1 H), 7.18 (d, 1 H), 6.93 (dd, 1 H), 5.08 (t, 1 H), 4.29 - 4.34 (m, 1 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 3.96 - 4.02 (m, 1 H), 3.51 - 3.57 (m, 1 H), 3.36 - 3.42 (m, 1 H), 2.54 - 2.66 (m, 5 H), 2.19 - 2.30 (m, 1 H), 1.68 -1.77 (m, 1 H), 1.44 - 1.52 (m, 1 H).
化合物 057-En2	408.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.91 (d, 1 H), 7.46 (d, 1 H), 7.18 (d, 1 H), 6.93 (dd, 1 H), 5.08 (t, 1 H), 4.29 - 4.34 (m, 1 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 3.96 - 4.02 (m, 1 H), 3.51 - 3.57 (m, 1 H), 3.36 - 3.42 (m, 1 H), 2.54 - 2.66 (m, 5 H), 2.19 - 2.30 (m, 1 H), 1.68 -1.77 (m, 1 H), 1.44 - 1.52 (m, 1 H).
化合物 057-En3	408.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.91 (d, 1 H), 7.46 (d, 1 H), 7.18 (d, 1 H), 6.93 (dd, 1 H), 5.08 (t, 1 H), 4.29 - 4.34 (m, 1 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 3.96 - 4.02 (m, 1 H), 3.51 - 3.57 (m, 1 H), 3.36 - 3.42 (m, 1 H), 2.54 - 2.66 (m, 5 H), 2.19 - 2.30 (m, 1 H), 1.68 -1.77 (m, 1 H), 1.44 - 1.52 (m, 1 H).
化合物 057-En4	408.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.91 (d, 1 H), 7.46 (d, 1 H), 7.18 (d, 1 H), 6.93 (dd, 1 H), 5.08 (t, 1 H), 4.29 - 4.34 (m, 1 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 3.96 - 4.02 (m, 1 H), 3.51 - 3.57 (m, 1 H), 3.36 - 3.42 (m, 1 H), 2.54 - 2.66 (m, 5 H), 2.19 - 2.30 (m, 1 H), 1.68 -1.77 (m, 1 H), 1.44 - 1.52 (m, 1 H).
化合物 058-En1	375.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.46 (d, 2 H), 7.33 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.89 - 6.87 (m, 1 H), 5.12 (s, 1 H), 3.98 - 3.95 (m, 1 H), 3.92 - 3.90 (m, 2 H), 3.76 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 2.56 - 2.49 (m, 1 H), 2.33 - 2.17 (m, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.04 (d 2 H), 1.02 (s, 3 H).

