(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)特許出願公表番号
特表2011-506461
(P2011-506461A)
(43)公表日　平成23年3月3日(2011.3.3)

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
C07D 471/04	(2006.01)	C07D 471/04	104Z	4C050
C07D 498/04	(2006.01)	C07D 498/04	105	4C065
C07D 513/04	(2006.01)	C07D 513/04	351	4C072
C07D 491/048	(2006.01)	C07D 491/048	CSP	4C084
C07D 487/04	(2006.01)	C07D 487/04	144	4C086

審査請求 有　予備審査請求 未請求　（全 237 頁）　最終頁に続く

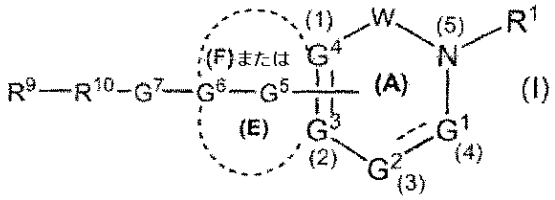
(21)出願番号　特願2010-538093 (P2010-538093)
(86)(22)出願日　平成20年12月9日 (2008.12.9)
(85)翻訳文提出日　平成22年8月9日 (2010.8.9)
(86)国際出願番号　PCT/US2008/086058
(87)国際公開番号　WO2009/076352
(87)国際公開日　平成21年6月18日 (2009.6.18)
(31)優先権主張番号　61/012,857
(32)優先日　平成19年12月11日 (2007.12.11)
(33)優先権主張国　米国 (US)

(71)出願人　596129215
シェーリング　コーポレイション
Ｓｃｈｅｒｉｎｇ　Ｃｏｒｐｏｒａｔｉｏｎ
アメリカ合衆国　ニュージャージー　０７０３３－０５３０，ケニルワース，ギャロッピング　ヒル　ロード　２０００
(74)代理人　100078282
弁理士　山本　秀策
(74)代理人　100062409
弁理士　安村　高明
(74)代理人　100113413
弁理士　森下　夏樹

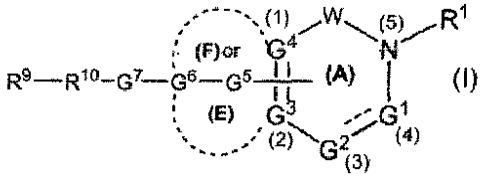
最終頁に続く

(54)【発明の名称】γ－セクレターゼモジュレーター

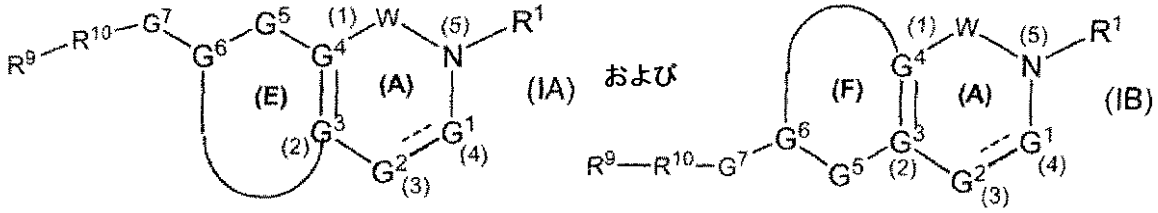
(57)【要約】
本発明は、γ－セクレターゼのモジュレーターである新規化合物を提供する。前記化合物は、以下の式を有する：



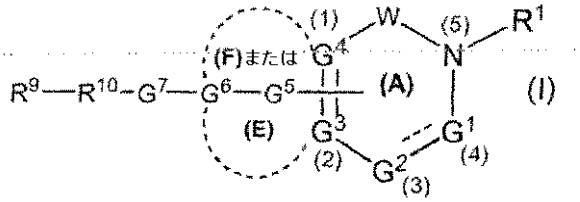
さらに、式（Ｉ）の化合物を用い、γ－セクレターゼ活性を調節する方法、およびアルツハイマーを処置する方法も開示されている。本発明は、γ－セクレターゼモジュレーター（阻害剤、アンタゴニストなどを含む）としての新規な化合物クラス、そのような化合物を調製する方法、１つ以上のそのような化合物を含む医薬組成物、１つ以上のそのような化合物を含む医薬調合物を調製する方法、そのような化合物またはそのような医薬組成物



【特許請求の範囲】
【請求項１】
以下の化合物
【化２３６】



からなる群から選択される式（Ｉ）の化合物
【化２３５】



またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物：
〔式中、G^1、G^2、G^3、G^4、Ｗ、R^1、環（Ａ）、環（Ｅ）、環（Ｆ）、G^5、G^6、G^7、R^9、およびR^{10}は、独立して選択され；
式中の文字（Ａ）、（Ｅ）、および（Ｆ）は、前記環を特定するための参照文字であり；
G^1とG^2との間にある点線は、任意の結合をあらわし；
数字（１）、（２）、（３）、（４）および（５）は、環（Ａ）の位置を特定するための参照番号であり；G^4は、位置（１）にあり、G^3は、位置（２）にあり、G^2は、位置（３）にあり、G^1は、位置（４）にあり、Ｎは、位置（５）にあり；
G^5がG^4に結合している場合（式ＩＡ）、G^4は、－Ｃ－であり、G^5がG^3に結合している場合（式ＩＢ）、G^3は、－Ｃ－であり；
前記環（Ｅ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^3はＮであり、G^4はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｅ）に対して互変異性化し、
前記環（Ｆ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^4はＮであり、G^3はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｆ）に対して互変異性化し；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、４～１０員のヘテロアリール環、アリール環、シクロアルケニル環、またはヘテロシクロアルケニル環であり；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）がヘテロシクロアルケニル環またはヘテロアリール環である場合、前記環は、場合により、－NR^2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択される少なくとも１個の他のヘテロ原子を含み；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、場合により、１～６個の独立して選択されるR^2置換基で置換されており；
ｄは、０または１であり；
ｍは、０～６であり；
ｎは、１～５であり；
ｐは、０～５であり；
ｑは、０、１または２であり、ｑは、それぞれ独立して選択され；
ｒは、１～３であり；

ｔは、１または２であり、
Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｃ（＝ＮＲ^2）－からなる群から選択され；
Ｇ^{1}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$－、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－（Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝ＮＲ^2）－からなる群から選択され；但し、
（１）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、任意の結合が存在しない場合、Ｇ^{1}は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－ではなく；
（２）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、
（ｂ）－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－基のｄは、０であり（Ｇ^{1}とＧ^{2}との間にある二重結合によって、Ｎ上にＨは存在しない）、
（ｃ）Ｇ^{1}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^2）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－（Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝ＮＲ^2）－からなる群から選択され；但し、
（１）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在しない場合、Ｇ^{2}は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－ではなく；
（２）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、
（ｂ）－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－基のｄは、０であり、
（ｃ）Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^2）－）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{5}は、直接結合、ＣＨ、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_t$、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^2）－、－ＣＨＲ^3－、Ｃ（Ｒ^4）$_2$、－ＣＦ$_2$－、－Ｎ（Ｒ^2）－、－ＣＲ^4（ＯＨ）－、－ＣＲ^4（ＯＲ^4）－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
Ｇ^{6}は、Ｃ、ＣＲ^3、およびＮからなる群から選択され；
Ｇ^{7}は、直接結合、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^2）－、－ＣＨＲ^3－、Ｃ（Ｒ^4）$_2$、－ＣＦ$_2$－、－Ｎ（Ｒ^2）－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_t$、－ＣＲ^4（ＯＨ）－、－ＣＲ^4（ＯＲ^4）－、－Ｃ＝Ｃ－、アルキニル、－（ＣＨ$_2$）$_r$Ｎ（Ｒ^2）－、－（ＣＨＲ^4）$_r$Ｎ（Ｒ^2）－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$Ｎ（Ｒ^2）－、－Ｎ（Ｒ^2）（ＣＨ$_2$）$_r$－、－Ｎ（Ｒ^2）（ＣＨＲ^4）$_r$－、－Ｎ（Ｒ^2）（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－、－（ＣＨ$_2$）$_r$－Ｏ－、－（ＣＨＲ^4）$_r$－Ｏ－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－Ｏ－、－Ｏ－（ＣＨ$_2$）$_r$－、－Ｏ－（ＣＨＲ^4）$_r$－、－Ｏ－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^5－、－ＮＲ^{5}Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨ$_2$）$_r$ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨＲ^4）$_r$ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5（ＣＨ$_2$）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5（ＣＨＲ^4）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－、－ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（ＣＨ$_2$）$_r$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（ＣＨＲ^4）$_r$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_t$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$ＮＲ^5－、－Ｓ（Ｏ）$_t$ＮＲ^5（ＣＨ$_2$）$_r$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$ＮＲ^5（ＣＨＲ^4）$_r$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$ＮＲ^5（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－、－ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^5－、－ＮＲ^5－Ｓ（Ｏ）$_t$－ＮＲ^5－、－ＮＲ^5－Ｃ（＝ＮＲ^2）－ＮＲ^5－、－ＮＲ^5－Ｃ（＝ＮＲ^2）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（＝ＮＲ^2）－ＮＲ^5－、－Ｃ（Ｒ^4）＝Ｎ－Ｏ－、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）－、－Ｏ－Ｃ（Ｒ^4）＝Ｎ－、－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）－Ｏ－、－（ＣＨ$_2$）$_2$－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_2$－、－（ＣＨＲ^4）$_2$－、－（ＣＨ$_2$）$_3$－、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_3$－、－（ＣＨＲ^4）

$_3$－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
但し、G^1、G^2、G^3およびG^4部分のうち０～２個が－Ｎ（R^2）$_d$－であり、R^2は、それぞれ独立して選択され、ｄは、それぞれ独立して選択され、但し、環（Ａ）は、連続した３個の環窒素原子を有しておらず；
R^1は、アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、前記アルキル－、アルケニル－、およびアルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル－であるR^1基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；
R^2は、それぞれ独立して、Ｈ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ$_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；
R^3は、Ｈ、－ＯＨ、ハロ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｓ（R^4）、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ$_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニ

ル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されており；

Ｒ^{4}は、それぞれ独立して、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されており；

Ｒ^{5}は、それぞれ独立して、Ｈ、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群から選択され、前記置換基は、Ｒ^{2}から独立して選択される１個以上の（例えば、１～５個の）置換基で置換されており；

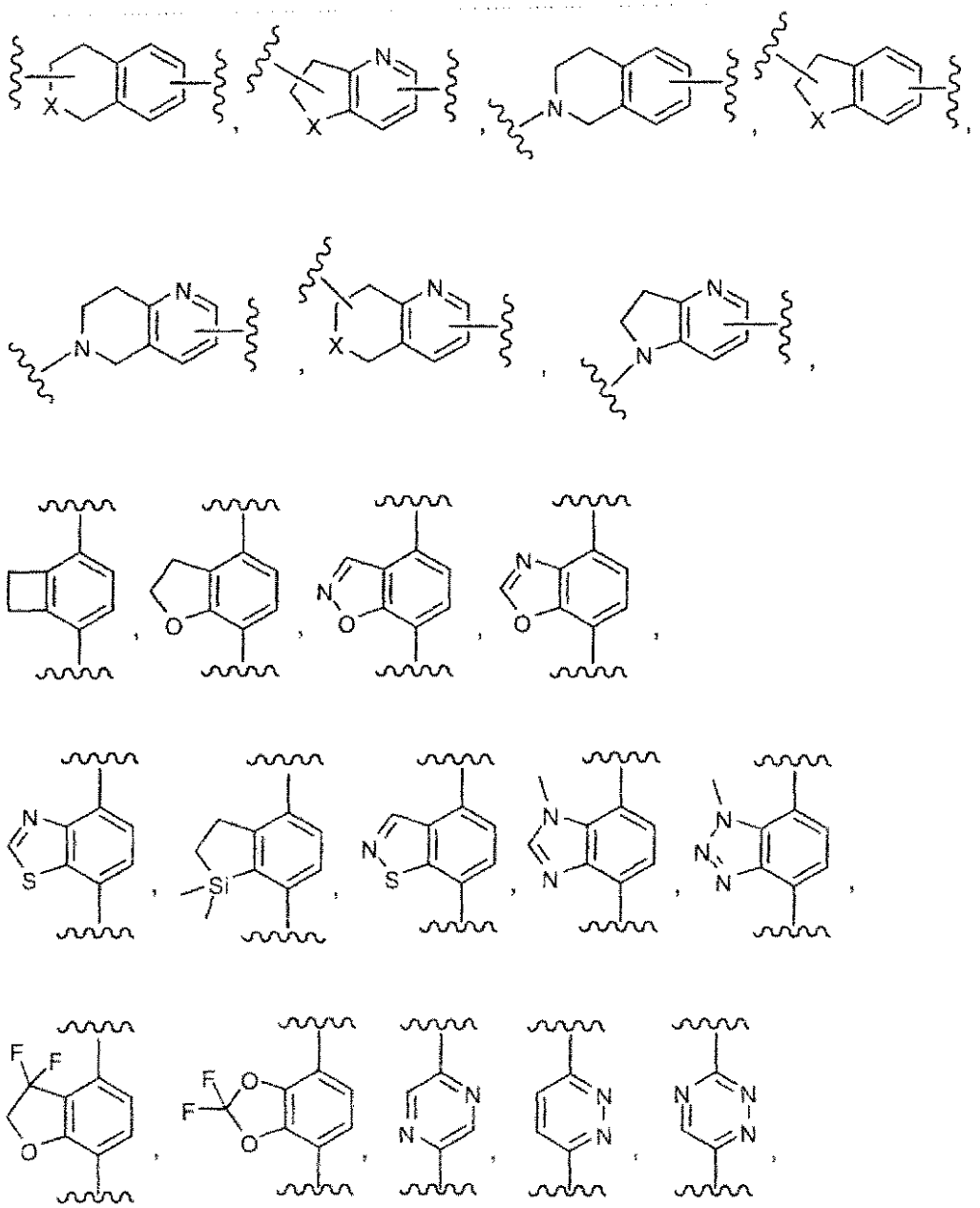
Ｒ^{6}は、それぞれ独立して、Ｈ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{4}、－Ｓ（Ｏ）（ＯＲ^{4}）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨＲ^{4}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{4}）$_{2}$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＨＲ^{4}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{4}）$_{2}$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{24}）Ｒ^{25}、および－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{24}、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{4}、－Ｃ（Ｏ）ＮＨＲ^{4}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{4}）$_{2}$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{4}、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されており；

Ｒ^{9}は、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－である前記Ｒ^{9}は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で場合により置換されており；

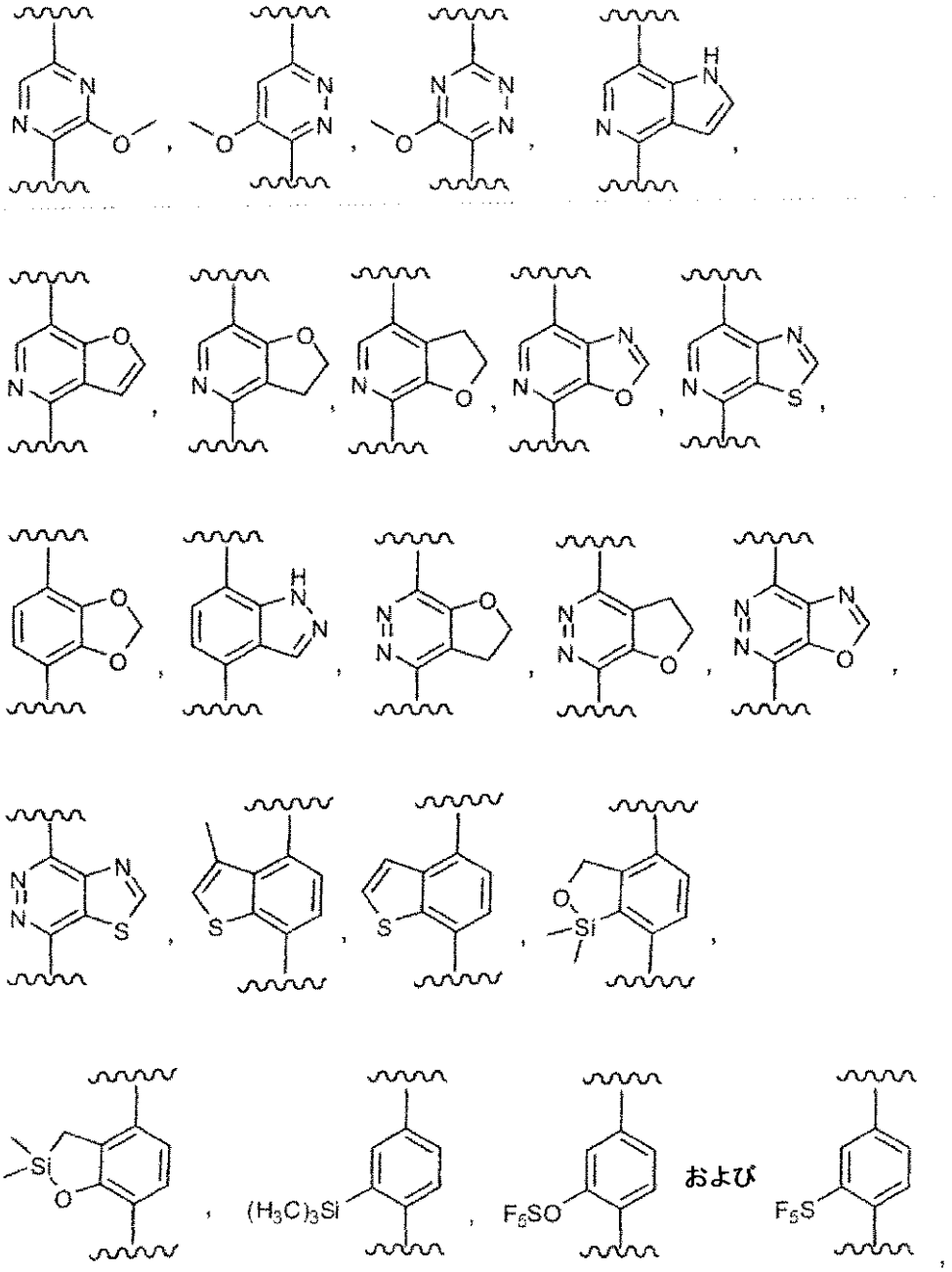
Ｒ^{10}は、アリール－（例えば、フェニル）、ヘテロアリール－（例えば、ピリジル）、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－、ヘテロシクリルアルケニル－、縮合ベンゾシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル－）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合シクロアルキルアリール（すなわち、シクロアルキル縮合アリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合アリール－）、縮合シクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、シクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合ヘ

テロアリール－）、

【化２３７】



【化２３８】



からなる群から選択され、式中、Ｘは、Ｏ、－Ｎ（Ｒ^{14}）－および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｒ^{10}部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で場合により置換されているか；または

Ｒ^{9}とＲ^{10}とが結合して、縮合三環系を形成し、Ｒ^{9}およびＲ^{10}は、先に定義したとおりであり、Ｒ^{9}とＲ^{10}とを結合する環は、アルキル環またはヘテロアルキル環またはアリール環またはヘテロアリール環またはアルケニル環またはヘテロアルケニル環であり（例えば、前記三環系は、Ｒ^{9}とＲ^{10}の両方を結合している原子に隣接する原子を結合することによって形成され）；

Ｒ^{14}は、Ｈ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル－、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、および－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）

からなる群から選択され；

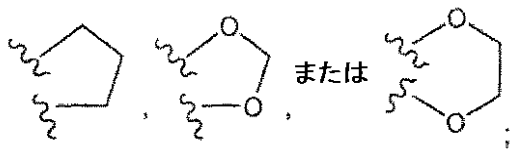
R^{15A}およびR^{16A}は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－アルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキルアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリルアルキル、$(R^{18})_n$－アリール、$(R^{18})_n$－アリールアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロアリールおよび$(R^{18})_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択されるか；または

R^{15}、R^{16}およびR^{17}は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－アルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキルアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリルアルキル、$(R^{18})_n$－アリール、$(R^{18})_n$－アリールアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロアリールおよび$(R^{18})_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{18}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、$-NO_2$、ハロ、ヘテロアリール、HO－アルキルオキシアルキル、$-CF_3$、－CN、アルキル－CN、$-C(O)R^{19}$、$-C(O)OH$、$-C(O)OR^{19}$、$-C(O)NHR^{20}$、$-C(O)NH_2$、$-C(O)NH_2-C(O)N$（アルキル）$_2$、$-C(O)N$（アルキル）（アリール）、$-C(O)N$（アルキル）（ヘテロアリール）、$-SR^{19}$、$-S(O)_2R^{20}$、$-S(O)NH_2$、$-S(O)NH$（アルキル）、$-S(O)N$（アルキル）（アルキル）、$-S(O)NH$（アリール）、$-S(O)_2NH_2$、$-S(O)_2NHR^{19}$、$-S(O)_2NH$（ヘテロシクリル）、$-S(O)_2N$（アルキル）$_2$、$-S(O)_2N$（アルキル）（アリール）、$-OCF_3$、$-OH$、$-OR^{20}$、－O－ヘテロシクリル、－O－シクロアルキルアルキル、－O－ヘテロシクリルアルキル、$-NH_2$、$-NHR^{20}$、$-N$（アルキル）$_2$、$-N$（アリールアルキル）$_2$、$-N$（アリールアルキル）－（ヘテロアリールアルキル）、$-NHC(O)R^{20}$、$-NHC(O)NH_2$、$-NHC(O)NH$（アルキル）、$-NHC(O)N$（アルキル）（アルキル）、$-N$（アルキル）C（O）NH（アルキル）、$-N$（アルキル）C（O）N（アルキル）（アルキル）、$-NHS(O)_2R^{20}$、$-NHS(O)_2NH$（アルキル）、$-NHS(O)_2N$（アルキル）（アルキル）、$-N$（アルキル）$S(O)_2NH$（アルキル）および－N（アルキル）$S(O)_2N$（アルキル）（アルキル）からなる群から選択されるか；または

隣接する炭素上にある２個のR^{18}部分が結合して、

【化２３９】



；

を形成し；

R^{19}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{20}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ置換アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{21}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、＝O、＝N－R^{2}、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテ

ロアリールアルキル、ハロ、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｐ（Ｏ）（ＣＨ$_3$）$_2$、－ＳＯ（＝ＮＲ^{15}）Ｒ^{16}－、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＣＨ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｒ^{15}；－ＣＨ$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}、＝ＮＯＲ^{15}、－Ｎ$_3$、－ＮＯ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{15A}、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）$_2$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）および－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）$_2$（Ｒ^{4}と、これらが結合する炭素原子とが一緒になって、５～１０員の環を形成し、前記環が、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－ＮＲ^2－からなる群から選択される１～３個のヘテロ原子を場合により含有する）からなる群から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルであるＲ^{21}基が、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{22}基で場合により置換されており；

Ｒ^{22}基は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、－ＣＦ$_3$、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－アルキル－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｎ$_3$、＝ＮＯＲ^{15}、－ＮＯ$_2$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}および－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{15A}からなる群から選択され、

但し、環（Ａ）は、環に、－Ｓ－Ｓ－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に－Ｏ－Ｏ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｏ－Ｓ－結合、－Ｏ－Ｓ（Ｏ）－結合、または－Ｏ－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｓ－Ｎ－結合を有しておらず；

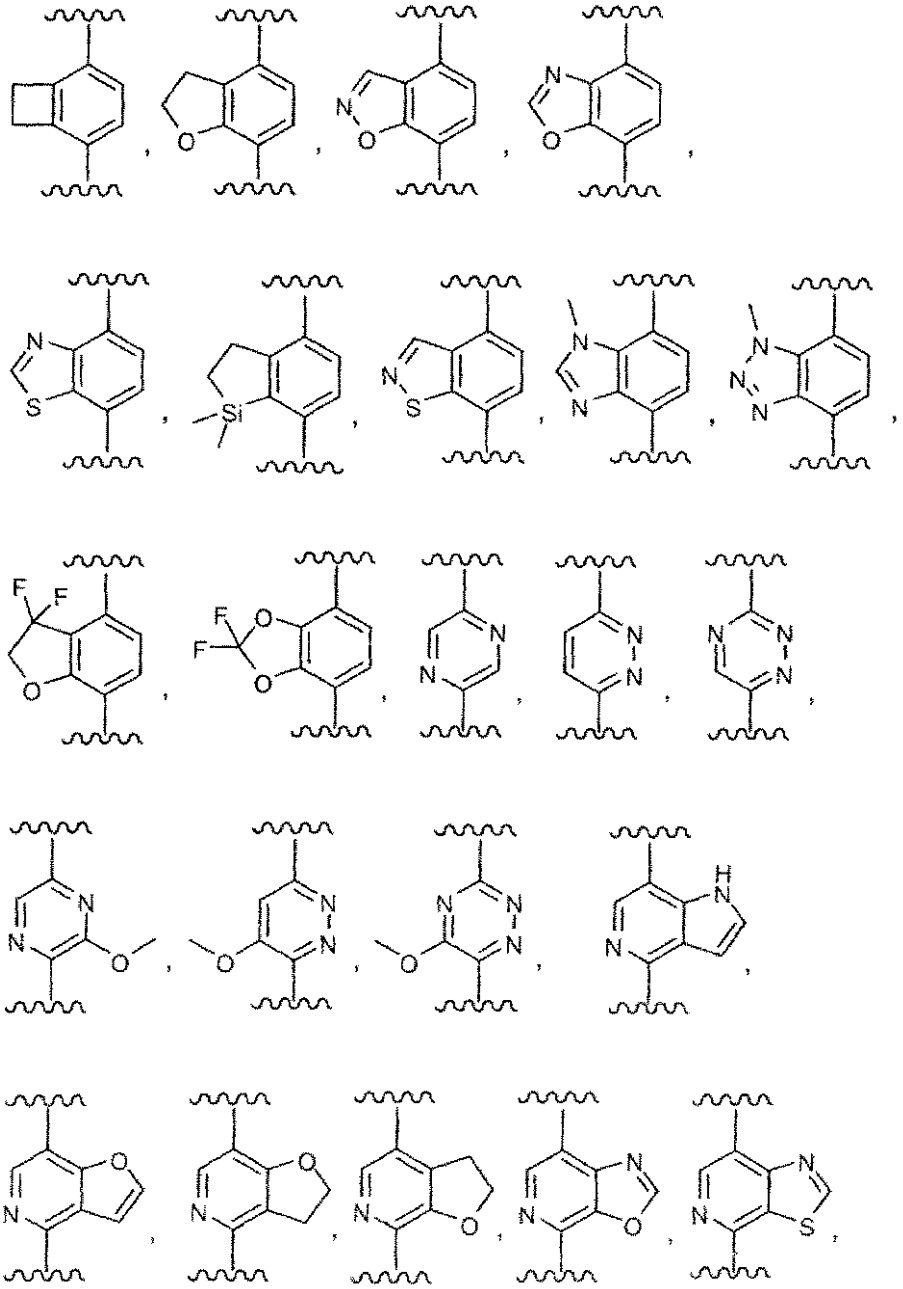
環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｏ－Ｎ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、隣接する３個の窒素原子を有していない〕。

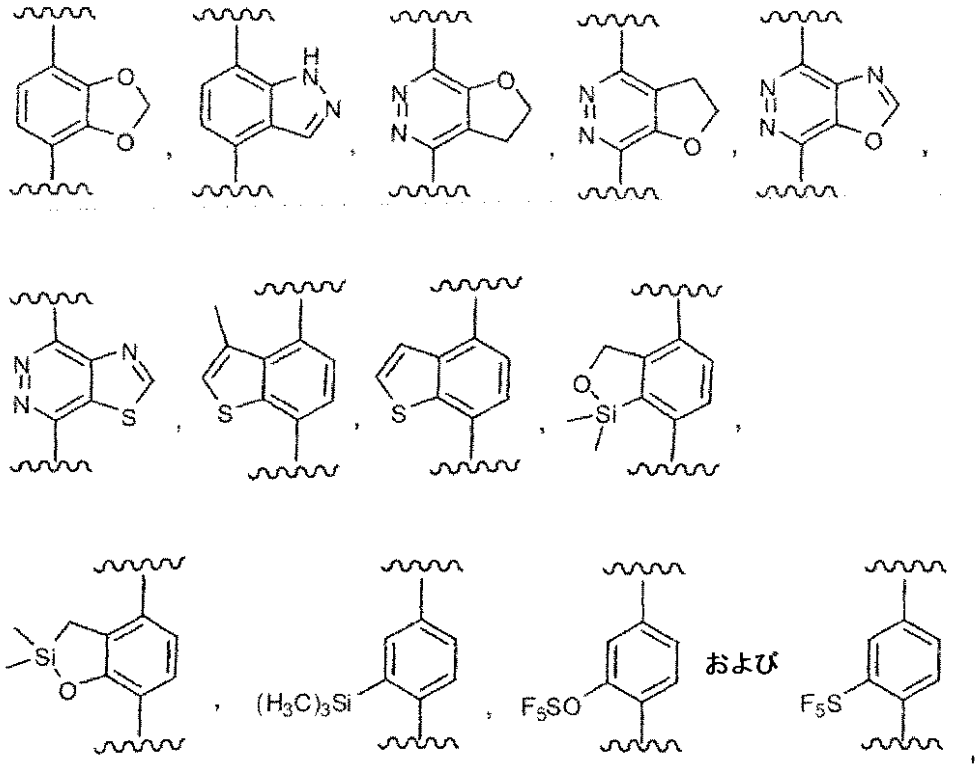
【請求項２】

Ｒ^{10}が、

【化２４０】



【化２４１】



からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する、請求項２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ^{9}が、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項５】

Ｒ^{9}が、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される、請求項２に記載の化合物。

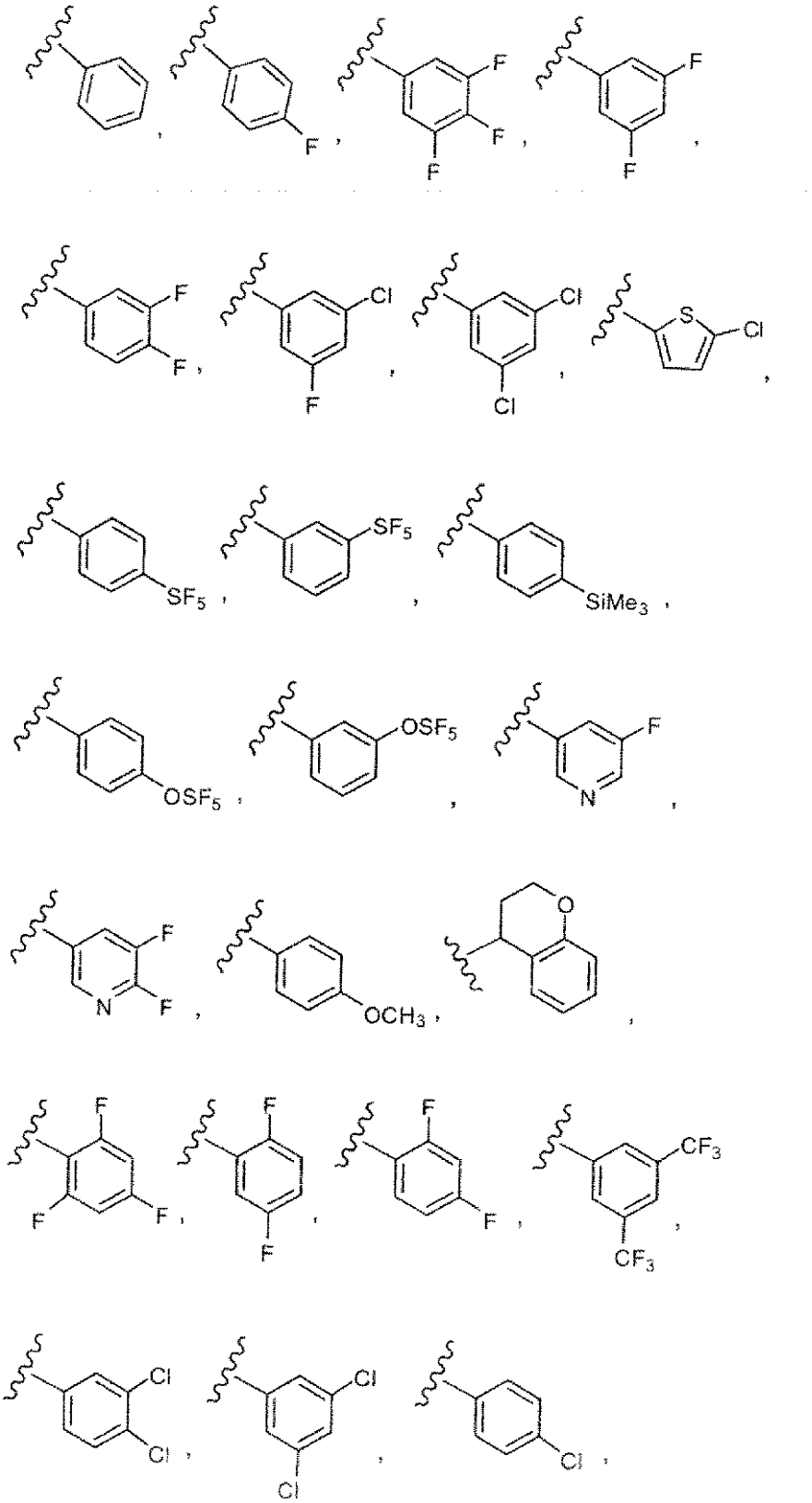
【請求項６】

Ｒ^9－Ｒ^{10}－部分が、１ｂｂ～４０ｂｂからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項７】

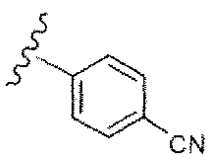
Ｒ^{1}が、

【化２４２】

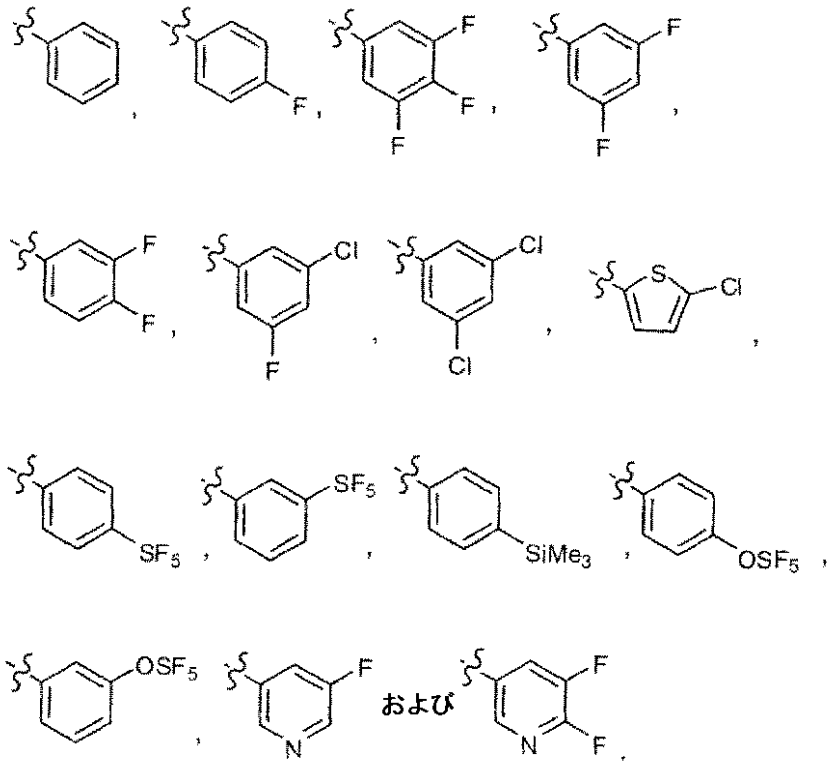


【化２４３】

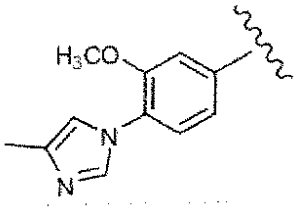
および



からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項８】
Ｒ^{1}が、
【化２４４】

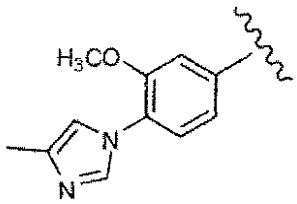


からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項９】
Ｒ^{1}が、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}部分で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}部分が、－ＳＦ$_{5}$、－ＯＳＦ$_{5}$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_{3}$からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１０】
Ｒ^{1}が、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}部分で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}部分が、－ＳＦ$_{5}$および－ＯＳＦ$_{5}$からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１１】
Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２４５】



である、請求項１に記載の化合物。
【請求項１２】
Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４６】

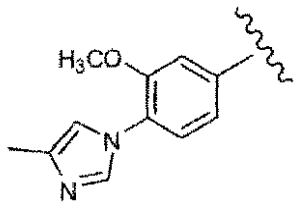


である、請求項７に記載の化合物。

【請求項１３】

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４７】

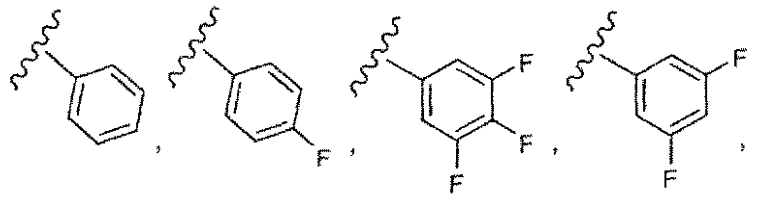


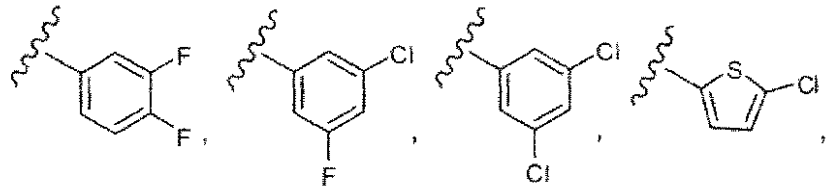
である、請求項８に記載の化合物。

【請求項１４】

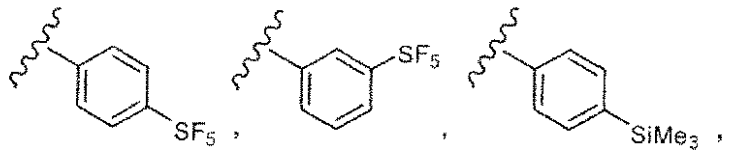
Ｒ^{1}が、

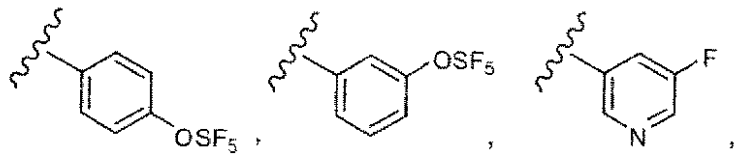
【化２４８】

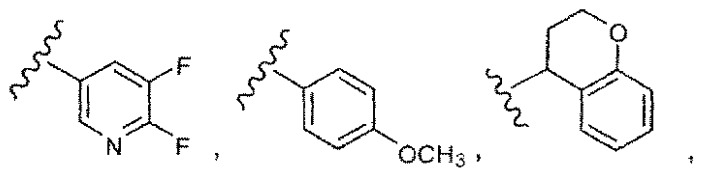


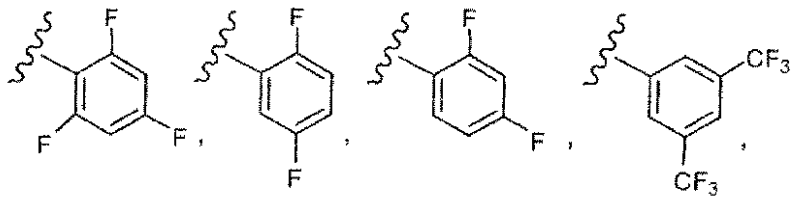


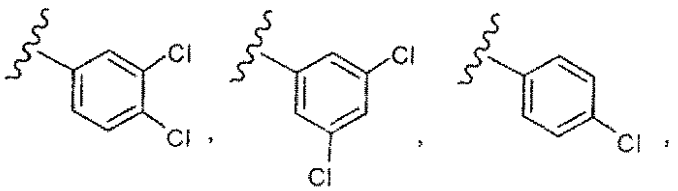
【化２４９】



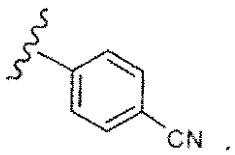








および

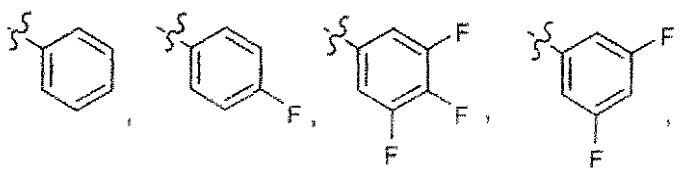


からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である、請求項１に記載の化合物。

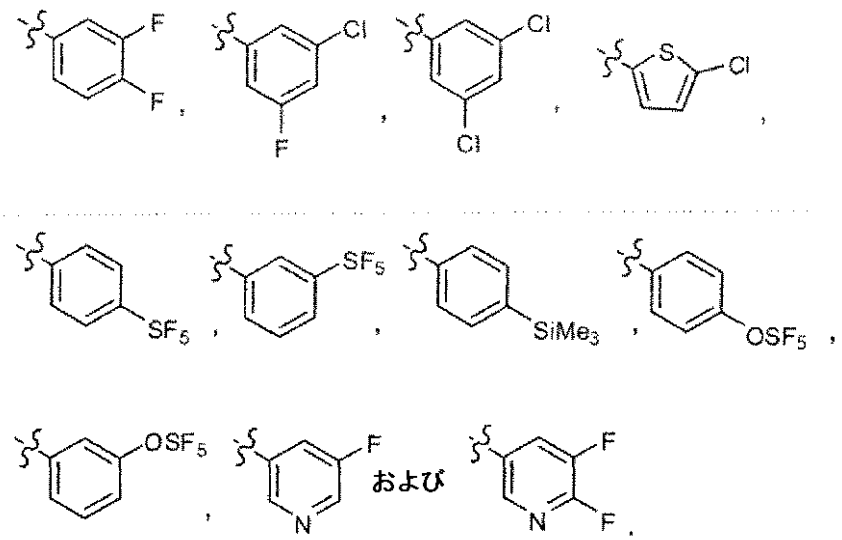
【請求項１５】

Ｒ[1]が、

【化２５０】



【化２５１】



からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１６】

R^1が、ＦおよびＣｌからなる群から独立して選択される１～３個のハロで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１７】

R^1が、１～３個の独立して選択されるR^{21}部分で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり、少なくとも１個のR^{21}部分が、－SF_5、－OSF_5、および－Si（R^{15A}）$_3$からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項１８】

前記R^{10}が、アリール、および１個以上のR^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記R^9基が、ヘテロアリール、および１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、R^{21}が、それぞれ独立して選択される、請求項１に記載の化合物。

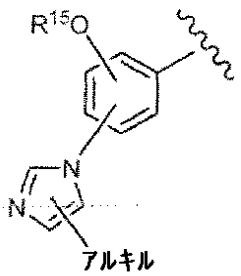
【請求項１９】

前記R^{10}が、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^9が、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、R^{21}が、それぞれ独立して選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項２０】

R^9－R^{10}－部分が、

【化２５２】

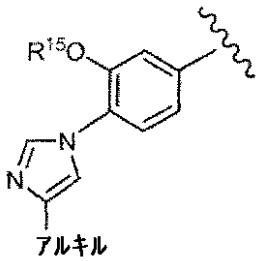


である、請求項１に記載の化合物。

【請求項２１】

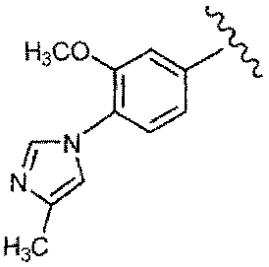
R^9－R^{10}－部分が、

【化２５３】



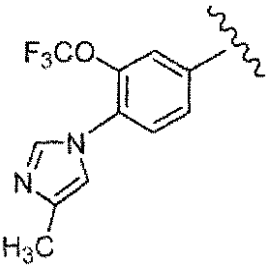
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５４】



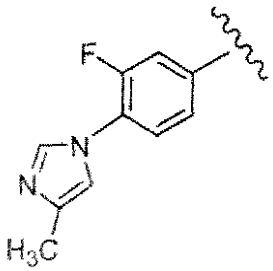
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５５】



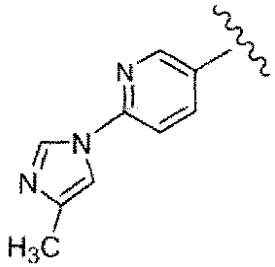
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５６】



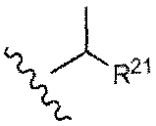
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５７】

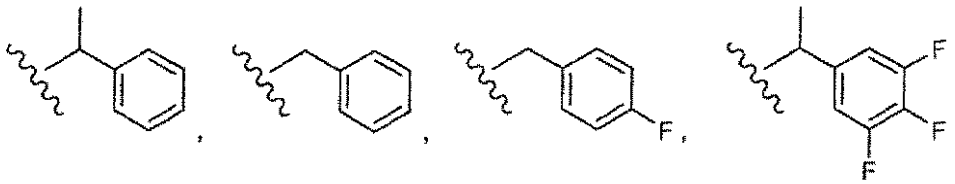


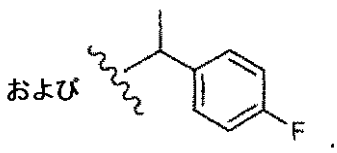
である、請求項１に記載の化合物。

【請求項２２】
前記Ｒ[1]基が、
【化２５８】



であり、Ｒ[21]が、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ[22]基で置換される、請求項１に記載の化合物。
【請求項２３】
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリールがフェニルであり、前記アルキル基が、メチルまたはエチルであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ[22]基で置換されており、各Ｒ[22]基が、同じハロであるか、または異なるハロであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ[22]基で置換されており、ハロがＦであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ[22]基で置換されており、ハロがＦである、請求項１に記載の化合物。
【請求項２４】
前記Ｒ[1]が、
【化２５９】





からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項２５】
前記Ｒ[10]が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、前記Ｒ[9]基が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択

される、請求項１に記載の化合物。
【請求項２６】
（１）R^1が、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であるか、または
R^1が、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、前記R^{21}基が、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、
R^{10}が、アリール、および１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、
R^9が、ヘテロアリール、および１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択されるか；または
（２）R^1が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
R^9が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（３）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるハロで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個以上の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
R^9が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（４）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}がアルキルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（５）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（６）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（７）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（８）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェ

ニルが、１個または２個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（９）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１０）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、およびハロである１個または２個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１１）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のハロであるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１２）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のハロであるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記Ｒ^{21}基がＦであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１３）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記Ｒ^{21}基が－ＯＲ^{15}基であり、Ｒ^{15}が$(R^{18})_n$アルキル基であり、Ｒ^{18}がハロであり、ｎが１～３であり、ハロがそれぞれ独立して選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１４）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個のＲ^{21}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{21}が－ＯＲ^{15}基であり、Ｒ^{15}が$(R^{18})_n$アルキル基であり、Ｒ^{18}がＦであり、ｎが３であり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１５）Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

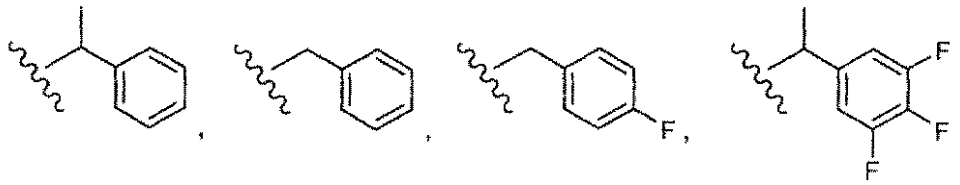
Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、

Ｒ[10]が、１個のＲ[21]基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ[21]基が－ＯＲ[15]基であり、Ｒ[15]が（Ｒ[18]）[n]アルキル基であり、Ｒ[18]がＦであり、ｎが３であり、アルキル基がメチルであり、

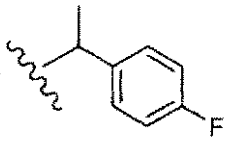
Ｒ[9]が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１６）Ｒ[1]が、

【化２６０】

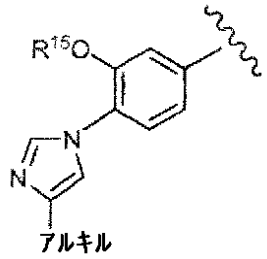


および



からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

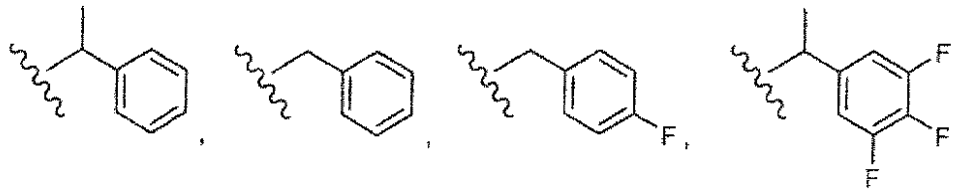
【化２６１】



であるか；または

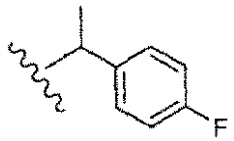
（１７）Ｒ[1]が、

【化２６２】



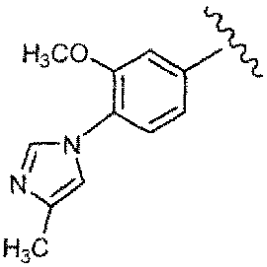
【化２６３】

および



からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

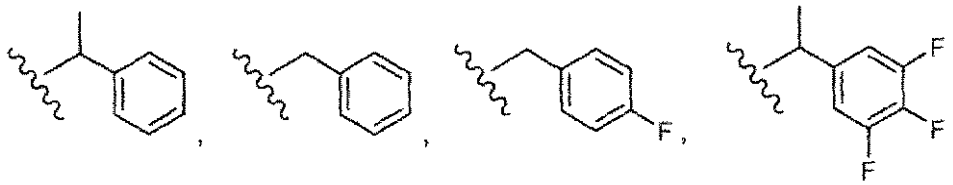
【化２６４】



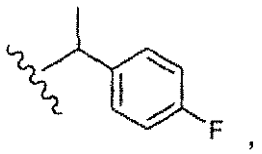
であるか；または

（１８）Ｒ[1]が、

【化２６５】

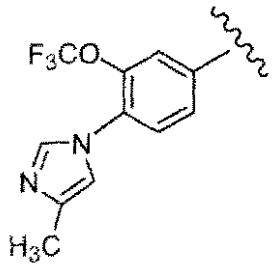


および



からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

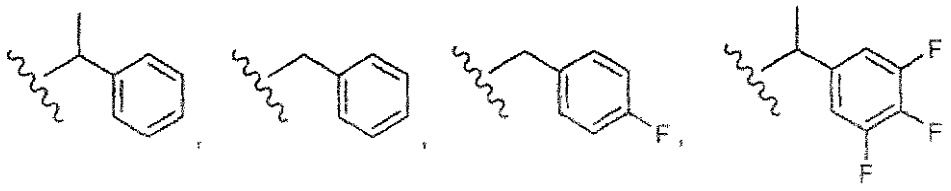
【化２６６】



であるか；または

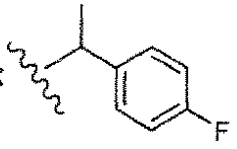
（１９）Ｒ[1]が、

【化２６７】



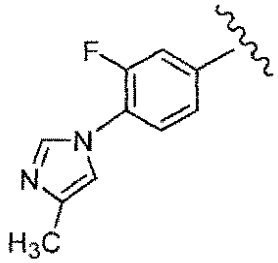
【化２６８】

および



からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

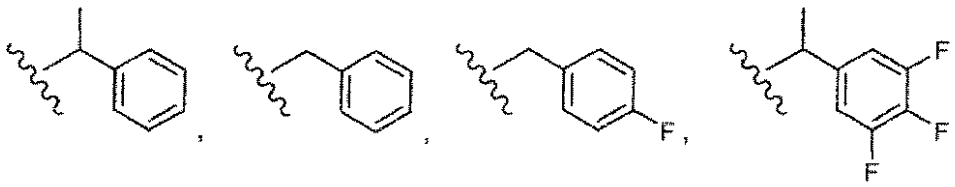
【化２６９】



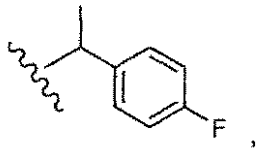
であるか；または

（２０）Ｒ[1]が、

【化２７０】

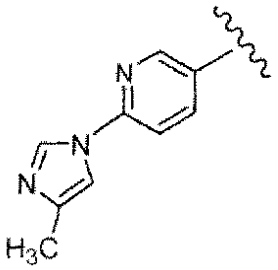


および



からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

【化２７１】



である、請求項１に記載の化合物。

【請求項２７】

Ｇ[5]が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項２８】

Ｇ[5]が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ[6]が、ＣおよびＣＨからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項２９】

ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３０】

４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３１】

ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、およびＩＢからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３２】

４３Ａ～５４Ａからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項３３】
４３～５４からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項３４】
８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項３５】
前記化合物が８５．１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項３６】
前記化合物が８８．１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項３７】
前記化合物が９１．１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項３８】
前記化合物が１００である、請求項１に記載の化合物。
【請求項３９】
前記化合物が１０１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４０】
前記化合物が１０２である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４１】
前記化合物が１０３である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４２】
前記化合物が１０４である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４３】
前記化合物が１０５である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４４】
前記化合物が１０６である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４５】
前記化合物が１０７である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４６】
前記化合物が１０８である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４７】
前記化合物が１０９である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４８】
前記化合物が１１０である、請求項１に記載の化合物。
【請求項４９】
前記化合物が１１１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５０】
前記化合物が１１２である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５１】
前記化合物が１１３である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５２】
前記化合物が１１４である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５３】
前記化合物が１１５である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５４】
前記化合物が１１６である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５５】
前記化合物が１１７である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５６】
前記化合物が１１８である、請求項１に記載の化合物。

【請求項５７】
前記化合物が１１９である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５８】
前記化合物が１２０である、請求項１に記載の化合物。
【請求項５９】
前記化合物が１２１である、請求項１に記載の化合物。
【請求項６０】
前記化合物が１２２である、請求項１に記載の化合物。
【請求項６１】
前記化合物が１２３である、請求項１に記載の化合物。
【請求項６２】
前記化合物が１２４である、請求項１に記載の化合物。
【請求項６３】
式（ＩＡ）を有する、請求項１に記載の化合物。
【請求項６４】
式（ＩＢ）を有する、請求項１に記載の化合物。
【請求項６５】
純粋で単離された形態である、請求項１に記載の化合物。
【請求項６６】
純粋で単離された形態である、請求項３４に記載の化合物。
【請求項６７】
請求項１に記載の化合物の医薬的に許容される塩。
【請求項６８】
請求項３４に記載の化合物の医薬的に許容される塩。
【請求項６９】
請求項１に記載の化合物の溶媒和物。
【請求項７０】
請求項３４に記載の化合物の溶媒和物。
【請求項７１】
請求項１に記載の化合物の医薬的に許容されるエステル。
【請求項７２】
請求項３４に記載の化合物の医薬的に許容されるエステル。
【請求項７３】
治療有効量の請求項１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む、医薬組成物。
【請求項７４】
治療有効量の請求項３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む、医薬組成物。
【請求項７５】
治療有効量の請求項１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む、医薬組成物。
【請求項７６】
治療有効量の請求項３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セ

クレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む、医薬組成物。

【請求項７７】

治療有効量の請求項１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む、医薬組成物。

【請求項７８】

治療有効量の請求項３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む、医薬組成物。

【請求項７９】

（１）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物、または

（２）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む医薬組成物、または

（３）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む医薬組成物、または

（４）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤とを含む医薬組成物、または

（５）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤とを含む医薬組成物、または

（６）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤とを含む医薬組成物、または

（７）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤とを含む医薬組成物、または

（８）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許

容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の塩酸ドネペジルとを含む医薬組成物、または
（９）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の塩酸ドネペジルとを含む医薬組成物。
【請求項８０】
有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、γ－セクレターゼを調節する方法。
【請求項８１】
有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、１つ以上の神経変成疾患を処置する方法。
【請求項８２】
有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害する方法。
【請求項８３】
有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８４】
有効量の請求項３４に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８５】
有効量の請求項１に記載の１種の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８６】
有効量の請求項３４に記載の１種の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８７】
（１）有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物と、
（２）ＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する成分とを、処置の必要な患者に投与する工程を含む、（ａ）γ－セクレターゼを調節する方法、または（ｂ）１つ以上の神経変性疾患を処置する方法、または（ｃ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害する方法、または（ｄ）アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８８】
有効量の請求項１に記載の１種類の化合物と、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤およびβ－セクレターゼ阻害剤から選択される有効量の１つ以上の化合物とを、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項８９】
有効量の請求項１に記載の１種類の化合物と、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
【請求項９０】
（１）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の

１つ以上のコリンエステラーゼと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（２）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（３）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１種類の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（４）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１種類の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（５）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のリバスティグミンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（６）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のタクリンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（７）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のＴａｕキナーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（８）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、ＧＳＫ３β阻害剤、ｃｄｋ５阻害剤、ＥＲＫ阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上のＴａｕキナーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（９）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１種類の抗－Ａβワクチン接種と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１０）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＡＰＰリガンドと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１１）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、インスリン分解酵素および／またはネプリライシンをアップレギュレーションする有効な量の１つ以上の薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１２）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のコレステロール値低下剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１３）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、およびエゼチミブからなる群から選択される有効量の１つ以上のコレステロール値低下薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１４）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のフィブラートと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１５）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、アルミニウムクロフィブラートからなる群から選択される有効量の１つ以上のフィブラートと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１６）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＬＸＲアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を

処置する方法、または
（１７）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＬＲＰ模倣物と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（１８）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（１９）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のニコチン性受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２０）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＨ３受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２１）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のヒストンデアセチラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２２）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｈｓｐ９０阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２３）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｍ１ムスカリン受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２４）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストｍＧｌｕＲ１またはｍＧｌｕＲ５のポジティブアロステリックモジュレーターまたはアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２５）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｍＧｌｕＲ２／３アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２６）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、神経炎症を減らすことが可能な有効量の１つ以上の抗炎症剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２７）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のプロスタグランジンＥＰ２受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２８）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＰＡＩ－１阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２９）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、Ａβ流出を誘導することが可能な有効量の１つ以上の薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（３０）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のゲルゾリンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（３１）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３２）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１種類の化合物を投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３３）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候

群を処置する方法、または
（３４）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３５）処置が必要な患者に、有効量の１つ以上の請求項１に記載の１種類の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３７）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１種類の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３８）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、軽度認知障害を処置する方法、または
（３９）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、緑内障を処置する方法、または
（４０）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、脳アミロイド血管症を処置する方法、または
（４１）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、卒中を処置する方法、または
（４２）本発明は、処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、認知症を処置する方法を提供するか、または
（４３）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、小膠細胞症を処置する方法、または
（４４）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、脳の炎症を処置する方法、または
（４５）処置が必要な患者に、有効量の請求項１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、嗅覚機能の低下を処置する方法。
【請求項９１】
別個の容器に入れられ、１個の包装に入れられた、組み合わせて使用するための医薬組成物を含み、１つの容器は、医薬的に許容されるキャリアに有効量の請求項１に記載の１種類の化合物を加えたものを含み、別の容器は、有効量の別の医薬活性を有する成分を含み、請求項１に記載の化合物と、他の医薬活性を有する成分とを合わせた量が、（ａ）アルツハイマーを処置するのに有効であるか、または（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害するのに有効であるか、または（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有効であるか、または（ｄ）γ－セクレターゼ活性を調節するのに有効である、キット。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
（関連出願への相互参照）
本願は、２００７年１２月１１日に出願された米国仮特許出願第６０／０１２，８５７号の利益を主張する。
【０００２】
発明の分野
本発明は、γ－セクレターゼモジュレーター（阻害剤、アンタゴニストなどを含む）として有用な特定のヘテロ環化合物、この化合物を含む医薬組成物、中枢神経系の障害（例えば、アルツハイマー病のような神経変性疾患、アミロイドタンパク質の沈着に関する他の疾患）を含む種々の疾患を処置するための、この化合物および組成物を用いる処置方法に関する。これらの物質は、特に、アミロイドβ（本明細書では以下、Ａβと称する）の産生を減らすのに有用であり、これは、Ａβによって生じる疾患（例えば、アルツハイマー病およびダウン症候群）の処置に有効である。

【背景技術】
【０００３】
発明の背景
アルツハイマー病は、ニューロンの変性および消失、ならびに老人斑の形成、神経原線維の変化を特徴とする疾患である。現時点では、アルツハイマー病の処置は、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤を代表例とする症状を改善する薬剤を用いた、症状の治療に限定されており、疾患の進行を抑える基本的な治療薬はまだ開発されていない。アルツハイマー病の基本的な治療薬を作り出すためには、病態の発症の原因を制御する方法の開発が必要である。
【０００４】
アミロイド前駆体タンパク質の代謝物であるＡβタンパク質（本明細書では以下、ＡＰＰと称する）は、ニューロンの変性および消失、および認知症の状態の発症に大きくかかわっていると考えられている（例えば、Ｋｌｅｉｎ Ｗ Ｌら、Ｐｒｏｃｅｅｄｉｎｇ Ｎａｔｉｏｎａｌ Ａｃａｄｅｍｙ ｏｆ Ｓｃｉｅｎｃｅ ＵＳＡ、Ｓｅｐ．２、２００３、１００（１８）、ｐ．１０４１７－２２を参照、この文献は、可逆的な記憶喪失に関する分子基盤を示唆している。
【０００５】
Ｎｉｔｓｃｈ Ｒ Ｍおよび１６名の共同研究者のＡｎｔｉｂｏｄｉｅｓ ａｇａｉｎｓｔ β－ａｍｙｌｏｉｄ ｓｌｏｗ ｃｏｇｎｉｔｉｖｅ ｄｅｃｌｉｎｅ ｉｎ Ａｌｚｈｅｉｍｅｒ’ｓ ｄｉｓｅａｓｅ、Ｎｅｕｒｏｎ、Ｍａｙ ２２、２００３、３８（４）、ｐ．５４７－５５４）は、Ａβタンパク質の主成分が、４０アミノ酸からなるＡβ４０と、Ｃ末端にさらに２個のアミノ酸が加わったＡβ４２であることを示唆している。Ａβ４０およびＡβ４２は、凝集する傾向があり（例えば、Ｊａｒｒｅｌｌ Ｊ Ｔら、Ｔｈｅ ｃａｒｂｏｘｙ ｔｅｒｍｉｎｕｓ ｏｆ ｔｈｅ β ａｍｙｌｏｉｄ ｐｒｏｔｅｉｎ ｉｓ ｃｒｉｔｉｃａｌ ｆｏｒ ｔｈｅ ｓｅｅｄｉｎｇ ｏｆ ａｍｙｌｏｉｄ ｆｏｒｍａｔｉｏｎ：ｉｍｐｌｉｃａｔｉｏｎｓ ｆｏｒ ｔｈｅ ｐａｔｈｏｇｅｎｅｓｉｓ ｏｆ Ａｌｚｈｅｉｍｅｒ’ｓ ｄｉｓｅａｓｅ、Ｂｉｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ、Ｍａｙ １１，１９９３、３２（１８）、ｐ．４６９３－４６９７）、老人斑の主成分を構成している（例えば、（Ｇｌｅｎｎｅｒ ＧＧら、Ａｌｚｈｅｉｍｅｒ’ｓ ｄｉｓｅａｓｅ：ｉｎｉｔｉａｌ ｒｅｐｏｒｔ ｏｆ ｔｈｅ ｐｕｒｉｆｉｃａｔｉｏｎ ａｎｄ ｃｈａｒａｃｔｅｒｉｚａｔｉｏｎ ｏｆ ａ ｎｏｖｅｌ ｃｅｒｅｂｒｏｖａｓｃｕｌａｒ ａｍｙｌｏｉｄ ｐｒｏｔｅｉｎ、Ｂｉｏｃｈｅｍｉｃａｌ ａｎｄ Ｂｉｏｐｈｙｓｉｃａｌ Ｒｅｓｅａｒｃｈ Ｃｏｍｍｕｎｉｃａｔｉｏｎｓ、Ｍａｙ １６、１９８４、１２０（３）、ｐ．８８５－９０。さらに、Ｍａｓｔｅｒｓ Ｃ Ｌら、Ａｍｙｌｏｉｄ ｐｌａｑｕｅ ｃｏｒｅ ｐｒｏｔｅｉｎ ｉｎ Ａｌｚｈｅｉｍｅｒ ｄｉｓｅａｓｅ ａｎｄ Ｄｏｗｎ ｓｙｎｄｒｏｍｅ、Ｐｒｏｃｅｅｄｉｎｇ Ｎａｔｉｏｎａｌ Ａｃａｄｅｍｙ ｏｆ Ｓｃｉｅｎｃｅ ＵＳＡ、Ｊｕｎｅ １９８５、８２（１２）、ｐ．４２４５－４２４９を参照）。
【０００６】
さらに、ＡＰＰ遺伝子およびプレセニリン遺伝子の変異が、家族性アルツハイマー病で観察されており、この変異によって、Ａβ４０およびＡβ４２の産生増加が観察されている（例えば、Ｇｏｕｒａｓ Ｇ Ｋら、Ｉｎｔｒａｎｅｕｒｏｎａｌ Ａβ１４２ ａｃｃｕｍｕｌａｔｉｏｎ ｉｎ ｈｕｍａｎ ｂｒａｉｎ、Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐａｔｈｏｌｏｇｙ、Ｊａｎｕａｒｙ ２０００、１５６（１）、ｐ．１５－２０を参照。さらに、Ｓｃｈｅｕｎｅｒ Ｄら、Ｎａｔｕｒｅ Ｍｅｄｉｃｉｎｅ、Ａｕｇｕｓｔ １９９６、２（８）、ｐ．８６４－８７０；および、Ｆｏｒｍａｎ Ｍ Ｓら、Ｄｉｆｆｅｒｅｎｔｉａｌ ｅｆｆｅｃｔｓ ｏｆ ｔｈｅ Ｓｗｅｄｉｓｈ ｍｕｔａｎｔ ａｍｙｌｏｉｄ ｐｒｅｃｕｒｓｏｒ ｐｒｏｔｅｉｎ ｏｎ β－ａｍｙｌｏｉｄ ａｃｃｕｍｕｌａｔｉｏｎ ａｎｄ ｓｅｃｒｅｔｉｏｎ ｉｎ ｎｅｕｒｏｎｓ ａｎｄ ｎｏｎｎｅｕｒｏｎａｌ ｃｅｌｌｓ、Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｂｉｏｌｏ

ｇｉｃａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ、Ｄｅｃ．１９、１９９７、２７２（５１）、ｐ．３２２４７－３２２５３を参照）。したがって、Ａβ４０およびＡβ４２の産生を減らす化合物は、アルツハイマー病の進行を制御する薬剤であるか、または疾患を予防する薬剤であると予測される。

【０００７】

βーセクレターゼによってＡＰＰが開裂し、次いで、γーセクレターゼによって開裂することによって、上述のＡβが産生する。このことを考慮し、Ａβの産生を減らすために、γーセクレターゼおよびβーセクレターゼの阻害剤を作製することが試みられてきた。これらの既知のセクレターゼ阻害剤の多くは、ペプチドまたはペプチド模倣物（例えば、Ｌ－６８５，４５８）である。アスパルチルプロテアーゼの遷移状態模倣物であるＬ－６８５，４５８は、γーセクレターゼ活性の強力な阻害剤である（Ｂｉｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ、Ａｕｇ．１、２０００、３９（３０）、ｐ．８６９８－８７０４）。

【０００８】

本発明に関連して、興味深いのは、以下の文献である。ＵＳ　２００７／０１１７７９８（Ｅｉｓａｉ、２００７年５月２４日公開）；ＵＳ　２００７／０１１７８３９（Ｅｉｓａｉ、２００７年５月２４日公開）；ＵＳ　２００６／０００４０１３（Ｅｉｓａｉ、２００６年１月５日公開）；ＷＯ　２００５／１１０４２２（Ｂｏｅｈｒｉｎｇｅｒ　Ｉｎｇｅｌｈｅｉｍ、２００５年１１月２４日公開）；ＷＯ　２００６／０４５５５４（Ｃｅｌｌｚｏｎｅ　ＡＧ、２００６年５月４日公開）；ＷＯ　２００４／１１０３５０（Ｎｅｕｒｏｇｅｎｅｔｉｃｓ、２００４年１２月２３日公開）；ＷＯ　２００４／０７１４３１（Ｍｙｒｉａｄ　Ｇｅｎｅｔｉｃｓ、２００４年８月２６日公開）；ＵＳ　２００５／００４２２８４（Ｍｙｒｉａｄ　Ｇｅｎｅｔｉｃｓ、２００５年２月２３日公開）、ＷＯ　２００６／００１８７７（Ｍｙｒｉａｄ　Ｇｅｎｅｔｉｃｓ、２００６年１月５日公開）。

【０００９】

Ａβに関連する疾患および障害を処置するための新規化合物、調合物、処置薬および治療薬が必要とされている。したがって、本発明の目的は、上述の疾患および障害を処置または予防または軽減するのに有用な化合物を提供することである。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【００１０】

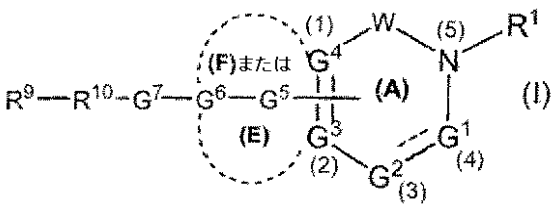
多くの実施形態において、本発明は、γーセクレターゼモジュレーター（阻害剤、アンタゴニストなどを含む）としての新規な化合物クラス、そのような化合物を調製する方法、１つ以上のそのような化合物を含む医薬組成物、１つ以上のそのような化合物を含む医薬調合物を調製する方法、そのような化合物またはそのような医薬組成物を用い、Ａβに関連する１つ以上の疾患を処置、予防、阻害または軽減する方法を提供する。

【００１１】

本発明は、γーセクレターゼモジュレーターである下式の新規化合物

【００１２】

【化１】

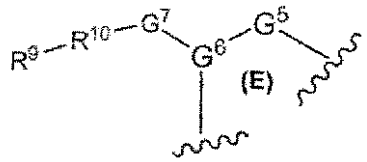


またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物を提供し、式中、

（１）環（Ｅ）は、以下の部分

【００１３】

【化２】

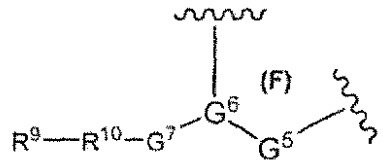


を含み、Ｇ^{5}は、Ｇ^{4}に結合しており、環（Ｅ）の残りの部分が、Ｇ^{6}とＧ^{3}との間に形成されており、

（２）環（Ｆ）は、以下の部分

【００１４】

【化３】



を含み、Ｇ^{5}は、Ｇ^{3}に結合しており、環（Ｆ）の残りの部分が、Ｇ^{6}とＧ^{4}との間に形成されており、

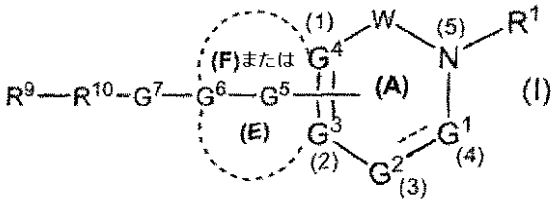
（３）Ｇ^{1}、Ｇ^{2}、Ｇ^{3}、Ｇ^{4}、Ｗ、Ｒ^{1}、環（Ａ）、環（Ｅ）、環（Ｆ）、Ｇ^{5}、Ｇ^{6}、Ｇ^{7}、Ｒ^{9}、Ｒ^{10}は、独立して選択され、式（ＩＡ）および式（ＩＢ）について先に定義したとおりである。

【００１５】

したがって、本発明は、

【００１６】

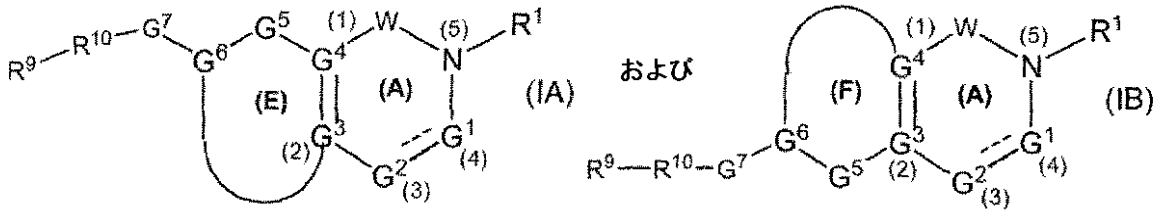
【化４】



式（Ｉ）の新規化合物であって、

【００１７】

【化５】



からなる群から選択されるもの、またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物を提供し、式中のすべての置換基は、以下に定義されている。

【００１８】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００１９】

さらに、本発明は、本発明は、精製され、単離された形態で、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２０】

さらに、本発明は、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４

、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２１】

さらに、本発明は、式４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２２】

さらに、本発明は、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２３】

さらに、本発明は、式４３Ａ～５４Ａの化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２４】

さらに、本発明は、式４３～５４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２５】

さらに、本発明は、式８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物を提供する。

【００２６】

さらに、本発明は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容されるその塩、エステルまたは溶媒和物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物を提供する。

【００２７】

さらに、本発明は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容されるその塩、エステルまたは溶媒和物と、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）他の医薬活性成分（例えば、薬物）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物を提供する。

【００２８】

式（Ｉ）の化合物は、γ－セクレターゼモジュレーターとして有用な場合があり、例えば、中枢神経系の障害（例えば、アルツハイマー病、ダウン症候群）のような疾患を処置し、予防するのに有用な場合がある。

【００２９】

したがって、本発明は、（１）γ－セクレターゼを調節する（阻害すること、アンタゴナイズすることなどを含む）方法；（２）１つ以上の神経変性疾患を処置する方法；（３）神経組織（例えば、脳）内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害する方法；（４）アルツハイマー病に対する方法；（５）ダウン症候群を処置する方法を提供し、それぞれの方法は、そのような処置が必要な患者に、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物を投与する工程を含む。

【００３０】

さらに、本発明は、（１）γ－セクレターゼを調整するための組み合わせ治療、または（２）１つ以上の神経変性疾患を処置するための組み合わせ治療、または（３）神経組織（例えば、脳）内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するための組み合わせ治療、または（４）アルツハイマー病を処置するための組み合わせ治療を提供する。この組み合わせ治療は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物の投与と、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の他の医薬活性成分の投与（例えば、薬物）とを含む方法に関する。

【００３１】

さらに、本発明は、（１）軽度認知障害を処置する方法；（２）緑内障を処置する方法；（３）脳アミロイド血管症を処置する方法；（４）脳卒中を処置する方法；（５）認知症を処置する方法；（６）小膠細胞症を処置する方法；（７）脳の炎症を処置する方法；

（８）嗅覚機能の低下を処置する方法を提供し、それぞれの方法は、処置が必要な患者に、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物を投与する工程を含む。

【００３２】

さらに、本発明は、組み合わせて使用するための医薬組成物を別個の容器に入れ、１個の包装で含み、１つの容器には、医薬的に許容されるキャリアに有効量の式（Ｉ）の化合物を加えたものを含み、別の容器（すなわち、第２の容器）には、有効量の別の医薬活性成分（下記のように）を含み、式（Ｉ）の化合物と、他の医薬活性成分とを合わせた量で、上述のいずれかの方法に記載した疾患または状態を処置するのに有効である、キットを提供する。

【００３３】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、および９１．１の化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３４】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、および９１．１の化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３５】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１の化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３６】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式４３Ａ～５４Ａの化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３７】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式４３～５４の化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３８】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、上述の方法、医薬組成物またはキットのうち任意のものを提供する。

【００３９】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式（ＩＡ）の化合物である、上述のいずれかの実施形態を提供する。

【００４０】

さらに、本発明は、式（Ｉ）の化合物が、式（ＩＢ）の化合物である、上述のいずれかの実施形態を提供する。

【発明を実施するための形態】

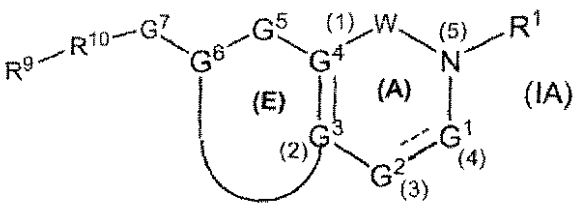
【００４１】

（発明の詳細な説明）

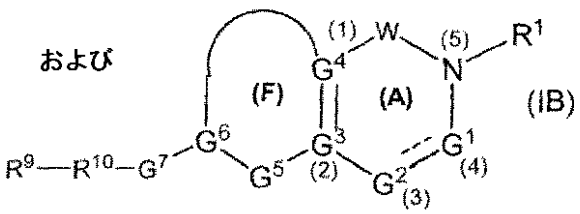
本発明は、以下の式

【００４２】

【化７】



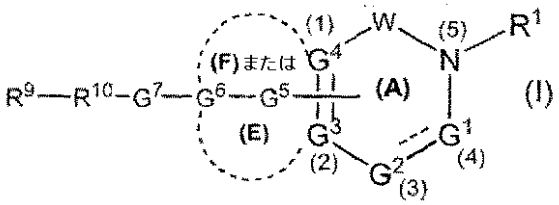
および



からなる群から選択される以下の式

【００４３】

【化６】



〔式中、G^1、G^2、G^3、G^4、W、R^1、環（Ａ）、環（Ｅ）、環（Ｆ）、G^5、G^6、G^7、R^9、およびR^{10}は、独立して選択され；

式中の文字（Ａ）、（Ｅ）、および（Ｆ）は、前記環を特定するための参照文字であり；

G^1とG^2との間にある点線は、任意の結合をあらわし；

数字（１）、（２）、（３）、（４）および（５）は、環（Ａ）の位置を特定するための参照番号であり；G^4は、位置（１）にあり、G^3は、位置（２）にあり、G^2は、位置（３）にあり、G^1は、位置（４）にあり、Ｎは、位置（５）にあり；

G^5がG^4に結合している場合（式ＩＡ）、G^4は、－Ｃ－であり、G^5がG^3に結合している場合（式ＩＢ）、G^3は、－Ｃ－であり；

前記環（Ｅ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^3はＮであり、G^4はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｅ）に対して互変異性化し、

前記環（Ｆ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^4はＮであり、G^3はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｆ）に対して互変異性化し；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、４～１０員のヘテロアリール環、アリール環、シクロアルケニル環、またはヘテロシクロアルケニル環であり；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）がヘテロシクロアルケニル環またはヘテロアリール環である場合、前記環は、場合により、－NR^2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－および－$S(O)_2$－からなる群から選択される少なくとも１個の他のヘテロ原子を含み；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、場合により、１～６個の独立して選択されるR^{21}置換基で置換されており；

ｄは、０または１であり；

ｍは、０～６であり；

ｎは、１～５であり；

ｐは、０～５であり；

ｑは、０、１または２であり、ｑは、それぞれ独立して選択され；

ｒは、１～３であり；

ｔは、１または２であり、

Wは、－Ｃ（Ｏ）－、－$S(O)_2$－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；

G^1は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－$C(R^{21})_q$－、－$N(R^2)_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、$S(O)_2$、－$C(N(R^2)_2)$－（R^2は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；但し、

（１）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在しない場合、G^1は、－$C(N(R^2)_2)$－ではなく；

（２）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在する場合、

（ａ）－$C(R^{21})_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、

（ｂ）－$N(R^2)_d$－基のｄは、０であり（G^1とG^2との間にある二重結合によ

って、Ｎ上にＨは存在しない）、
（ｃ）Ｇ^{1}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$、－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_{2}$、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$）－（Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－からなる群から選択され；但し、
（１）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在しない場合、Ｇ^{2}は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$）－ではなく；
（２）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、
（ｂ）－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－基のｄは、０であり、
（ｃ）Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{5}は、直接結合、ＣＨ、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$、－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^{2}）－、－ＣＨＲ^{3}－、Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）－、－ＣＲ^{4}（ＯＨ）－、－ＣＲ^{4}（ＯＲ^{4}）－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
Ｇ^{6}は、Ｃ、ＣＲ^{3}、およびＮからなる群から選択され；
Ｇ^{7}は、直接結合、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^{2}）－、－ＣＨＲ^{3}－、Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$、－ＣＲ^{4}（ＯＨ）－、－ＣＲ^{4}（ＯＲ^{4}）－、－Ｃ＝Ｃ－、アルキニル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－Ｏ－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－Ｏ－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－Ｏ－、－Ｏ－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｏ－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｏ－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｓ（Ｏ）$_{t}$－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－ＮＲ^{5}－、－Ｃ（Ｒ^{4}）＝Ｎ－Ｏ－、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）－、－Ｏ－Ｃ（Ｒ^{4}）＝Ｎ－、－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）－Ｏ－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{2}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{2}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{2}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{3}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{3}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{3}$－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
但し、Ｇ^{1}、Ｇ^{2}、Ｇ^{3}およびＧ^{4}部分のうち０～２個が－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－であり、Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択され、ｄは、それぞれ独立して選択され、但し、環（Ａ）は、連続した３個の環窒素原子を有しておらず；
Ｒ^{1}は、アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテ

ロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、前記アルキル－、アルケニル－、およびアルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル－であるR^1基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^2は、それぞれ独立して、Ｈ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^3は、Ｈ、－ＯＨ、ハロ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（R^4）、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^4は、それぞれ独立して、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^5は、それぞれ独立して、H、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群から選択され、前記置換基は、R^2から独立して選択される１個以上の（例えば、１～５個の）置換基で置換されており；

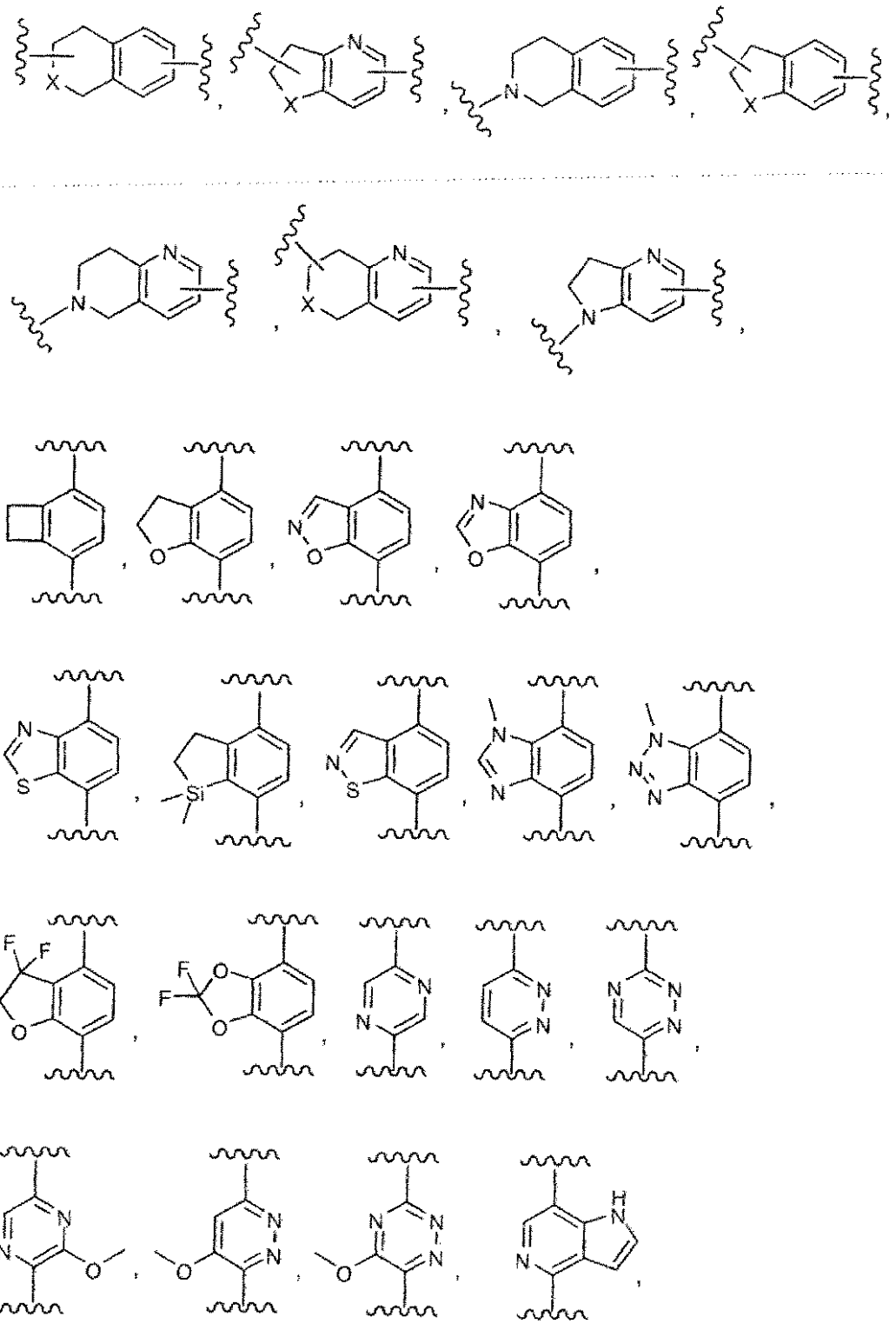
R^6は、それぞれ独立して、H、ハロ、－CF_3、－O－アルキル、－O－（ハロ置換アルキル）、－S（O）R^4、－S（O）（OR^4）、－S（O）NHR^4、－S（O）$N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－S（O）NH_2、－S（O）$_2NHR^4$、－S（O）$_2N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－S（O）$_2NH_2$、－C（＝NOR^{24}）R^{25}、および－S（O）$_2R^{24}$、－CN、－C（O）$_2R^4$、－C（O）NHR^4、－C（O）$N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－C（O）NH_2、－C（O）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^9は、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－である前記R^9は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^{10}は、アリール－（例えば、フェニル）、ヘテロアリール－（例えば、ピリジル）、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－、ヘテロシクリルアルケニル－、縮合ベンゾシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル－）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合シクロアルキルアリール（すなわち、シクロアルキル縮合アリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合アリール－）、縮合シクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、シクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、

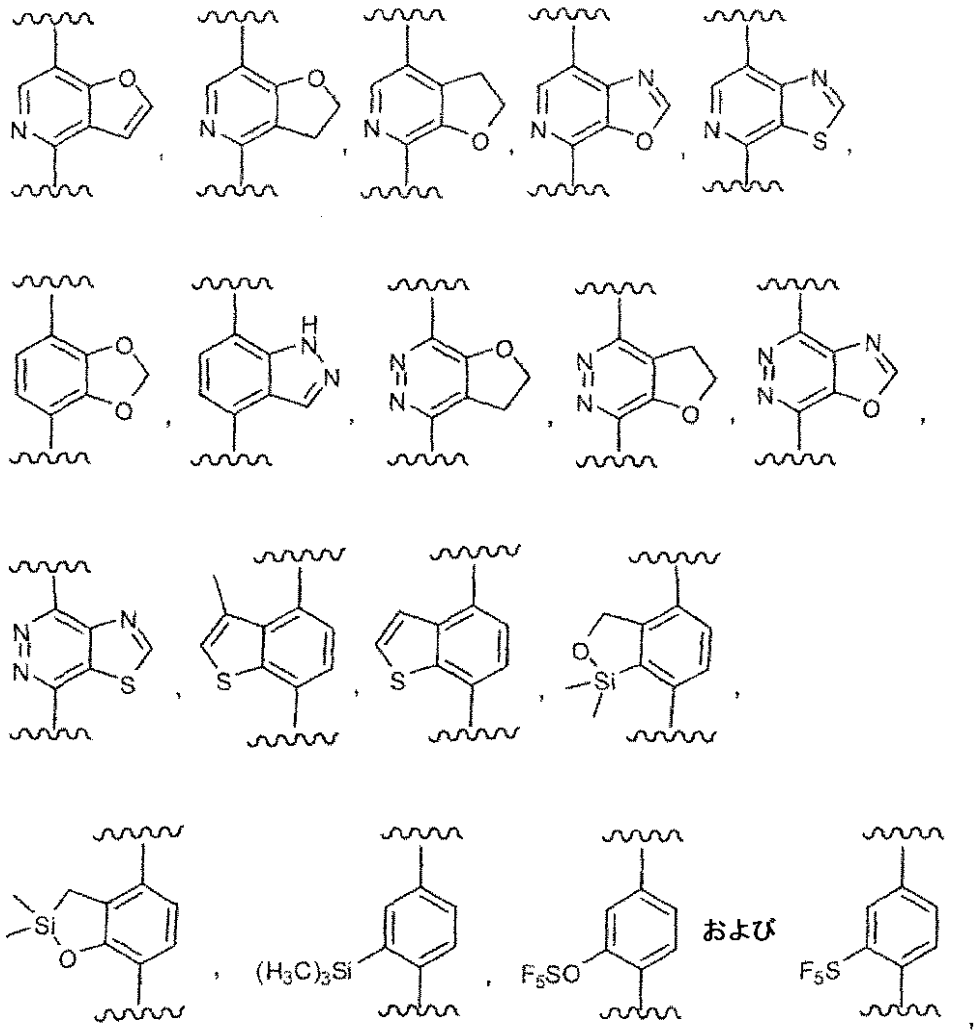
【００４４】

【化８】



【００４５】

【化９】



からなる群から選択され、式中、Ｘは、Ｏ、－Ｎ（Ｒ１４）－および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｒ１０部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ２１基で場合により置換されているか；または

Ｒ９とＲ１０とが結合して、縮合三環系を形成し、Ｒ９およびＲ１０は、先に定義したとおりであり、Ｒ９とＲ１０とを結合する環は、アルキル環またはヘテロアルキル環またはアリール環またはヘテロアリール環またはアルケニル環またはヘテロアルケニル環であり（例えば、前記三環系は、Ｒ９とＲ１０の両方を結合している原子に隣接する原子を結合することによって形成され）；

Ｒ１４は、Ｈ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル－、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ１５、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ１５、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ１５）（Ｒ１６）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ１５）（Ｒ１６）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ１５）（Ｒ１６）、－Ｃ（＝ＮＯＲ１５）Ｒ１６、および－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ１５）（ＯＲ１６）からなる群から選択され；

Ｒ１５ＡおよびＲ１６Ａは、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、（Ｒ１８）$_n$－アルキル、（Ｒ１８）$_n$－シクロアルキル、（Ｒ１８）$_n$－シクロアルキルアルキル、（Ｒ１８）$_n$－ヘテロシクリル、（Ｒ１８）$_n$－ヘテロシクリルアルキル、（Ｒ１８）$_n$－アリール、（Ｒ１８）$_n$－アリールアルキ

ル、（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールおよび（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択されるか；または

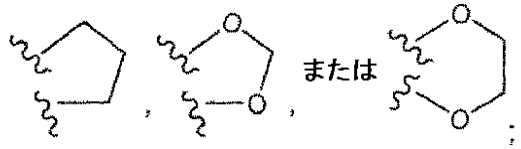
R^{15}、R^{16}およびR^{17}は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－アルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキルアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリルアルキル、（R^{18}）$_n$－アリール、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールおよび（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{18}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、－NO_2、ハロ、ヘテロアリール、HO－アルキルオキシアルキル、－CF_3、－CN、アルキル－CN、－C（O）R^{19}、－C（O）OH、－C（O）OR^{19}、－C（O）NHR^{20}、－C（O）NH_2、－C（O）NH_2－C（O）N（アルキル）$_2$、－C（O）N（アルキル）（アリール）、－C（O）N（アルキル）（ヘテロアリール）、－SR^{19}、－S（O）$_2R^{20}$、－S（O）NH_2、－S（O）NH（アルキル）、－S（O）N（アルキル）（アルキル）、－S（O）NH（アリール）、－S（O）$_2NH_2$、－S（O）$_2NHR^{19}$、－S（O）$_2$NH（ヘテロシクリル）、－S（O）$_2$N（アルキル）$_2$、－S（O）$_2$N（アルキル）（アリール）、－OCF_3、－OH、－OR^{20}、－O－ヘテロシクリル、－O－シクロアルキルアルキル、－O－ヘテロシクリルアルキル、－NH_2、－NHR^{20}、－N（アルキル）$_2$、－N（アリールアルキル）$_2$、－N（アリールアルキル）－（ヘテロアリールアルキル）、－NHC（O）R^{20}、－NHC（O）NH_2、－NHC（O）NH（アルキル）、－NHC（O）N（アルキル）（アルキル）、－N（アルキル）C（O）NH（アルキル）、－N（アルキル）C（O）N（アルキル）（アルキル）、－NHS（O）$_2R^{20}$、－NHS（O）$_2$NH（アルキル）、－NHS（O）$_2$N（アルキル）（アルキル）、－N（アルキル）S（O）$_2$NH（アルキル）および－N（アルキル）S（O）$_2$N（アルキル）（アルキル）からなる群から選択されるか；または