【表２－９】

化合物	[M+H]+ (m/z):	^{1H} NMR (δ ppm)
化合物 058-En2	375.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.46 (d, 2 H), 7.33 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.89 - 6.87 (m, 1 H), 5.11 (s, 1 H), 3.98 - 3.90 (m, 3 H), 3.77 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 2.58 - 2.52 (m, 1 H), 2.32 - 2.17 (m, 3 H), 1.52 (s, 3 H), 1.50 - 1.35 (m 2 H), 1.02 - 1.00 (m, 3 H).
化合物 059-En1	375.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.62 (s, 1 H), 7.47 - 7.44 (m, 2 H), 7.36 (d, 1 H), 7.30 (s, 1 H), 6.91 - 6.88 (m, 1 H), 5.13 (s, 1 H), 4.02 - 4.00 (m, 3 H), 3.98 - 3.95 (m, 1 H), 2.71 - 2.62 (m, 4 H), 2.51 - 2.49 (m, 1 H), 2.02 - 1.97 (m 2 H), 1.76 - 1.72 (m, 2 H), 1.50 (s, 3 H), 1.10 (d, 3 H).
化合物 059-En2	375.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.62 (s, 1 H), 7.47 - 7.44 (m, 2 H), 7.36 (d, 1 H), 7.30 (s, 1 H), 6.91 - 6.88 (m, 1 H), 5.13 (s, 1 H), 4.02 - 4.00 (m, 3 H), 3.75 (d, 1 H), 2.71 - 2.62 (m, 4 H), 2.47 - 2.41 (m, 1 H), 2.00 - 1.95 (m, 2 H), 1.76 - 1.73 (m, 2 H), 1.52 (s, 3 H), 1.11 - 1.10 (m, 3 H).
化合物 060-En1	416.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.45 (d, 1 H), 7.16 (d, 1 H), 7.10 (s, 1 H), 6.88 - 6.91 (dd, 1 H), 4.98 (t, 1 H), 4.12 (s, 2 H), 3.62 - 3.66 (m, 2 H), 3.51 - 3.55 (m, 2 H), 2.57 (s, 3 H), 1.34 (s, 3 H), 1.02 - 1.11 (m, 4 H).
化合物 060-En2	416.3	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.45 (d, 1 H), 7.16 (d, 1 H), 7.11 (s, 1 H), 6.88 - 6.91 (dd, 1 H), 4.99 (s, 1 H), 4.12 (s, 2 H), 3.59 - 3.65 (m, 2 H), 3.51 - 3.55 (m, 2 H), 2.57 (s, 3 H), 1.34 (s, 3 H), 1.08 - 1.11 (m, 2 H), 1.02 - 1.05 (m, 2 H).
化合物 061-En1	425.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.95 (s, 1 H), 7.41 - 7.45 (m, 2 H), 7.14 (d, 1 H), 6.87 - 6.90 (dd, 1 H), 4.13 (s, 2 H), 3.24 - 3.27 (m, 1 H), 3.12 - 3.15 (m, 1 H), 2.58 (s, 3 H), 2.43 - 2.45 (m, 1 H), 1.78 - 1.86 (m, 3 H), 1.43 (s, 3 H), 1.03 - 1.10 (m, 4 H).
化合物 061-En2	425.4	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.96 (s, 1 H), 7.42 - 7.45 (m, 2 H), 7.14 (d, 1 H), 6.87 - 6.90 (dd, 1 H), 4.13 (s, 2 H), 3.22 - 3.27 (m, 1 H), 3.12 - 3.14 (m, 1 H), 2.58 (s, 3 H), 2.41 - 2.45 (m, 1 H), 1.78 - 1.86 (m, 3 H), 1.43 (s, 3 H), 1.03 - 1.10 (m, 4 H).
化合物 062-En1	375.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.46 (d, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.28 (s, 1 H), 6.91 - 6.88 (m, 1 H), 5.10 (s, 1 H), 3.98 - 3.88 (m, 1 H), 3.86 (d, 2 H), 3.75 - 3.73 (m, 1 H), 2.66 - 2.50 (d, 3 H), 2.36 - 2.29 (m, 1 H), 1.82 - 1.78 (m, 2 H), 1.63 - 1.52 (m, 7 H), 1.38 - 1.30 (m, 2 H).
化合物 062-En2	375.2	(400 MHz, DMSO-D6) δ ppm: 7.61 (s, 1 H), 7.43 (t, 2 H), 7.35 (d, 1 H), 7.27 (s, 1 H), 6.90 - 6.88 (m, 1 H), 3.97 (d, 1 H), 3.88 (d, 2 H), 3.77 (d, 1 H), 2.64 (s, 3 H), 2.36 - 2.29 (m, 1 H), 1.82 - 1.75 (m, 2 H), 1.63 - 1.54 (m, 7 H), 1.38 - 1.30 (m, 2 H).

【表３－１】

キラル分析データ

キラル SFC						
化合物コード	カラム	共溶媒	共溶媒%	流量[g/分]	RT[分]	純度[%]
化合物 001	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	4	2.06	99.5
化合物 002-En1	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	5.4	99.8
化合物 002-En2	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	6.59	97.2
化合物 005	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	45	3	4.42	98.3
化合物 009	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	4	1.61	98.8
化合物 012	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.66	99.6
化合物 014-En1	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	5.59	98.3
化合物 014-En2	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	6.35	97.4
化合物 017-En1	(6)	MeOH	25	3	2.9	98.8
化合物 017-En2	(6)	MeOH	25	3	3.39	98.9
化合物 019-En1	(2)	MeOH 中の 0.%DEA	30	3	2.41	99.4
化合物 019-En2	(2)	MeOH 中の 0.%DEA	30	3	4.09	97.7
化合物 027-En1	(5)	MeOH	40	3	3.27	99.3
化合物 027-En2	(5)	MeOH	40	3	6.67	99.4
化合物 028-En1	(2)	MeOH	35	3	4.43	98.7
化合物 028-En2	(2)	MeOH	35	3	6.24	96.5
化合物 032-En1	(1)	EtOH	20	3	2.73	99.9
化合物 032-En2	(1)	EtOH	20	3	4.41	96.9
化合物 033-En1	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	15	3	4.39	95.9
化合物 033-En2	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	15	3	9.25	97.7
化合物 033-En3	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	15	3	6.87	98.9
化合物 033-En4	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	15	3	3.64	98.8
化合物 035-En1	(2)	MeOH	40	3	2.61	99.8
化合物 035-En2	(2)	MeOH	40	3	3.41	95.5
化合物 036-En1	(7)	MeOH	30	3	3.26	99.9