隣接する炭素上にある２個のR^{18}部分が結合して、

【００４６】

【化１０】



を形成し；

R^{19}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{20}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ置換アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{21}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、＝O、＝N－R^2、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ハロ、－CN、－OR^{15}、－C（O）R^{15}、－C（O）OR^{15}、－C（O）N（R^{15}）（R^{16}）、－SR^{15}、－P（O）（CH_3）$_2$、－SO（＝NR^{15}）R^{16}－、－SF_5、－OSF_5、－Si（R^{15A}）$_3$（R^{15A}は、それぞれ独立して選択される）、－S（O）N（R^{15}）（R^{16}）、－CH（R^{15}）（R^{16}）、－S（O）$_2$N（R^{15}）（R^{16}）、－C（＝NOR^{15}）R^{16}、－P（O）（OR^{15}）（OR^{16}）、－N（R^{15}）（R^{16}）、－アルキル－N（R^{15}

）（R^{16}）、－N（R^{15}）C（O）R^{16}、－CH_2－N（R^{15}）C（O）R^{16}、－CH_2－N（R^{15}）C（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－CH_2－R^{15}；－CH_2N（R^{15}）（R^{16}）、－N（R^{15}）S（O）R^{16A}、－N（R^{15}）S（O）$_2R^{16A}$、－CH_2－N（R^{15}）S（O）$_2R^{16A}$、－N（R^{15}）S（O）$_2$N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）S（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）C（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－CH_2－N（R^{15}）C（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）C（O）OR^{16}、－CH_2－N（R^{15}）C（O）OR^{16}、－S（O）R^{15A}、＝NOR^{15}、－N_3、－NO_2、－S（O）$_2R^{15A}$、－O－N＝C（R^4）$_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）および－O－N＝C（R^4）$_2$（R^4と、これらが結合する炭素原子とが一緒になって、５～１０員の環を形成し、前記環が、－O－、－S－、－S（O）－、－S（O）$_2$－および－NR^2－からなる群から選択される１～３個のヘテロ原子を場合により含有する）からなる群から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルであるR^{21}基が、それぞれ、１～５個の独立して選択されるR^{22}基で場合により置換されており；

R^{22}基は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、－CF_3、－CN、－OR^{15}、－C（O）R^{15}、－C（O）OR^{15}、－アルキル－C（O）OR^{15}、C（O）N（R^{15}）（R^{16}）、－SR^{15}、－S（O）N（R^{15}）（R^{16}）、－S（O）$_2$N（R^{15}）（R^{16}）、－C（＝NOR^{15}）R^{16}、－P（O）（OR^{15}）（OR^{16}）、－N（R^{15}）（R^{16}）、－アルキル－N（R^{15}）（R^{16}）、－N（R^{15}）C（O）R^{16}、－CH_2－N（R^{15}）C（O）R^{16}、－N（R^{15}）S（O）R^{16A}、－N（R^{15}）S（O）$_2R^{16A}$、－CH_2－N（R^{15}）S（O）$_2R^{16A}$、－N（R^{15}）S（O）$_2$N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）S（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）C（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－CH_2－N（R^{15}）C（O）N（R^{16}）（R^{17}）、－N（R^{15}）C（O）OR^{16}、－CH_2－N（R^{15}）C（O）OR^{16}、－N_3、＝NOR^{15}、－NO_2、－S（O）R^{15A}および－S（O）$_2R^{15A}$からなる群から選択され、

但し、環（A）は、環に、－S－S－結合、－S－S（O）－結合、－S－S（O）$_2$－結合、－S（O）－S（O）－結合、－S（O）－S（O）$_2$－結合、または－S（O）$_2$－S（O）$_2$－結合を有しておらず；

環（A）は、環に－O－O－結合を有しておらず；

環（A）は、環に、－O－S－結合、－O－S（O）－結合、または－O－S（O）$_2$－結合を有しておらず；

環（A）は、環に、－N－S－N－結合を有しておらず；

環（A）は、環に、－N－O－N－結合を有しておらず；

環（A）は、環に、隣接する３個の窒素原子を有していない〕

のγセクレターゼモジュレーターである新規の化合物またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物を提供する。

【００４７】

本発明の化合物は、中枢神経系の障害、例えば、アルツハイマー病や、アミロイドタンパク質の沈着に関係する他の疾患のような神経変性疾患などを処置するのに有用である。本発明の化合物は、特に、Ａβによって引き起こされる疾患、例えば、アルツハイマー病およびダウン症候群などを処置するのに有効な、アミロイドβ（本明細書では、以後Ａβと称する）の産生を減らすのに有用である。

【００４８】

したがって、例えば、本発明の化合物を、以下の疾患または状態を処置するのに使用してもよい：アルツハイマー病、軽度認知障害（ＭＣＩ）、ダウン症候群、緑内障（Ｇｕｏら、Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ　１０４、１３４４４－１３４４９

（２００７））、脳アミロイド血管症、脳卒中または認知症（Ｆｒａｎｇｉｏｎｅら、Ａｍｙｌｏｉｄ：Ｊ．Ｐｒｏｔｅｉｎ ｆｏｌｄｉｎｇ Ｄｉｓｏｒｄ．８、ｓｕｐｐｌ．１、３６－４２（２００１）、小膠細胞症および脳の炎症（Ｍ Ｐ Ｌａｍｂｅｒ、Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ ９５、６４４８－５３（１９９８））、および嗅覚機能の低下（Ｇｅｔｃｈｅｌｌら、Ｎｅｕｒｏｂｉｏｌｏｇｙ ｏｆ Ａｇｉｎｇ、６６３－６７３、２４、２００３）。

【００４９】

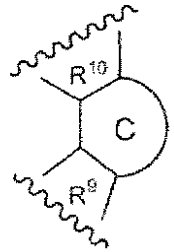
本発明の一実施形態では、R^{1}は、アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル）、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、前記アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－（ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｙａｌｋｙｌ－）であるR^{1}基は、各々、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されている。

【００５０】

R^{10}とR^{9}とが結合して、縮合三環系を形成する場合に形成される部分の例としては、限定されないが、

【００５１】

【化１１】



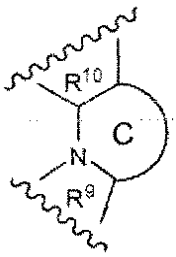
が挙げられる。式中、R^{10}およびR^{9}は、式（Ｉ）について定義されているとおりであり、環Ｃは、R^{10}とR^{9}とを結合する環であり、つまり、環Ｃは、アルキル環またはヘテロアルキル環またはアリール環またはヘテロアリール環またはアルケニル環またはヘテロアルケニル環である。

【００５２】

R^{10}とR^{9}とが結合して、縮合三環系を形成する場合に形成される部分の例としては、限定されないが、

【００５３】

【化１２】



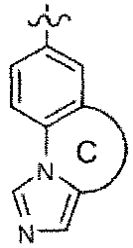
が挙げられる。式中、R^{10}およびR^{9}は、式（Ｉ）について定義されているとおりであり、環Ｃは、R^{10}とR^{9}とを結合する環であり、つまり、環Ｃは、ヘテロアルキル環またはヘテロアリール環またはヘテロアルケニル環である。

【００５４】

一例では、R^{10}とR^{9}とが結合して、形成される縮合三環系は、

【００５５】

【化１３】



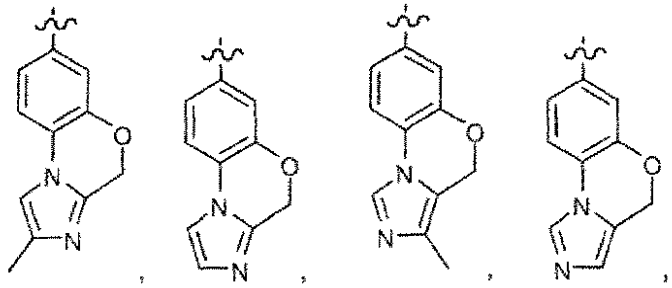
であり、環Ｃは、ヘテロアルキル環またはヘテロアリール環またはヘテロアルケニル環であり、したがって、例えば、この三環系は、R^{10}とR^{9}の両方が結合している原子に隣接する原子に結合することによって形成され、前記縮合三環系は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されている。

【００５６】

R^{10}とR^{9}とが結合して、縮合三環系を形成する場合に形成される部分の他の例としては、限定されないが、

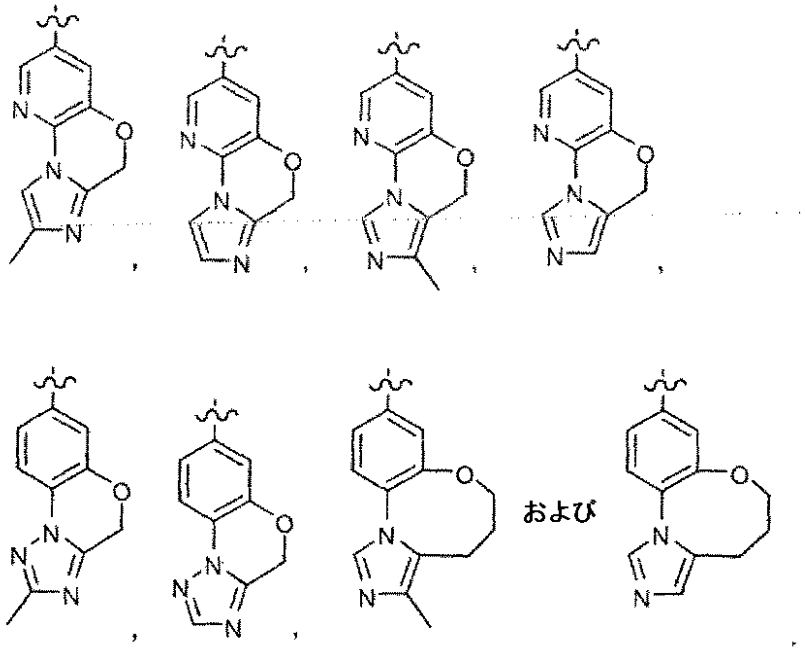
【００５７】

【化１４】



【００５８】

【化１５】



が挙げられる。

【００５９】

本発明の別の実施形態は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される少なくとも１個（例えば、１～３個、１～２個、または１個）の基が存在し、Ｒ^{15A}が、それぞれ独立して選択される式（Ｉ）の化合物に関する。この化合物で、２個以上の基が存在する場合、それぞれの基は、独立して選択される。

【００６０】

本発明の別の実施形態は、－ＳＦ$_5$および－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される少なくとも１個（例えば、１～３個、１～２個、または１個）の基が存在する、式（Ｉ）の化合物に関する。この化合物で、２個以上の基が存在する場合、それぞれの基は、独立して選択される。

【００６１】

本発明の一実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。

【００６２】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。

【００６３】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【００６４】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。

【００６５】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。

【００６６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【００６７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【００６８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。
【００６９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００７０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００７１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【００７２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【００７３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。
【００７４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００７５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００７６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチルからなる群から選択さ

れる）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【００７７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【００７８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。
【００７９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００８０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外である。
【００８１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される１個の基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外であり、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外であり、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される１個の基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される

。
【００８７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００８９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外であり、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００９０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$以外であり、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）－フェニル、－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。
【００９１】
本発明の別の実施形態では、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される１個の基が存在する。
【００９２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在する。
【００９３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在する。
【００９４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$以外である。
【００９５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{24}）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在し、少なくとも１個の基が－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$以外である。
【００９６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個の基が存在する。
【００９７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される２個の基が存在する。
【００９８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される３個の基が存在する。
【００９９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＳＦ$_5$基が存在する。
【０１００】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－ＳＦ$_5$基が存在する。

【０１０１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－ＳＦ$_5$基が存在する。
【０１０２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＯＳＦ$_5$基が存在する。
【０１０３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－ＯＳＦ$_5$基が存在する。
【０１０４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－ＯＳＦ$_5$基が存在する。
【０１０５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15a}）$_3$基（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）が存在する。
【０１０６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15a}）$_3$基（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）が存在する。
【０１０７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15a}）$_3$基（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）が存在する。
【０１０８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）が存在する。
【０１０９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）が存在する。
【０１１０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）が存在する。
【０１１１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、およびフェニルからなる群から選択される）が存在する。
【０１１２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、およびフェニルからなる群から選択される）が存在する。
【０１１３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、およびフェニルからなる群から選択される）が存在する。
【０１１４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、およびエチルからなる群から選択される）が存在する。
【０１１５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、およびエチルからなる群から選択される）が存在する。
【０１１６】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、およびエチルからなる群から選択される）が存在する。

【０１１７】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。

【０１１８】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から独立して選択される。

【０１１９】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から独立して選択される。

【０１２０】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から選択される。

【０１２１】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から独立して選択される。

【０１２２】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$からなる群から独立して選択される。

【０１２３】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である。

【０１２４】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、２個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である。

【０１２５】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、３個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基が存在し、前記－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である。

【０１２６】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される１個の基が存在する。

【０１２７】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される１個の基が存在する。

【０１２８】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される１個の基が存在する。

【０１２９】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択され

る）からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＳＦ$_5$基が存在し、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＯＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＯＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、および－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＯＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、および－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個または２個の追加の基も存在する。
【０１３５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）が存在し、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される１個または２個の基も式（Ｉ）の化合物に存在する。
【０１３６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$基（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）が存在し、－ＳＦ$_5$、および－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個または２個の基も式（Ｉ）の化合物に存在する。
【０１３７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。
【０１３８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびフェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。
【０１３９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。
【０１４０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される）少なくとも１個の基が存在する。
【０１４１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。

【０１４２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。
【０１４３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４４】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびフェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４５】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４６】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４７】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４８】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される１個の基が存在する。
【０１４９】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【０１５０】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【０１５１】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびフェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【０１５２】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される２個の基が存在する。
【０１５３】
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）から

なる群から選択される２個の基が存在する。

【０１５４】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される２個の基が存在する。

【０１５５】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される２個の基が存在する。

【０１５６】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）Ｉの化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１５７】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびアリール（例えば、フェニル）からなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１５８】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、アルキル（例えば、メチルおよびエチル）およびフェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１５９】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチル、エチル、フェニルからなる群から選択される）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１６０】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_2$フェニル、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１６１】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$）からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１６２】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$からなる群から選択される３個の基が存在する。

【０１６３】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ同じアルキル基であるか、または異なるアルキル基である）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。

【０１６４】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して、メチルおよびエチルからなる群から選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する。

【０１６５】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個または２個の基も式（Ｉ）の化合物に存在する。

【０１６６】

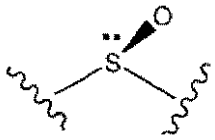
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物に、１個の－ＯＳＦ$_5$基が存在し、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される１個または２個の基も式（Ｉ）の化合物に存在する。

【０１６７】

当業者は、Ｗが－Ｓ（Ｏ）－である場合、－Ｓ（Ｏ）－部分は、

【０１６８】

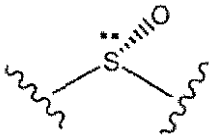
【化１６】



であってもよく、または－Ｓ（Ｏ）－部分が

【０１６９】

【化１７】



であってもよいことを理解するであろう。

【０１７０】

式（Ｉ）の化合物は、環に連続した３個の窒素原子を有していない。したがって、Ｒ^{1}が結合している窒素に加え、環に、さらなる窒素が２個まで存在し（すなわち、環に２個までの－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－基が存在し）、但し、窒素は、環の連続した位置には存在しない。したがって、（ａ）Ｇ^{1}が－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－である場合、Ｇ^{2}は、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－ではなく、（ｂ）Ｇ^{3}は－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－であり、Ｇ^{2}が－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－である場合、Ｇ^{1}は－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－ではなく、（ｃ）Ｇ^{3}が－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－であり、Ｇ^{1}が－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－である場合、Ｇ^{2}は、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－ではない。

【０１７１】

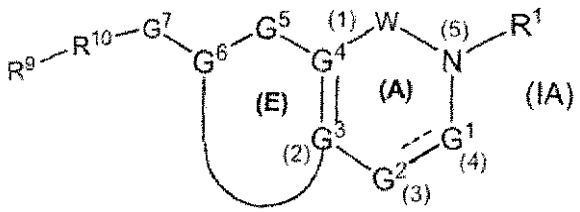
式（Ｉ）において、Ｇ^1、Ｇ^2、Ｇ^{3}およびＧ^{4}部分のうち０～２個が－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－であり、ｄおよびＲ^{2}は、それぞれ独立して選択される。したがって、式（Ｉ）の環（Ａ）は、環（Ａ）が連続した３個の窒素原子を有しないように、全部で１～３個の窒素原子（－ＮＲ^1－部分と、０～２個の－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－部分）を環に含み、ｄおよびＲ^{2}は、それぞれ独立して選択される。

【０１７２】

本発明の一実施形態は、式（ＩＡ）の化合物に関する。

【０１７３】

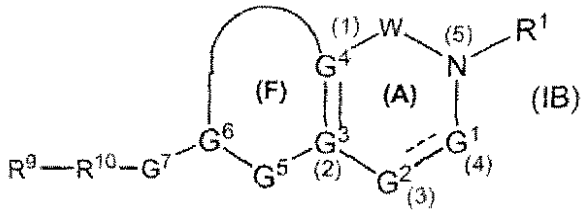
【化１８】



本発明の別の実施形態は、式（ＩＢ）の化合物に関する。

【０１７４】

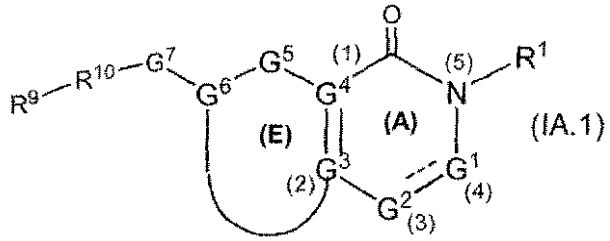
【化１９】



本発明の別の実施形態は、以下の式

【０１７５】

【化２０】



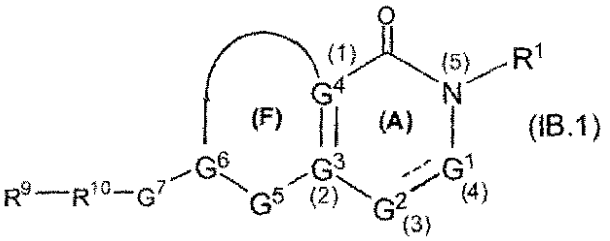
を有する、式（ＩＡ）の化合物に関する。

【０１７６】

本発明の別の実施形態は、以下の式

【０１７７】

【化２１】



を有する、式（ＩＢ）の化合物に関する。

【０１７８】

本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｃ（R^{21}）$_q$－である。

【０１７９】

本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｎ（R^2）$_d$－である。

【０１８０】

本発明の別の実施形態では、G^1は、直接結合である。

【０１８１】

本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｏ－である。

【０１８２】

本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｓ－である。

【０１８３】

本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｃ（R^{21}）$_q$－である。

【０１８４】

本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｎ（R^2）$_d$－である。

【０１８５】

本発明の別の実施形態では、G^2は、直接結合である。

【０１８６】

本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｏ－である。

【０１８７】

本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｓ－である。
【０１８８】
本発明の別の実施形態では、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１８９】
本発明の別の実施形態では、Ｗは、－Ｓ（Ｏ）－である。
【０１９０】
本発明の別の実施形態では、Ｗは、－Ｓ（Ｏ）$_2$－である。
【０１９１】
本発明の別の実施形態では、Ｗは、－Ｃ（＝ＮＲ^2）－である。
【０１９２】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｃ（Ｒ$^{2\ 1}$）$_q$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９３】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９４】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｃ（Ｏ）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９５】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｓ（Ｏ）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９６】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９７】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｃ（＝ＮＲ^2）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９８】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－であり、R^2は、それぞれ独立して選択され、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０１９９】
本発明の別の実施形態では、G^1は、直接結合であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２００】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｏ－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０１】
本発明の別の実施形態では、G^1は、－Ｓ－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０２】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｃ（Ｒ$^{2\ 1}$）$_q$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０３】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｎ（Ｒ^2）$_d$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０４】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｃ（Ｏ）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０５】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｓ（Ｏ）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０６】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－であ

る。
【０２０７】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｃ（＝ＮＲ^2）－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０８】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^2）$_2$）－であり、Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択され、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２０９】
本発明の別の実施形態では、G^2は、直接結合であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２１０】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｏ－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２１１】
本発明の別の実施形態では、G^2は、－Ｓ－であり、Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２１２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－である。
【０２１３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－である。
【０２１４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝である。
【０２１５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－である。
【０２１６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－である。
【０２１７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－である。
【０２１８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－である。
【０２１９】
本発明の別の実施形態では、G^6は、Ｃである。
【０２２０】
本発明の別の実施形態では、G^6は、ＣＨである。
【０２２１】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6は、Ｃである。
【０２２４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6は、Ｃである。
【０２２８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２２９】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３０】

本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３１】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6は、ＣＨである。
【０２３５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、直接結合である（すなわち、R^{10}は、G^6に直接結合している）。
【０２３６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２３７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ＝ＮR^2）－である。
【０２３８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＣＨR^3－である。
【０２３９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、Ｃ（R^4）$_2$である。
【０２４０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＣＦ$_2$－である。
【０２４１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｎ（R^2）－である。
【０２４２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－である。
【０２４３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ－である。
【０２４４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ（Ｏ）$_t$である。
【０２４５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＣR^4（ＯＨ）－である。
【０２４６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＣR^4（ＯR^4）－である。
【０２４７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ＝Ｃ－である。
【０２４８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、アルキニルである。
【０２４９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨ$_2$）$_r$Ｎ（R^2）－である。
【０２５０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨR^4）$_r$Ｎ（R^2）－である。
【０２５１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$Ｎ（R^2）－である。
【０２５２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｎ（R^2）（ＣＨ$_2$）$_r$－である。
【０２５３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｎ（R^2）（ＣＨR^4）$_r$－である。
【０２５４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｎ（R^2）（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－である。

【０２５５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CH_2）$_r$－Ｏ－である。
【０２５６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CHR^4）$_r$－Ｏ－である。
【０２５７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－Ｏ－である。
【０２５８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－（CH_2）$_r$－である。
【０２５９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－（CHR^4）$_r$－である。
【０２６０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－である。
【０２６１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）NR^5－である。
【０２６２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２６３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－である。
【０２６４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－NR^5－である。
【０２６５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－NR^5Ｃ（Ｏ）－である。
【０２６６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CH_2）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２６７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CHR^4）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２６８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－である。
【０２６９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）NR^5（CH_2）$_r$－である。
【０２７０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）NR^5（CHR^4）$_r$－である。
【０２７１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｏ）NR^5（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－である。
【０２７２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－NR^5Ｓ（Ｏ）$_t$－である。
【０２７３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CH_2）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－である。
【０２７４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（CHR^4）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－である。
【０２７５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－である。
【０２７６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$－である。
【０２７７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$（$CH_2$）$_r$－である。
【０２７８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$（$CHR^4$）$_r$－である。

【０２７９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｓ（Ｏ）$_t$ＮＲ^5（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_r$－である。
【０２８０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－である。
【０２８１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＮＲ^5－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^5－である。
【０２８２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＮＲ^5－Ｓ（Ｏ）$_t$－ＮＲ^5－である。
【０２８３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＮＲ^5－Ｃ（＝ＮＲ^2）－ＮＲ^5－である。
【０２８４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－ＮＲ^5－Ｃ（＝ＮＲ^2）－Ｏ－である。
【０２８５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－Ｃ（＝ＮＲ^2）－ＮＲ^5－である。
【０２８６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｃ（Ｒ^4）＝Ｎ－Ｏ－である。
【０２８７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）－である。
【０２８８】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｏ－Ｃ（Ｒ^4）＝Ｎ－である。
【０２８９】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）－Ｏ－である。
【０２９０】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨ$_2$）$_2$－である。
【０２９１】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_2$－である。
【０２９２】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨＲ^4）$_2$－である。
【０２９３】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨ$_2$）$_3$－である。
【０２９４】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（Ｃ（Ｒ^4）$_2$）$_3$－である。
【０２９５】
本発明の別の実施形態では、G^7は、－（ＣＨＲ^4）$_3$－である。
【０２９６】
本発明の別の実施形態では、G^7は、シクロアルキルである。
【０２９７】
本発明の別の実施形態では、G^7は、ヘテロシクロアルキルである。
【０２９８】
本発明の別の実施形態では、ｔは、１である。
【０２９９】
本発明の別の実施形態では、ｔは、２である。
【０３００】
本発明の別の実施形態では、ｒは、１である。
【０３０１】
本発明の別の実施形態では、ｒは、２である。
【０３０２】
本発明の別の実施形態では、ｒは、３である。
【０３０３】

本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３０４】
本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３０５】
本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３０６】
本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３０７】
本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、５員のヘテロシクロアルケニル環である。
【０３０８】
本発明の別の実施形態では、環（Ｅ）は、６員のヘテロシクロアルケニル環である。
【０３０９】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３１０】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３１１】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３１２】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３１３】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルケニル環である。
【０３１４】
本発明の別の実施形態では、環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルケニル環である。
【０３１５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３１６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３１７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３１８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３１９】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３２０】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３２１】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロアリール環である。
【０３２２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。

【０３２４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6はＣであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロアリール環である。
【０３２９】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３０】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３１】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、５員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３３９】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３４０】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）また

は環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３４１】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３４２】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6はＣＨであり、環（Ｅ）または環（Ｆ）は、６員のヘテロシクロアルキル環である。
【０３４３】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＣＨ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４４】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－ＮＨ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４５】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｎ＝であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４６】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｏ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４７】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４８】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３４９】
本発明の別の実施形態では、G^5は、－Ｓ（Ｏ）$_2$－であり、G^6は、ＣＨである。
【０３５０】
本発明の他の実施形態は、G^5、G^6、G^7が、G^5、G^6、G^7に関して上述のいずれかの実施形態で記載したとおりである、式（ＩＡ）の化合物に関する。
【０３５１】
本発明の他の実施形態は、G^5、G^6、G^7が、G^5、G^6、G^7に関して上述のいずれかの実施形態で記載したとおりである、式（ＩＢ）の化合物に関する。
【０３５２】
本発明の別の実施形態では、R^{21}は、アルキル、－ＯR^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$、１～５個の独立して選択されるR^{22}基（例えば、ハロ、例えば、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒなど）で置換されたアルキルからなる群から選択される。
【０３５３】
本発明の別の実施形態では、R^{21}は、アルキル、－ＯR^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$、１～５個の独立して選択されるR^{22}基（例えば、ハロ、例えば、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒなど、一例では、アルキル置換されたR^{21}基は－CF_3である）で置換されたアルキルからなる群から選択され、R^{15}およびR^{16}は、Ｈ、アルキル、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル－（例えば、ｎは１であり、R^{18}は－ＯR^{20}であり、R^{20}は、アルキル（例えば、メチル）、シクロアルキル（例えば、シクロブチル）である）、（R^{18}）$_n$－アルキル（例えば、ｎは１であり、R^{18}は－ＯR^{20}であり、R^{20}は、アルキル（例えば、メチル）である）からなる群から独立して選択される。
【０３５４】
本発明の別の実施形態では、R^{21}は、（ａ）アルキル、－ＯR^{15}（R^{15}は、アルキル、例えば、メチル、エチルである）、（ｂ）－Ｃ（Ｏ）ＯR^{15}（R^{15}は、アルキル、例えば、メチルである）、（ｃ）－Ｃ（Ｏ）Ｎ$R^{15}R^{16}$（R^{15}およびR^{16}は、Ｈ、アルキル、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル－（例えば、ｎは１であり、R^{18}は－ＯR^{20}であり、R^{20}は、アルキル（例えば、メチル）、シクロアルキル（例えば、シクロブチル）である）、（R^{18}）$_n$－アルキル（例えば、ｎは１であり、R^{18}は－ＯR^{20}であり、R^{20}は、アルキル（例えば、メチル）である）からなる群から独立して選択され、一例では、R^{15}およびR^{16}のうち１個だけがＨである）、（ｄ）１～５個の独立して選択されるR^{22}基（例えば、ハロ、例えば、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒなど、一例で

は、アルキル置換されたＲ２１基は－ＣＦ３である）で置換されたアルキルからなる群から選択される。

【０３５５】

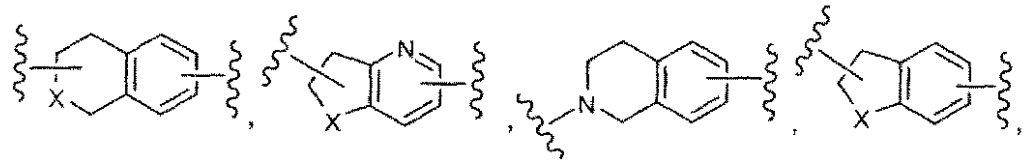
本発明の一実施形態では、Ｒ１０は、アリール－（例えば、フェニル）、ヘテロアリール－（例えば、ピリジル）、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－、ヘテロシクリルアルケニル－（ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｙａｌｋｅｎｙｌ－）、縮合ベンゾシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル－）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合シクロアルキルアリール（すなわち、シクロアルキル縮合アリール－（ｃｙｃｌｏａｌｋｙｆｕｓｅｄａｒｙｌ－））、縮合ヘテロシクロアルキルアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合アリール－）、縮合シクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、シクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合ヘテロアリール－）からなる群から選択され、前記Ｒ１０部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ２１基で場合により置換されている。

【０３５６】

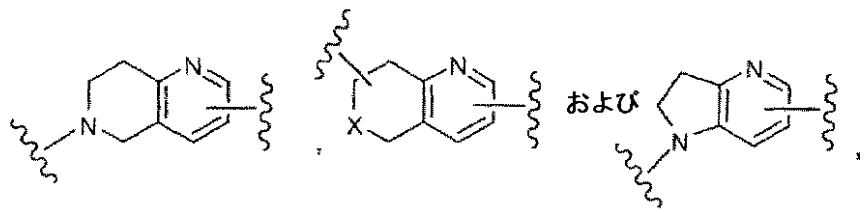
本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、

【０３５７】

【化２２】



および



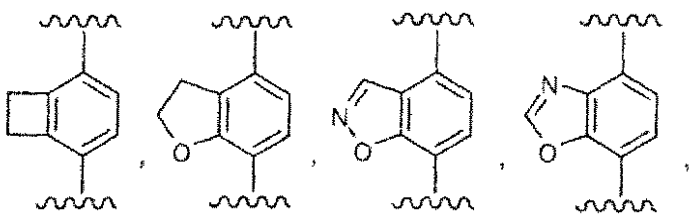
からなる群から選択され、Ｘは、Ｏ、－Ｎ（Ｒ１４）－、－Ｓ－からなる群から選択され、前記Ｒ１０部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ２１基で場合により置換されている。

【０３５８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、

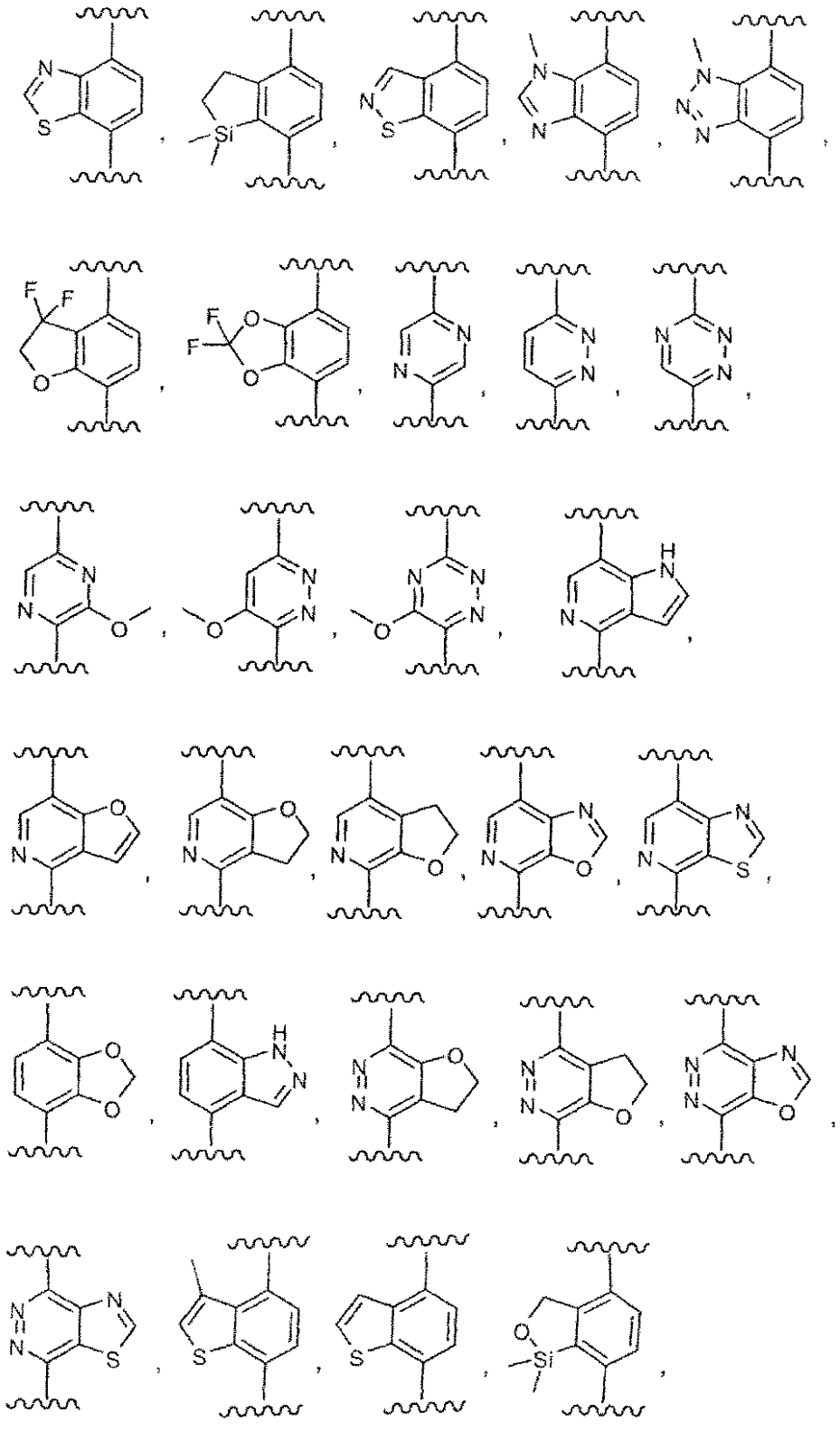
【０３５９】

【化２３】



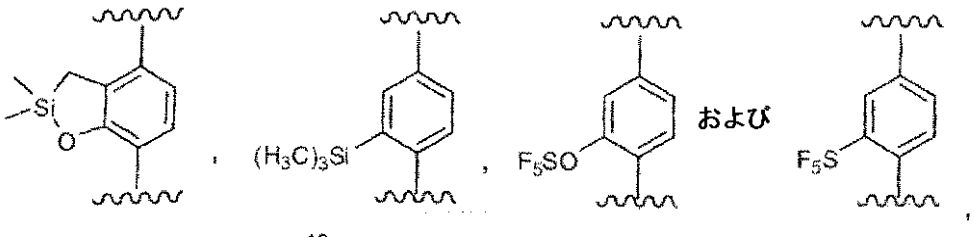
【０３６０】

【化２４】



【０３６１】

【化２５】



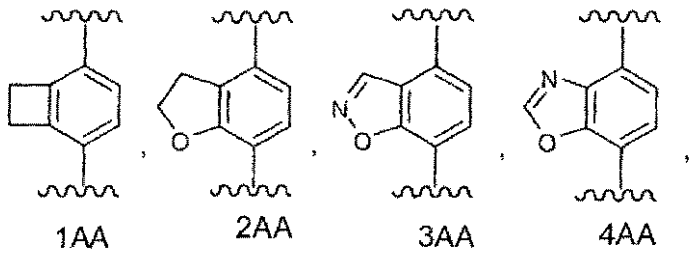
からなる群から選択され、前記Ｒ１０部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ２１基で場合により置換されている。

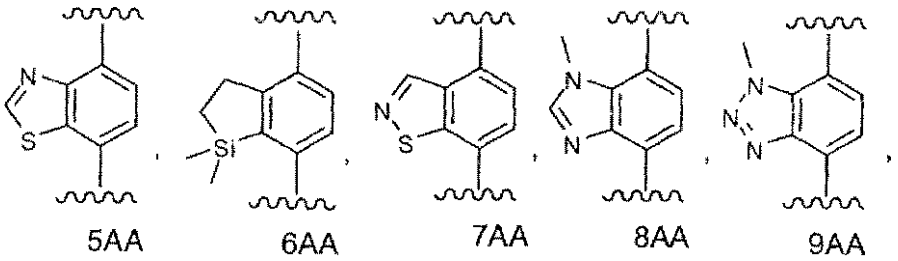
【０３６２】

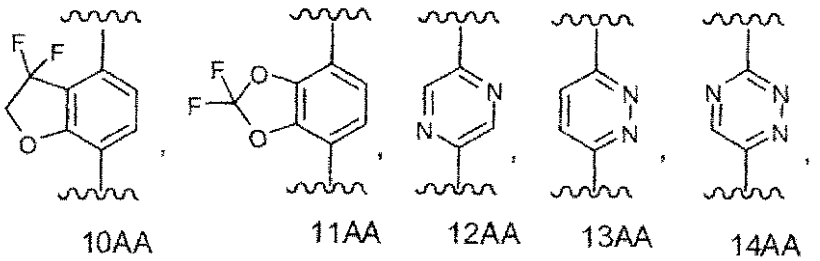
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）のＲ１０は、

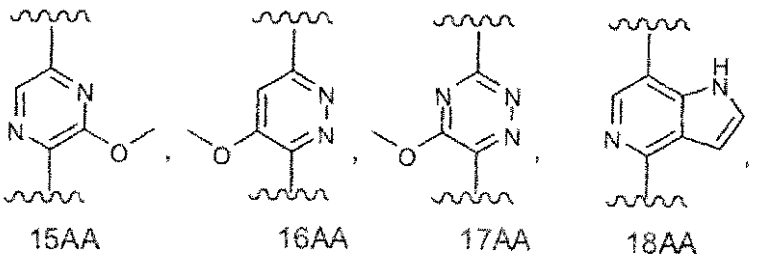
【０３６３】

【化２６】



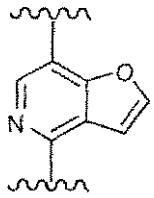


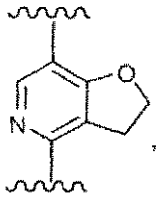


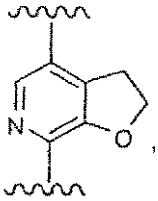


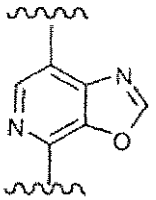
【０３６４】

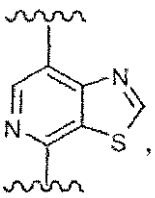
【化２７】

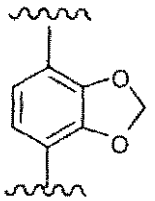

19AA

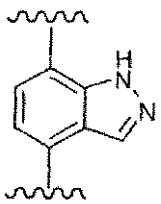

20AA

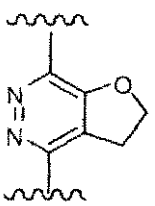

21AA

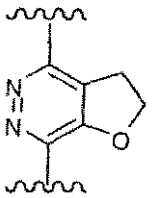

22AA

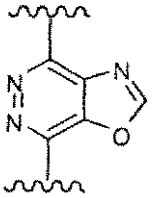

23AA

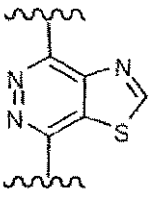

24AA

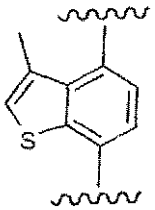

25AA

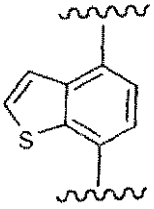

26AA

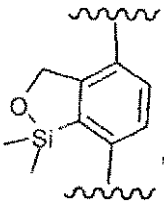

27AA

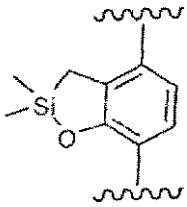

28AA

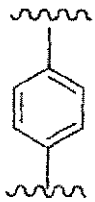

29AA

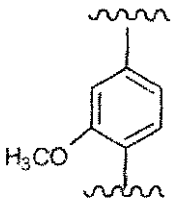

30AA

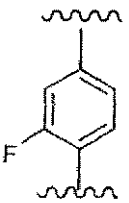

31AA

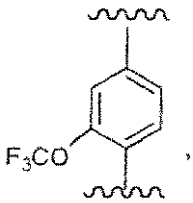

32AA

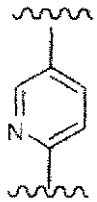

33AA

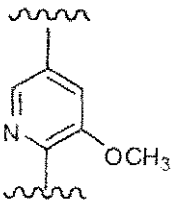

34AA

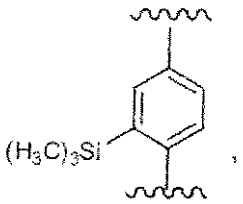

35AA


36AA


37AA

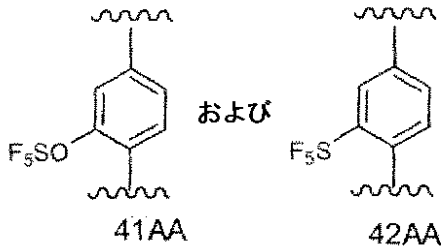

38AA


39AA


40AA

【０３６５】

【化２８】



からなる群から選択される。

【０３６６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、４ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、５ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、６ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、７ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、８ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、９ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１０ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１１ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１２ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１３ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１４ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１５ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１６ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１７ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１８ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１９ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２０ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２１ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２２ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２３ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２４ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２５ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２６ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２７ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２８ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、２９ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３０ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３１ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３２ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３３ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３４ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３５ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３６ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３７ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３８ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、３９Ａ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、４０ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、４１ＡＡ基である。本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、４２ＡＡ基である。

【０３６７】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、アリールである。

【０３６８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０アリールは、アリールであり、前記アリールは、フェニルである。

【０３６９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１個以上のＲ２１基で置換されたアリールである。

【０３７０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１０は、１個以上のＲ２１基で置換されたアリールであ

り、前記アリールはフェニルであり、すなわち、前記R^{10}基は、１個以上のR^{21}基で置換されたフェニルである。

【０３７１】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上のR^{21}基で置換されたフェニルであり、それぞれのR^{21}基は、同じ－OR^{15}基であるか、異なる－OR^{15}基である。

【０３７２】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上のR^{21}基で置換されたフェニルであり、それぞれのR^{21}基は、同じ－OR^{15}基であるか、異なる－OR^{15}基であり、前記R^{15}はアルキルであり、アルキルは、それぞれ独立して選択される。

【０３７３】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}基は、－OR^{15}であり、前記R^{15}はアルキルである。

【０３７４】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}基は、－OR^{15}であり、前記R^{15}はアルキルであり、前記アルキルはメチルである。

【０３７５】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上（例えば、１個または２個、または１個の）独立して選択されるハロであるR^{21}基で置換されたフェニルである。

【０３７６】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}基はハロである。

【０３７７】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}基はＦである。

【０３７８】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}は、－OR^{15}基であり、R^{15}は、$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}はハロであり、ｎは１～３であり、ハロは、それぞれ独立して選択される。

【０３７９】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}は、－OR^{15}基であり、R^{15}は、$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}はＦであり、ｎは、３である。

【０３８０】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}は、－OR^{15}基であり、R^{15}は、$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}はＦであり、ｎは３であり、アルキルは、メチルである（すなわち、R^{21}置換基は－OCF_3である）。

【０３８１】

本発明の別の実施形態では、R^{10}は、ヘテロアリールである。

【０３８２】

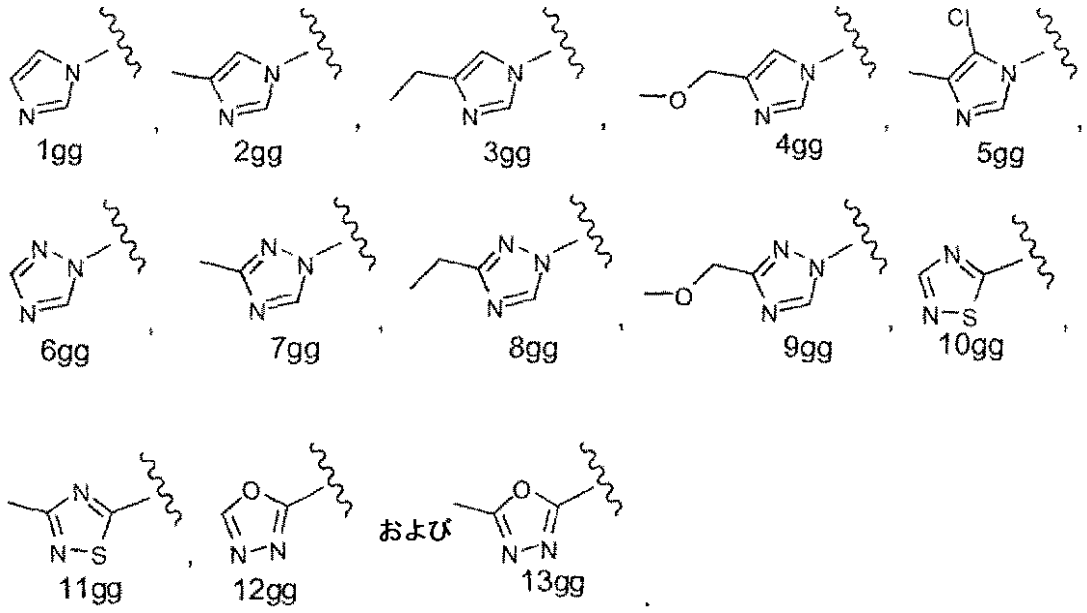
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールである。