【表３－２】

キラル SFC						
化合物コード	カラム	共溶媒	共溶媒%	流量[g/分]	RT[分]	純度[%]
化合物 036-En2	(7)	MeOH	30	3	5.36	99.8
化合物 042-En2	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	2.92	99.8
化合物 042-En1	(2)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	1.98	99.6
化合物 043-En1	(7)	IPA 中の 0.5%IPAmine	20	3	2.32	99.3
化合物 043-En2	(7)	IPA 中の 0.5%IPAmine	20	3	3.62	98.5
化合物 044-En2	(7)	MeOH	40	3	2.88	98.8
化合物 044-En1	(7)	MeOH	40	3	1.84	99
化合物 045-En1	(7)	MeOH	25	3	4.55	99.9
化合物 045-En2	(7)	MeOH	25	3	5.57	99.7
化合物 046-En1	(5)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	2	7.33	98.7
化合物 046-En2	(5)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	2	8.38	91
化合物 047-En1	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	5.02	99.7
化合物 047-En2	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	5.55	97.4
化合物 048-En1	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	15	3	2.93	98.3
化合物 048-En2	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	15	3	3.27	91.6
化合物 050-En1	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	20.96	96.8
化合物 050-En2	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	26.14	99.1
化合物 051-En1	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	29.98	98.8
化合物 051-En2	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	10	3	22.99	99
化合物 052-En1	(9)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	3	5.05	99.6
化合物 052-En2	(9)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	3	6.13	97.8
化合物 053-En1	(6)	MeOH	20	3	4.02	99.9
化合物 053-En2	(6)	MeOH	20	3	4.82	95.2

【表３－３】

キラル SFC						
化合物コード	カラム	共溶媒	共溶媒%	流量[g/分]	RT[分]	純度[%]
化合物 054-En1	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	3.06	99.3
化合物 054-En2	(8)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	3.42	98.2
化合物 055-En1	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	4.02	97
化合物 055-En2	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	2.98	99.4
化合物 056-En1	(7)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	1.6	98.7
化合物 056-En2	(10)	IPA 中の 0.5%IPAmine	20	3	4.93	99.7
化合物 056-En3	(7)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	1.34	99.2
化合物 056-En4	(10)	IPA 中の 0.5%IPAmine	20	3	4.31	99.3
化合物 057-En1	(11)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	3	9.82	99.7
化合物 057-En2	(11)	IPA 中の 0.5%IPAmine	10	3	11.8	98.8
化合物 058-En1	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	3.2	98.8
化合物 058-En2	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	3.84	99.8
化合物 059-En1	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	15	3	5.48	95.6
化合物 059-En2	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	15	3	6.91	96.9
化合物 060-En1	(7)	MeOH	10	3	5.73	99.9
化合物 060-En2	(7)	MeOH	10	3	8.08	99.7
化合物 061-En1	(3)	MeOH	40	3	3.95	99.9
化合物 061-En2	(3)	MeOH	40	3	5.35	99.7
化合物 062-En1	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	35	3	3.03	99.8
化合物 062-En2	(6)	MeOH 中の 0.5%DEA	35	3	3.45	99.9