【０３８３】

本発明の別の実施形態では、R^{9}は、

【０３８４】

【化２９】



からなる群から選択される。

【０３８５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、１ＡＡ～４２ＡＡからなる群から選択され、Ｒ^{9}は、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される。

【０３８６】

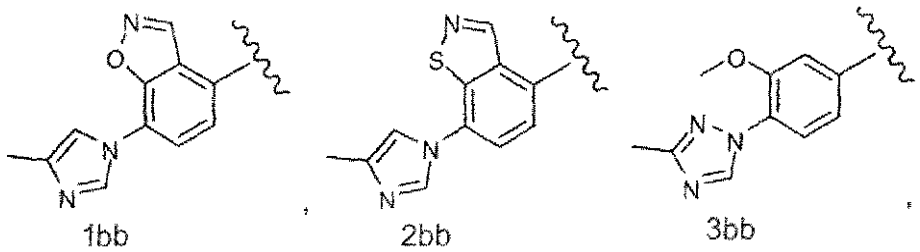
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、１ＡＡ～４２ＡＡからなる群から選択され、Ｒ^{9}は、２ｇｇである。

【０３８７】

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分の例としては、限定されないが、以下のものが挙げられる。

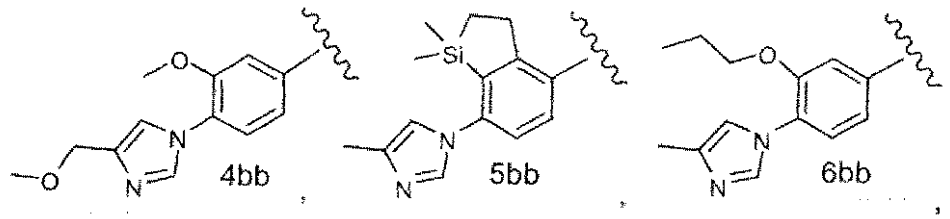
【０３８８】

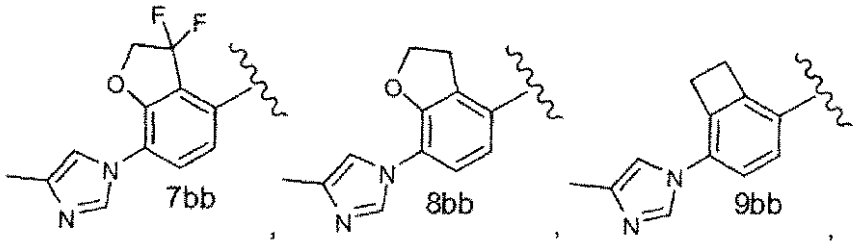
【化３０】

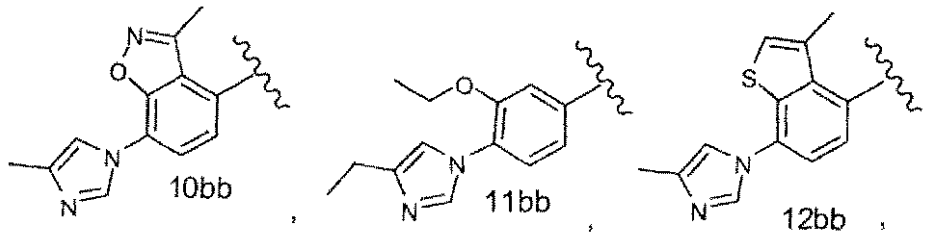


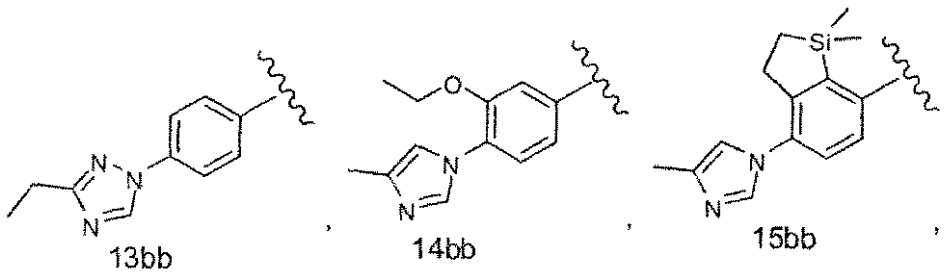
【０３８９】

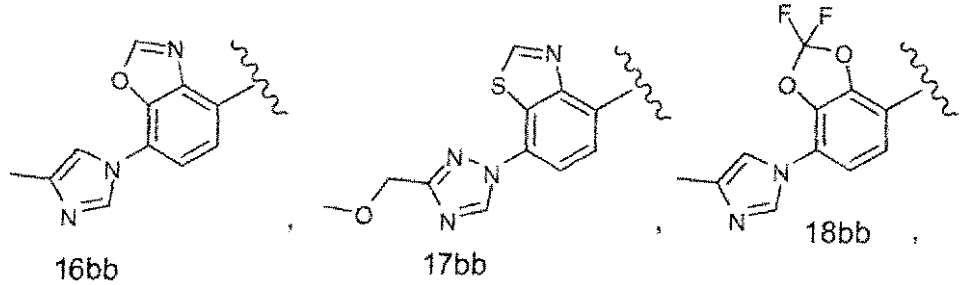
【化３１】


4bb
5bb
6bb


7bb
8bb
9bb

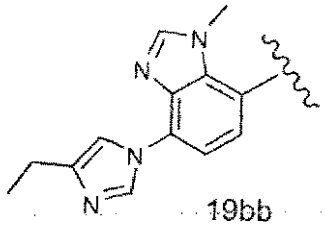

10bb
11bb
12bb

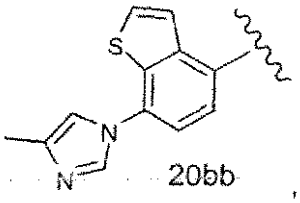

13bb
14bb
15bb

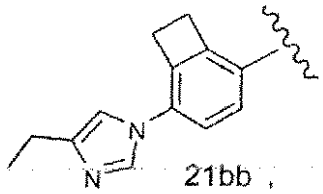

16bb
17bb
18bb

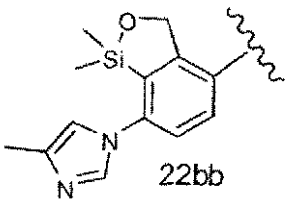
【０３９０】

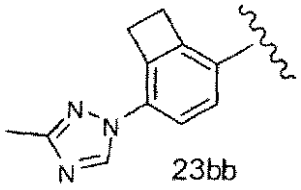
【化３２】

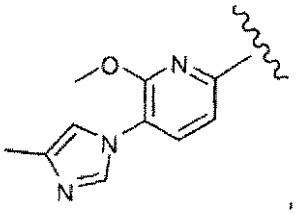

19bb ,

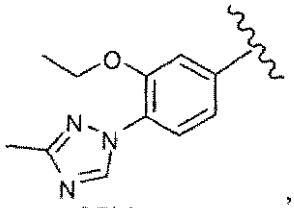

20bb ,

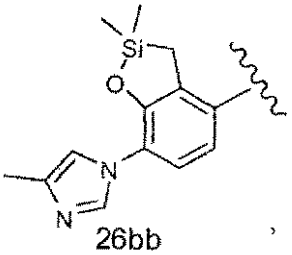

21bb ,

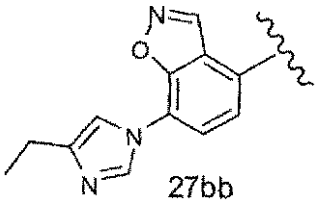

22bb ,

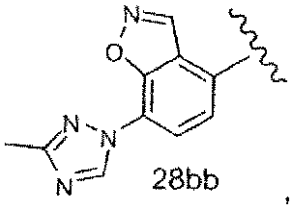

23bb ,

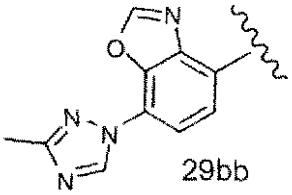

24bb ,

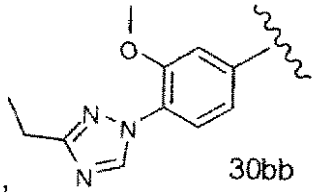

25bb ,

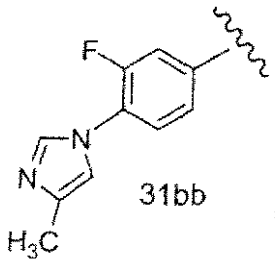

26bb ,

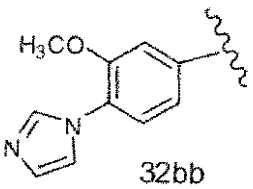

27bb ,

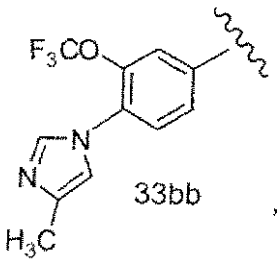

28bb ,


29bb ,


30bb ,

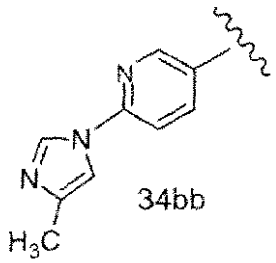

31bb ,

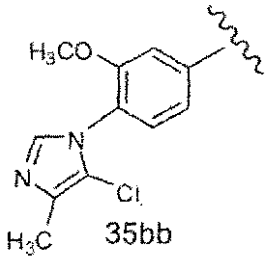

32bb ,

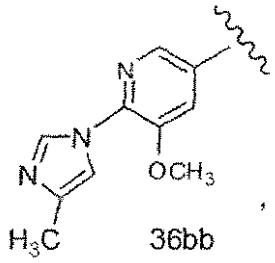

33bb ,

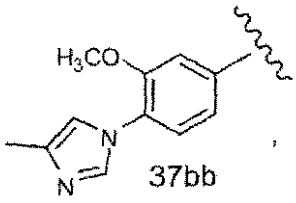
【０３９１】

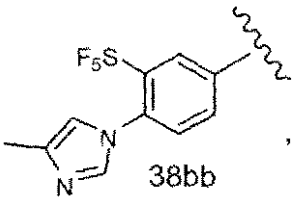
【化３３】

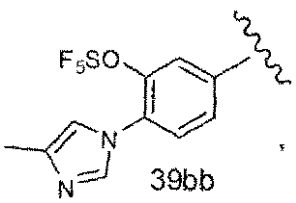

34bb


35bb

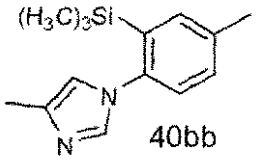

36bb


37bb


38bb


39bb

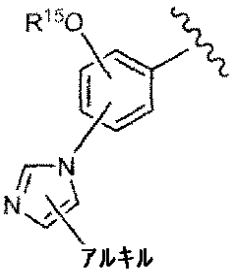
および


40bb

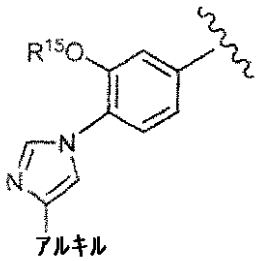
別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、４ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、５ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、６ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、７ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、８ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、９ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１０ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１１ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１２ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１３ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１４ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１５ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１６ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１７ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１８ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、１９ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２０ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２１ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２２ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２３ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２４ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２５ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２６ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２７ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２８ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、２９ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３０ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３１ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３２ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３３ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３４ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３５ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３６ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３７ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３８ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、３９ｂｂである。別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、４０ｂｂである。

【０３９２】
本発明の別の実施形態では、R^9は、ヘテロアリールである。
【０３９３】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールである。
【０３９４】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、前記R^{21}基は、同じアルキルであるか、異なるアルキルである。
【０３９５】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、前記R^{21}はアルキルである。
【０３９６】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、前記R^{21}はアルキルであり、前記アルキルは、メチルである。
【０３９７】
本発明の別の実施形態では、R^9はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールはイミダゾイルである。
【０３９８】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個以上のR^{21}基で置換されたイミダゾリルである。
【０３９９】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個以上のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、前記R^{21}基は、同じアルキルであるか、異なるアルキルである。
【０４００】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、前記R^{21}はアルキルである。
【０４０１】
本発明の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、前記R^{21}はアルキルであり、前記アルキルは、メチルである。
【０４０２】
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、アリール、および１個以上のR^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記R^9基は、ヘテロアリール、および１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、R^{21}は、それぞれ独立して選択される。
【０４０３】
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^9は、１個以上のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、R^{21}は、それぞれ独立して選択される。
【０４０４】
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^9は、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、R^{21}は、それぞれ独立して選択される。
【０４０５】
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、前記R^9は、１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルである。
【０４０６】
本発明の別の実施形態では、R^{10}は、１個以上の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、前記R^9は、１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルであり、それぞれのR^{15}は、同じアルキル基であるか、異なるア

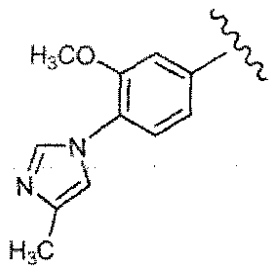
ルキル基である。
【０４０７】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{9}は、１個のアルキル基で置換されたイミダゾリルである。
【０４０８】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{9}は、１個のアルキル基で置換されたイミダゾリルであり、Ｒ^{15}はアルキルであり、Ｒ^{15}のアルキル基、前記イミダゾリルのアルキル基は、独立して選択される。
【０４０９】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{9}は、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルであり、Ｒ^{15}はメチルであり、Ｒ^{15}のアルキル基、前記イミダゾリルのアルキル基は、独立して選択される。
【０４１０】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０４１１】
【化３４】



である。
【０４１２】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０４１３】
【化３５】



である。
【０４１４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０４１５】
【化３６】



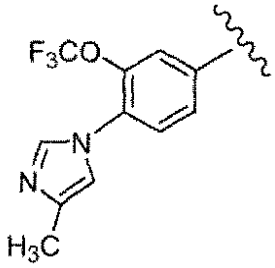
である。

【０４１６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０４１７】

【化３７】



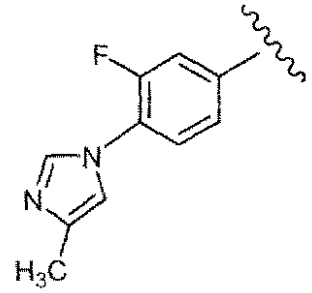
である。

【０４１８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０４１９】

【化３８】



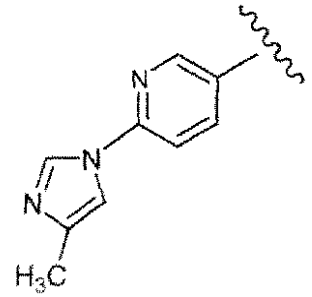
である。

【０４２０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０４２１】

【化３９】



である。

【０４２２】

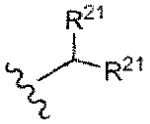
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたアルキル基である。

【０４２３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４２４】

【化４０】



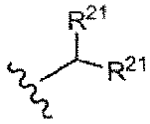
であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択され、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ^{22}基で置換されている。

【０４２５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４２６】

【化４１】



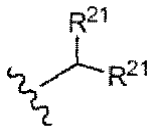
であり、１個のＲ^{21}は、非置換アルキル基であるか、または置換アルキル基である。

【０４２７】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４２８】

【化４２】



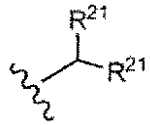
であり、１個のＲ^{21}は、非置換アルキル基である。

【０４２９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４３０】

【化４３】



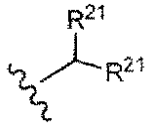
であり、１個のＲ^{21}は、置換アルキル基である。

【０４３１】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４３２】

【化４４】



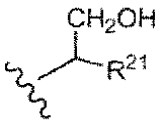
であり、一方のＲ^{21}は、非置換アルキル基であるか、または置換アルキル基であり、他方のＲ^{21}は、非置換アリール（例えば、フェニル）基であるか、置換アリール基である。

【０４３３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４３４】

【化４５】



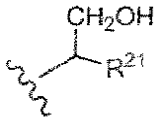
であり、Ｒ２１は、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されている。

【０４３５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、

【０４３６】

【化４６】



であり、Ｒ２１は、非置換アリール（例えば、フェニル）であるか、または１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されたアリール（例えば、フェニル）である。

【０４３７】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基である。

【０４３８】

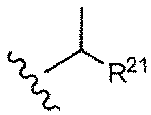
本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、Ｒ２１基は、１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されている。

【０４３９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、

【０４４０】

【化４７】



であり、Ｒ２１は、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されている。

【０４４１】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、Ｒ２１基は、アリール基である。

【０４４２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、Ｒ２１基は、アリール基であり、前記アリールは、フェニルである。

【０４４３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたエチル基であり、Ｒ２１基は、アリール基であり、前記アリールは、フェニルである。

【０４４４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたメチル基であり、Ｒ２１基は、アリール基であり、前記アリールは、フェニルである。

【０４４５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、Ｒ２１基は、アリール基であり、前記アリール基は、１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されている。

【０４４６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ１は、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、

R^{21}基は、アリール基であり、前記アリール基は、１個以上のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４４７】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基は、アリール基であり、前記アリール基は、１～３個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４４８】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基は、アリール基であり、前記アリール基は、ハロ基である１個または２個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４４９】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基は、アリール基であり、前記アリール基は、Ｆである１個または２個のR^{22}基で置換されている。

【０４５０】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基は、フェニル基であり、前記フェニルは、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。

【０４５１】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基はフェニルであり、このフェニルは、１個以上のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４５２】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個または２個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４５３】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである１個または２個のR^{22}基で置換されている。

【０４５４】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである３個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０４５５】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである３個のR^{22}基で置換されている。

【０４５６】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はアリール基であり、前記アリール基は、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。

【０４５７】

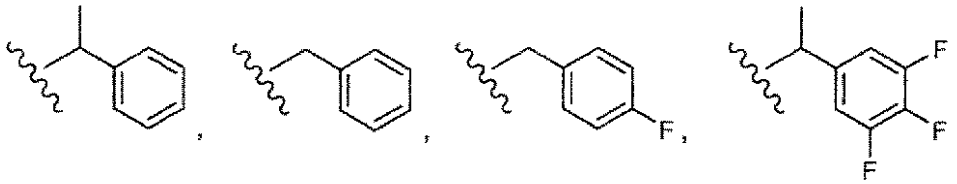
本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はアリール基であり、前記アリール基は、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。

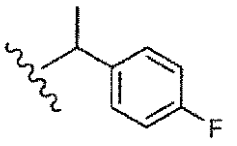
【０４５８】

本発明の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。

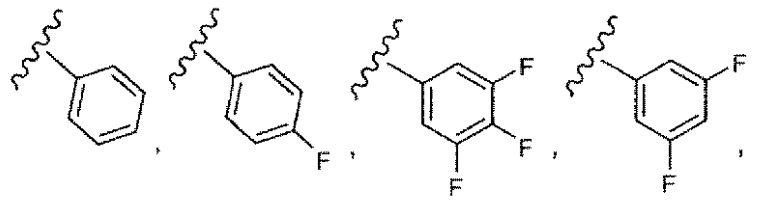
【０４５９】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、１個以上の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０４６０】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個または２個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。
【０４６１】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個または２個のR^{22}基で置換されており、各R^{22}基は、同じハロであるか、異なるハロである。
【０４６２】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである１個または２個のR^{22}基で置換されている。
【０４６３】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである１個または２個のR^{22}基で置換されている。
【０４６４】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個のR^{22}基で置換されている。
【０４６５】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個のR^{22}基で置換されている。
【０４６６】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである１個のR^{22}基で置換されている。
【０４６７】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである１個のR^{22}基で置換されている。
【０４６８】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである３個の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０４６９】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、ハロ基から独立して選択される３個のR^{22}で置換されている。
【０４７０】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたエチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである３個のR^{22}基で置換されている。
【０４７１】
本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたメチル基であり、R^{21}基はフェニルであり、前記フェニルは、Ｆである３個のR^{22}基で置換されている。
【０４７２】
本発明の別の実施形態では、R^1は、

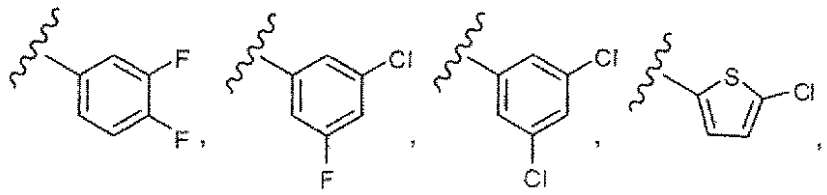
【０４７３】
【化４８】

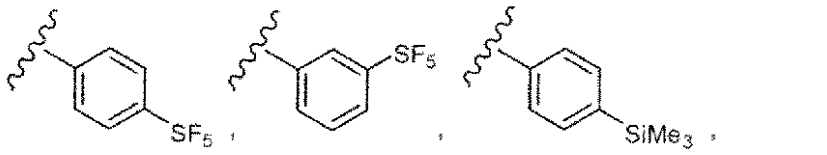


および 

からなる群から選択される。
【０４７４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０４７５】
【化４９】

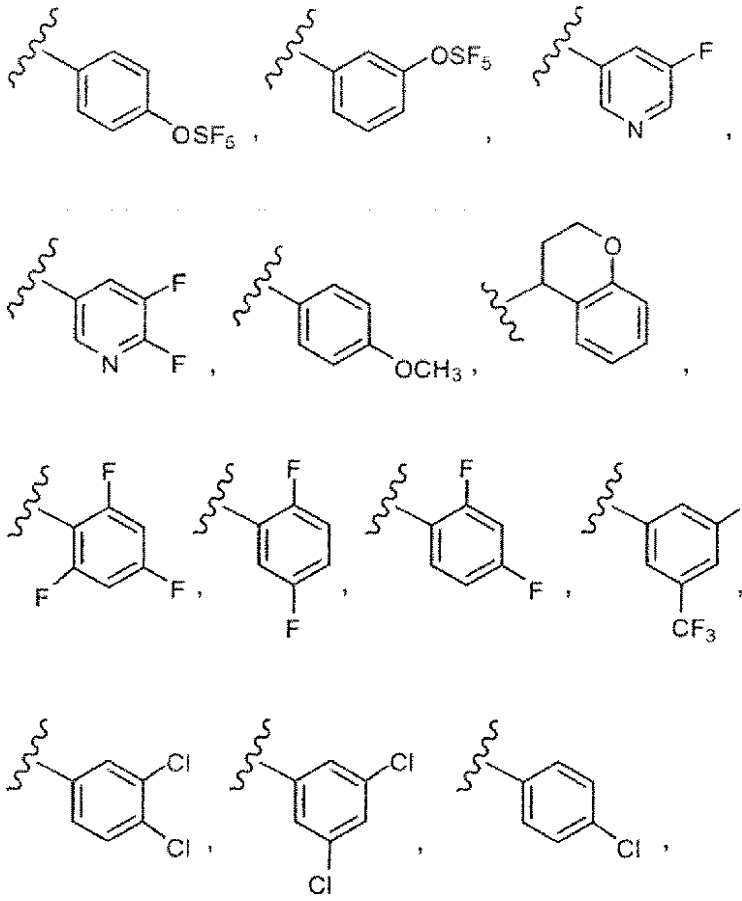




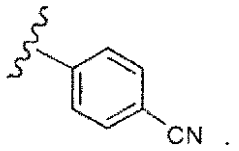


【０４７６】

【化５０】



および



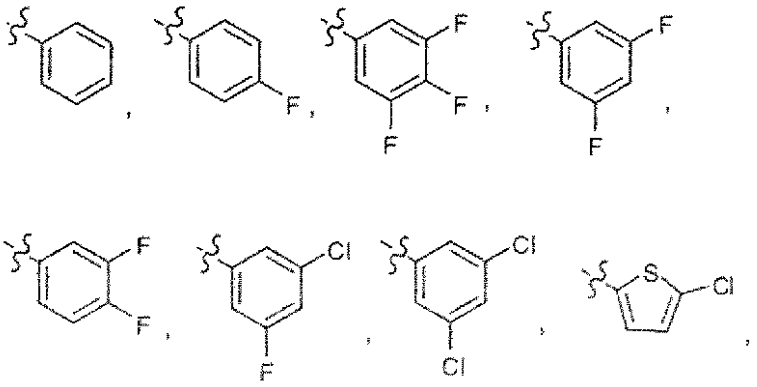
からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４７７】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

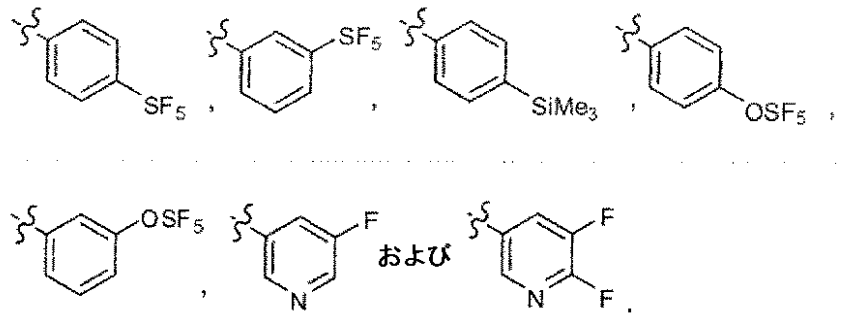
【０４７８】

【化５１】



【０４７９】

【化５２】



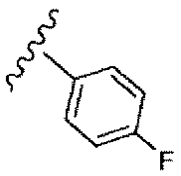
からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４８０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４８１】

【化５３】



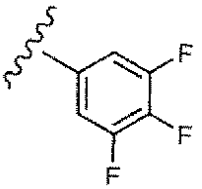
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４８２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４８３】

【化５４】



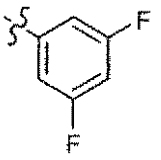
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４８４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４８５】

【化５５】



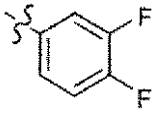
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４８６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４８７】

【化５６】



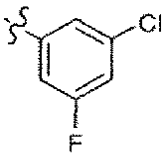
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４８８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４８９】

【化５７】



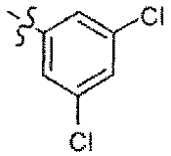
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４９０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４９１】

【化５８】



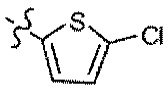
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４９２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４９３】

【化５９】



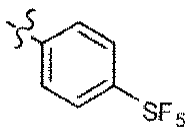
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０４９４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０４９５】

【化６０】

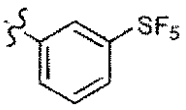


で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

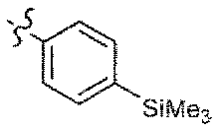
【０４９６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

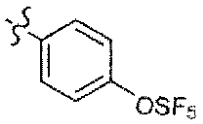
【０４９７】
【化６１】



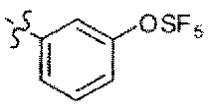
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０４９８】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０４９９】
【化６２】



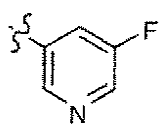
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５００】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５０１】
【化６３】



で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５０２】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５０３】
【化６４】

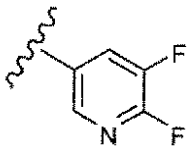


で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５０４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５０５】
【化６５】

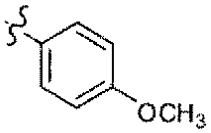


で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５０６】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

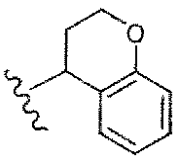
【０５０７】
【化６６】



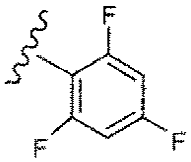
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５０８】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５０９】
【化６７】



で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５１０】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５１１】
【化６８】

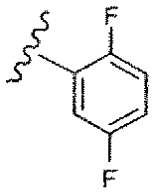


で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５１２】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５１３】
【化６９】



で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。
【０５１４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５１５】

【化７０】



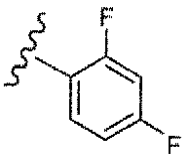
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０５１６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５１７】

【化７１】



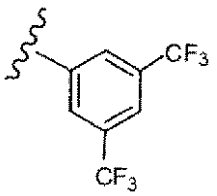
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０５１８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５１９】

【化７２】



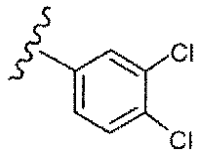
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０５２０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５２１】

【化７３】



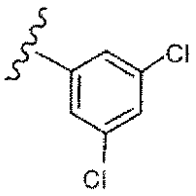
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ^{1}はメチルであり、別の例では、Ｒ^{1}はエチルである）。

【０５２２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５２３】

【化７４】



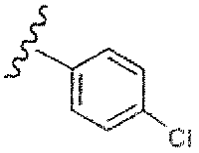
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルである）。

【０５２４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ[1]は、

【０５２５】

【化７５】



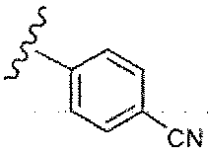
で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルである）。

【０５２６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ[1]は、

【０５２７】

【化７６】



で置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルである）。

【０５２８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ[1]は、Ｆ、Ｃｌからなる群から独立して選択される１～３個のハロで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルである）。一例では、前記フェニルは、１個のＦと、１個のＣｌで置換されている。

【０５２９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）で置換されたアルキル基であり（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルであり）、少なくとも１個のＲ[21]部分は、－ＳＦ$_5$，　－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（Ｒ[15A]）$_3$からなる群から選択される（一例では、各Ｒ[15A]は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、－Ｓｉ（Ｒ[24]）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$または－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$であり、別の例では、－Ｓｉ（Ｒ[24]）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である）。

【０５３０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）で置換されたアルキル基であり（一例では、Ｒ[1]はメチルであり、別の例では、Ｒ[1]はエチルであり）、少なくとも１個のＲ[21]部分は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される。

【０５３１】

本発明の別の実施形態では、R^1は、ハロ（例えば、Ｆ）、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）で置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$または－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$であり、別の例では、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である）、少なくとも１個のR^{21}部分は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$からなる群から選択される（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$または－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$であり、別の例では、－Ｓｉ（R^{24}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である）。

【０５３２】

本発明の別の実施形態では、R^1は、ハロ（例えば、Ｆ）、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）で置換されたアルキル基であり（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルであり）、少なくとも１個のR^{21}部分は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から選択される。

【０５３３】

本発明の別の実施形態では、R^1は、１～３個の独立して選択されるR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）で置換されたアルキル基であり（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルであり）、少なくとも１個のR^{21}部分は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$からなる群から選択される（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$または－Ｓｉ（ＣＨ$_2$ＣＨ$_3$）$_2$ＣＨ$_3$であり、別の例では、－Ｓｉ（R^{15A}）$_3$基は、－Ｓｉ（ＣＨ$_3$）$_3$である）。

【０５３４】

本発明の別の実施形態では、R^1は、ハロ、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルであり）、少なくとも１個のR^{21}基は、－ＳＦ$_5$または－ＯＳＦ$_5$である。

【０５３５】

本発明の別の実施形態では、R^1は、ハロ、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルであり）、少なくとも１個のR^{21}基は、－ＳＦ$_5$または－ＯＳＦ$_5$である。

【０５３６】

本発明の別の実施形態では、R^1は、Ｆ、Ｃｌ、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５３７】

本発明の別の実施形態では、R^1は、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５３８】

本発明の別の実施形態では、R^1は、Ｆ、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のR^{21}基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルであり）、少なくとも１個のR^{21}基は、－ＳＦ$_5$または－ＯＳＦ$_5$である。

【０５３９】

本発明の別の実施形態では、R^1は、１個の－ＳＦ$_5$基で置換されたフェニルで置換さ

れたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４０】

本発明の別の実施形態では、R^1は、２個の－SF_5基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４１】

本発明の別の実施形態では、R^1は、３個の－SF_5基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４２】

本発明の別の実施形態では、R^1は、１個の－OSF_5基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４３】

本発明の別の実施形態では、R^1は、２個の－OSF_5基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４４】

本発明の別の実施形態では、R^1は、３個の－OSF_5基で置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４５】

本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のＦで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４６】

本発明の別の実施形態では、R^1は、１個のＦで置換されたフェニルで置換されており、さらに、－SF_5、－OSF_5からなる群から独立して選択される１～２個の基で置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４７】

本発明の別の実施形態では、R^1は、２個のＦで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４８】

本発明の別の実施形態では、R^1は、３個のＦで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である（一例では、R^1はメチルであり、別の例では、R^1はエチルである）。

【０５４９】

本発明の別の実施形態では、R^1は、非置換アリール（例えば、フェニル）基であるか、置換アリールである。

【０５５０】

本発明の別の実施形態では、R^1は、非置換アリール（例えば、フェニル）基であるか、１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されたアリール（例えば、フェニル）である。

【０５５１】

本発明の別の実施形態では、R^1は、アリール基である。

【０５５２】

本発明の別の実施形態では、R^1基はアリール基であり、前記アリール基は、１個以上の独立して選択されるR^{21}基で置換されている。

【０５５３】

本発明の別の実施形態では、R^1基はアリール基であり、前記アリール基は、１～３個

の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されている。

【０５５４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、１個以上のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５５５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、１～３個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５５６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、ハロである３個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５５７】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、ハロである２個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５５８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、ハロである１個のＲ^{21}基で置換されている。

【０５５９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、ハロである１個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５６０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、１個のＦで置換されている（すなわち、前記アリールは、１個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。

【０５６１】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、２個のＦ原子で置換されている（すなわち、前記アリールは、２個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。

【０５６２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}基はアリール基であり、前記アリール基は、３個のＦ原子で置換されている（すなわち、前記アリールは、３個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。

【０５６３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、フェニルである。

【０５６４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されている。

【０５６５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されている。

【０５６６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、１個以上のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５６７】

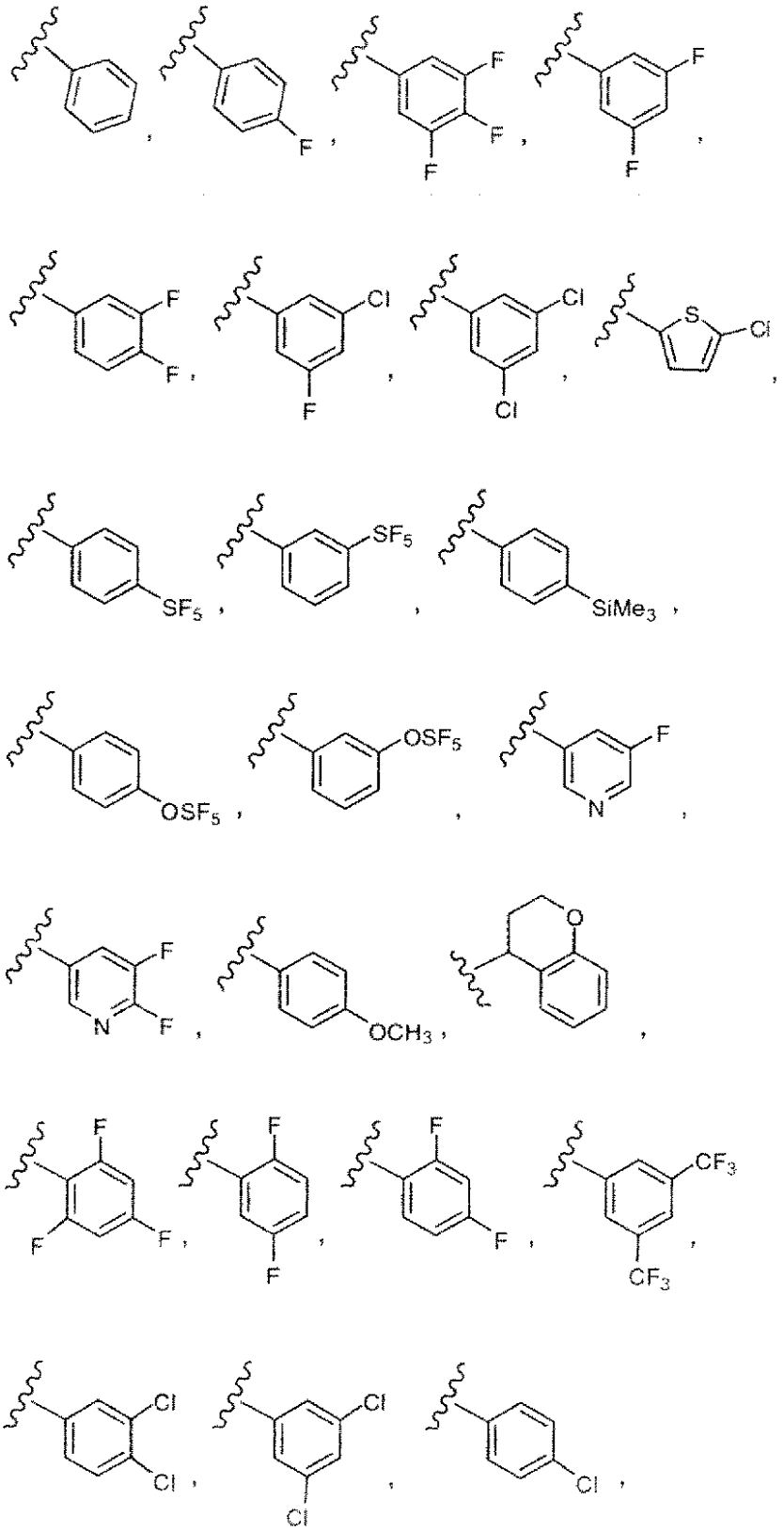
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、１～３個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。

【０５６８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである３個

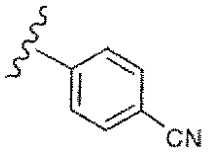
のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。
【０５６９】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである２個のＲ^{21}基で置換されており、各Ｒ^{21}基は、同じハロであるか、異なるハロである。
【０５７０】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個のＲ^{21}基で置換されている。
【０５７１】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、ハロである１個のＲ^{21}基で置換されている。
【０５７２】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、１個のＦで置換されている（すなわち、前記アリールは、１個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。
【０５７３】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、２個のＦ原子で置換されている（すなわち、前記アリールは、２個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。
【０５７４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}はフェニルであり、前記フェニルは、３個のＦ原子で置換されている（すなわち、前記アリールは、３個のＲ^{21}基で置換されており、前記Ｒ^{21}基はハロであり、前記ハロはＦである）。
【０５７５】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５７６】

【化７７】



【０５７７】

【化７８】

および 

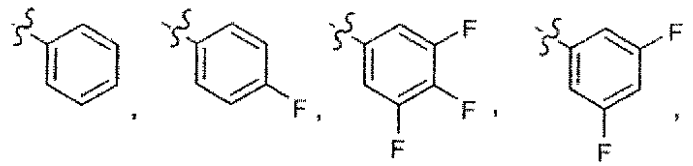
からなる群から選択される。

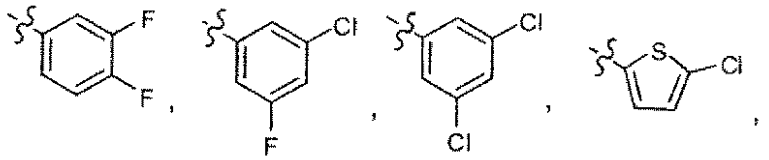
【０５７８】

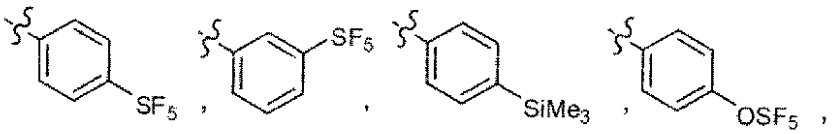
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

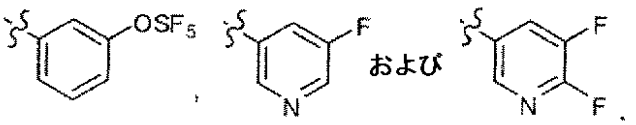
【０５７９】

【化７９】









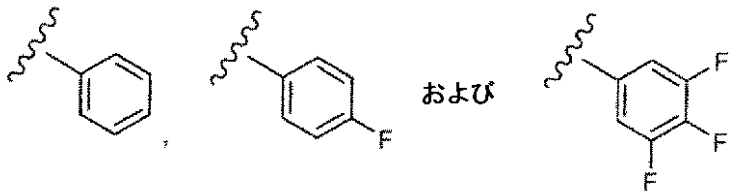
からなる群から選択される。

【０５８０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５８１】

【化８０】



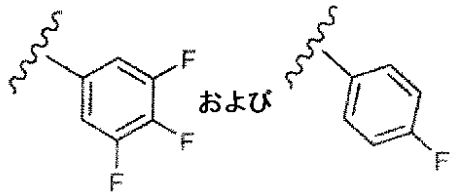
からなる群から選択される。

【０５８２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５８３】

【化８１】



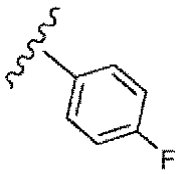
からなる群から選択される。

【０５８４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５８５】

【化８２】



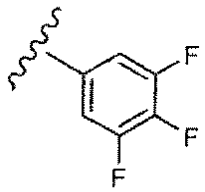
である。

【０５８６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５８７】

【化８３】



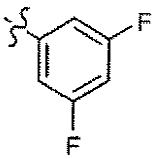
である。

【０５８８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０５８９】

【化８４】



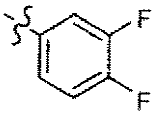
である。

【０５９０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ$^{1\ A}$は、

【０５９１】

【化８５】

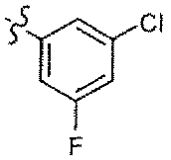


である。

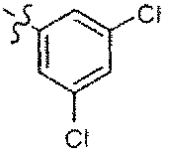
【０５９２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

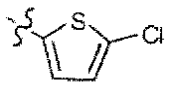
【０５９３】
【化８６】



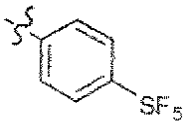
である。
【０５９４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1A}は、
【０５９５】
【化８７】



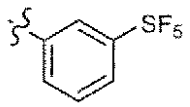
である。
【０５９６】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０５９７】
【化８８】



である。
【０５９８】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1A}は、
【０５９９】
【化８９】

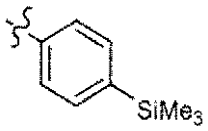


である。
【０６００】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６０１】
【化９０】



である。
【０６０２】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６０３】

【化９１】



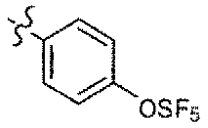
である。

【０６０４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６０５】

【化９２】



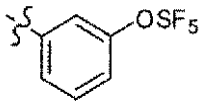
である。

【０６０６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ$^{1\ A}$は、

【０６０７】

【化９３】



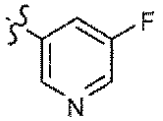
である。

【０６０８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６０９】

【化９４】



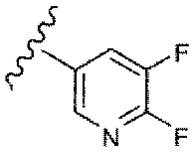
である。

【０６１０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６１１】

【化９５】



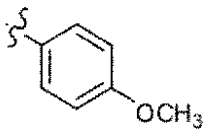
である。

【０６１２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６１３】

【化９６】



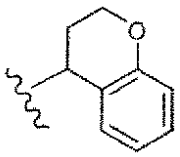
である。

【０６１４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６１５】

【化９７】



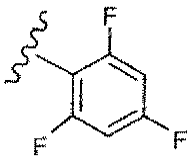
である。

【０６１６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６１７】

【化９８】



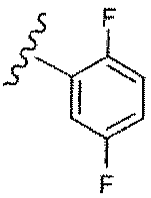
である。

【０６１８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６１９】

【化９９】



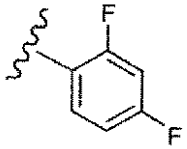
である。

【０６２０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６２１】

【化１００】



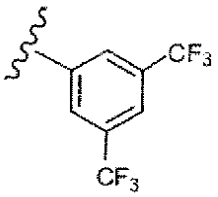
である。

【０６２２】

本発明の別の実施形態では、Ｒ$^{1\ A}$は、

【０６２３】

【化１０１】



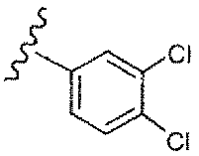
である。

【０６２４】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６２５】

【化１０２】



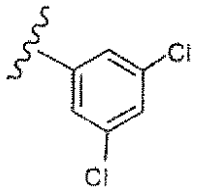
である。

【０６２６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６２７】

【化１０３】



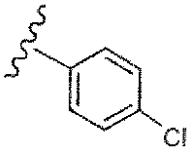
である。

【０６２８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６２９】

【化１０４】



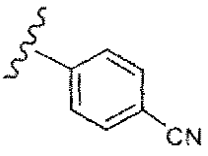
である。

【０６３０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６３１】

【化１０５】



である。

【０６３２】

別の実施形態では、R^1は、F、Clからなる群から独立して選択される1～3個のハロで置換されたフェニルである。一例では、前記フェニルは、1個のFと、1個のClで置換されている。

【0633】

別の実施形態では、R^1は、1～3個の独立して選択されるR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）であり、少なくとも1個のR^{21}部分は、$-SF_5$、$-OSF_5$、$-Si(R^{15A})_3$からなる群から選択される（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、$-Si(R^{24})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$または$-Si(CH_2CH_3)_2CH_3$であり、別の例では、$-Si(R^{24})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$である）。

【0634】

別の実施形態では、R^1は、1～3個の独立して選択されるR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）であり、少なくとも1個のR^{21}部分は、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から選択される。

【0635】

別の実施形態では、R^1は、ハロ（例えば、F）、$-SF_5$、$-OSF_5$、$-Si(R^{15A})_3$からなる群から独立して選択される1～3個のR^{21}部分で置換されたアリール（例えばフェニル）であり（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、$-Si(R^{15A})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$または$-Si(CH_2CH_3)_2CH_3$であり、別の例では、$-Si(R^{15A})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$である）、少なくとも1個のR^{21}部分は、$-SF_5$、$-OSF_5$、$-Si(R^{15A})_3$からなる群から選択される（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、$-Si(R^{15A})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$または$-Si(CH_2CH_3)_2CH_3$であり、別の例では、$-Si(R^{24})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$である）。

【0636】

別の実施形態では、R^1は、ハロ（例えば、F）、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から独立して選択される1～3個のR^{21}部分で置換されたアリール（例えばフェニル）であり、少なくとも1個のR^{21}部分は、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から選択される。

【0637】

別の実施形態では、R^1は、1～3個の独立して選択されるR^{21}部分で置換されたアリール（例えば、フェニル）であり、少なくとも1個のR^{21}部分は、$-SF_5$、$-OSF_5$、$-Si(R^{15A})_3$からなる群から選択される（一例では、各R^{15A}は、同じアルキルであるか、異なるアルキルであり、別の例では、$-Si(R^{15A})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$または$-Si(CH_2CH_3)_2CH_3$であり、別の例では、$-Si(R^{15A})_3$基は、$-Si(CH_3)_3$である）。

【0638】

別の実施形態では、R^1は、ハロ、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から独立して選択される1～3個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個のR^{21}基は、$-SF_5$または$-OSF_5$である。

【0639】

別の実施形態では、R^1は、ハロ、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から独立して選択される1～3個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、少なくとも1個のR^{21}基は、$-SF_5$または$-OSF_5$である。

【0640】

別の実施形態では、R^1は、F、Cl、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から独立して選択される1～3個のR^{21}基で置換されたフェニルである。

【0641】

別の実施形態では、R^1は、$-SF_5$、$-OSF_5$からなる群から独立して選択される

１～３個のＲ^{21}基で置換されたフェニルである。

【０６４２】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、Ｆ、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～３個のＲ^{21}基で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}基は、－ＳＦ$_5$または－ＯＳＦ$_5$である。

【０６４３】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個の－ＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４４】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、２個の－ＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４５】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、３個の－ＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４６】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個の－ＯＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４７】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、２個の－ＯＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４８】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、３個の－ＯＳＦ$_5$基で置換されたフェニルである。

【０６４９】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個のＦで置換されたフェニルである。

【０６５０】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個のＦで置換されたフェニルであり、さらに、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$からなる群から独立して選択される１～２個の基で置換されている。

【０６５１】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、２個のＦで置換されたフェニルである。

【０６５２】

別の実施形態では、Ｒ^{1}は、３個のＦで置換されたフェニルである。

【０６５３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{10}は、アリール、１個以上のＲ^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記Ｒ^{9}基は、ヘテロアリール、１個以上のＲ^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される。

【０６５４】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のＲ^{21}基で置換されたアルキル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のＲ^{21}基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ^{21}基が、１個以上の独立して選択されるＲ^{22}基で置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}は、アリール、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、（ｄ）Ｒ^{9}基は、ヘテロアリール、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択される。

【０６５５】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたアルキル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたアルキル基であり、前記フェニル基が、１個以上の独立して選択されるＲ^{22}基で置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}は、フェニル、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、（ｄ）Ｒ^{9}は、イミダゾリル、１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６５６】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるハロで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}は、フェニル、１個以上の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換され

たフェニルからなる群から選択され、（ｄ）Ｒ^{9}は、イミダゾリル、１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６５７】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}は、フェニル、１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}はアルキルであり、（ｄ）Ｒ^{9}は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６５８】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}はメチルであり、（ｄ）Ｒ^{9}基は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６５９】

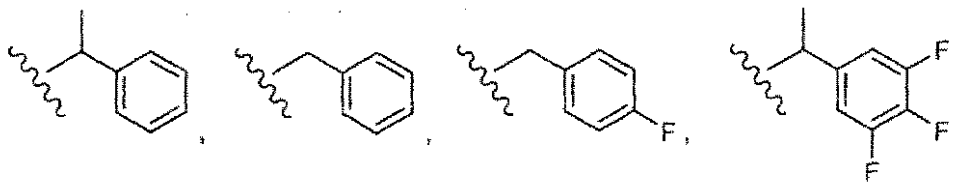
本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}はメチルであり、（ｄ）Ｒ^{9}は、イミダゾリル、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

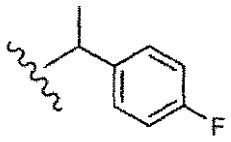
【０６６０】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６６１】

【化１０６】

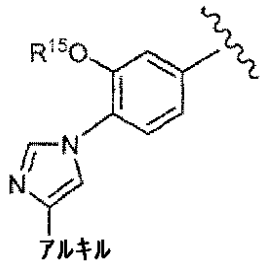


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６６２】

【化１０７】



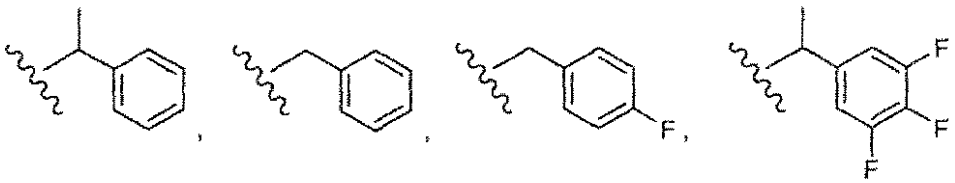
である。

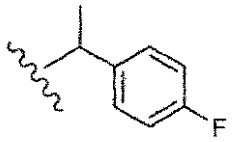
【０６６３】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６６４】

【化１０８】

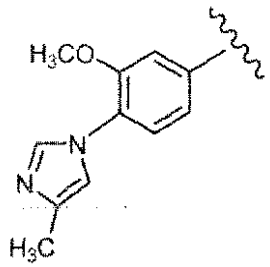


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６６５】

【化１０９】



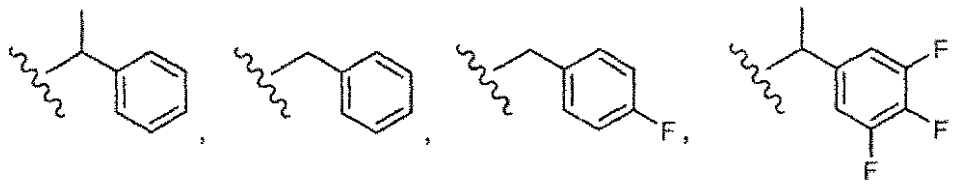
である。

【０６６６】

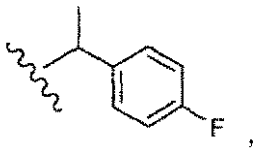
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６６７】

【化１１０】



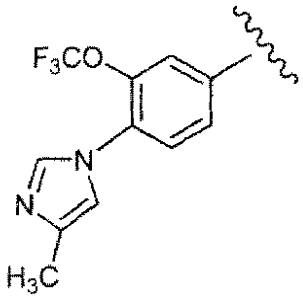
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６６８】

【化１１１】



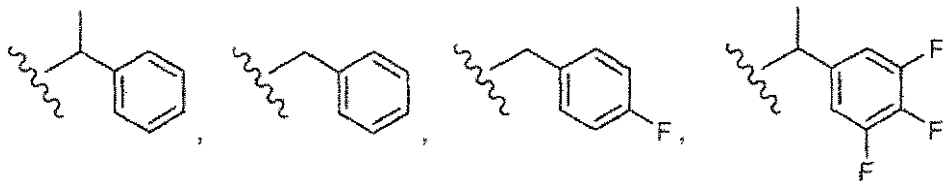
である。

【０６６９】

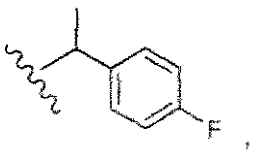
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６７０】

【化１１２】



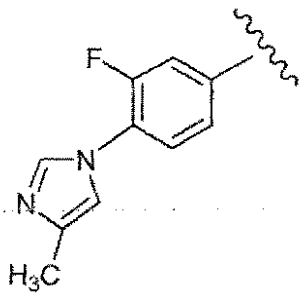
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６７１】

【化１１３】



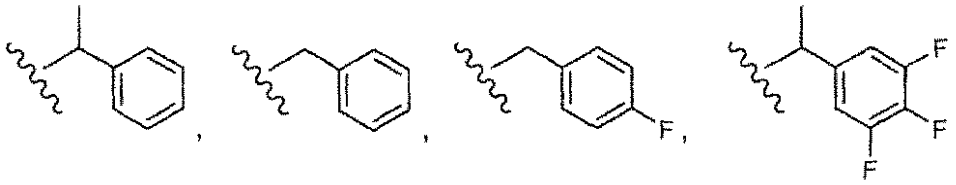
である。

【０６７２】

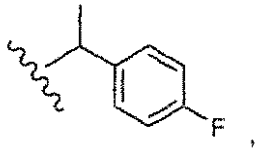
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６７３】

【化１１４】



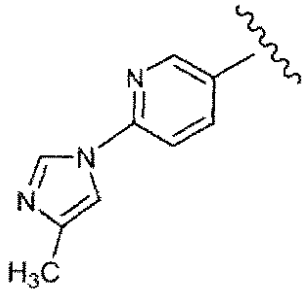
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６７４】

【化１１５】



である。

【０６７５】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個の独立して選択されるハロで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}はアルキルであり、（ｄ）Ｒ^{9}基は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６７６】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個の独立して選択されるハロで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}はアルキルであり、（ｄ）Ｒ^{9}基は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択される。

【０６７７】

本発明の別の実施形態では、（ａ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個の独立して選択されるハロで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基

で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}はアルキルであり、（ｄ）R^{9}基は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）G^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、（ｆ）G^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０６７８】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニル基で置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}はアルキルであり、（ｄ）R^{9}基は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０６７９】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}はアルキルであり、（ｄ）R^{9}は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）G^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択される。

【０６８０】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}が、フェニル、１個または２個の独立して選択される－OR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}はアルキルであり、（ｄ）R^{9}は、イミダゾリル、１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）G^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、（ｆ）G^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０６８１】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}が、１個の－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}はメチルであり、（ｄ）R^{9}は、イミダゾリル、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

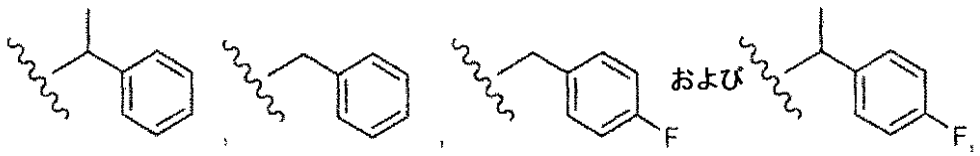
【０６８２】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}は、１個の－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、（ｄ）R^{9}は、イミダゾリル、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）G^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択される。

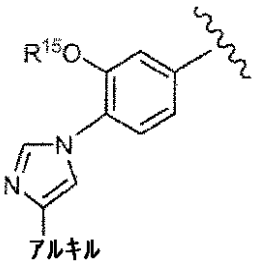
【０６８３】

本発明の別の実施形態では、（ａ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）R^{1}は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはアルキル基であり、前記フェニルが、１～３個のＦで置換されており、（ｃ）R^{10}は、１個の－OR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、（ｄ）R^{9}は、イミダゾリル、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択され、（ｅ）G^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、（ｆ）G^{6}は、ＣまたはＣＨである。

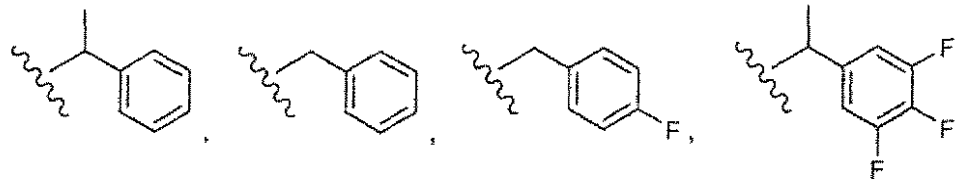
【０６８４】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６８５】
【化１１６】

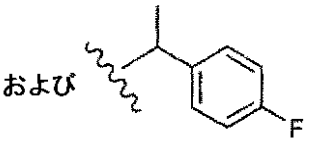


からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０６８６】
【化１１７】

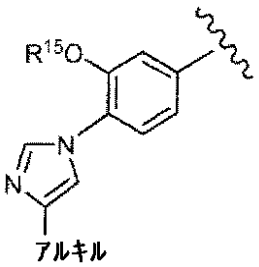


である。
【０６８７】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６８８】
【化１１８】



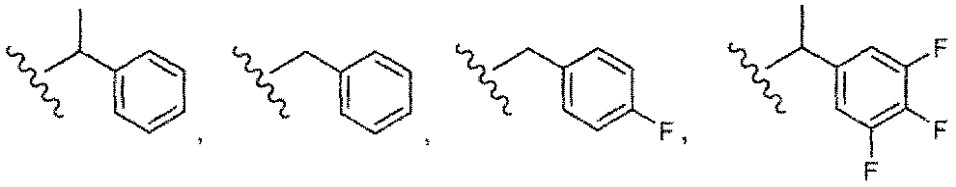


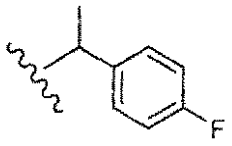
からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０６８９】
【化１１９】



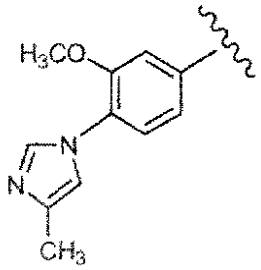
であり、Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０６９０】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６９１】
【化１２０】

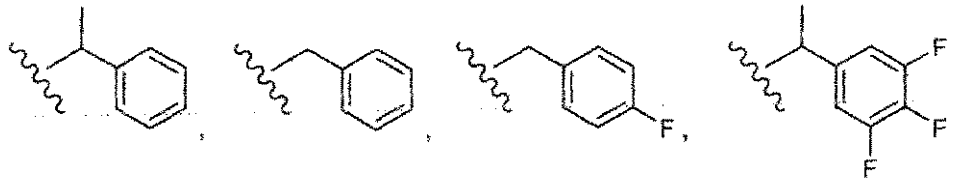


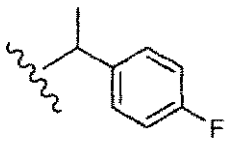
および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０６９２】
【化１２１】



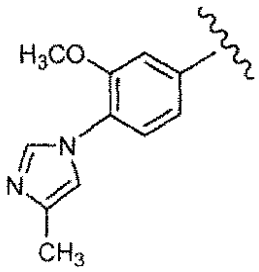
である。
【０６９３】
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０６９４】
【化１２２】



および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、
【０６９５】

【化１２３】



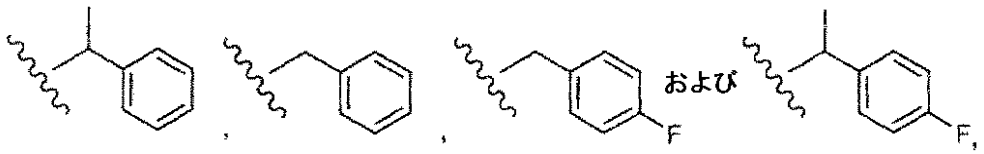
であり、Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０６９６】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０６９７】

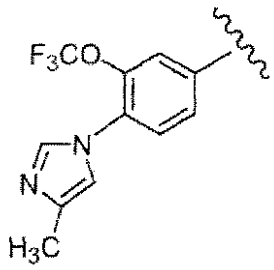
【化１２４】



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０６９８】

【化１２５】



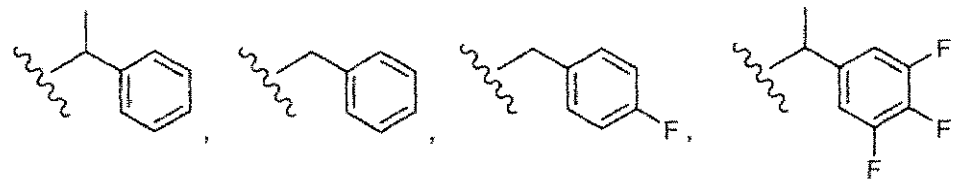
である。

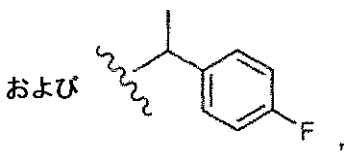
【０６９９】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７００】

【化１２６】

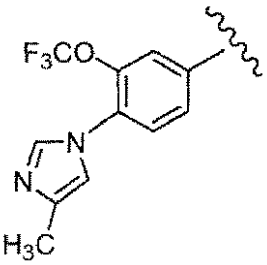




からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０７０１】

【化１２７】



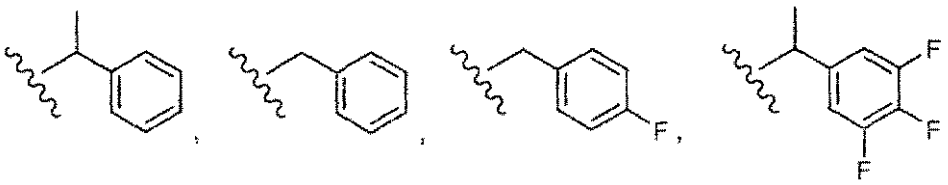
であり、Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０７０２】

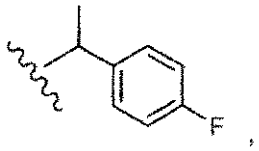
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７０３】

【化１２８】



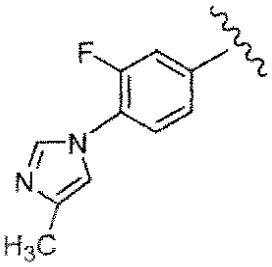
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０７０４】

【化１２９】



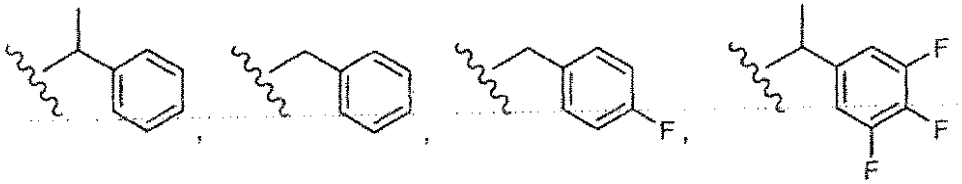
である。

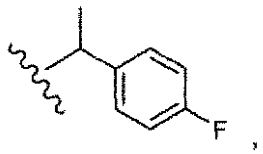
【０７０５】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７０６】

【化１３０】

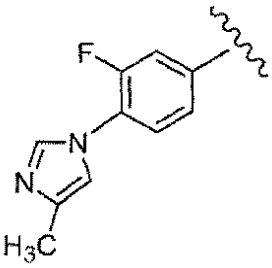


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０７０７】

【化１３１】



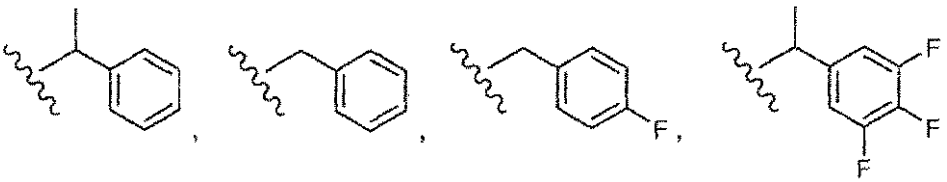
であり、Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}は、ＣまたはＣＨである。

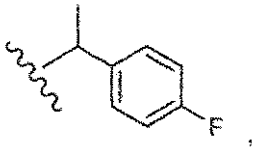
【０７０８】

本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７０９】

【化１３２】

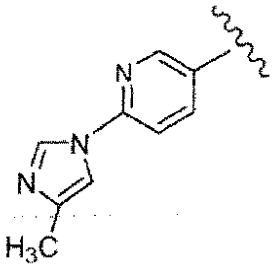


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０７１０】

【化１３３】



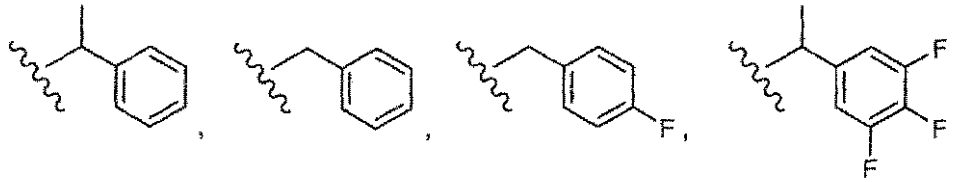
である。

【０７１１】

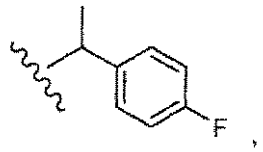
本発明の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７１２】

【化１３４】



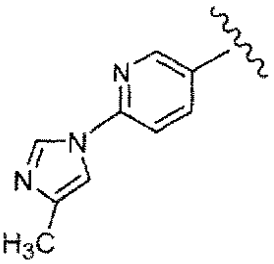
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０７１３】

【化１３５】



であり、Ｇ^{5}は、－Ｎ＝、－ＮＨ－、－Ｏ－、－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}は、ＣまたはＣＨである。

【０７１４】

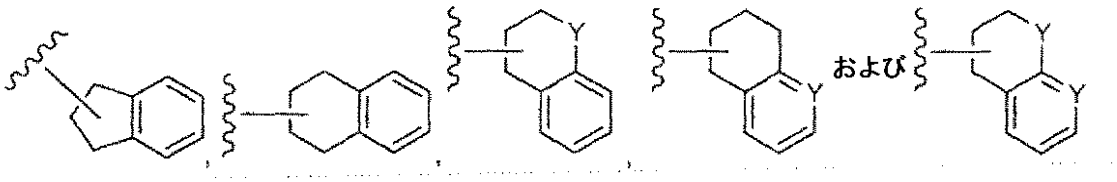
本発明の他の実施形態は、Ｒ^{1}が、ベンゾ縮合シクロアルキル（すなわち、縮合ベンゾシクロアルキル）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルからなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関し、このＲ^{1}基は、場合により、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されている。一例では、Ｒ^{21}基は、ハロである（例えば、Ｆ）。

【０７１５】

縮合環であるＲ^{1}基の例としては、限定されないが、

【０７１６】

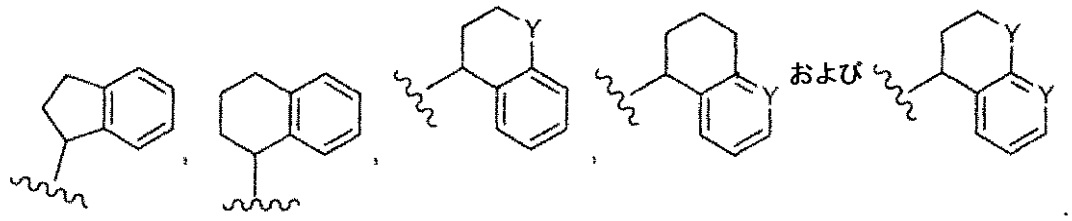
【化１３６】



が挙げられ、式中、Ｙは、それぞれ独立して、－Ｏ－、－ＮＲ^{14}－、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_q$－からなる群から選択され、ｑは、先に定義したとおりであり（すなわち、０、１または２であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される）、Ｒ^{14}およびＲ^{21}は、式（Ｉ）について定義したとおりである。これらのＲ^{1}基の例としては、例えば、

【０７１７】

【化１３７】



が挙げられる。

【０７１８】

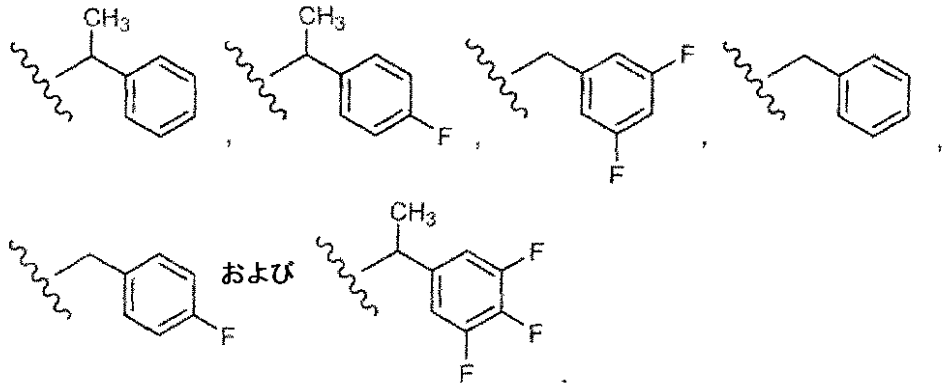
式（Ｉ）の化合物としては、Ｒ^{1}が、１個のＲ^{21}基で置換されたアルキル基（例えば、エチル）である化合物が挙げられる。前記Ｒ^{1}基の例としては、アリールであるＲ^{21}部分（例えば、フェニルまたはナフチル）で置換されたアルキル（例えば、メチルまたはエチル）が挙げられる。さらに、前記Ｒ^{1}基の例としては、アリールであるＲ^{21}部分（例えば、フェニルまたはナフチル）で置換され、１個以上（例えば、１個または２個）の独立して選択されるＲ^{22}基（例えば、Ｒ^{22}は、ハロ、例えば、Ｆである）で置換されたアルキル（例えば、メチルまたはエチル）が挙げられる。

【０７１９】

置換されたＲ^{1}アルキル基の例としては、限定されないが、

【０７２０】

【化１３８】



が挙げられる。

【０７２１】

本発明の他の実施形態は、Ｒ^{1}が、１個のＲ^{21}基（例えば、アリール、例えば、フェニル）で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロプロピルまたはシクロブチル）であるか、または１個のＲ^{21}基（例えば、アリール、例えば、フェニル）で置換され、１個以上（例えば、１個または２個）の独立して選択されるＲ^{22}基（例えば、ハロ、例え

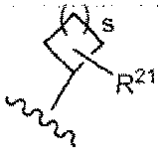
ば、Ｆ）で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロペンチルまたはシクロヘキシル）である、式（Ｉ）の化合物に関する。一例では、Ｒ^{21}基は、Ｒ^{1}基を分子の残りの部分と結合しているＲ^{1}基の同じ炭素に結合している。

【０７２２】

シクロアルキルであるＲ^{1}基の例としては、限定されないが、

【０７２３】

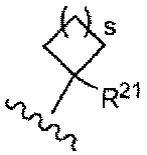
【化１３９】



例えば、

【０７２４】

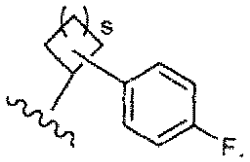
【化１４０】



であり、式中、ｓは０であるか（すなわち、環は、シクロプロピルであるか）、または１である（すなわち、環は、シクロブチルである）化合物が挙げられる。これらのＲ^{1}基の例としては、限定されないが、

【０７２５】

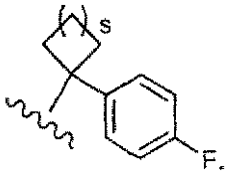
【化１４１】



例えば、

【０７２６】

【化１４２】



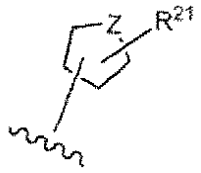
であり、式中、ｓは０であるか（すなわち、環は、シクロプロピルであるか）、または１である（すなわち、環は、シクロブチルである）化合物が挙げられる。

【０７２７】

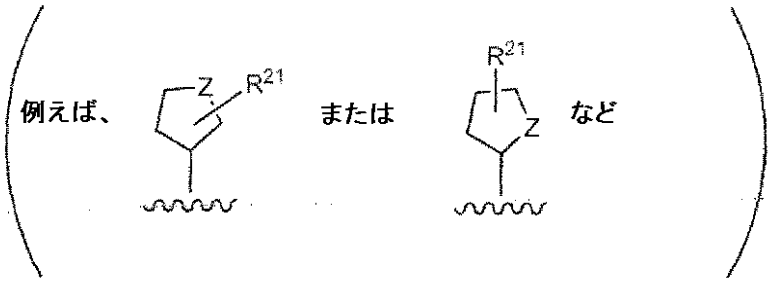
本発明の他の実施形態は、Ｒ^{1}が

【０７２８】

【化１４３】

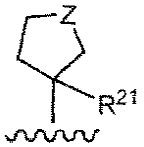


【０７２９】
【化１４４】



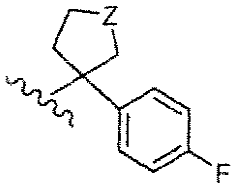
であり、Ｚが、（１）－Ｏ－、（２）－ＮＲ^{14}－、（３）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$－（ｑは、０、１または２であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される）、（４）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$－（ｑは、それぞれ独立して、０、１または２であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される）、（５）－（Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$）$_{q}$－Ｏ－（Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$）$_{q}$－（ｑは、それぞれ独立して、０、１または２であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される）、（６）－（Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$）$_{q}$－Ｎ（Ｒ^{14}）－（Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$）$_{q}$－（ｑは、それぞれ独立して、０、１または２であり、Ｒ^{21}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。Ｒ^{21}の例としては、アリール（例えば、フェニル）、１個以上（例えば、１個または２個、または１個）の独立して選択されるＲ^{22}基（例えば、ハロ、例えば、Ｆ）で置換されたアリール（例えば、フェニル）が挙げられるが、これらに限定されない。このＲ^{1}の例としては、限定されないが、

【０７３０】
【化１４５】



が挙げられる。したがって、このＲ^{1}基の例としては、限定されないが、

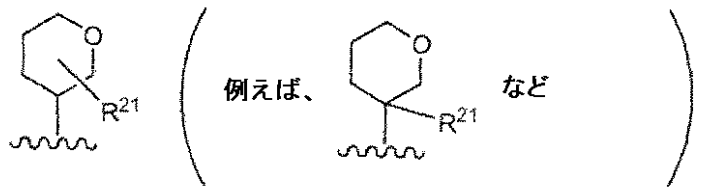
【０７３１】
【化１４６】



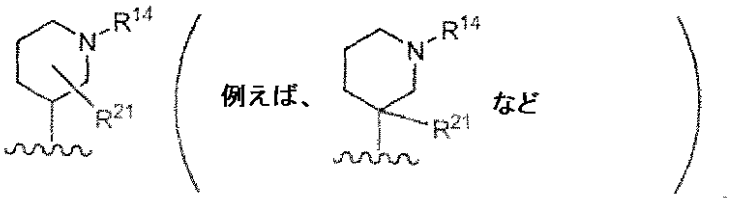
が挙げられる。Ｒ^{1}の例としては、限定されないが、

【０７３２】

【化１４７】

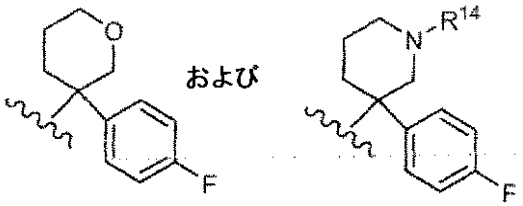


,



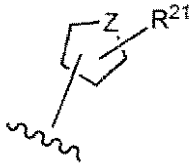
,

【０７３３】
【化１４８】



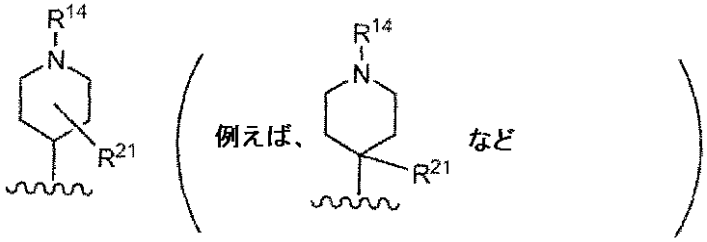
が挙げられる。さらに、このＲ[1]基

【０７３４】
【化１４９】



の例としては、限定されないが、

【０７３５】
【化１５０】

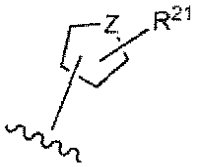


.

が挙げられる。さらに、このＲ[1]基

【０７３６】

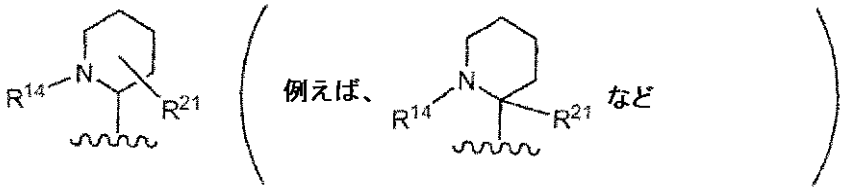
【化１５１】



の例としては、限定されないが、

【０７３７】

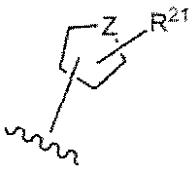
【化１５２】



が挙げられる。さらに、このＲ[1]基

【０７３８】

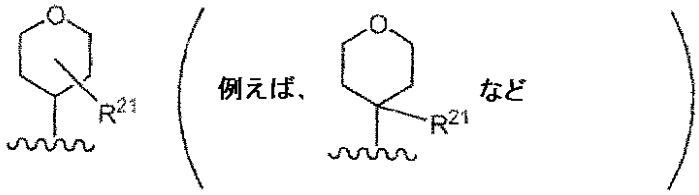
【化１５３】



の例としては、限定されないが、

【０７３９】

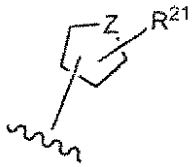
【化１５４】



が挙げられる。さらに、このＲ[1]基

【０７４０】

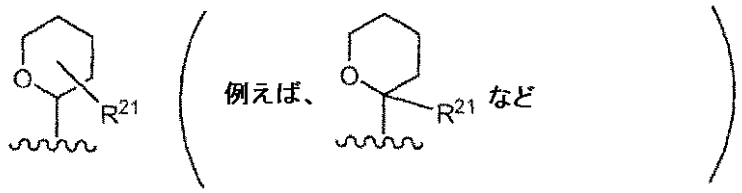
【化１５５】



の例としては、限定されないが、

【０７４１】

【化１５６】



が挙げられる。

【０７４２】

本発明の他の実施形態は、R^{10}が、アリール（例えば、フェニル）、または１個以上（例えば、１個または２個、または１個）のR^{21}基（例えば、－OR^{15}、ここで、例えば、R^{15}は、例えば、メチルのようなアルキルである）で置換されたアリール（例えば、フェニル）であり、R^{9}は、ヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）、または１個以上（例えば、１個または２個、または１個）のR^{21}基（例えば、アルキル、例えば、メチル）で置換されたヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）である、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０７４３】

本発明の他の実施形態は、R^{10}が、ヘテロアリール、または１個以上のR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、R^{9}は、ヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）、または１個以上（例えば、１個または２個、または１個）のR^{21}基（例えば、アルキル、例えば、メチル）で置換されたヘテロアリール（例えば、イミダゾリル）である、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０７４４】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたアリールであり、R^{21}基は、－OR^{15}である。一例では、R^{15}は、アルキルである。別の例では、R^{15}は、メチルである。

【０７４５】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{10}は、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、R^{21}基は、－OR^{15}である。一例では、R^{15}は、アルキルである。別の例では、R^{15}は、メチルである。

【０７４６】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{10}は、ヘテロアリールである。

【０７４７】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、ヘテロアリールである。

【０７４８】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、１個以上の（例えば、１個の）独立して選択されるR^{21}基で置換されたヘテロアリールである。

【０７４９】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、１個以上の（例えば、１個の）独立して選択されるR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、各R^{21}基は、同じアルキル基であるか、異なるアルキル基である（例えば、メチル）。

【０７５０】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、１個のR^{21}基で置換されたヘテロアリールである。

【０７５１】

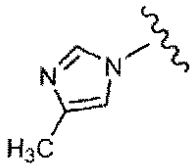
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、１個のR^{21}基で置換されたヘテロアリールであり、R^{21}は、アルキル基である（例えば、メチル）。

【０７５２】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{9}は、イミダゾリルである。

【０７５３】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、１個以上の（例えば、１個の）独立して選択されるR^{21}基で置換されたイミダゾリルである。
【０７５４】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、１個以上の（例えば、１個の）独立して選択されるR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、各R^{21}基は、同じアルキル基であるか、異なるアルキル基である（例えば、メチル）。
【０７５５】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルである。
【０７５６】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、１個のR^{21}基で置換されたイミダゾリルであり、R^{21}は、アルキル基である（例えば、メチル）。
【０７５７】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、ヘテロアリールであり、このヘテロアリールは、場合により、１個以上のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個以上の（例えば、１個の）R^{21}基で置換されたアリールである。
【０７５８】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、ヘテロアリールであり、このヘテロアリールは、場合により、１個のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個のR^{21}基で置換されたアリールである。
【０７５９】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、ヘテロアリールであり、このヘテロアリールは、場合により、１個以上のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個以上の（例えば、１個の）R^{21}基で置換されたフェニルである。
【０７６０】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、ヘテロアリールであり、このヘテロアリールは、場合により、１個のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個のR^{21}基で置換されたフェニルである。
【０７６１】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、イミダゾリルであり、このイミダゾリルは、場合により、１個以上のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個以上の（例えば、１個の）R^{21}基で置換されたアリールである。
【０７６２】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、イミダゾリルであり、このイミダゾリルは、場合により、１個のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個のR^{21}基で置換されたアリールである。
【０７６３】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、イミダゾリルであり、このイミダゾリルは、場合により、１個以上のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個以上の（例えば、１個の）R^{21}基で置換されたフェニルである。
【０７６４】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^9は、イミダゾリルであり、このイミダゾリルは、場合により、１個のR^{21}基で置換されており、R^{10}は、場合により、１個のR^{21}基で置換されたフェニルである。
【０７６５】
式（Ｉ）の化合物の他の実施形態は、R^9が
【０７６６】

【化１５７】



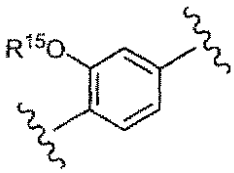
である、上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０７６７】

式（Ｉ）の化合物の他の実施形態は、Ｒ^{10}が

【０７６８】

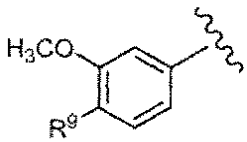
【化１５８】



であり、式中、－ＯＲ^{15}は、Ｒ^{9}が結合している炭素に対しオルト位置にあり、すなわち、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が

【０７６９】

【化１５９】



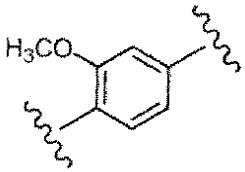
である、上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０７７０】

式（Ｉ）の化合物の他の実施形態は、Ｒ^{10}が

【０７７１】

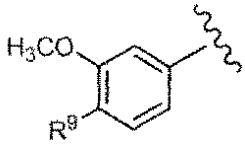
【化１６０】



であり、式中、－ＯＣＨ$_3$は、Ｒ^{9}が結合している炭素に対しオルト位置にあり、すなわち、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が

【０７７２】

【化１６１】



である、上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０７７３】

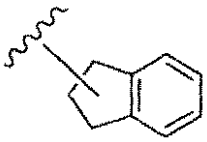
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、ベンゾ縮合シクロアルキルである。

【０７７４】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７７５】

【化１６２】



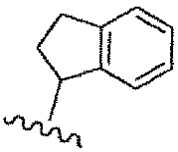
である。

【０７７６】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７７７】

【化１６３】



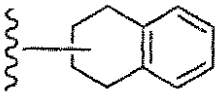
である。

【０７７８】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７７９】

【化１６４】



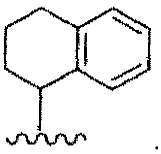
である。

【０７８０】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、

【０７８１】

【化１６５】



である。

【０７８２】

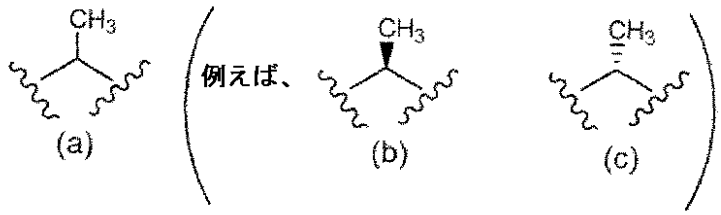
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個のＲ$^{2\ 1}$基で置換されたアルキルである。

【０７８３】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、１個のＲ$^{2\ 1}$基で置換されたアルキルであり、前記アルキルは、

【０７８４】

【化１６６】



である。
【０７８５】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換され、前記R^{21}基がアリールである、アルキルである（例えば、上述の（ａ）、（ｂ）または（ｃ））。
【０７８６】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換され、前記R^{21}基がフェニルである、アルキルである（例えば、上述の（ａ）、（ｂ）または（ｃ））。
【０７８７】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換され、前記R^{21}基がナフチルである、アルキルである（例えば、上述の（ａ）、（ｂ）または（ｃ））。
【０７８８】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換され、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０７８９】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されている。
【０７９０】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０７９１】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されている。
【０７９２】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０７９３】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されている。
【０７９４】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されている。
【０７９５】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されている。
【０７９６】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、R^{22}は、それぞれハロである。
【０７９７】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^1は、１個のR^{21}基で置換されたアルキル

であり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されており、前記R^{22}は、ハロである。

【０７９８】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、R^{22}は、それぞれハロである。

【０７９９】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されており、前記R^{22}は、ハロである。

【０８００】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、R^{22}は、それぞれＦである。

【０８０１】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記R^{21}基が、１個のR^{22}基で置換されており、前記R^{22}は、Ｆである。

【０８０２】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基は、２個の独立して選択されるR^{22}基で置換されており、R^{22}は、それぞれＦである。

【０８０３】

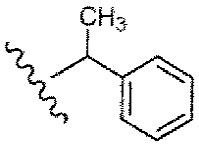
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、１個のR^{21}基で置換されたアルキルであり、前記R^{21}基がアリールであり、前記アルキル基が、上述の（ａ）（例えば、（ｂ）または（ｃ））であり、前記R^{21}基は、１個のR^{22}基で置換されており、前記R^{22}は、Ｆである。

【０８０４】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、

【０８０５】

【化１６７】



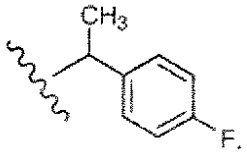
である。

【０８０６】

式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、R^{1}は、

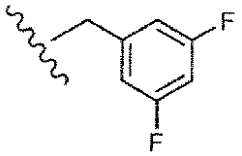
【０８０７】

【化１６８】

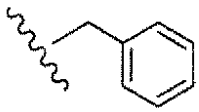


である。

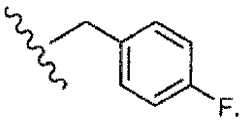
【０８０８】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０８０９】
【化１６９】



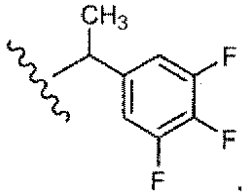
である。
【０８１０】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０８１１】
【化１７０】



である。
【０８１２】
式（Ｉ）の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０８１３】
【化１７１】



である。
【０８１４】
本発明の化合物の別の実施形態では、Ｒ^{1}は、
【０８１５】
【化１７２】



である。
【０８１６】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＡ）の化合物である、Ｒ^{1}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。
【０８１７】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＢ）の化合物である、Ｒ^{1}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。
【０８１８】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＡ）の化合物である、Ｒ^{9}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。
【０８１９】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＢ）の化合物である、Ｒ^{9}に関す

る上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２０】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＡ）の化合物である、R^{10}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２１】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＢ）の化合物である、R^{10}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２２】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＡ）の化合物である、R^{9}およびR^{10}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２３】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が式（ＩＢ）の化合物である、R^{9}およびR^{10}に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２４】

R^{21}基の例としては、－OR^{15}が挙げられ、例えば、R^{15}は、アルキル（例えば、メチルまたはエチル）であるか、またはR^{15}は、シクロアルキルアルキル（例えば、－CH_2－シクロプロピル）であるか、またはR^{15}は、－アルキル－（R^{18}）$_n$である（例えば、前記R^{18}は、－OR^{20}であり、前記R^{20}は、アルキルであり、前記－アルキル－（R^{18}）$_n$部分の例は、－（CH_2）$_2$$OCH_3$である。）

さらに、R^{21}の例としては、－Ｃ（Ｏ）OR^{15}が挙げられ、例えば、R^{15}は、アルキル（例えば、メチル）である。

【０８２５】

さらに、R^{21}の例としては、－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$が挙げられ、例えば、R^{15}またはR^{16}のうち１つはＨであり、他方は、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル－、（R^{18}）$_n$－アルキル－、シクロアルキルからなる群から選択される。この－Ｃ（Ｏ）$NR^{15}R^{16}$部分の一例では、R^{18}は－OR^{20}であり、ｎは１であり、R^{20}はアルキルであり、前記シクロアルキルはシクロブチルであり、前記アリールアルキルはベンジルである。

【０８２６】

さらに、R^{21}の例としては、ハロが挙げられる（例えば、Ｂｒ、ＣｌまたはＦ）。

【０８２７】

さらに、R^{21}の例としては、アリールアルキルが挙げられる（例えば、ベンジル）。

【０８２８】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）が式（ＩＡ）である、式（Ｉ）に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８２９】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）が式（ＩＢ）である、式（Ｉ）に関する上述の実施形態のうち、いずれかのものに関する。

【０８３０】

本発明の別の実施形態では、式（ＩＡ）において、G^1とG^2との間に任意の結合が存在しない（すなわち、G^1とG^2との間に単結合が存在する）。

【０８３１】

本発明の別の実施形態では、式（ＩＡ）において、G^1とG^2との間に任意の結合が存在する（すなわち、G^1とG^2との間に二重結合が存在する）。

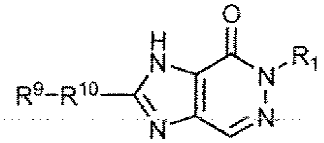
【０８３２】

本発明の別の実施形態では、式（ＩＢ）において、G^1とG^2との間に任意の結合が存在しない（すなわち、G^1とG^2との間に単結合が存在する）。

【０８３３】

本発明の別の実施形態では、式（ＩＢ）において、G^1とG^2との間に任意の結合が存在する（すなわち、G^1とG^2との間に二重結合が存在する）。

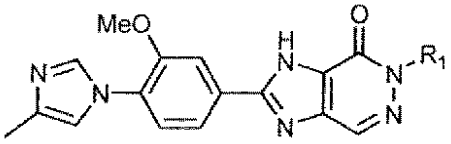
【０８３４】
本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。
【０８３５】
【化１７３】