Chiralcel OD-H(4.6*250 mm)5 μ m = (1); Chiralpak AD-3(4.6*150mm)3.5 μ m= (2); Chiralpak AD-H(4.6*250 mm)5 μ m = (3); Chiralpak IC (4.6*250mm)5 μ m = (4); Chiralpak IE-3(4.6*150mm)3 μ m = (5); Chiralpak IF-3(4.6*150mm)3 μ m = (6); Chiralpak IG-3(4.6*150 mm)3 μ m = (7); Lux Cellulose-2(4.6*250mm)5 μ m = (8), Chiralpak AD-3(4.6*150mm)3.5 μ m= (9); Chiralpak AS-3(4.6*150mm)3 μ m= (9); (R,R) WHELK-01 (4.6*150mm)3.5 μ m = (10); CHIRALCEL OX-H (4.6*150mm) 5 μ m = (11)。

【表４】

キラル HPLC						
化合物コード	カラム	相 A/B	比 A/B	流量[mL/分]	RT[分]	純度[%]
化合物 031-En1	(1)	ヘキサン/EtOH	1/1	1	14.21	99.4
化合物 031-En2	(1)	ヘキサン/EtOH	1/1	1	20.91	94.1
化合物 031-En3	(1)	ヘキサン/EtOH	1/1	1	16.17	97.3
化合物 031-En4	(1)	ヘキサン/EtOH	1/1	1	25.81	99.2
化合物 049-En1	(2)	n-Hex/EtOH	95/5	1	24.63	99.4
化合物 049-En2	(2)	n-Hex/EtOH	95/5	1	27.65	98.4
化合物 049-En3	(2)	n-Hex/EtOH	95/5	1	33.93	95.3
化合物 049-En4	(2)	n-Hex/EtOH	95/5	1	29.04	96.3
化合物 057-En3	(3)	n-Hex/EtOH	9/1	1	16.99	98.7
化合物 057-En4	(3)	n-Hex/EtOH	9/1	1	22.45	98.33

Chiralpak IG(250×4.6 mm)5 μ m = (1); Chiralpak IF (250×4.6 mm)5 μ m = (2); Chiralpak AD-H (250×4.6 mm) 5 μ m = (3)。

【０２６３】

パートＢ

ＴＲＰＭ３イオンチャネル駆動型Ｃａ$^{2+}$取り込みのモニタリング。

【０２６４】

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

【０２６５】

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

【０２６６】

細胞播種の前に（黒色の３８４ウェルプレート（Ｇｒｅｉｎｅｒ）への±２０００細胞／ウェル）、希釈された化合物を、カルシウムを含むＫｒｅｂｓ緩衝液に溶解したＰＳとともに、アッセイプレートに添加した。これにより、２．４ｍＭ　Ｃａ$^{2+}$アッセイ溶液

が得られた。細胞添加の直後に、プレートを、４８５ｎＭの励起及び５３５ｎＭの放出によってＥｎｖｉｓｉｏｎ蛍光リーダ（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）上で読み取った。

【０２６７】

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

【０２６８】

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

【表５】

化合物	IC50
化合物 001	A
化合物 002-En1	A
化合物 002-En2	A
化合物 003	A
化合物 004	A
化合物 005	A
化合物 006	A
化合物 007	A
化合物 008	A
化合物 009	A
化合物 010	A
化合物 011	A
化合物 012	A
化合物 013	A
化合物 014-En1	A
化合物 014-En2	A
化合物 015	A
化合物 016	A
化合物 017-En1	A
化合物 017-En2	A
化合物 018	A
化合物 019-En1	B
化合物 019-En2	A
化合物 020	C
化合物 021	B
化合物 022	B
化合物 023	A
化合物 024-En1	B
化合物 024-En2	A
化合物 025	A
化合物 026	B
化合物 027-En1	A
化合物 027-En2	B
化合物 028-En1	A
化合物 028-En2	A
化合物 029	A
化合物 030	A

化合物	IC50
化合物 031-En1	B
化合物 031-En2	A
化合物 031-En3	B
化合物 031-En4	A
化合物 032-En1	A
化合物 032-En2	B
化合物 033-En1	B
化合物 033-En2	B
化合物 033-En3	A
化合物 033-En4	B
化合物 034	A
化合物 035-En1	A
化合物 035-En2	A
化合物 036-En1	B
化合物 036-En2	A
化合物 037	A
化合物 038	A
化合物 039	A
化合物 040	A
化合物 041-En1	A
化合物 041-En2	B
化合物 042-En2	A
化合物 042-En1	B
化合物 043-En1	B
化合物 043-En2	B
化合物 044-En2	A
化合物 044-En1	B
化合物 045-En1	A
化合物 045-En2	A
化合物 046-En1	A
化合物 046-En2	A
化合物 047-En1	B
化合物 047-En2	A
化合物 048-En1	A
化合物 048-En2	A
化合物 049-En1	A
化合物 049-En2	A