43A

本発明の一実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ$^{2\ 1}$基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３ＡのＲ^{1}は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

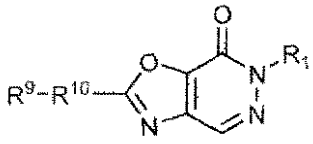
【０８３６】
本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。
【０８３７】
【化１７４】



43

本発明の一実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ$^{2\ 1}$基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４３のＲ^{1}は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８３８】
本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。
【０８３９】
【化１７５】



44A

本発明の一実施形態では、化合物４４ＡのＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４４ＡのＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４４ＡのＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ$^{2\ 1}$基で置換され

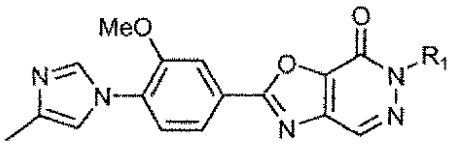
たフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８４０】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８４１】

【化１７６】



44

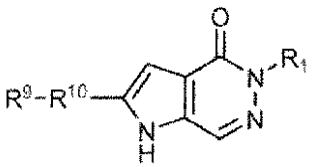
本発明の一実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４４のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８４２】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８４３】

【化１７７】



45A

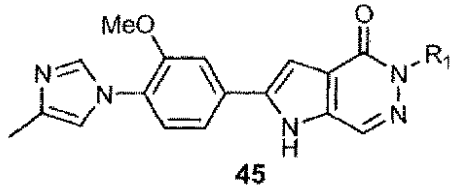
本発明の一実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８４４】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８４５】

【化１７８】



45

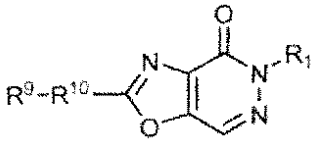
本発明の一実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４５のＲ^{1}は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８４６】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８４７】

【化１７９】



46A

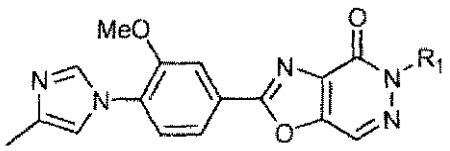
本発明の一実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６ＡのＲ^{1}は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８４８】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８４９】

【化１８０】



46

本発明の一実施形態では、化合物４６のＲ^{1}は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４６のＲ^{1}は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４６のＲ^{1}は、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６のＲ^{1}は、１～３個（例えば、１～３個、

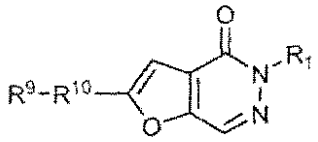
または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４６のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８５０】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８５１】

【化１８１】



47A

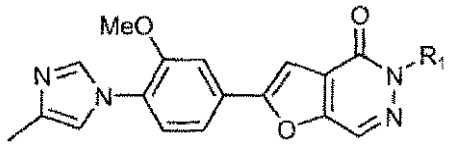
本発明の一実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８５２】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８５３】

【化１８２】



47

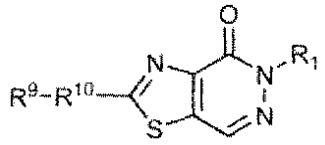
本発明の一実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４７のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８５４】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８５５】

【化１８３】



48A

本発明の一実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。

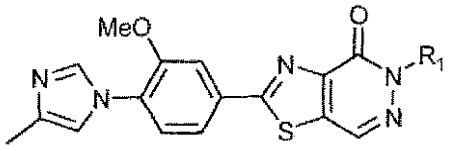
別の実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８５６】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８５７】

【化１８４】



48

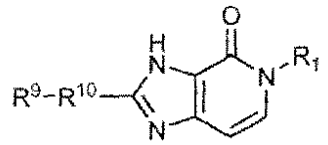
本発明の一実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４８のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８５８】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８５９】

【化１８５】



49A

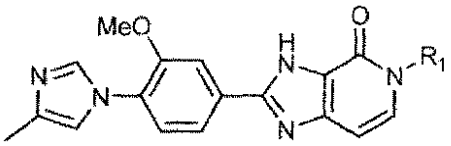
本発明の一実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８６０】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８６１】

【化１８６】



49

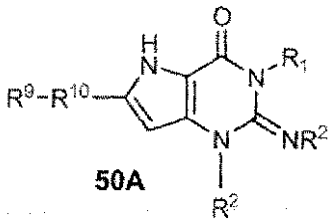
本発明の一実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物４９のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８６２】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８６３】

【化１８７】



50A

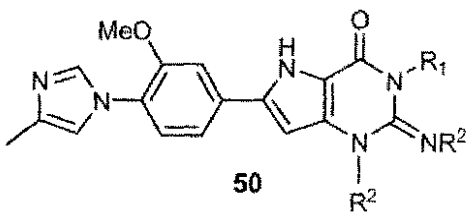
式中、Ｒ[2]は、それぞれ独立して選択される。本発明の一実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８６４】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８６５】

【化１８８】



50

式中、Ｒ[2]は、それぞれ独立して選択される。本発明の一実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独

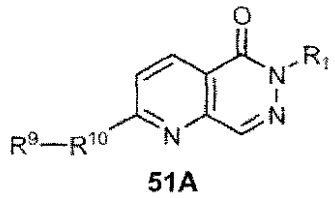
立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５０のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８６６】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８６７】

【化１８９】



51A

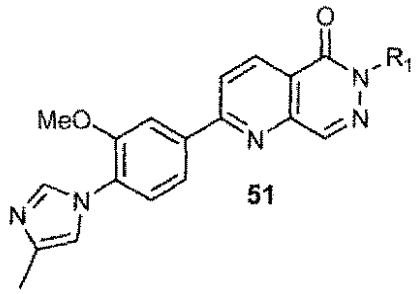
本発明の一実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８６８】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８６９】

【化１９０】



51

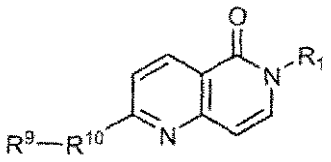
本発明の一実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５１のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８７０】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８７１】

【化１９１】



52A

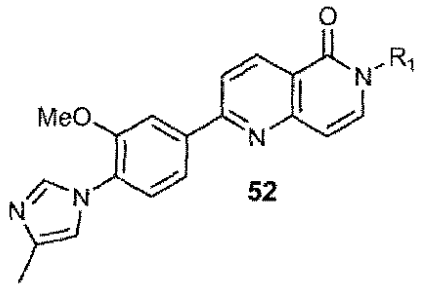
本発明の一実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８７２】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８７３】

【化１９２】



52

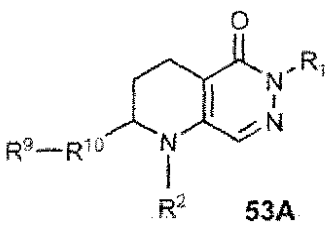
本発明の一実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５２のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８７４】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８７５】

【化１９３】



53A

本発明の一実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換され

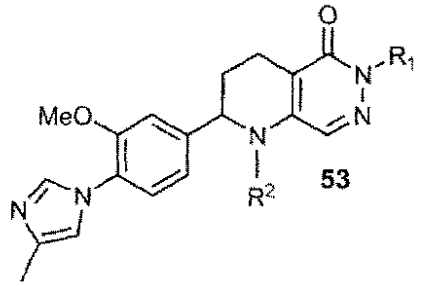
たフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８７６】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８７７】

【化１９４】



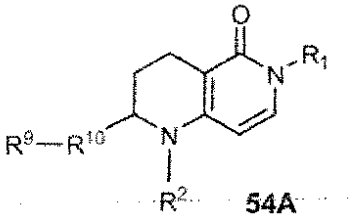
本発明の一実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５３のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８７８】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８７９】

【化１９５】



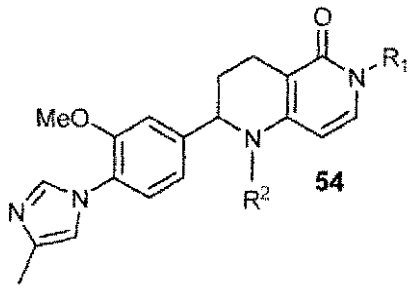
本発明の一実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４ＡのＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８８０】

本発明の別の実施形態は、以下の式を有する式（Ｉ）の化合物に関する。

【０８８１】

【化１９６】



本発明の一実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、アリールまたは置換アリールである。別の実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、フェニルまたは置換フェニルである。別の実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、１～３個の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）の独立して選択されるハロで置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、１～３個（例えば、１～３個、または１～２個、または１個）のＦ原子で置換されたフェニルである。本発明の別の実施形態では、化合物５４のＲ[1]は、１個のＦ原子で置換されたフェニルである。

【０８８２】

本発明の実施形態におけるＲ[21]部分の例としては、限定されないが、（ａ）－ＯＲ[15]、（ｂ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]はアルキルである）、（ｃ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]はアルキルであり、前記アルキルは、メチルまたはエチルである）、（ｄ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]はシクロアルキルアルキルである）、（ｅ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]は、－アルキル－（Ｒ[18]）[n]である）、（ｆ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]は、－アルキル－（Ｒ[18]）[n]であり、前記Ｒ[18]は、－ＯＲ[20]である）、（ｇ）－ＯＲ[15]（Ｒ[15]は、－アルキル－（Ｒ[18]）[n]であり、前記Ｒ[18]は－ＯＲ[20]であり、前記Ｒ[20]はアルキルである）が挙げられる。Ｒ[21]部分の例としては、限定されないが、－ＯＣＨ[3]、－ＯＣＨ[2]ＣＨ[3]、－Ｏ（ＣＨ[2]）[2]ＯＣＨ[3]、－ＣＨ[2]－シクロプロピルが挙げられる。

【０８８３】

さらに、Ｒ[21]の例としては、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ[15]が挙げられ、例えば、Ｒ[15]は、アルキルである（例えば、メチル）。

【０８８４】

さらに、Ｒ[21]の例としては、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ[15]Ｒ[16]が挙げられ、例えば、Ｒ[15]またはＲ[16]のうち１つはＨであり、もう片方は、（Ｒ[18]）[n]－アリールアルキル－、（Ｒ[18]）[n]－アルキル－、シクロアルキルからなる群から選択される。この－Ｃ（Ｏ）ＮＲ[15]Ｒ[16]部分の一例では、Ｒ[18]は、－ＯＲ[20]であり、ｎは１であり、Ｒ[20]はアルキルであり、シクロアルキルはシクロブチルであり、アリールアルキル－は、ベンジルである。

【０８８５】

さらに、Ｒ[21]の例としては、ハロが挙げられる（例えば、Ｂｒ、ＣｌまたはＦ）。

【０８８６】

さらに、Ｒ[21]の例としては、アリールアルキルが挙げられる（例えば、ベンジル）。

【０８８７】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、（ａ）Ｒ[1]は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ[1]は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルは、１個、２個または３個のＦで置換されている。

【０８８８】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、（ａ）Ｒ[1]は、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または（ｂ）Ｒ[1]は、１個のフェニルで置換されたメチル基ま

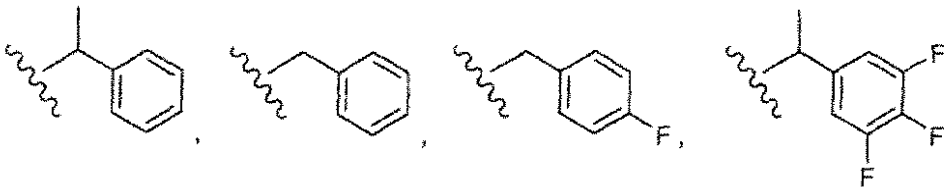
たはエチル基であり、前記フェニルは、１個、２個または３個のＦで置換されており、（ｃ）Ｒ^{10}は、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}は、メチルであり、（ｅ）Ｒ^{9}は、イミダゾリル、１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択される。

【０８８９】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

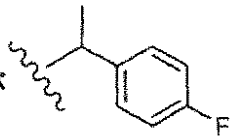
【０８９０】

【化１９７】



【０８９１】

【化１９８】

および 

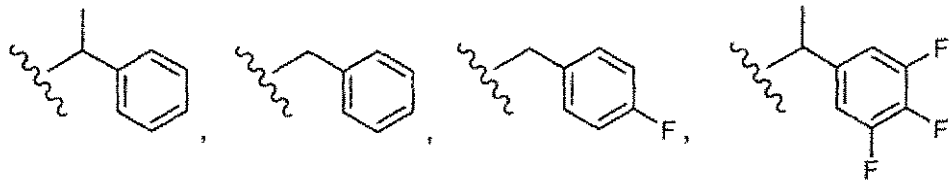
からなる群から選択される。

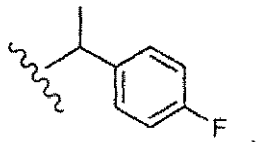
【０８９２】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

【０８９３】

【化１９９】

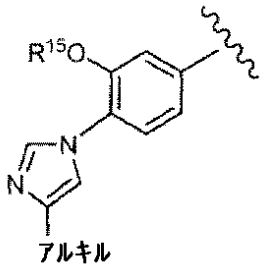


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０８９４】

【化２００】



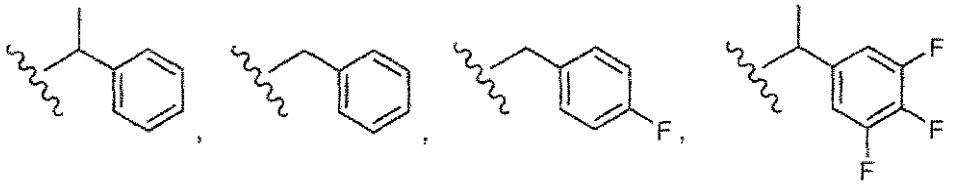
である。

【０８９５】

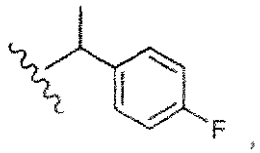
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

【０８９６】

【化２０１】



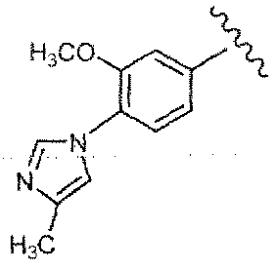
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０８９７】

【化２０２】



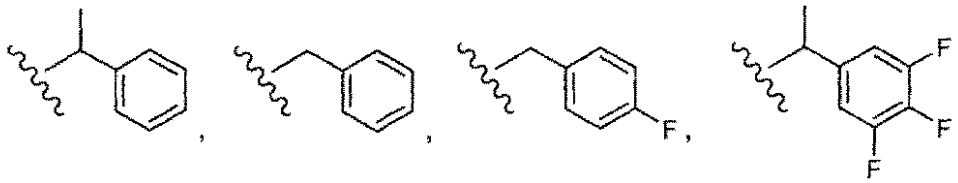
である。

【０８９８】

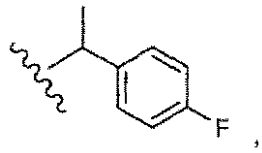
本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

【０８９９】

【化２０３】



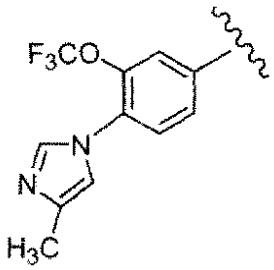
および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０９００】

【化２０４】



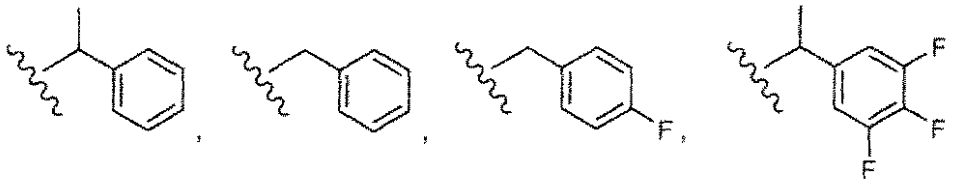
である。

【０９０１】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

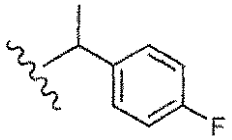
【０９０２】

【化２０５】



【０９０３】

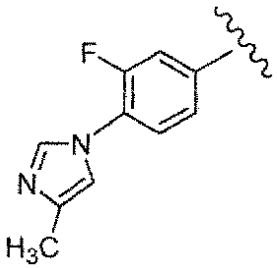
【化２０６】

および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０９０４】

【化２０７】



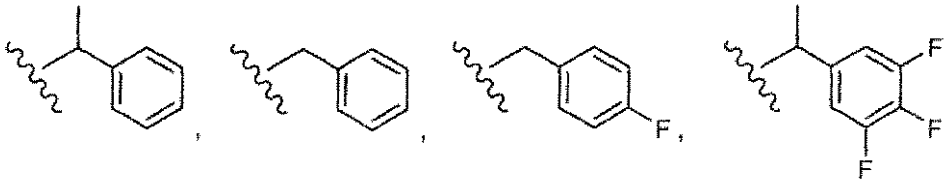
である。

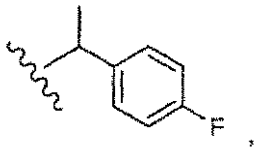
【０９０５】

本発明の別の実施形態では、式（Ｉ）の化合物は、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４からなる群から選択される化合物であり、Ｒ^{1}は、

【０９０６】

【化２０８】

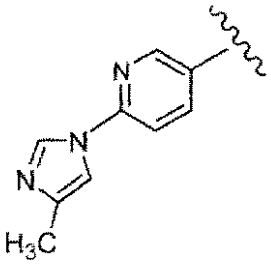


および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分は、

【０９０７】

【化２０９】



である。

【０９０８】

本発明の別の実施形態は、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９０９】

本発明の別の実施形態は、式４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１０】

本発明の別の実施形態は、式ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１１】

本発明の別の実施形態は、式４３Ａ～５４Ａの化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１２】

本発明の別の実施形態は、式４３～５４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１３】

本発明の別の実施形態は、式８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物からなる群から選択される、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１４】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が８５．１である、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１５】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が８８．１である、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１６】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が９１．１である、式（Ｉ）の化合物に関する。

【０９１７】

本発明の別の実施形態は、前記化合物が１００である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９１８】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０１である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９１９】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０２である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２０】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０３である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２１】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０４である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２２】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０５である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２３】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０６である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２４】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０７である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２５】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０８である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２６】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１０９である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２７】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１０である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２８】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１１である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９２９】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１２である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３０】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１３である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３１】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１４である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３２】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１５である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３３】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１６である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３４】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１７である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３５】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１８である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３６】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１１９である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３７】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１２０である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３８】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１２１である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９３９】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１２２である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４０】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１２３である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４１】
本発明の別の実施形態は、前記化合物が１２４である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４２】

本発明の別の実施形態は、前記化合物がＩＡである、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４３】
本発明の別の実施形態は、前記化合物がＩＡ．１である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４４】
本発明の別の実施形態は、前記化合物がＩＢである、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４５】
本発明の別の実施形態は、前記化合物がＩＢ．１である、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４６】
以下の実施形態では、Ａ、Ｂ、Ｃ、Ｄ、Ｅ、Ｆ、Ｇ、Ｈ群は、以下に定義されるとおりである。
【０９４７】
（１）Ａ群：ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物；
（２）Ｂ群：４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物；
（３）Ｃ群：ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ．１の化合物；
（４）Ｄ群：４３Ａ～５４Ａの化合物；
（５）Ｅ群：４３～５４の化合物；
（６）Ｆ群：８５．１、８８．１、９１．１、１００～１２４の化合物。
【０９４８】
本発明の別の実施形態は、式（Ｉ）の化合物に関する。
【０９４９】
本発明の別の実施形態は、式（Ｉ）の化合物の医薬的に許容される塩に関する。一例では、この塩は、Ａ群からなる群から選択される化合物の塩である。別の例では、この塩は、Ｂ群からなる群から選択される化合物の塩である。別の例では、この塩は、Ｃ群からなる群から選択される化合物の塩である。別の例では、この塩は、Ｄ群からなる群から選択される化合物の塩である。別の例では、この塩は、Ｅ群からなる群から選択される化合物の塩である。別の例では、この塩は、Ｆ群からなる群から選択される化合物の塩である。
【０９５０】
本発明の別の実施形態は、式（Ｉ）の化合物の医薬的に許容されるエステルに関する。一例では、このエステルは、Ａ群からなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では、このエステルは、Ｂ群からなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では、このエステルは、Ｃ群からなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では、このエステルは、Ｄ群からなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では、このエステルは、Ｅ群からなる群から選択される化合物のエステルである。別の例では、このエステルは、Ｆ群からなる群から選択される化合物のエステルである。
【０９５１】
本発明の別の実施形態は、式（Ｉ）の化合物の溶媒和物に関する。一例では、この溶媒和物は、Ａ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では、この溶媒和物は、Ｂ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では、この溶媒和物は、Ｃ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では、この溶媒和物は、Ｄ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では、この溶媒和物は、Ｅ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。別の例では、この溶媒和物は、Ｆ群からなる群から選択される化合物の溶媒和物である。
【０９５２】
本発明の別の実施形態は、単離された形態の式（Ｉ）の化合物に関する。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ａ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｄ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｅ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｆ群からなる群から選択される。
【０９５３】

本発明の別の実施形態は、純粋な形態の式（Ｉ）の化合物に関する。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ａ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｄ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｅ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｆ群からなる群から選択される。

【０９５４】

本発明の別の実施形態は、純粋で、単離された形態の式（Ｉ）の化合物に関する。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ａ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｄ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｅ群からなる群から選択される。一例では、式（Ｉ）の化合物は、Ｆ群からなる群から選択される。

【０９５５】

本発明の別の実施形態は、有効量の式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物、または医薬的に許容されるその塩、溶媒和物またはエステルと、１つ以上（例えば、１種類）の医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９５６】

別の実施形態は、有効量の式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９５７】

別の実施形態は、有効量の医薬的に許容される式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物の塩と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９５８】

別の実施形態は、有効量の医薬的に許容される式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物のエステルと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９５９】

別の実施形態は、有効量の式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物の溶媒和物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６０】

本発明の別の実施形態は、有効量の式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物と、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の他の医薬活性成分（例えば、薬物）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。他の医薬活性成分の例としては、限定されないが、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織（例えば、脳）の内部、その表面またはその周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択されるものが挙げられる。

【０９６１】

本発明の別の実施形態は、治療有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容されるその塩、溶媒和物またはエステルと、１つ以上（例えば、１種類）の医薬的に許容されるキャリアと、コリンエステラーゼ阻害剤、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤およびβ－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上の化合物とを含む医薬組成物に関する。

【０９６２】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６３】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤および／またはブチリルコリンエステラーゼ阻害剤）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６４】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物を含む医薬組成物に関する。

【０９６５】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のムスカリンアンタゴニスト（例えば、m_1アゴニストまたはm_2アンタゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６６】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量のエクセロン（リバスティグミン）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６７】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量のコグネックス（タクリン）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６８】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量のＴａｕキナーゼ阻害剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９６９】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＴａｕキナーゼ阻害剤（例えば、ＧＳＫ３β阻害剤、ｃｄｋ５阻害剤、ＥＲＫ阻害剤）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７０】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つの抗－Ａβワクチン接種（能動免疫化）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７１】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＡＰＰリガンドと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７２】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効な量の１つ以上のインスリン分解酵素および／またはネプリライシンをアップレギュレートする薬剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７３】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のコレステロール低下剤（例えば、スタチン、例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、コレステロール吸収阻害剤、例えば、エゼチミブ）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７４】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のフィブラート（例えば、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、クロフィブラートアルミニウム）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７５】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＬＸＲアゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７６】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＬＲＰ模倣物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７７】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７８】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のニコチン性受容体アゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９７９】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＨ３受容体アンタゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８０】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のヒストンデアセチラーゼ阻害剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８１】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のｈｓｐ９０阻害剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８２】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のｍ１ムスカリン受容体アゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８３】

本発明の別の実施形態は、医薬的に許容されるキャリアと、有効な（すなわち、治療的に有効な）量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物とを、コリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤、β－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される有効な（すなわち、治療的に有効な）量の１つ以上の化合物と組み合わせて含む組み合わせ物（すなわち、医薬組成物）に関する。

【０９８４】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストｍＧｌｕＲ１またはｍＧｌｕＲ５のポジティブアロステリックモジュレーターまたはアゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８５】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のｍＧｌｕＲ２／３アンタゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８６】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、神経炎症を減らすことが可能な有効量の１つ以上の抗炎症剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８７】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のプロスタグランジンＥＰ２受容体アンタゴニストと、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８８】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、有効量の１つ以上のＰＡＩ－１阻害剤と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９８９】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物と、Ａβ流出を誘導することが可能な有効量の１つ以上の薬剤（例えば、ゲルソリン）と、医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【０９９０】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ａ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９１】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｂ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９２】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｃ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９３】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｄ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９４】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｅ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９５】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｆ群からなる群から選択される医薬組成物に関する上記の任意の１つの実施形態に関する。

【０９９６】

式（Ｉ）の化合物は、γ－セクレターゼモジュレーターとして有用な場合があり、例えば、中枢神経系の障害（例えば、アルツハイマー病、ダウン症候群）、軽度認知障害、緑内障、脳アミロイド血管症、脳卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症、嗅覚機能の低下のような疾患を処置し、予防するのに有用な場合がある。

【０９９７】

本発明の別の実施形態は、治療有効量の式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、中枢神経系の障害を処置する方法に関する。

【０９９８】

本発明の別の実施形態は、治療有効量の式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物、または医薬的に許容されるその塩、溶媒和物、エステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアとを含む治療有効量の医薬組成物を、投与する工程を含む、中枢神経系の障害を処置する方法に関する。

【０９９９】

本発明の別の実施形態は、治療有効量の式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物、または医薬的に許容されるその塩、溶媒和物、エステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、コリンエステラーゼ阻害剤、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤、β－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される１つ以上の化合物の治療的に有効な量とを含む治療有効量の医薬組成物を投与する工程を含む、中枢神経系の障害を処置する方法に関する。

【１０００】

したがって、本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、γ－セクレターゼを調節する（阻害すること、アンタゴナイズすることなどを含む）方法に関する。

【１００１】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、γ－セクレターゼを調節する（阻害すること、アンタゴナイズすることなどを含む）方法に関する。

【１００２】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、１つ以上の神経変性疾患を処置する方法に関する。

【１００３】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、１つ以上の神経変性疾患を処置する方法に関する。

【１００４】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、神経組織（例えば、脳）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害する方法に関する。

【１００５】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、神経組織（例えば、脳）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害する方法に関する。

【１００６】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１００７】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１００８】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１００９】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、軽度認知障害、緑内障、脳アミロイド血管症、脳卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症または嗅覚機能の低下を処置する方法に関する。

【１０１０】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、軽度認知障害、緑内障、脳アミロイド血管症、脳卒中、認知症、小膠細胞症、脳の炎症または嗅覚機能の低下を処置する方法に関する。

【１０１１】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を

、処置が必要な患者に投与する工程を含む、軽度認知障害を処置する方法に関する。
【１０１２】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、緑内障を処置する方法に関する。
【１０１３】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、脳アミロイド血管症を処置する方法に関する。
【１０１４】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、脳卒中を処置する方法に関する。
【１０１５】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、認知症を処置する方法に関する。
【１０１６】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、小膠細胞症を処置する方法に関する。
【１０１７】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、脳の炎症を処置する方法に関する。
【１０１８】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、嗅覚機能の低下を処置する方法に関する。
【１０１９】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。
【１０２０】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。
【１０２１】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ａ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２２】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｂ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２３】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｃ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２４】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｄ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２５】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｅ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２６】
本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｆ群からなる群から選択される、処置法に関する上記の任意の実施形態に関する。
【１０２７】
さらに、本発明は、（１）γ－セクレターゼを調整する組み合わせ治療、または（２）１つ以上の神経変性疾患を処置する組み合わせ治療、または（３）神経組織（例えば、脳

）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害する組み合わせ治療、または（４）アルツハイマー病を処置する組み合わせ治療を提供する。この組み合わせ治療は、１つ以上（例えば、１種類）の式（Ｉ）の化合物の投与と、１つ以上（例えば、１種類）の他の医薬活性成分（例えば、薬物）の投与とを含む方法に関する。式（Ｉ）の化合物と、他の薬物とを別個に投与してもよく（すなわち、それぞれが別個の投与剤型を含む）、あるいは同じ投与剤型に、式（Ｉ）の化合物と他の薬物とを組み合わせて入れておいてもよい。

【１０２８】

したがって、本発明の他の実施形態は、有効量の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上の他の医薬活性成分（例えば、薬物）と組み合わせて使用する、本明細書に記載の処置方法、または阻害方法の任意の実施形態に関する。他の医薬活性成分（すなわち、薬物）は、ＢＡＣＥ阻害剤（β－セクレターゼ阻害剤）、ムスカリンアンタゴニスト（例えば、m_1アゴニストまたはm_2アンタゴニスト）、コリンエステラーゼ阻害剤（例えば、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤および／またはブチリルコリンエステラーゼ阻害剤）；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤；エクセロン（リバスティグミン）；コグネックス（タクリン）；Ｔａｕキナーゼ阻害剤（例えば、ＧＳＫ３β阻害剤、ｃｄｋ５阻害剤またはＥＲＫ阻害剤）；抗－Ａβワクチン；ＡＰＰリガンド；インスリンをアップレギュレートする薬剤、コレステロール低下剤（例えば、スタチン、例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン）；コレステロール吸収阻害剤（例えば、エゼチミブ）；フィブラート（例えば、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、クロフィブラートアルミニウムなど）；ＬＸＲアゴニスト；ＬＲＰ模倣物；ニコチン性受容体アゴニスト；Ｈ３受容体アンタゴニスト；ヒストンデアセチラーゼ阻害剤；ｈｓｐ９０阻害剤；ｍ１ムスカリン受容体アゴニスト；５－ＨＴ６受容体アンタゴニスト；ｍＧｌｕＲ１；ｍＧｌｕＲ５；ポジティブアロステリックモジュレーターまたはアゴニスト；ｍＧｌｕＲ２／３アンタゴニスト；神経の炎症を低減することが可能な抗炎症剤；プロスタグランジンＥＰ２受容体アンタゴニスト；ＰＡＩ－１阻害剤；ゲルソリンのようなＡβ流出を誘導することが可能な薬剤からなる群から選択される。

【１０２９】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物を、ＢＡＣＥ阻害剤（β－セクレターゼ阻害剤）、ムスカリンアンタゴニスト（例えば、m_1アゴニストまたはm_2アンタゴニスト）、コリンエステラーゼ阻害剤（例えば、アセチルコリンエステラーゼ阻害剤および／またはブチリルコリンエステラーゼ阻害剤）；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤、コレステロール吸収阻害剤（例えば、エゼチミブ）からなる群から選択される有効量の１つ以上の他の医薬活性成分と組み合わせて使用する、本明細書に記載の処置方法、または阻害方法の任意の実施形態に関する。

【１０３０】

本発明の別の実施形態は、処置の必要な患者に、有効量の（すなわち、治療有効量の）

１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３１】

本発明の別の実施形態は、処置の必要な患者に、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）コリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３２】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤、β－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の化合物と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３３】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３４】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量のエクセロン（リバスティグミン）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３５】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量のコグネックス（タクリン）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３６】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量のＴａｕキナーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３７】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＴａｕキナーゼ阻害剤（例えば、ＧＳＫ３β阻害剤、ｃｄｋ５阻害剤、ＥＲＫ阻害剤）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０３８】

さらに、本発明は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つの抗－Ａβワクチン接種（能動免疫化）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法を提供する。

【１０３９】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＡＰＰリガンドと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０４０】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効な量の１つ以上のインスリン分解酵素および／またはネプリライシンをアップレギュレートする薬剤と

組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４１】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のコレステロール低下剤（例えば、スタチン、例えば、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、コレステロール吸収阻害剤、例えば、エゼチミブ）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４２】
さらに、本発明は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のフィブラート（例えば、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、クロフィブラートアルミニウム）と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法を提供する。
【１０４３】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＬＸＲアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４４】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＬＲＰ模倣物と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４５】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４６】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のニコチン性受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４７】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＨ３受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０４８】
さらに、本発明は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のヒストンデアセチラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法を提供する。
【１０４９】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のｈｓｐ９０阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０５０】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のｍ１ムスカリン受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０５１】
本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストｍＧｌｕＲ１またはｍＧｌｕＲ５のポジティブアロステリックモジュレーターまたはアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。
【１０５２】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のｍＧｌｕＲ２／３アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０５３】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、神経炎症を減らすことが可能な有効量の１つ以上の抗炎症剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０５４】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のプロスタグランジンＥＰ２受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０５５】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、有効量の１つ以上のＰＡＩ－１阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０５６】

本発明の別の実施形態は、有効量の１つ以上の式（Ｉ）の化合物を、ゲルソリンなどのＡβ流出を誘導することが可能な有効量の１つ以上の薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法に関する。

【１０５７】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。

【１０５８】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。

【１０５９】

本発明の別の実施形態は、処置の必要な患者に、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。

【１０６０】

本発明の別の実施形態は、処置の必要な患者に、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つの式（Ｉ）の化合物を、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上（例えば、１種類）のコリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法に関する。

【１０６１】

本発明の別の実施形態は、有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の（例えば、１つの）式（Ｉ）の化合物を、コリンエステラーゼ阻害剤（例えば、（±）－２，３－ジヒドロ－５，６－ジメトキシ－２－［［１－（フェニルメチル）－４－ピペリジニル］メチル］－１Ｈ－インデン－１－オン塩酸塩（すなわち、塩酸ドネペジル、Ａｒｉｃｅｐｔ（登録商標）という商品名をもつ塩酸ドネペジルとして入手可能）など）、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤、β－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される有効量の（すなわち、治療有効量の）１つ以上の化合物と組み合わせて含む組み合わせ物（すな

わち、医薬組成物）に関する。さらに、この医薬組成物は、医薬的に許容されるキャリアを含む。

【１０６２】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＡ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６３】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＢ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６４】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＣ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６５】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＤ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６６】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＥ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６７】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物がＦ群からなる群から選択される、組み合わせ治療（すなわち、式（Ｉ）の化合物を他の医薬活性成分（すなわち、薬物）と組み合わせて用いる上記の処置方法）に関する上記の実施形態のうち任意のものに関する。

【１０６８】

本発明の別の実施形態は、単一の包装中の別々の容器（複数）に組み合わせて使用するための医薬組成物（複数）を含むキットであって、ここで、１つの容器には、医薬的に許容されるキャリアに有効量の式（Ｉ）の１つの化合物を加えたものが入っており、別の容器（すなわち、第２の容器）には、有効量の別の医薬活性成分（上記のような）が入っており、式（Ｉ）の化合物と、他の医薬活性成分とを合わせた量で、（ａ）アルツハイマーを処置するのに有効であるか、または（ｂ）神経組織（例えば、脳）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有効であるか、または（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有効であるか、または（ｄ）γ－セクレターゼ活性を調節するのに有用であるか、または（ｅ）軽度認知障害に有効であるか、または（ｆ）緑内障に有効であるか、または（ｇ）脳アミロイド血管症に有効であるか、または（ｈ）脳卒中に有効であるか、または（ｉ）認知症に有効であるか、または（ｊ）小膠細胞症に有効であるか、または（ｋ）脳の炎症に有効であるか、または（ｌ）嗅覚機能の低下に有効なキットに関する。

【１０６９】

本発明の別の形態は、単一の包装中の別々の容器（複数）に組み合わせて使用するための医薬組成物（複数）を含むキットであって、ここで、１つの容器には、医薬的に許容されるキャリアに有効量の式（Ｉ）の１つ以上（例えば、１種類）の化合物を加えたものが入っており、別の容器（すなわち、第２の容器）には、有効量の別の医薬活性成分（上記のような）が入っており、式（Ｉ）の化合物と、他の医薬活性成分とを合わせた量で、（ａ）アルツハイマーを処置するのに有効であるか、または（ｂ）神経組織（例えば、脳）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有効であるか、または（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有効であるか、または（ｄ）γ－セクレターゼ活性を調節するのに有効

なキットに関する。

【１０７０】

本発明の別の形態は、単一の包装中の別々の容器（複数）に組み合わせて使用するための医薬組成物（複数）を含むキットであって、ここで、１つの容器には、医薬的に許容されるキャリアに有効量の式（Ｉ）の１つの化合物を加えたものが入っており、別の容器（すなわち、第２の容器）には、有効量の別の医薬活性成分（上記のような）が入っており、式（Ｉ）の化合物と、他の医薬活性成分とを合わせた量で、（ａ）アルツハイマー病を処置するのに有効であるか、または（ｂ）神経組織（例えば、脳）の内部、神経組織の表面または神経組織の周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有効であるか、または（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有効であるか、または（ｄ）γ－セクレターゼ活性を調節するのに有効なキットに関する。

【１０７１】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ａ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７２】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｂ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７３】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｃ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７４】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｄ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７５】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｅ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７６】

本発明の他の実施形態は、式（Ｉ）の化合物が、Ｆ群からなる群から選択される、キットに関する上述の実施形態のうちの任意のものに関する。

【１０７７】

コリンエステラーゼ阻害剤の例は、タクリン、ドネペジル、リバスティグミン、ガランタミン（ｇａｌａｎｔａｍｉｎｅ）、ピリドスチグミン、ネオスチグミンであり、タクリン、ドネペジル、リバスティグミン、ガランタミンが好ましい。

【１０７８】

m_1アゴニストの例は、当該技術分野で知られている。m_2アンタゴニストの例も、当該技術分野で知られており、特に、m_2アンタゴニストは、米国特許第５，８８３，０９６号；第６，０３７，３５２号；第５，８８９，００６号；第６，０４３，２５５号；第５，９５２，３４９号；第５，９３５，９５８号；第６，０６６，６３６号；第５，９７７，１３８号；第６，２９４，５５４号；第６，０４３，２５５号；第６，４５８，８１２号；ＷＯ０３／０３１４１２に開示されており、これらの内容を、すべて本明細書に援用する。

【１０７９】

ＢＡＣＥ阻害剤の例としては、０６／０２／２００５に公開されたＵＳ２００５／０１１９２２７（０２／２４／２００５に公開されたＷＯ２００５／０１６８７６も参照）、０２／２４／２００５に公開されたＵＳ２００５／００４３２９０（０２／１７／２００５に公開されたＷＯ２００５／０１４５４０も参照）、０６／３０／２００５に公開されたＷＯ２００５／０５８３１１（０３／２９／２００７に公開されたＵＳ２００７／００７２８５２も参照）、０５／２５／２００６に公開されたＵＳ２００６／０１１１３７０（０６／２２／２００６に公開されたＷＯ２００６／０６５２７７も参照）、０２／２３／２００７に出願された米国特許出願番号第１１／７１０５８２号、０２／２３／２００

６に公開されたＵＳ２００６／００４０９９４（０２／０９／２００６に公開されたＷＯ２００６／０１４７６２も参照）、０２／０９／２００６に公開されたＷＯ２００６／０１４９４４（０２／２３／２００６に公開されたＵＳ２００６／００４０９４８も参照）、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８２６６（０１／１１／２００７に公開されたＵＳ２００７／００１０６６７も参照）、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８２６５、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８２３０、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８１９５（１２／１４／２００６に公開されたＵＳ２００６／０２８１７２９も参照）、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８２６４（０３／１５／２００７に公開されたＵＳ２００７／００６０５７５も参照）、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８１９２（１２／１４／２００６に公開されたＵＳ２００６／０２８１７３０も参照）、１２／２８／２００６に公開されたＷＯ２００６／１３８２１７（１２／２１／２００６に公開されたＵＳ２００６／０２８７２９４も参照）、０５／０３／２００に公開されたＵＳ２００７／００９９８９８（０５／０３／２００７に公開されたＷＯ２００７／０５０７２１も参照）、０５／１０／２００７に公開されたＷＯ２００７／０５３５０６（０５／０３／２００７に公開されたＵＳ２００７／０９９８７５も参照）、０６／０７／２００７に出願された米国特許出願番号第１１／７５９３３６号、１２／１２／２００６に出願された米国特許出願番号第６０／８７４３６２、１２／１２／２００６に出願された米国特許出願番号第６０／８７４４１９に記載されているものが挙げられる（これらの各開示内容は、本明細書に援用される）。

【１０８０】

本明細書中の式（Ｉ）および他の式の炭素は、すべての原子価の要求を満たしている場合に限り、１～３個のケイ素原子と置き換えてもよいことを注記しておく。

【１０８１】

上で使用される場合、および本開示内容全体で使用する場合、他の意味であると記載されていない限り、以下の用語は、以下に示す意味を有すると理解すべきである。

【１０８２】

「患者」は、ヒト、動物の両方を含む。

【１０８３】

「哺乳動物」は、ヒト、他の哺乳動物を意味する。

【１０８４】

「１つ以上の」は、少なくとも１つ存在することを意味し、２つ以上であってもよく、例えば、１つ、２つまたは３つ、または１つおよび２つ、または１つを含む。

【１０８５】

「少なくとも１つ」は、少なくとも１つ存在することを意味し、２つ以上であってもよく、例えば、１つ、２つまたは３つ、または１つおよび２つ、または１つを含む。

【１０８６】

「Ｂｎ」は、ベンジルを意味する。

【１０８７】

「ＣＡＮ」は、硝酸セリウムアンモニウムを意味する。

【１０８８】

「ＥＤＣＩ」は、（３－（ジメチルアミノ）プロピル）エチルカルボジイミド塩酸塩を意味する。

【１０８９】

「Ｅｔ」は、エチルを意味する。

【１０９０】

「ＨＯＢＴ」は、１－ヒドロキシベンゾトリアゾールを意味する。

【１０９１】

「ｉ－ｐｒ」は、イソプロピルを意味する。

【１０９２】

「Ｍｅ」は、メチルを意味する。

【１０９３】

「ＰＭＢ」は、ｐ－メトキシベンジルを意味する。

【１０９４】

「ＰＭＢＯ」は、ｐ－メトキシベンジルオキシを意味する。

【１０９５】

「Ｐｒ」は、プロピルを意味する。

【１０９６】

「ＰＴＳＡ」は、ｐ－トルエンスルホン酸を意味する。

【１０９７】

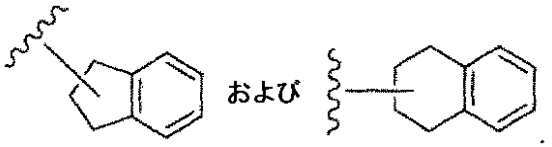
「ｔ－Ｂｕ」は、ｔｅｒｔ－ブチルを意味する。

【１０９８】

「縮合ベンゾシクロアルキル環」は、シクロアルキル環（シクロアルキルは、以下に定義されるとおりである）に縮合したフェニル環を意味し、例えば、

【１０９９】

【化２１０】



である。

【１１００】

「アルキル」は、鎖に約１～約２０個の炭素原子を有する、直鎖であるかまたは分枝鎖であってよい脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルキル基は、鎖に約１～約１２個の炭素原子を有する。さらに好ましいアルキル基は、鎖に約１～約６個の炭素原子を有する。分枝とは、１個以上の低級アルキル基（例えば、メチル、エチルまたはプロピル）が直鎖アルキル鎖に結合していることを意味する。「低級アルキル」は、鎖に約１～約６個の炭素原子を有する基を意味し、直鎖であっても分枝鎖であってもよい。「アルキル」は、置換されていなくてもよく、または１個以上の同じ置換基または異なる置換基で場合により置換されていてもよく、それぞれの置換基は、独立して、ハロ、アルキル、アリール、シクロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アミノ、オキシム（例えば、＝Ｎ－ＯＨ）、－ＮＨ（アルキル）、－ＮＨ（シクロアルキル）、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－アリール、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、カルボキシ、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキルからなる群から選択される。適切なアルキル基の非限定的な例としては、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｔ－ブチルが挙げられる。

【１１０１】

「アルケニル」は、鎖に約２～約１５個の炭素原子を有し、少なくとも１個の炭素－炭素二重結合を含み、直鎖であるかまたは分枝鎖であってよい脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルケニル基は、鎖に約２～約１２個の炭素原子を有し、さらに好ましくは鎖に約２～約６個の炭素原子を有する。分枝とは、１個以上の低級アルキル基（例えば、メチル、エチルまたはプロピル）が直鎖アルケニル鎖に結合していることを意味する。「低級アルケニル」は、鎖に約２～約６個の炭素原子を有する基を意味し、直鎖であっても分枝鎖であってもよい。「アルケニル」は、置換されていなくてもよく、または１個以上の同じ置換基または異なる置換基で場合により置換されていてもよく、それぞれの置換基は、独立して、ハロ、アルキル、アリール、シクロアルキル、シアノ、アルコキシ、－Ｓ（アルキル）からなる群から選択される。適切なアルケニル基の非限定的な例としては、エテニル、プロペニル、ｎ－ブテニル、３－メチルブタ－２－エニル、ｎ－ペンテニル、オクテニル、デセニルが挙げられる。

【１１０２】
「アルキレン」は、先に定義したアルキル基から水素原子を取り除くことによって得られる二官能基を意味する。アルキレンの非限定的な例としては、メチレン、エチレン、プロピレンが挙げられる。
【１１０３】
「アルキニル」は、鎖に約２～約１５個の炭素原子を有し、少なくとも１個の炭素－炭素三重結合を含み、直鎖であるかまたは分枝鎖であってよい脂肪族炭化水素基を意味する。好ましいアルキニル基は、鎖に約２～約１２個の炭素原子を有し、さらに好ましくは鎖に約２～約４個の炭素原子を有する。分枝とは、１個以上の低級アルキル基（例えば、メチル、エチルまたはプロピル）が直鎖アルキニル鎖に結合していることを意味する。「低級アルキニル」は、鎖に約２～約６個の炭素原子を有する基を意味し、直鎖であっても分枝鎖であってもよい。適切なアルキニル基の非限定的な例としては、エチニル、プロピニル、２－ブチニル、３－メチルブチニルが挙げられる。「アルキニル」は、置換されていなくてもよく、または１個以上の同じ置換基または異なる置換基で場合により置換されていてもよく、それぞれの置換基は、独立して、アルキル、アリール、シクロアルキルからなる群から選択される。
【１１０４】
「アリール」は、約６～約１４個の炭素原子、好ましくは、約６～約１０個の炭素原子を含む、芳香族の単環系または複数環系（ｍｕｌｔｉｃｙｃｌｉｃ　ｒｉｎｇ　ｓｙｓｔｅｍ）を意味する。アリール基は、場合により、１個以上の「環系置換基」で置換されていてもよく、この置換基は、同じであっても異なっていてもよく、本明細書で以下に定義されるとおりである。適切なアリール基の非限定的な例としては、フェニルおよびナフチルが挙げられる。
【１１０５】
「ヘテロアリール」は、約５～約１４個の環原子を有し、好ましくは、約５～約１０個の環原子を有し、１個以上の環原子が、炭素以外の元素（例えば、窒素、酸素、硫黄のうち、１種類またはこれらの組み合わせ）である、芳香族の単環または複数環系を意味する。好ましいヘテロアリールは、約５～約６個の環原子を有する。「ヘテロアリール」は、場合により、１個以上の「環系置換基」で置換されていてもよく、この置換基は、同じであっても異なっていてもよく、本明細書で定義されるとおりである。骨格の名前（ｒｏｏｔ　ｎａｍｅ）のヘテロアリールの前につく、アザ、オキサまたはチアという接頭語は、それぞれ、少なくとも窒素原子、酸素原子または硫黄原子が環原子として存在することを意味する。ヘテロアリールの窒素原子が、場合により、対応するＮ－オキシドに酸化されていてもよい。「ヘテロアリール」は、先に定義したようなアリールに縮合した先に定義したようなヘテロアリールも包含する。適切なヘテロアリールの非限定的な例としては、ピリジル、ピラジニル、フラニル、チエニル、ピリミジニル、ピリドン（Ｎ－置換ピリドンを含む）、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、フラザニル、ピロリル、ピラゾリル、トリアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、キノキサリニル、フタラジニル、オキシインドリル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］チアゾリル、ベンゾフラザニル、インドリル、アザインドリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、イミダゾリル、チエノピリジル、キナゾリニル、チエノピリミジル、ピロロピリジル、イミダゾピリジル、イソキノリニル、ベンゾアザインドリル、１，２，４－トリアジニル、ベンゾチアゾリルなどが挙げられる。用語「ヘテロアリール」は、部分的に飽和なヘテロアリール部分も指し、例えば、テトラヒドロイソキノリル、テトラヒドロキノリルなどがある。
【１１０６】
「アラルキル」または「アリールアルキル」は、アリール－アルキル基を意味し、アリールおよびアルキルは、すでに記載したとおりである。好ましいアラルキルは、低級アルキル基を含む。適切なアラルキル基の非限定的な例としては、ベンジル、２－フェネチル

、ナフタレニルメチルが挙げられる。親部分に対する結合は、アルキルを介している。

【１１０７】

「アルキルアリール」は、アルキル－アリール基を意味し、アリールおよびアルキルは、すでに記載したとおりである。好ましいアルキルアリールは、低級アルキル基を含む。適切なアルキルアリール基の非限定的な例は、トリルである。親部分に対する結合は、アリールを介している。

【１１０８】

「シクロアルキル」は、約３～約１０個の炭素原子、好ましくは、約５～約１０個の炭素原子を有する非芳香族の単環系または複数環系を意味する。好ましいシクロアルキル環は、約５～約７個の環原子を有する。シクロアルキルは、場合により、１個以上の「環系置換基」で置換されていてもよく、この置換基は、同じであっても異なっていてもよく、上記で定義されるとおりである。適切な単環シクロアルキルの非限定的な例としては、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルなどが挙げられる。適切な複数環シクロアルキルの非限定的な例としては、１－デカリニル、ノルボルニル、アダマンチルなどが挙げられる。

【１１０９】

「シクロアルキルアルキル」は、親の核にアルキル部分（先に定義した）を介して結合する、先に定義したようなシクロアルキル部分を意味する。適切なシクロアルキルアルキルの非限定的な例としては、シクロヘキシルメチル、アダマンチルメチルなどが挙げられる。

【１１１０】

「シクロアルケニル」は、約３～約１０個の炭素原子を有し、好ましくは、約５～約１０個の炭素原子を有し、少なくとも１個の炭素－炭素二重結合を有する、非芳香族の単環系または複数環系を指す。好ましいシクロアルケニル環は、約５～約７個の環原子を有する。シクロアルケニルは、場合により、１個以上の「環系置換基」で置換されていてもよく、この置換基は、同じであっても異なっていてもよく、上記で定義されるとおりである。適切な単環シクロアルケニルの非限定的な例としては、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプター１，３－ジエニルなどが挙げられる。適切な複数環シクロアルケニルの非限定的な例は、ノルボルニルエニルである。

【１１１１】

「シクロアルケニルアルキル」は、親の核にアルキル部分（先に定義した）を介して結合する、先に定義したようなシクロアルケニル部分を意味する。適切なシクロアルケニルアルキルの非限定的な例として、シクロペンテニルメチル、シクロヘキセニルメチルなどが挙げられる。

【１１１２】

「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を意味する。フッ素、塩素、臭素が好ましい。「ハロ」は、フルオロ、クロロ、ブロモまたはヨードを指す。

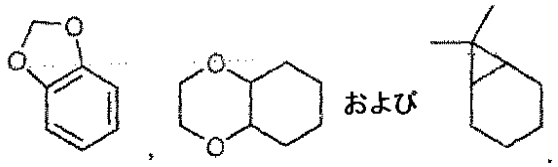
【１１１３】

「環系置換基」は、芳香族の環系または非芳香族の環系に結合する置換基を意味し、例えば、環系にある利用可能な水素を置換する。環系置換基は、同じであっても異なっていてもよく、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アルキルアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、アルキルヘテロアリール、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルコキシ、アシル、アロイル、ハロ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、アラルコキシカルボニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アルキルチオ、アリールチオ、ヘテロアリールチオ、アラルキルチオ、ヘテロアラルキルチオ、シクロアルキル、ヘテロシクリル、＝Ｏ、＝Ｎ－ＯＹ$_1$、－ＯＣ（Ｏ）－アルキル、－ＯＣ（Ｏ）－アリール、－ＯＣ（Ｏ）－シクロアルキル、－Ｃ（＝Ｎ－ＣＮ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝ＮＨ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝ＮＨ）－ＮＨ（アルキル）、オキシム（例えば、＝Ｎ

－ＯＨ）、$Ｙ_1Ｙ_2Ｎ$－、$Ｙ_1Ｙ_2Ｎ$－アルキル－、$Ｙ_1Ｙ_2ＮＣ$（Ｏ）－、$Ｙ_1Ｙ_2ＮＳＯ_2$－、－$ＳＯ_2ＮＹ_1Ｙ_2$からなる群から選択され、ここで、$Ｙ_1$および$Ｙ_2$は、同じであっても異なっていてもよく、独立して、水素、アルキル、アリール、シクロアルキルおよびアラルキルからなる群から選択される。「環系置換基」は、環系の２個の隣接する炭素原子にある２個の利用可能な水素（それぞれの炭素上の水素１個ずつ）を同時に置換する１個の部分を意味していてもよい。このような部分の例は、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、－$Ｃ（ＣＨ_3）_2$－などであり、例えば、

【１１１４】

【化２１１】



のような部分を形成する。

【１１１５】

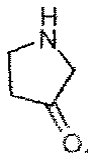
「ヘテロアリールアルキル」は、親の核にアルキル部分（先に定義した）を介して結合する、先に定義したようなヘテロアリール部分を意味する。適切なヘテロアリールの非限定的な例としては、２－ピリジニルメチル、キノリニルメチルなどが挙げられる。

【１１１６】

「ヘテロシクリル」または「ヘテロシクロアルキル」は、約３～約１０個の環原子、好ましくは、約５～約１０個の環原子を含み、環系内の１つ以上の原子は、炭素以外の元素（例えば、窒素、酸素または硫黄）を単独または組み合わせた状態で含む、芳香族ではない飽和の単環系または複数環系を意味する。環系に隣り合う酸素原子および／または硫黄原子は存在しない。好ましいヘテロシクリルは、約５～約６個の環原子を含有する。骨格の名前のヘテロシクリルの前につく、アザ、オキサまたはチアという接頭語は、それぞれ、少なくとも窒素原子、酸素原子または硫黄原子が環原子として存在することを意味する。ヘテロシクリル環に含まれるいずれの－ＮＨも、保護された基（例えば、－Ｎ（Ｂｏｃ）、－Ｎ（ＣＢｚ）、－Ｎ（Ｔｏｓ）など）として存在してもよく、このような保護も、本発明の一部であるとみなす。ヘテロシクリルは、場合により、１個以上の「環系置換基」で置換されていてもよく、この置換基は、同じであっても異なっていてもよく、本明細書で定義されるとおりである。ヘテロシクリルの窒素原子または硫黄原子は、場合により、対応するＮ－オキシド、Ｓ－オキシドまたはＳ，Ｓ－ジオキシドへと酸化されていてもよい。適切な単環のヘテロシクリル環の非限定的な例としては、ピペリジル、ピロリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、チアゾリジニル、１，４－ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフェニル、ラクタム、ラクトンなどが挙げられる。「ヘテロシクリル」は、＝Ｏが、環系の同じ炭素原子上にある２個の水素原子を置換する環も含む（すなわち、ヘテロシクリルは、環にカルボニルを有する環を含む）。このような部分の例は、ピロリドンである。

【１１１７】

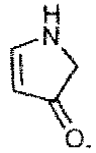
【化２１２】



「ヘテロシクリルアルキル」または（または「ヘテロシクロアルキルアルキル」）は、親の核に対し、アルキル部分（先に定義した）を介して結合する、先に定義したヘテロシクリル部分を意味する。適切なヘテロシクリルアルキルの非限定的な例としては、ピペリジニルメチル、ピペラジニルメチルなどが挙げられる。

【１１１８】
「ヘテロシクレニル」（または「ヘテロシクロアルケニル」）は、約３～約１０個の環原子、好ましくは、約５～約１０個の環原子を含み、環系に含まれる１つ以上の原子は、炭素以外の元素（例えば、窒素原子、酸素原子または硫黄原子）を単独または組み合わせた状態で含み、少なくとも１個の炭素－炭素二重結合または炭素－窒素二重結合を含む、芳香族ではない単環系または複数環系を意味する。環系に隣り合う酸素原子および／または硫黄原子は存在しない。好ましいヘテロシクレニル環は、約５～約６個の環原子を含有する。骨格の名前のヘテロシクレニルの前につく、アザ、オキサまたはチアという接頭語は、それぞれ、少なくとも窒素原子、酸素原子または硫黄原子が環原子として存在することを意味する。ヘテロシクレニルは、場合により、１個以上の環系置換基で置換されていてもよく、「環系置換基」は、先に定義したとおりである。ヘテロシクレニルの窒素原子または硫黄原子は、場合により、対応するＮ－オキシド、Ｓ－オキシドまたはＳ，Ｓ－ジオキシドへと酸化されていてもよい。適切なヘテロシクレニル基の非限定的な例としては、１，２，３，４－テトラヒドロピリジニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，４－ジヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジニル、２－ピロリニル、３－ピロリニル、２－イミダゾリニル、２－ピラゾリニル、ジヒドロイミダゾリル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロオキサジアゾリル、ジヒドロチアゾリル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラニル、ジヒドロフラニル、フルオロジヒドロフラニル、７－オキサビシクロ［２．２．１］ヘプテニル、ジヒドロチオフェニル、ジヒドロチオピラニルなどが挙げられる。「ヘテロシクレニル」は、＝Ｏで、環系の同じ炭素原子上にある２個の利用可能な水素原子を置換する環も含む（すなわち、ヘテロシクリルは、環にカルボニルを有する環を含む）。このような部分の例は、ピロリジノンである。

【１１１９】
【化２１３】



「ヘテロシクレニルアルキル」（または「ヘテロシクロアルケニルアルキル」）は、先に定義したヘテロシクレニル部分が、親の核に対し、アルキル部分（先に定義した）を介して結合したものを意味する。

【１１２０】
本発明のヘテロ原子を含有する環系において、Ｎ、ＯまたはＳに隣接する炭素原子にはヒドロキシル基が存在しないこと、別のヘテロ原子に隣接する炭素上にＮ基またはＳ基が存在しないことを注記しておく。したがって、例えば、環

【１１２１】
【化２１４】

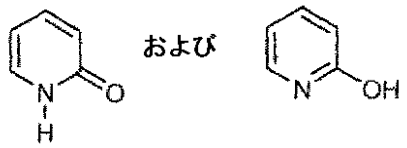


において、２および５と記載された炭素に直接結合する－ＯＨは存在しない。

【１１２２】
互変異性体形態、例えば、以下の部分

【１１２３】

【化２１５】



が、本発明の特定の実施形態では等価であると考えられることも注記しておくべきである。

【１１２４】

「アルキニルアルキル」は、アルキニル－アルキル基を意味し、アルキニルおよびアルキルは、すでに記載したとおりである。好ましいアルキニルアルキルは、低級アルキニル基と、低級アルキル基とを含有する。親部分に対する結合は、アルキルを介している。適切なアルキニルアルキル基の非限定的な例としては、プロパルギルメチルが挙げられる。

【１１２５】

「ヘテロアラルキル」は、ヘテロアリール－アルキル基を意味し、ヘテロアリールおよびアルキルは、すでに記載したとおりである。好ましいヘテロアラルキルは、低級アルキル基を含む。適切なアラルキル基の非限定的な例としては、ピリジルメチル、キノリン－３－イルメチルが挙げられる。親部分に対する結合は、アルキルを介している。

【１１２６】

「ヒドロキシアルキル」は、ＨＯ－アルキル基を意味し、アルキルは、すでに記載したとおりである。好ましいヒドロキシアルキルは、低級アルキルを含む。適切なヒドロキシアルキル基の非限定的な例としては、ヒドロキシメチル、２－ヒドロキシエチルが挙げられる。

【１１２７】

「アシル」は、Ｈ－Ｃ（Ｏ）－基、アルキル－Ｃ（Ｏ）－基またはシクロアルキル－Ｃ（Ｏ）－基を意味し、これらの種々の基は、すでに記載したとおりである。親部分に対する結合は、カルボニルを介している。好ましいアシルは、低級アルキルを含む。適切なアシル基の非限定的な例としては、ホルミル、アセチル、プロパノイルが挙げられる。

【１１２８】

「アロイル」は、アリール－Ｃ（Ｏ）－基を意味し、そのアリール基は、すでに記載したとおりである。親部分に対する結合は、カルボニルを介している。適切な基の非限定的な例としては、ベンゾイル、１－ナフトイルが挙げられる。

【１１２９】

「アルコキシ」は、アルキル－Ｏ－基を意味し、そのアルキル基は、すでに記載したとおりである。適切なアルコキシ基の非限定的な例としては、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソプロポキシ、ｎ－ブトキシが挙げられる。親部分に対する結合は、エーテル酸素を介している。

【１１３０】

「アリールオキシ」は、アリール－Ｏ－基を意味し、そのアリール基は、すでに記載したとおりである。適切なアリールオキシ基の非限定的な例としては、フェノキシおよびナフトキシが挙げられる。親部分に対する結合は、エーテル酸素を介している。

【１１３１】

「アラルキルオキシ」は、アラルキル－Ｏ－基を意味し、そのアラルキル基は、すでに記載したとおりである。適切なアラルキルオキシ基の非限定的な例としては、ベンジルオキシ、１－ナフタレンメトキシ、２－ナフタレンメトキシが挙げられる。親部分に対する結合は、エーテル酸素を介している。

【１１３２】

「アルキルチオ」は、アルキル－Ｓ－基を意味し、そのアルキル基は、すでに記載したとおりである。適切なアルキルチオ基の非限定的な例としては、メチルチオ、エチルチオが挙げられる。親部分に対する結合は、硫黄を介している。

【１１３３】
「アリールチオ」は、アリール－Ｓ－基を意味し、そのアリール基は、すでに記載したとおりである。適切なアリールチオ基の非限定的な例としては、フェニルチオ、ナフチルチオが挙げられる。親部分に対する結合は、硫黄を介している。
【１１３４】
「アラルキルチオ」は、アラルキル－Ｓ－基を意味し、そのアラルキル基は、すでに記載したとおりである。適切なアラルキルチオ基の非限定的な例は、ベンジルチオである。親部分に対する結合は、硫黄を介している。
【１１３５】
「アルコキシカルボニル」は、アルキル－Ｏ－ＣＯ－基を意味する。適切なアルコキシカルボニル基の非限定的な例としては、メトキシカルボニル、エトキシカルボニルが挙げられる。親部分に対する結合は、カルボニルを介している。
【１１３６】
「アリールオキシカルボニル」は、アリール－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－基を意味する。適切なアリールオキシカルボニル基の非限定的な例としては、フェノキシカルボニル、ナフトキシカルボニルが挙げられる。親部分に対する結合は、カルボニルを介している。
【１１３７】
「アラルコキシカルボニル」は、アラルキル－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－基を意味する。適切なアラルコキシカルボニル基の非限定的な例は、ベンジルオキシカルボニルである。親部分に対する結合は、カルボニルを介している。
【１１３８】
「アルキルスルホニル」は、アルキル－Ｓ（$Ｏ_2$）－基を意味する。そのアルキル基が低級アルキルであるものが、好ましい基である。親部分に対する結合は、スルホニルを介している。
【１１３９】
「アリールスルホニル」は、アリール－Ｓ（$Ｏ_2$）－基を意味する。親部分に対する結合は、スルホニルを介している。
【１１４０】
用語「置換された」は、所定の原子上にある１個以上の水素が、示した基から選ばれる基で置換されていることを意味する。ただし、この所定の原子が存在する環境下でこの原子の通常の原子価を超えず、この置換によって安定な化合物を生ずる場合に限る。置換基および／または変数の組み合わせは、その組み合わせによって安定な化合物を生じる場合のみが可能である。「安定な化合物」または「安定な構造」とは、反応混合物から有用な純度で単離することができるほど丈夫であり、有効な治療薬剤に調合することができるほど丈夫な化合物を意味する。
【１１４１】
用語「場合により置換された」は、特定の基（ｇｒｏｕｐ）、基（ｒａｄｉｃａｌ）または部分での任意選択の置換を意味する。
【１１４２】
用語「精製された」、「精製された形態で」または「単離され、精製された形態で」は、ある化合物について、合成プロセスから（例えば、反応混合物から）単離した後の、または天然の供給源またはこれらの組み合わせから単離した後の化合物の物理的状態を指す。したがって、用語「精製された」、「精製された形態で」または「単離され、精製された形態で」は、ある化合物について、本明細書に記載した１つ以上の精製プロセスまたは当業者がよく知っている１つ以上の精製プロセス（例えば、クロマトグラフィー、再結晶など）から、本明細書に記載したかまたは当業者がよく知っている標準的分析技法で特性決定するのに十分な純度で得られた化合物の物理的状態を指す。
【１１４３】
本明細書の本文、スキーム、実施例および表に、原子価を満足しない状態で書かれた任意の炭素原子およびヘテロ原子には、原子価を満足するのに十分な数の水素原子（複数可

）が結合していると想定されることも注記しておくべきである。

【１１４４】

ある化合物中の官能基について、「保護された」という用語が用いられている場合、この化合物が反応を受ける際に、この基が、保護された部位で望ましくない副反応が起こらないような改変された形態であることを意味する。適切な保護基は、当業者には認識されており、例えば、Ｔ，Ｗ，Ｇｒｅｅｎｅら、Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ（１９９１）、Ｗｉｌｅｙ、Ｎｅｗ Ｙｏｒｋなどの標準的な教科書を参照することによっても認識される。

【１１４５】

任意の選択肢（例えば、アリール、ヘテロ環、R^2など）が、任意の構成要素中または式Ｉ中に２箇所以上存在する場合、それぞれの存在箇所（ｏｃｃｕｒｅｎｃｅ）の定義は、他のあらゆる存在箇所の定義とは独立したものである。

【１１４６】

本明細書で使用する場合、用語「組成物」は、特定の成分を特定の量で含む生成物、および特定の成分を特定の量で組み合わせたものから直接的または間接的に得られる任意の生成物を包含することを意図している。

【１１４７】

本明細書では、本発明の化合物のプロドラッグおよび溶媒和物も想定されている。プロドラッグの論考は、Ｔ．ＨｉｇｕｃｈｉおよびＶ．Ｓｔｅｌｌａ、Ｐｒｏ－ｄｒｕｇｓ ａｓ Ｎｏｖｅｌ Ｄｅｌｉｖｅｒｙ Ｓｙｓｔｅｍｓ（１９８７）、ｔｈｅ Ａ．Ｃ．Ｓ．Ｓｙｍｐｏｓｉｕｍ Ｓｅｒｉｅｓの第１４巻、およびＢｉｏｒｅｖｅｒｓｉｂｌｅ Ｃａｒｒｉｅｒｓ ｉｎ Ｄｒｕｇ Ｄｅｓｉｇｎ、（１９８７）Ｅｄｗａｒｄ Ｂ．Ｒｏｃｈｅ編集、Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ａｓｓｏｃｉａｔｉｏｎ ａｎｄ Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓに記載されている。用語「プロドラッグ」は、ｉｎ ｖｉｖｏで変換され、式（Ｉ）の化合物、またはこの化合物の医薬的に許容される塩、水和物または溶媒和物を生じる化合物（例えば、薬物前駆体）を意味する。この変換は、種々の機構（例えば、代謝プロセスまたは化学プロセス）によって進行してもよく、例えば、血液中での加水分解などによって進行してもよい。プロドラッグの使用についての論考は、Ｔ．ＨｉｇｕｃｈｉおよびＶ．Ｓｔｅｌｌａ、「Ｐｒｏ－ｄｒｕｇｓ ａｓ Ｎｏｖｅｌ Ｄｅｌｉｖｅｒｙ Ｓｙｓｔｅｍｓ」ｔｈｅ Ａ．Ｃ．Ｓ．Ｓｙｍｐｏｓｉｕｍ Ｓｅｒｉｅｓの第１４巻、およびＢｉｏｒｅｖｅｒｓｉｂｌｅ Ｃａｒｒｉｅｒｓ ｉｎ Ｄｒｕｇ Ｄｅｓｉｇｎ、Ｅｄｗａｒｄ Ｂ．Ｒｏｃｈｅ編集、Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ａｓｓｏｃｉａｔｉｏｎ ａｎｄ Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ、１９８７に記載されている。

【１１４８】

例えば、式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容されるその化合物の塩、水和物または溶媒和物が、カルボン酸官能基を含有する場合、プロドラッグは、このカルボン酸基の水素原子を、例えば、（C_1～C_8）アルキル、（C_2～C_{12}）アルカノイルオキシメチル、４～９個の炭素原子を有する１－（アルカノイルオキシ）エチル、５～１０個の炭素原子を有する１－メチル－１－（アルカノイルオキシ）－エチル、３～６個の炭素原子を有するアルコキシカルボニルオキシメチル、４～７個の炭素原子を有する１－（アルコキシカルボニルオキシ）エチル、５～８個の炭素原子を有する１－メチル－１－（アルコキシカルボニルオキシ）エチル、３～９個の炭素原子を有するＮ－（アルコキシカルボニル）アミノメチル、４～１０個の炭素原子を有する１－（Ｎ－（アルコキシカルボニル）アミノ）エチル、３－フタリジル、４－クロトノラクトニル、γ－ブチロラクトン－４－イル、ジ－Ｎ，Ｎ－（C_1～C_2）アルキルアミノ（C_2～C_3）アルキル（例えば、β－ジメチルアミノエチル）、カルバモイル－（C_1～C_2）アルキル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_2）アルキルカルバモイル－（C_1～C_2）アルキルおよびピペリジノ（C_2～C_3）アルキル、ピロリジノ（C_2～C_3）アルキルまたはモルホリノ（C_2～C_3）アルキルなどの基で置き換えることによって生成するエステルを含んでいてもよい。

【１１４９】
同様に、式（Ｉ）の化合物がアルコール官能基を含有する場合、プロドラッグは、このアルコール基の水素原子を、例えば、（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルカノイルオキシメチル、１－（（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルカノイルオキシ）エチル、１－メチル－１－（（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルカノイルオキシ）エチル、（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルコキシカルボニルオキシメチル、Ｎ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルコキシカルボニルアミノメチル、スクシノイル、（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルカノイル、α－アミノ（Ｃ$_1$～Ｃ$_4$）アルカニル、アリールアシルおよびα－アミノアシル、またはα－アミノアシル－α－アミノアシルなどの基で置き換えることによって生成するものであってもよく、ここで、それぞれのα－アミノアシル基は、独立して、天然に存在するＬ－アミノ酸、Ｐ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｏ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル）$_2$またはグリコシル（炭水化物のヘミアセタール形態のヒドロキシル基を除去して得られる基）などから選択される。

【１１５０】
式（Ｉ）の化合物に、アミン官能基が組み込まれている場合、プロドラッグは、このアミン基の水素原子を、例えば、Ｒ－カルボニル、ＲＯ－カルボニル、ＮＲＲ’－カルボニルなどの基で置き換えることによって生成するものであってもよく、ここで、ＲおよびＲ’は、それぞれ独立して、（Ｃ$_1$～Ｃ$_{10}$）アルキル、（Ｃ$_3$～Ｃ$_7$）シクロアルキル、ベンジルであるか、またはＲ－カルボニルは、天然のα－アミノアシルまたは天然のα－アミノアシル、－Ｃ（ＯＨ）Ｃ（Ｏ）ＯＹ^{1}であり、Ｙ^{1}は、Ｈ、（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルまたはベンジル、－Ｃ（ＯＹ^2）Ｙ^{3}であり、Ｙ^{2}は、（Ｃ$_1$～Ｃ$_4$）アルキルであり、Ｙ^{3}は、（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、カルボキシ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、アミノ（Ｃ$_1$～Ｃ$_4$）アルキルまたはモノ－Ｎ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルアミノアルキルまたはジ－Ｎ，Ｎ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルアミノアルキル、－Ｃ（Ｙ^4）Ｙ^{5}であり、Ｙ^{4}は、Ｈまたはメチルであり、Ｙ^{5}は、モノ－Ｎ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルアミノモルホリノまたはジ－Ｎ，Ｎ－（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルアミノモルホリノ、ピペリジン－１－イルまたはピロリジン－１－イルなどである。

【１１５１】
本発明の１つ以上の化合物は、溶媒和物ではない状態で存在してもよいし、医薬的に許容される溶媒（例えば、水、エタノールなど）を用いて形成される溶媒和物の状態で存在してもよく、本発明は、溶媒和物ではない形態および溶媒和物の形態の両方を包含することを意図している。「溶媒和物」は、本発明の化合物と、１つ以上の溶媒分子との物理的な会合を意味する。この物理的な会合には、種々の程度のイオン結合および共有結合（水素結合を含む）が含まれる。特定の場合、例えば、１つ以上の溶媒分子が、結晶性固体の結晶格子に組み込まれている場合、溶媒和物を単離することが可能である。「溶媒和物」は、溶液状態と、単離可能な溶媒和物の両方を包含する。適切な溶媒和物の非限定的な例としては、エタノレート、メタノレートなどが挙げられる。「水和物」は、溶媒分子がH_2Oである溶媒和物である。

【１１５２】
本発明の１つ以上の化合物は、場合により、溶媒和物に変換されてもよい。溶媒和物の調製は、一般的に知られている。したがって、例えば、Ｍ．Ｃａｉｒａら、Ｊ．Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　Ｓｃｉ，９３（３）、６０１－６１１（２００４）には、抗真菌薬フルコナゾールの酢酸エチル中での溶媒和物および水からの溶媒和物の調製法が記載されている。溶媒和物、ヘミ溶媒和物、水和物などの同様の調製法は、Ｅ．Ｃ．ｖａｎ　Ｔｏｎｄｅｒら、ＡＡＰＳ　ＰｈａｒｍＳｃｉＴｅｃｈ．、５（１）、ａｒｔｉｃｌｅ　１２（２００４）、およびＡ．Ｌ．Ｂｉｎｇｈａｍら、Ｃｈｅｍ，Ｃｏｍｍｕｎ．、６０３－６０４（２００１）に記載されている。典型的で、非限定的なプロセスは、周囲温度よりも高い温度で、所望の溶媒（有機溶媒または水、またはこれらの混合物）の所望の量に本発明の化合物を溶解し、この溶液を、結晶を形成するのに十分な速度で冷却し、次に結晶を標準的な方法で単離する工程を含む。例えば、ＩＲ分光法のような分析方法によって、結晶中に溶媒和物（または水和物）として溶媒（または水）が存在することが示される

。

【１１５３】

「有効量」または「治療的に有効な量」は、上述の疾患を阻害するのに有効であり、従って、所望の治療効果、改善効果、阻害効果または予防効果を発揮する、本発明の化合物または組成物の量を記載することを意味する。

【１１５４】

式（Ｉ）の化合物は、塩を形成してもよく、このような塩もまた、本発明の範囲内である。本明細書で式（Ｉ）の化合物と記載する場合、他の意味であると記載されていない限り、その化合物の塩も指すことが理解される。用語「塩」は、本明細書で用いる場合、無機酸および／または有機酸を用いて形成される酸性塩、および無機塩基および／または有機塩基を用いて形成される塩基性塩を示す。さらに、式Ｉの化合物が、塩基性部分（例えば、限定されないが、ピリジンまたはイミダゾール）と、酸性部分（例えば、限定されないが、カルボン酸）の両方を含む場合、双性イオン（「分子内塩」）が形成され得、この双性イオンも、本明細書で使用する場合、用語「塩」に含まれる。医薬的に許容される（すなわち、毒性がない、生理学的に許容される）塩が好ましいが、他の塩も有用である。式（Ｉ）の化合物と、所定量（例えば、等量）の酸または塩基とを、塩が析出するような媒質で反応させるか、または水性媒質中で反応させた後に凍結乾燥させることによって、式（Ｉ）の化合物の塩を合成してもよい。

【１１５５】

例示的な酸付加塩としては、酢酸塩、アスコルビン酸塩、安息香酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、重硫酸塩、ホウ酸塩、酪酸塩、クエン酸塩、ショウノウ酸塩、ショウノウスルホン酸塩、フマル酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、メタンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、硝酸塩、シュウ酸塩、リン酸塩、プロピオン酸塩、サリチル酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、チオシアン酸塩、トルエンスルホン酸塩（トシレートとしても知られる）などが挙げられる。さらに、塩基性の医薬化合物から医薬的に有用な塩を得るのに適していると一般的に考えられる酸は、例えば、Ｐ．Ｓｔａｈｌら、Ｃａｍｉｌｌｅ Ｇ．（編集）Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓａｌｔｓ．Ｐｒｏｐｅｒｔｉｅｓ，Ｓｅｌｅｃｔｉｏｎ ａｎｄ Ｕｓｅ．（２００２）Ｚｕｒｉｃｈ：Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ；Ｓ．Ｂｅｒｇｅら、Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ（１９７７）６６（１）１－１９；Ｐ．Ｇｏｕｌｄ、Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ Ｊ．ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃｓ（１９８６）３３：２０１－２１７；Ａｎｄｅｒｓｏｎら、Ｔｈｅ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ（１９９６）、Ａｃａｄｅｍｉｃ Ｐｒｅｓｓ、Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ；およびＴｈｅ Ｏｒａｎｇｅ Ｂｏｏｋ（Ｆｏｏｄ ＆ Ｄｒｕｇ Ａｄｍｉｎｉｓｔｒａｔｉｏｎ、Ｗａｓｈｉｎｇｔｏｎ、Ｄ．Ｃ．のウエブサイト上）に記載されている。これらの開示内容を、参照によって本明細書に援用する。

【１１５６】

例示的な塩基性塩としては、アンモニウム塩、アルカリ金属塩（例えば、ナトリウム塩、リチウム塩およびカリウム塩）、アルカリ土類金属塩（例えば、カルシウム塩およびマグネシウム塩）、有機塩基（例えば、有機アミン）との塩（例えば、ジシクロヘキシルアミン、ｔ－ブチルアミン）、アミノ酸（例えば、アルギニン、リジン）との塩などが挙げられる。塩基性窒素を含有する基は、低級ハロゲン化アルキル（例えば、メチル、エチルおよびブチルの塩化物、臭化物およびヨウ化物）、硫酸ジアルキル（例えば、硫酸ジメチル、硫酸ジエチルおよび硫酸ジブチル）、長鎖ハロゲン化物（例えば、デシル、ラウリルおよびステアリルの塩化物、臭化物およびヨウ化物）、ハロゲン化アラルキル（例えば、臭化ベンジルおよび臭化フェネチル）などのような薬剤で四級化されていてもよい。

【１１５７】

このような酸性塩および塩基性塩はすべて、本発明の範囲内にある医薬的に許容される塩であることを意図し、あらゆる酸性塩および塩基性塩は、本発明の目的について、対応

する化合物の遊離形態と等価であるとみなす。

【１１５８】

本発明の化合物の医薬的に許容されるエステルとしては、以下の基が挙げられる：（１）ヒドロキシ基のエステル化によって得られるカルボン酸エステル、ここで、このエステル基のカルボン酸部分のカルボニルではない部分は、直鎖アルキルまたは分枝鎖アルキル（例えば、アセチル、ｎ－プロピル、ｔ－ブチルまたはｎ－ブチル）、アルコキシアルキル（例えば、メトキシメチル）、アラルキル（例えば、ベンジル）、アリールオキシアルキル（例えば、フェノキシメチル）、アリール（例えば、ハロゲン、$C_{1\sim4}$アルキルまたは$C_{1\sim4}$アルコキシまたはアミノで場合により置換されたフェニル）から選択される；（２）スルホン酸エステル、例えば、アルキルスルホニルまたはアラルキルスルホニル（例えば、メタンスルホニル）；（３）アミノ酸エステル（例えば、Ｌ－バリルまたはＬ－イソロイシル）；（４）ホスホン酸エステルおよび（５）一リン酸エステル、二リン酸エステルまたは三リン酸エステル。リン酸エステルは、例えば、$C_{1\sim20}$アルコールまたはその反応性誘導体によってさらにエステル化されていてもよく、または、２，３－ジ（$C_{6\sim24}$）アシルグリセロールによってさらにエステル化されていてもよい。

【１１５９】

式（Ｉ）の化合物、およびその塩、溶媒和物、エステル、プロドラッグは、互変異性体形態として存在してもよい（例えば、アミド、エノール、ケトエーテルまたはイミノエーテルとして）。このようなすべての互変異性体形態が、本発明の一部分であることを意図する。

【１１６０】

式（Ｉ）の化合物は、不斉中心またはキラル中心を含有していてもよく、したがって、異なる立体異性体形態で存在してもよい。式（Ｉ）の化合物のあらゆる立体異性体形態、およびこれらの混合物（ラセミ混合物を含む）は、本発明の一部分を形成することを意図する。さらに、本発明は、あらゆる幾何異性体および位置異性体を包含する。例えば、式（Ｉ）の化合物に、二重結合または縮合環が組み込まれている場合、ｃｉｓ形態およびｔｒａｎｓ形態、およびこれらの混合物も、本発明の範囲に含まれる。

【１１６１】

ジアステレオマー混合物は、当業者がよく知っている方法（例えば、クロマトグラフィーおよび／または分別晶出）によるなど、物理化学的な差に基づいて個々のジアステレオマーに分割することができる。エナンチオマーは、エナンチオマー混合物を適切な光学活性化合物（例えば、キラルアルコールまたはＭｏｓｈｅｒ酸塩化物のようなキラル補助剤）と反応させることによってジアステレオマー混合物に変換し、このジアステレオマーを分割し、個々のジアステレオマーを対応する純粋なエナンチオマーに変換する（例えば、加水分解による）ことによって分割することができる。さらに、式（Ｉ）の化合物のいくつかは、アトロプ異性体であってもよく（例えば、置換ビアリール）、これも本発明の一部であるとみなす。エナンチオマーは、キラルＨＰＬＣカラムを用いることによっても分割することができる。

【１１６２】

式（Ｉ）の化合物が、異なる互変異性体形態として存在してもよく、このようなすべての形態が、本発明の範囲に含まれることもあり得る。さらに、例えば、この化合物のすべてのケト－エノール形態およびイミン－エナミン形態も本発明に含まれる。

【１１６３】

本発明の化合物（この化合物の塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグ、およびプロドラッグの塩、溶媒和物およびエステルを含む）のすべての立体異性体（例えば、幾何異性体、光学異性体など）、例えば、種々の置換基上の不斉炭素によって存在する可能性があるもの（エナンチオマー形態（不斉炭素が存在しない場合でも、存在する場合がある）、回転異性体形態、アトロプ異性体、ジアステレオマー形態を含む）も、位置異性体（例えば、４－ピリジルおよび３－ピリジルなど）も、本発明の範囲内であることを意図する。（例えば、式（Ｉ）の化合物に、二重結合または縮合環が組み込まれている場合、ｃ

ｉｓ形態およびｔｒａｎｓ形態、およびこれらの混合物も、本発明の範囲に含まれる。さらに、例えば、この化合物のすべてのケト－エノール形態およびイミン－エナミン形態も本発明に含まれる。）本発明の化合物の個々の立体異性体は、例えば、実質的に他の異性体が存在しない状態であってもよく、ラセミ体の混合物またはあらゆる他の立体異性体との混合物、または他の選択したの立体異性体との混合物であってもよい。本発明のキラル中心は、ＩＵＰＡＣ　１９７４　Ｒｅｃｏｍｍｅｎｄａｔｉｏｎｓによって定義されるように、Ｓ配置またはＲ配置を有することができる。用語「塩」、「溶媒和物」、「エステル」、「プロドラッグ」などの使用は、本発明の化合物のエナンチオマー、立体異性体、回転異性体、互変異性体、位置異性体、ラセミ体またはプロドラッグの塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグにも等しく適用されることを意図する。

【１１６４】

さらに、本発明は、１個以上の原子が、天然に通常見出される原子質量または質量数とは異なる原子質量または質量数を有する原子によって置き換わるという事実以外は本明細書に引用された化合物と同一である、本発明の同位体標識された化合物も包含する。本発明の化合物に組み込むことが可能な同位体の例としては、水素、炭素、窒素、酸素、リン、フッ素および塩素の同位体、例えば、^{2}Ｈ、^{3}Ｈ、^{13}Ｃ、^{14}Ｃ、^{15}Ｎ、^{18}Ｏ、^{17}Ｏ、^{31}Ｐ、^{32}Ｐ、^{35}Ｓ、^{18}Ｆおよび^{36}Ｃｌが挙げられる。

【１１６５】

特定の同位体標識された式（Ｉ）の化合物（例えば、^{3}Ｈおよび^{14}Ｃで標識されたもの）は、化合物および／または基質の組織分布アッセイで有用である。三重水素（すなわち、^{3}Ｈ）および炭素－１４（すなわち、^{14}Ｃ）といった同位体は、調製が容易であり、検出が容易であるため、特に好ましい。さらに、重水素（すなわち、^{2}Ｈ）のようなもっと重い同位体は、代謝安定性が大きい（例えば、ｉｎ　ｖｉｖｏでの半減期が長くなっているか、必要な投薬量が減っている）ことによる特定の治療利点を有する場合があり、いくつかの状況下で好ましい場合がある。同位体標識された式（Ｉ）の化合物は、一般的に、本明細書で以下に記載するスキームおよび／または実施例で開示したものと類似の手順に従って、同位体標識されていない試薬を、適切な同位体標識された試薬に変えることにより、調製することができる。

【１１６６】

式（Ｉ）の化合物、および式（Ｉ）の化合物の塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグの多形形態も本発明に含まれることを意図する。

【１１６７】

本発明の化合物は、薬理特性を有する場合がある。特に、式（Ｉ）の化合物は、γ－セクレターゼのモジュレーター（阻害剤、アンタゴニストなどを含む）であり得る。

【１１６８】

さらに特定的には、式（Ｉ）の化合物は、例えば、限定されないが、アルツハイマー病、ＡＩＤＳに関連する認知症、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、網膜色素変性、脊髄性筋萎縮症、小脳変性症などのような中枢神経系の種々の障害を処置するのに有用な場合がある。

【１１６９】

本発明の別の態様は、中枢神経系の疾患または状態を有する哺乳動物（例えば、ヒト）に、治療有効量の式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物、または医薬的に許容される前記化合物の塩、溶媒和物、エステルまたはプロドラッグを投与することによって、前記哺乳動物を処置する方法である。

【１１７０】

式（Ｉ）の化合物の好ましい投薬量は、約０．００１～５００ｍｇ／ｋｇ体重／日である。式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容される前記化合物の塩または溶媒和物の特に好ましい投薬量は、約０．０１～２５ｍｇ／ｋｇ体重／日である。

【１１７１】

本発明の化合物は、上に列挙した１つ以上のその他の薬剤と組み合わせる（ともに投与

するか、または順次投与する）ことが、有用な場合がある。

【１１７２】

本発明の化合物は、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤、β－セクレターゼ阻害剤からなる群から選択される１つ以上の化合物と組み合わせる（ともに投与するか、または順次投与する）ことが、有用な場合がある。

【１１７３】

投薬量を固定した状態で調合する場合、このような組み合わせ製剤は、本発明の化合物を本明細書に記載した投薬量の範囲内で使用し、他の医薬活性薬剤または処置剤を、その薬剤の投薬量の範囲内で使用する。

【１１７４】

したがって、ある態様では、本発明は、所定量の少なくとも１つの式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容されるその塩、溶媒和物、エステルまたはプロドラッグと、所定量の１つ以上の上に列挙したその他の薬剤とを含む組み合わせ剤を含み、この量の化合物／処置剤によって、所望の治療効果が得られる。

【１１７５】

本発明の化合物の薬理学的性質を、いくつかの薬理アッセイによって確認してもよい。本明細書で、特定のアッセイを後に例示している。

【１１７６】

さらに、本発明は、少なくとも１つの式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容される前記化合物の塩、溶媒和物、エステルまたはプロドラッグと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物に関する。

【１１７７】

本発明に記載の化合物から医薬組成物を調製するために、不活性な医薬的に許容されるキャリアは、固体であっても液体であってもよい。固体形態の製剤としては、粉剤、錠剤、分散可能な顆粒剤、カプセル剤、カシェ剤および坐剤が挙げられる。粉剤および錠剤は、約５～約９５％の有効成分の量から構成されていてもよい。適切な固体キャリアは、当該技術分野で知られており、例えば、炭酸マグネシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、糖またはラクトースが知られている。錠剤、粉剤、カシェ剤およびカプセル剤を、経口投与に適した固体投与剤型として使用してもよい。医薬的に許容されるキャリアの例と、種々の組成物を製造する方法は、Ａ．Ｇｅｎｎａｒｏ（編集）、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ’ｓ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ、１８^{ｔｈ} Ｅｄｉｔｉｏｎ、（１９９０）、Ｍａｃｋ Ｐｕｂｌｉｓｈｉｎｇ Ｃｏ．（ペンシルバニア州イーストン）中に見出し得る。

【１１７８】

液体形態の製剤としては、溶液、懸濁液およびエマルションが挙げられる。非経口注射液の一例として、水または水－プロピレングリコールの溶液を挙げることができ、経口用の溶液、懸濁液およびエマルションの場合、甘味剤および乳化剤を加えてもよい。液体形態の製剤は、鼻腔内投与用溶液を含んでいてもよい。

【１１７９】

吸入に適したエアロゾル製剤は、溶液および粉末形態の固体を含んでいてもよく、これを、医薬的に許容されるキャリア、例えば、不活性圧縮ガス（例えば、窒素）と組み合わせてもよい。

【１１８０】

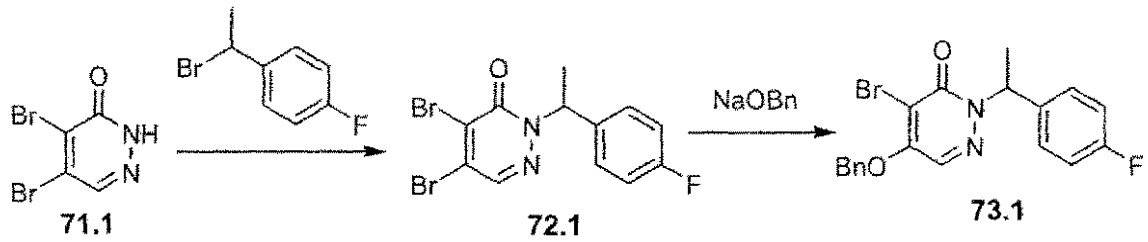
使用する少し前に、経口投与または非経口投与のための液体形態の製剤に変換することを目的とする、固体形態の製剤も含まれる。このような液体形態としては、溶液、懸濁液およびエマルションが挙げられる。

【１１８１】

本発明の化合物を、経皮送達してもよい。経皮用組成物は、クリーム、ローション、エアロゾルおよび／またはエマルションの形態であってもよく、この目的のために当該技術分野で一般的なマトリックス型または貯蔵型の経皮パッチ内に含まれていてもよい。