化合物	IC50
化合物 049-En3	A
化合物 049-En4	A
化合物 050-En1	B
化合物 050-En2	A
化合物 051-En1	A
化合物 051-En2	A
化合物 052-En1	A
化合物 052-En2	A
化合物 053-En1	A
化合物 053-En2	A
化合物 054-En1	B
化合物 054-En2	A
化合物 055-En1	A
化合物 055-En2	B
化合物 056-En1	B
化合物 056-En2	A
化合物 056-En3	A
化合物 056-En4	B
化合物 057-En1	A
化合物 057-En2	A
化合物 057-En3	B
化合物 057-En4	B
化合物 058-En1	A
化合物 058-En2	B
化合物 059-En1	A
化合物 059-En2	B
化合物 060-En1	B
化合物 060-En2	A
化合物 061-En1	C
化合物 061-En2	B
化合物 062-En1	A
化合物 062-En2	A

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063992

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D307/84 A61P25/04 A61P29/00 C07D405/12 C07D407/12
A61K31/343 A61K31/351 A61K31/443
ADD.
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2004/041201 A2 (VIROPHARMA INC [US]; WYETH CORP [US] ET AL.) 21 May 2004 (2004-05-21) claims 1-27 Table from page 93 to page 205: compounds where R2 according to claim is isopropoxy. & DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2004, "Preparation of benzofuran compounds for treatment and prophylaxis of hepatitis C viral infections and associated diseases", XP002807704, Database accession no. 2004:412769 Depicted compounds where R2 according to I is isopropoxy. ----- -/--	1-15

[x] Further documents are listed in the continuation of Box C.
[x] See patent family annex.

* Special categories of cited documents :
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
11 July 2023	19/07/2023

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

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063992

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2015/088958 A1 (SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]) 18 June 2015 (2015-06-18) page 18, line 25 page 19, line 19 page 20, line 19	1-15
A	WO 2014/159559 A1 (SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]) 2 October 2014 (2014-10-02) page 28, line 11 page 29, line 5 page 55, lines 5, 27 page 71, line 5 page 72, line 5 page 115, line 8 page 116, line 26 page 117, line 24 page 119, line 11 page 120, line 5 page 120, line 25 page 121, line 20 page 162, line 15 page 175, line 15	1-15
A	US 2013/203775 A1 (YEUNG KAP-SUN [US] ET AL) 8 August 2013 (2013-08-08) 4th compound in the sequence depicted in the lower part of page 12	1-15
X	WO 2014/113620 A1 (GLUNZ PETER W [US] ET AL) 24 July 2014 (2014-07-24) page 258; example 100	1-6,9,10
A	WO 2012/003164 A1 (SQUIBB BRISTOL MYERS CO [US]; YEUNG KAP-SUN [US] ET AL.) 5 January 2012 (2012-01-05) page 22, line 20 page 23, line 4	1-15
A	MIN LI LEOW ET AL: "BENZOFURAN-BASED ESTROGEN RECEPTOR ALPHA MODULATORS AS ANTI-CANCER THERAPEUTICS: IN SILICO AND EXPERIMENTAL STUDIES", CURRENT MEDICINAL CHEMISTRY,, vol. 20, 12 March 2013 (2013-03-12), pages 2820-2837, XP002791943, Benzyl protected precursors of compounds 19a to 19j (see table 1 on pages 2833-2834 and scheme 3 on page 2831)	1-15

-/--

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063992

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

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

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063992

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	KRÜGEL UTE ET AL: "Primidone inhibits TRPM3 and attenuates thermal nociception in vivo", PAIN , vol. 158, no. 5 1 May 2017 (2017-05-01), pages 856-867, XP055892729, NL ISSN: 0304-3959, DOI: 10.1097/j.pain.0000000000000846 Retrieved from the Internet: URL:https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC5402713/pdf/jop-158-856.pdf the whole document	1-15
X,P	WO 2022/112352 A1 (UNIV LEUVEN KATH [BE]) 2 June 2022 (2022-06-02) the whole document examples	1-15
X,P	WO 2022/112345 A1 (UNIV LEUVEN KATH [BE]) 2 June 2022 (2022-06-02) the whole document examples	1-15

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/063992

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004041201 A2	21-05-2004	AU 2003290584 A1	07-06-2004
		BR 0315937 A	13-09-2005
		CA 2504344 A1	21-05-2004
		CN 1731993 A	08-02-2006
		EA 200500723 A1	24-02-2006
		EC SP055801 A	22-11-2005
		EP 1581207 A2	05-10-2005
		HN 2003000348 A	14-10-2008
		IL 168282 A	18-11-2009
		JP 4537315 B2	01-09-2010
		JP 2006510736 A	30-03-2006
		KR 20050065661 A	29-06-2005
		MX PA05004608 A	20-09-2005
		NI 200500090 A	25-05-2006
		NZ 539727 A	31-01-2008
		UA 79834 C2	25-07-2007
		US 2004162318 A1	19-08-2004
		US 2007231318 A1	04-10-2007
		US 2009281336 A1	12-11-2009
		WO 2004041201 A2	21-05-2004
		ZA 200503501 B	25-10-2006
WO 2015088958 A1	18-06-2015	EP 3080106 A1	19-10-2016
		US 2016318912 A1	03-11-2016
		WO 2015088958 A1	18-06-2015
WO 2014159559 A1	02-10-2014	EP 2970174 A1	20-01-2016
		US 2016024103 A1	28-01-2016
		WO 2014159559 A1	02-10-2014
US 2013203775 A1	08-08-2013	EP 2812325 A1	17-12-2014
		US 2013203775 A1	08-08-2013
		WO 2013119499 A1	15-08-2013
WO 2014113620 A1	24-07-2014	---	---
WO 2012003164 A1	05-01-2012	BR 112012033675 A2	29-11-2016
		CA 2804319 A1	05-01-2012
		CN 103097370 A	08-05-2013
		EA 201270798 A1	30-04-2013
		EP 2588464 A1	08-05-2013
		JP 2013530232 A	25-07-2013
		US 2012165344 A1	28-06-2012
		WO 2012003164 A1	05-01-2012
WO 2022112352 A1	02-06-2022	AU 2021386627 A1	22-06-2023
		CA 3199496 A1	02-06-2022
		TW 202235072 A	16-09-2022
		WO 2022112352 A1	02-06-2022
WO 2022112345 A1	02-06-2022	AU 2021388798 A1	22-06-2023
		CA 3198096 A1	02-06-2022
		TW 202237573 A	01-10-2022
		WO 2022112345 A1	02-06-2022

フロントページの続き

(51)国際特許分類		FI			テーマコード（参考）
A61K	*31/351(2006.01)*	A61K	31/351		
A61K	*31/4025(2006.01)*	A61K	31/4025		
A61P	*29/00 (2006.01)*	A61P	29/00		
A61P	*25/08 (2006.01)*	A61P	25/08		
A61P	*43/00 (2006.01)*	A61P	43/00	111	

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

ルトラ、ロード・タウン、ピー・オー・ボックス１７３、リッター・ハウス

(74)代理人 100145403

弁理士 山尾 憲人

(74)代理人 100156144

弁理士 落合 康

(72)発明者 マルシャン，アルノー

ベルギー３３６０ビールベーク、ライスブルークストラート５９アー

(72)発明者 ファンヘルク，ジャン－クリストフ

ベルギー３００１ヘフェルレー、ズワールウェンラーン４８

(72)発明者 ライヒ，メラニー

ドイツ５２０７２アーヘン、ティッタルツフェルト５３

(72)発明者 クリューガー，ゼバスティアン

ドイツ５２０６２アーヘン、ベルクドリーシュ２２

(72)発明者 フーツ，トーマス

ベルギー３０１０ケッセル－ロー、ティーンセステーンウェッヒ１４９

(72)発明者 フリーンス，ヨーリス

ベルギー３１５０ワッケルゼール、ケルフスストラート９４

Ｆターム（参考） 4C086 AA01 AA02 AA03 BA06 BA07 BC08 BC21 GA02 GA07 MA01 MA04 NA14 ZA06 ZA08 ZC02