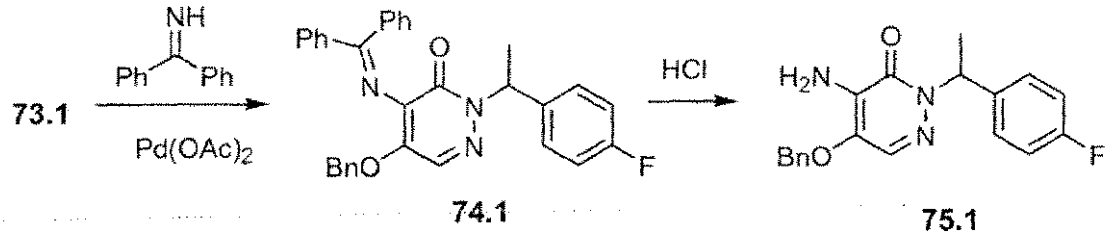
【１１８２】
本発明の化合物を、皮下送達してもよい。
【１１８３】
好ましくは、この化合物を経口投与する。
【１１８４】
好ましくは、この医薬製剤は、単位投与剤型である。この形態では、製剤は、適切な量の活性成分（例えば、所望の目的を達成するのに有効な量）を含む適したサイズの単位投薬量に小分けする。
【１１８５】
単位投薬量の製剤に含まれる、活性化合物の量は、特定の用途に従って、約１ｍｇ～約１００ｍｇ、好ましくは、約１ｍｇ～約５０ｍｇ、さらに好ましくは、約１ｍｇ～約２５ｍｇの間で変わってもよく、または調節してもよい。
【１１８６】
使用する実際の投薬量は、患者の要求、処置対象となる状態の重篤度に応じて変えてもよい。特定の状況に適した投薬計画の決定は、当業者の知識の範囲内である。簡便化のために、１日の合計投薬量を分割し、必要に応じて１日の間に何回かに分けて投与してもよい。
【１１８７】
本発明の化合物および／または医薬的に許容されるその塩の投与量および投与回数は、患者の年齢、状態および体の大きさ、および処置対象となる症状の重篤度のような因子を考慮して、主治医の判断によって調整する。経口投与の場合、典型的な１日の推奨投薬計画は、約１ｍｇ／日～約５００ｍｇ／日、好ましくは、１ｍｇ／日～２００ｍｇ／日であり、これを２～４回に分けて投与する。
【１１８８】
本発明の別の態様は、治療有効量の少なくとも１つの式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容される前記化合物の塩、溶媒和物、エステルまたはプロドラッグと、医薬的に許容されるキャリア、ビヒクルまたは希釈剤とを含むキットである。
【１１８９】
本発明のさらに別の態様は、少なくとも１つの式（Ｉ）の化合物、または医薬的に許容される前記化合物の塩、溶媒和物、エステルまたはプロドラッグと、上に列挙した少なくとも１つのその他の薬剤とをそれぞれ所定量含むキットであって、その２つ以上の成分の量によって、望ましい治療効果が得られる。
【１１９０】
本明細書に開示した発明を、以下の代表的なスキームおよび実施例によって説明するが、これらの内容は、本開示内容の範囲を限定するものと解釈されるべきではない。代替の機構的な経路および類似の構造は、当業者には明らかである。
【実施例】
【１１９１】
以下のスキームおよび実施例によって、本発明の化合物を調製することができる。異なる記載がない限り、同じ化学によって、G^5部分がG^3（すなわち、位置（２））に結合している本発明の化合物を調製することができる。
【１１９２】

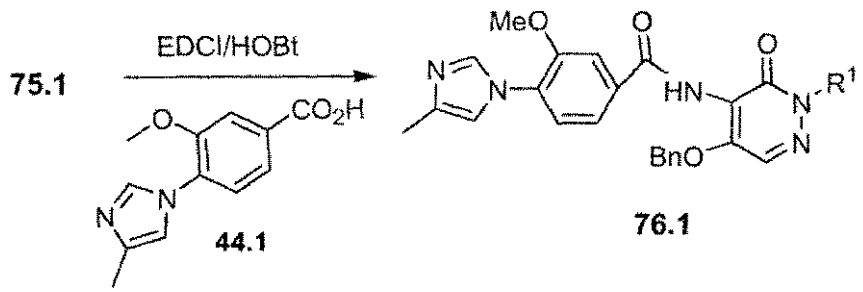
【化２１６】

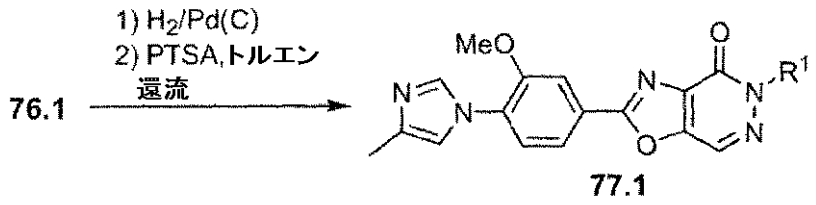


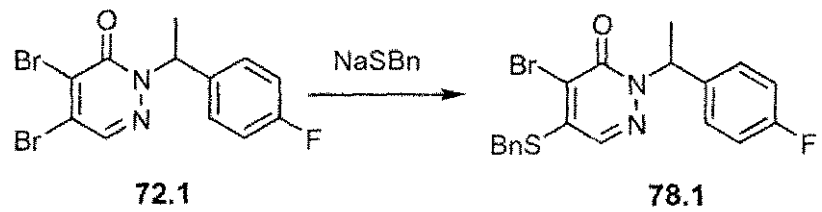
【１１９３】

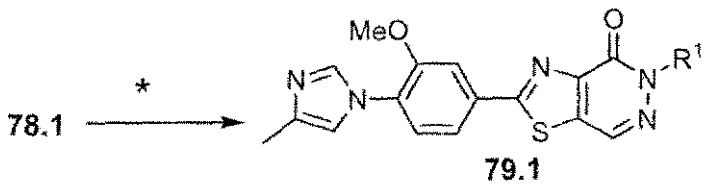
【化２１７】



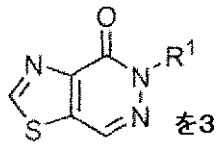






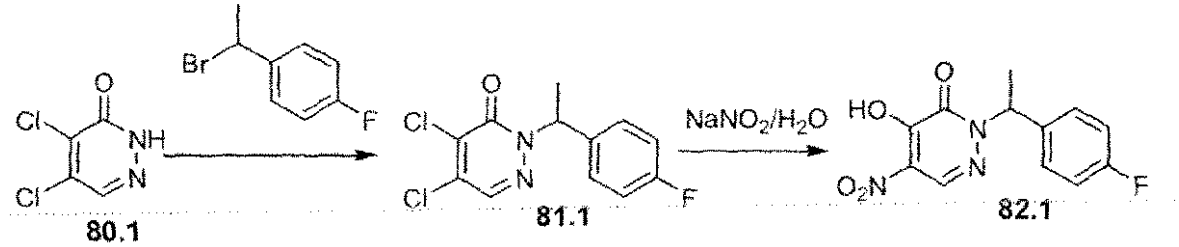


* 34．1から37．1を調製するのと同様の手順、

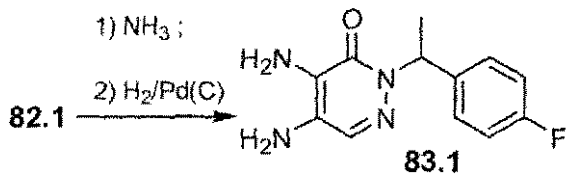
但し、  を34．1の代わりに使用してもよい。

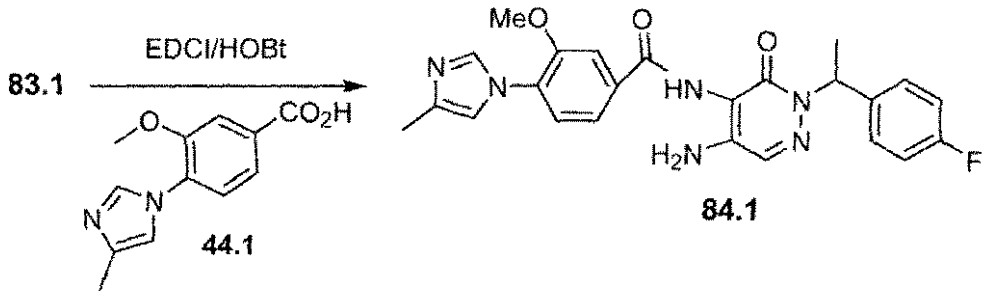
【１１９４】

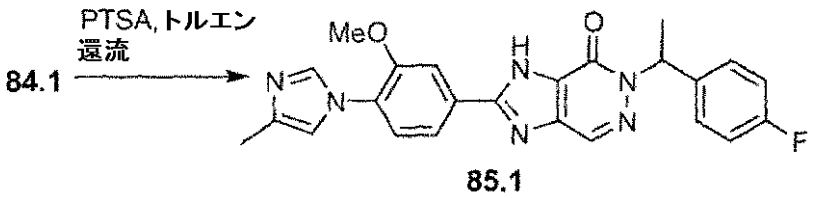
【化２１８】

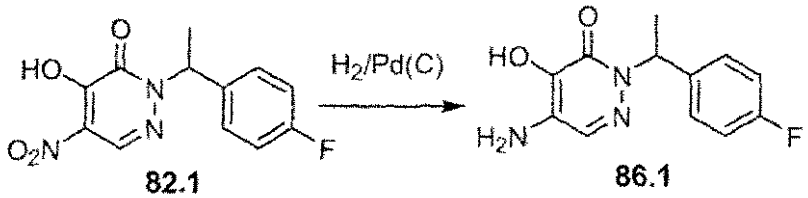


Gagnier, R. Paul; Halat, Michael J.; Otter, Brian A.; JHTCAD; J. Heterocycl. Chem.; EN; 21; 1984; 481-489.



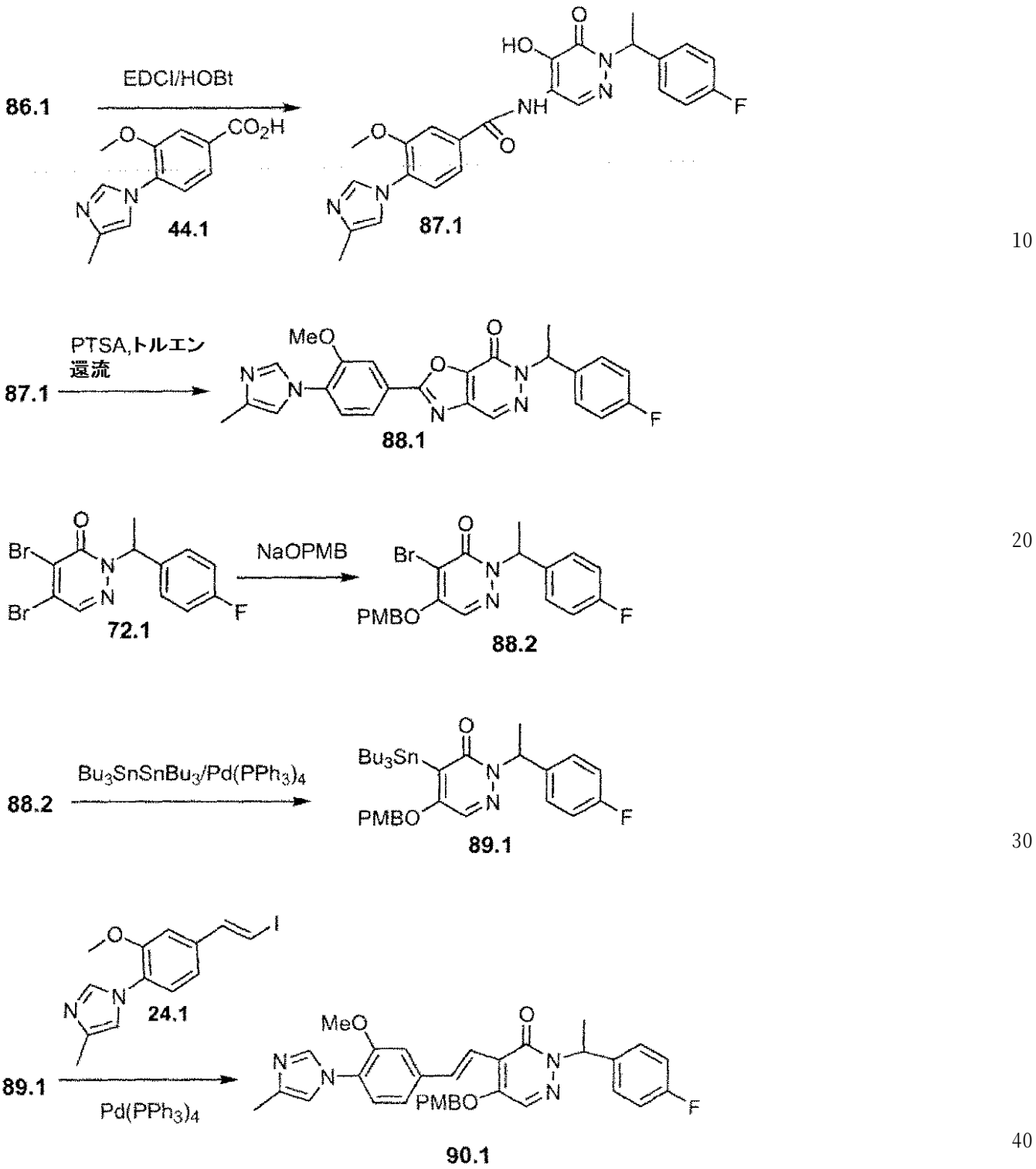






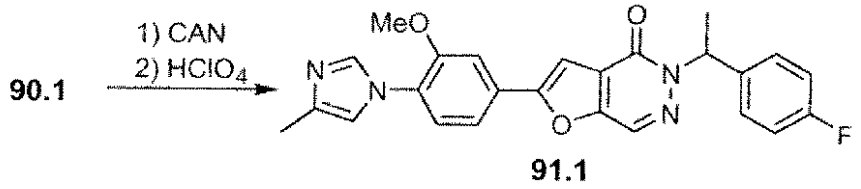
【１１９５】

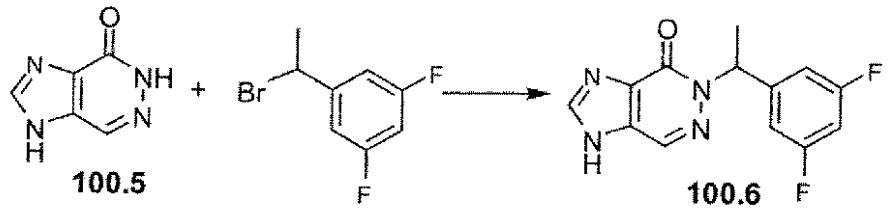
【化２１９】

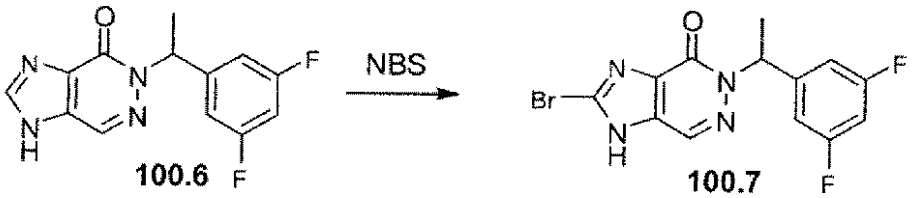

86.1
EDCI/HOBt
44.1
87.1
PTSA,トルエン
還流
88.1
NaOPMB
72.1
88.2
Bu3SnSnBu3/Pd(PPh3)4
89.1
24.1
Pd(PPh3)4
90.1

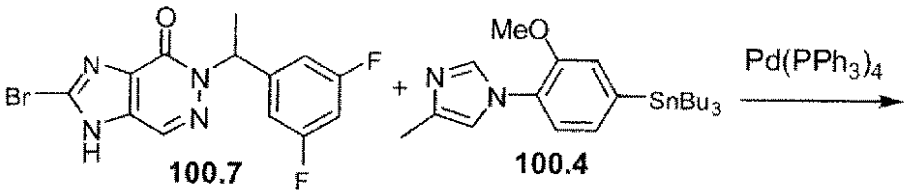
【１１９６】

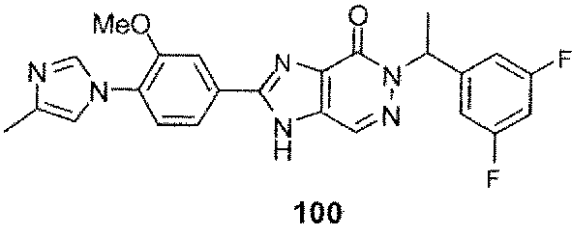
【化２２０】

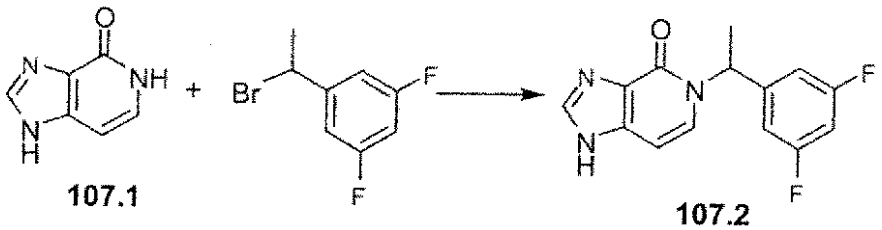

90.1
1) CAN
2) HClO4
MeO
F
91.1


100.5
Br
F
100.6


100.6
NBS
Br
100.7

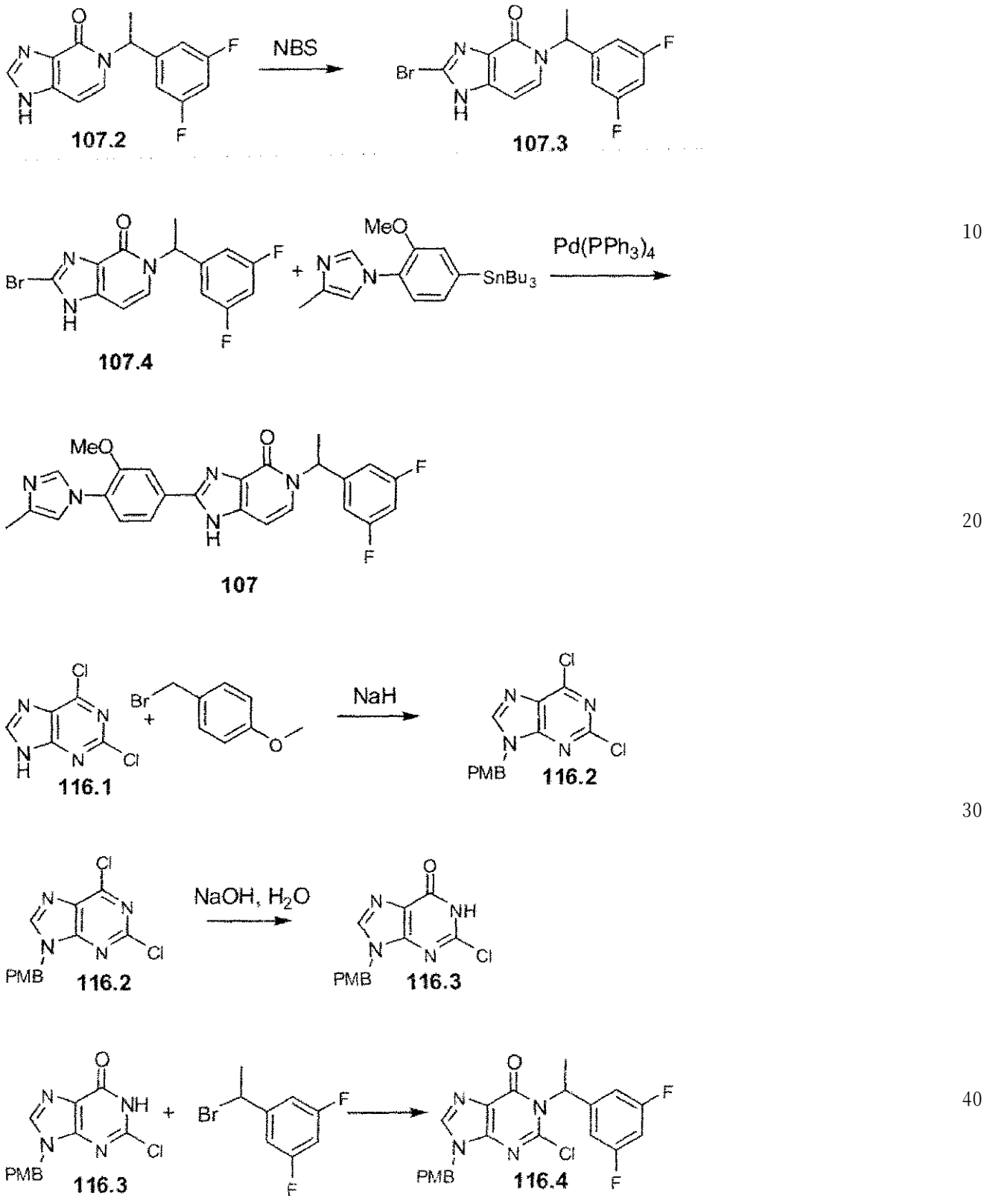

Br
100.7
MeO
SnBu3
100.4
Pd(PPh3)4


MeO
100


107.1
Br
F
107.2

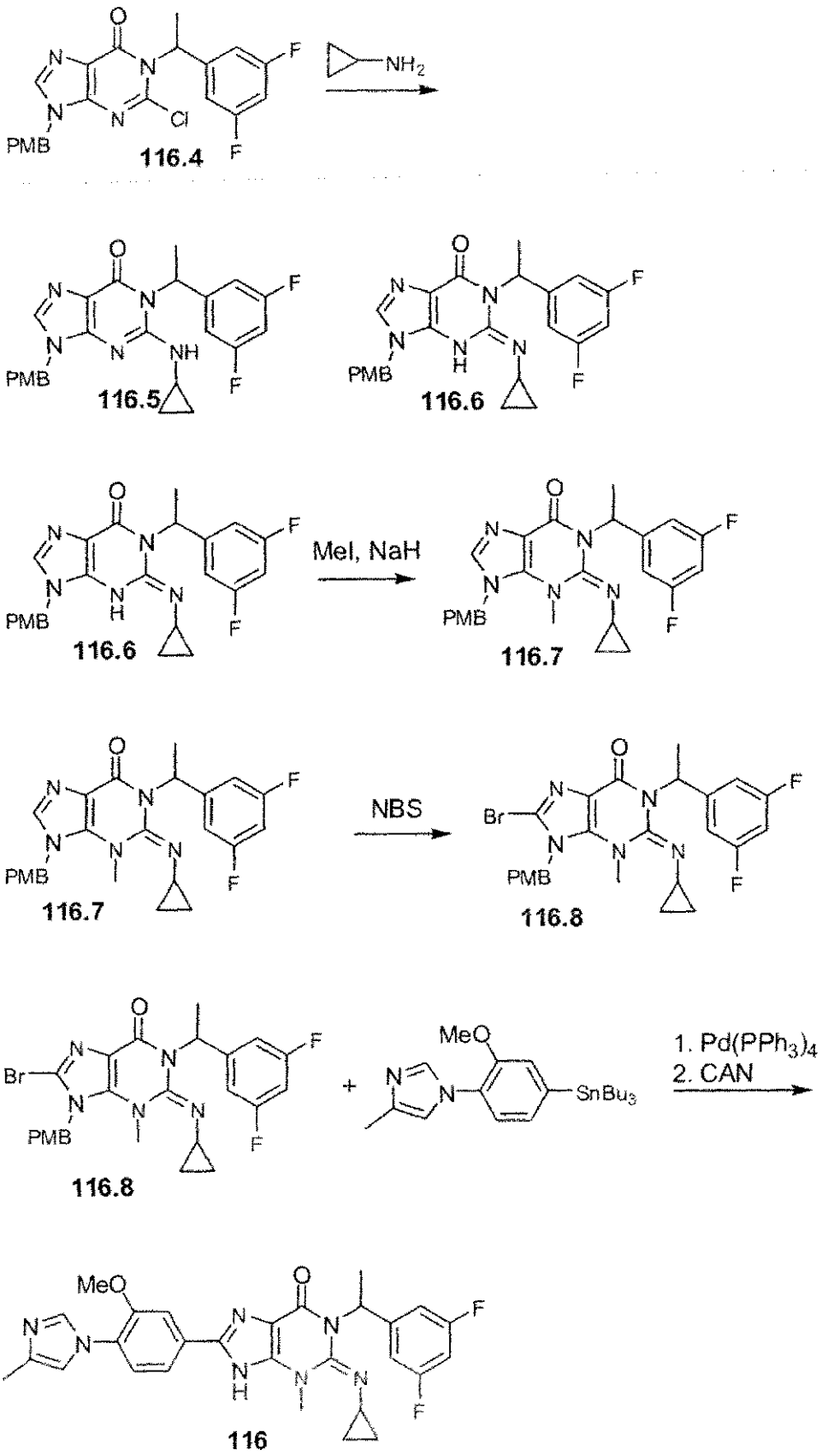
【１１９７】

【化２２１】


NBS
107.2
107.3
MeO
Pd(PPh3)4
SnBu3
107.4
107
NaH
116.1
116.2
NaOH, H2O
116.3
116.4
PMB

【１１９８】

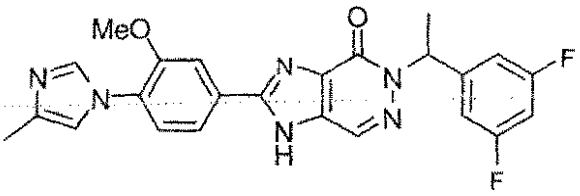
【化２２２】



（実施例１）

【１１９９】

【化２２３】

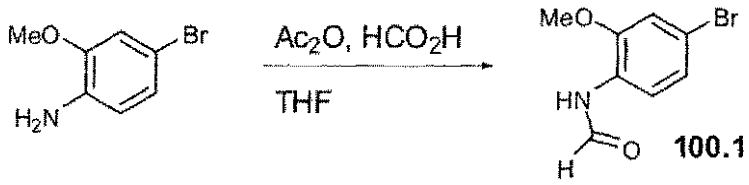


100

工程Ａ：

【１２００】

【化２２４】



100.1

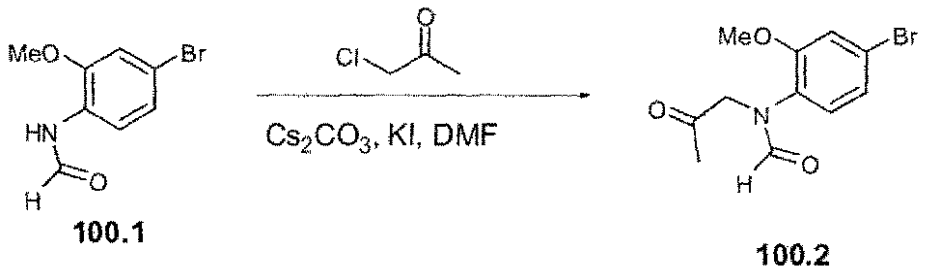
室温で、丸底フラスコにギ酸（８５％、２７ｍＬ、６２４．４ｍｍｏｌ）を加え、これに無水酢酸（１６ｍＬ、１６９．５ｍｍｏｌ）を滴下した。この反応物を４５分間攪拌し、その後、４－ブロモ－２－メトキシアニリン（９．０１ｇ、４４．６ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（５６ｍＬ）溶液を滴下した。２３時間後、この反応混合物を氷水でクエンチし、得られた沈殿を濾過し、化合物１００．１（９．２０ｇ、９０％）を褐色固体として得た。

【１２０１】

工程Ｂ：

【１２０２】

【化２２５】



100.1　　100.2

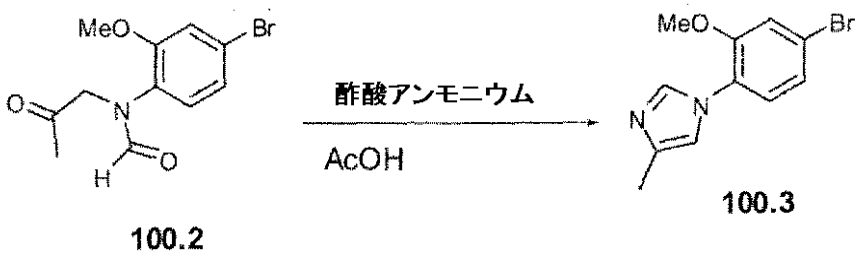
室温で、丸底フラスコ中で、ＤＭＦ（４０ｍＬ）中の化合物１００．１（９．２０ｇ、３９．９ｍｍｏｌ）、炭酸セシウム（２６．０５ｇ、７９．９ｍｍｏｌ）、ヨウ化カリウム（０．６６ｇ、３．９ｍｍｏｌ）とを混合し、これにクロロアセトン（６．７ｍＬ、７９．９ｍｍｏｌ）を滴下した。この反応物を３時間攪拌した後、炭酸セシウム（１３．０２ｇ、３９．９ｍｍｏｌ）、クロロアセトン（３．３５ｍＬ、３９．９ｍｍｏｌ）を加えた。１９時間後、反応物を水で希釈し、７５％　酢酸エチル／ヘキサンで抽出し、ブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥し、減圧下で濃縮した。この粗物質を、シリカゲルクロマトグラフィーを用いて酢酸エチル／ジクロロメタンで精製し、化合物１００．２（１０．９４ｇ、９６％）をベージュ色の固体として得た。

【１２０３】

工程Ｃ：

【１２０４】

【化２２６】



100.2　　100.3

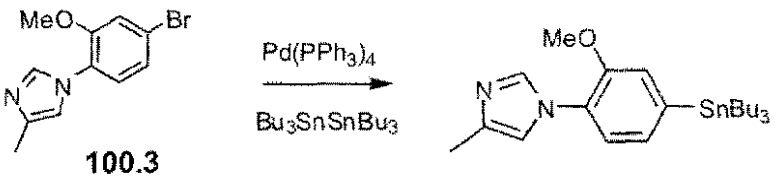
室温で、丸底フラスコに、化合物１００．２（１０．９４ｇ、３８．２４ｍｍｏｌ）、酢酸アンモニウム（１４．７４ｇ、１９１．２ｍｍｏｌ）、酢酸（２２ｍＬ、３８２．４ｍｍｏｌ）を入れて混合し、１４０℃まで加熱した。この反応物を１時間攪拌し、次いで、氷水に注いだ。この混合物に水酸化アンモニウム（６０ｍＬ）を加え、酢酸エチルで抽出し、Na_2SO_4で乾燥し、減圧下で濃縮した。この粗物質を、シリカゲルクロマトグラフィーを用いてアセトン／水酸化アンモニウム／ジクロロメタンで精製し、化合物１００．３（７．５７ｇ、７４％）を褐色／オレンジ色の固体として得た。

【１２０５】

工程Ｄ：

【１２０６】

【化２２７】



100.3　　100.4

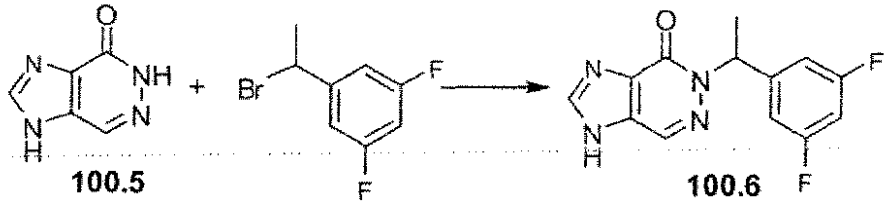
化合物１００．３（１．４ｍｍｏｌ）、$Bu_3SnSnBu_3$（２．１ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（７ｍｍｏｌ）に、トルエン３０ｍｌを加え、その後$Pd(PPh_3)_4$（０．１４ｍｍｏｌ）を加え、２時間かけて１２０℃まで加熱した。室温まで冷却し、次いで水およびジクロロメタンを加えることによって反応を行った。水層をジクロロメタンで３回抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、乾燥するまで濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ジクロロメタン／ＭｅＯＨ　９９：１から９０：１０で溶出）で精製し、生成物１００．４を得た。

【１２０７】

工程Ｅ：

【１２０８】

【化２２８】



100.5　　100.6

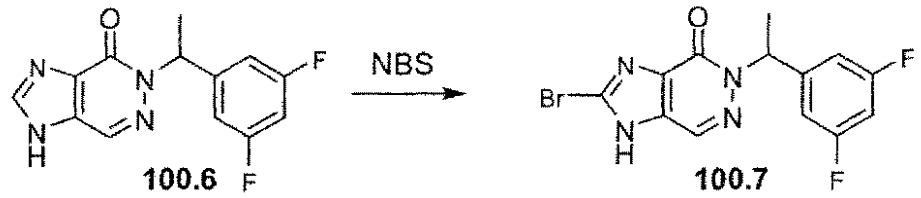
化合物１００．５（１．０ｍｍｏｌ）、α－メチル　３，５　ジフルオロベンジルブロミド（１．５ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（５．０ｍｍｏｌ）に、ＤＭＦ３０ｍＬを加える。この混合物を室温で一晩攪拌する。水およびＥｔＯＡｃを加えることによって反応を行う。水層をＥｔＯＡｃで３回抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、乾燥するまで濃縮する。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、生成物１００．６を得た。

【１２０９】

工程Ｆ：

【１２１０】

【化２２９】



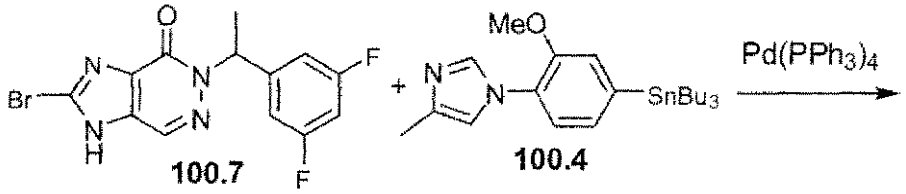
ＤＭＦ（６．０ｍＬ）中の化合物１００．６（１．０ｍｍｏｌ）に室温でＮ－ブロモスクシンイミド（１．１ｍｍｏｌ）を加える。この混合物を室温で一晩攪拌する。$Na_2S_2O_3$水溶液およびＥｔＯＡｃを加えることによって反応を行う。水層をＥｔＯＡｃで３回抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、乾燥するまで濃縮する。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、生成物１００．７を得る。

【１２１１】

工程Ｇ：

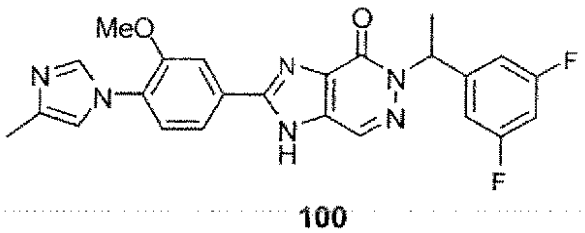
【１２１２】

【化２３０】



【１２１３】

【化２３１】



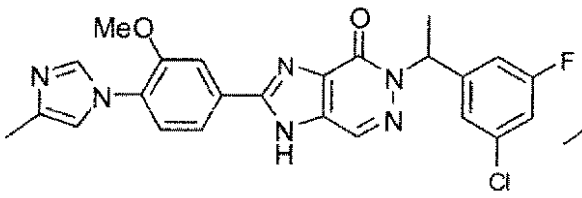
化合物１００．７（１．４ｍｍｏｌ）、化合物１００．４（２．１ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（７ｍｍｏｌ）に、トルエン３０ｍＬを加え、次いで$Pd(PPh_3)_4$（０．１４ｍｍｏｌ）を加え、２時間で１２０℃まで加熱する。室温まで冷却し、次いで水およびジクロロメタンを加えることによって反応を行う。水層をジクロロメタンで３回抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、乾燥するまで濃縮する。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、生成物１００を得る。

【１２１４】

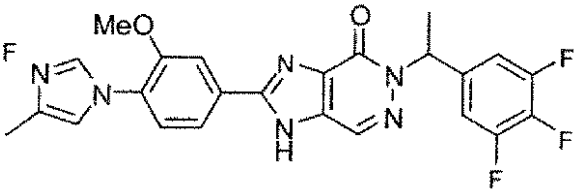
化合物１００を調製するのと同様の手順にしたがって、化合物１０１～１２４を調製する。

【１２１５】

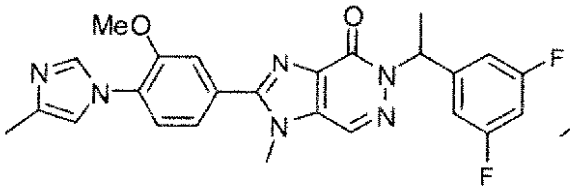
【化２３２】



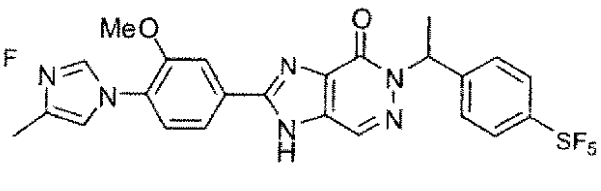
101



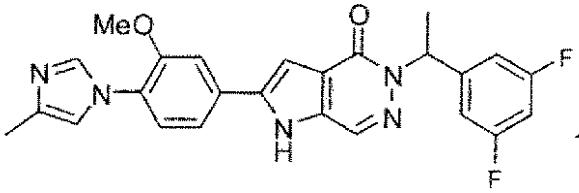
102



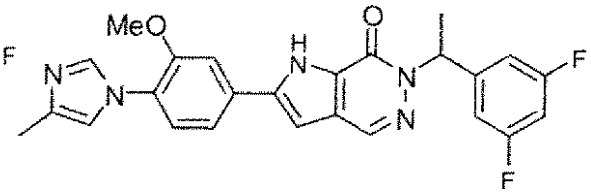
103



104



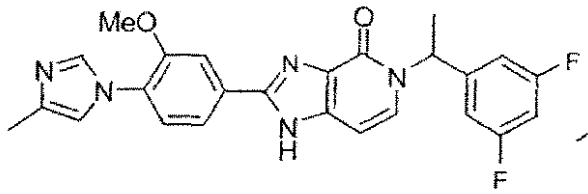
105



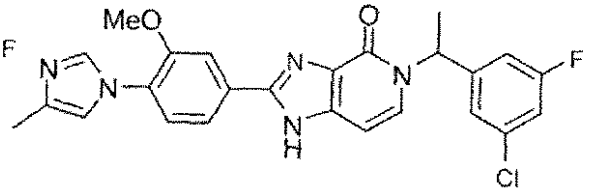
106

【１２１６】

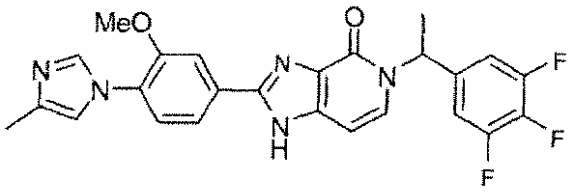
【化２３３】



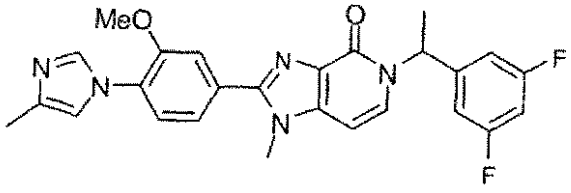
107



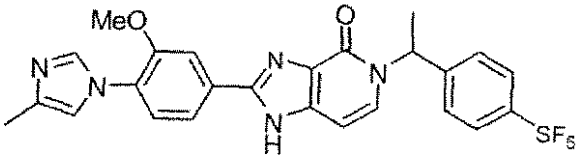
108



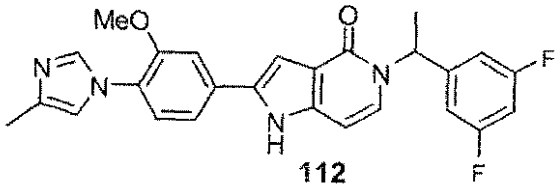
109



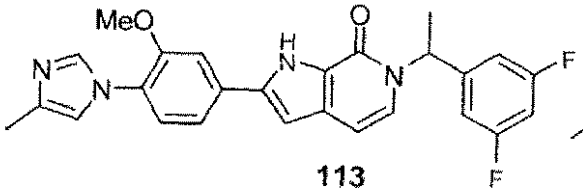
110



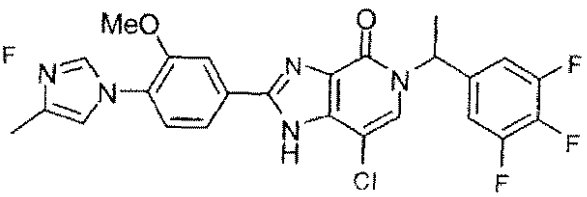
111



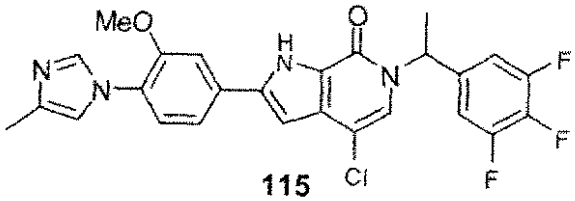
112



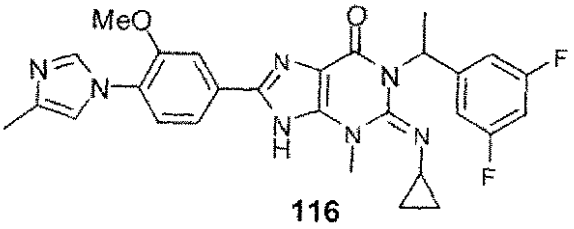
113



114



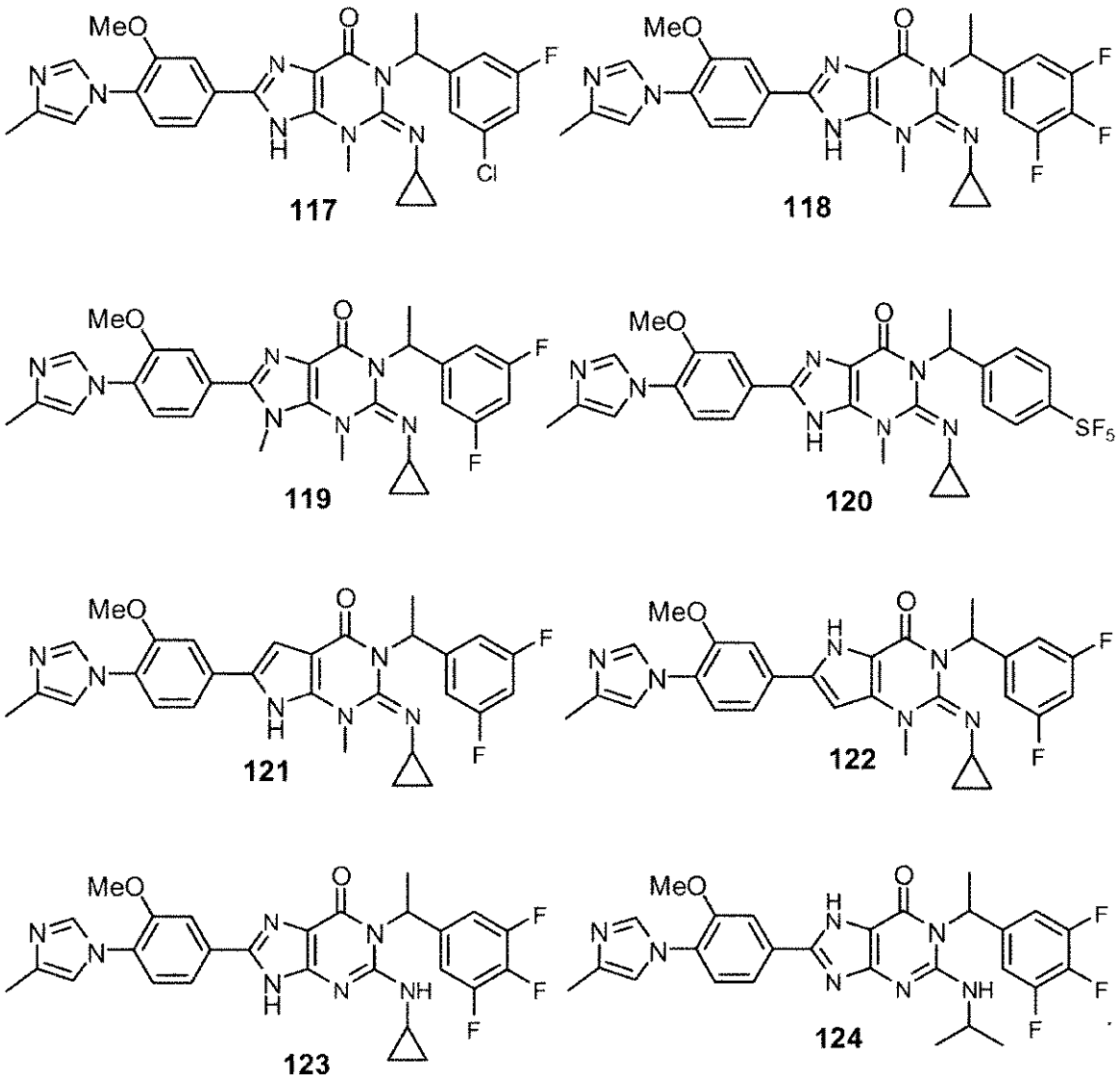
115



116

【１２１７】

【化２３４】



（アッセイ）

全細胞におけるセクレターゼ反応およびＡβ分析。Ｓｗｅｄｉｓｈ変異およびＬｏｎｄｏｎ変異を有するＡＰＰを過剰発現するＨＥＫ２９３細胞を、１０％ウシ胎仔血清を含むＤＭＥＭ培地１００ｍｌ中、３７℃で５時間、特定の化合物で処理する。インキュベーション終了後、サンドイッチイムノアッセイに基づく電気化学発光（ＥＣＬ）を用い、Ａβ合計量、Ａβ４０およびＡβ４２を測定する。ＴＡＧ－Ｗ０２およびビオチン－４Ｇ８の抗体の対を用い、Ａβ合計量を決定し、ＴＡＧ－Ｇ２－１０およびビオチン－４Ｇ８の抗体の対を用いてＡβ４０を同定し、一方、抗体ＴＡＧ－Ｇ２－１１およびビオチン－４Ｇ８を用いてＡβ４２を同定する。Ｓｅｃｔｏｒ　Ｉｍａｇｅｒ　２４００（Ｍｅｓｏ　Ｓｃａｌｅ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ）を用い、ＥＣＬシグナルを測定する。

【１２１８】

ＡβプロフィールのＭＳ分析。表面増強レーザー脱離／イオン化（ＳＥＬＤＩ）質量分析を用い、馴化培地（ｃｏｎｄｉｔｉｏｎｅｄ　ｍｅｄｉｕｍ）中のＡβプロフィールを決定する。馴化培地を、Ｗ０２抗体でコーティングしたＰＳ２０　ＰｒｏｔｅｉｎＣｈｉｐアレイでインキュベーションする。アレイに捕捉したＡβの質量スペクトルを、製造業者の指示に従ってＳＥＬＤＩ　ＰｒｏｔｅｉｎＣｈｉｐ　Ｒｅａｄｅｒ（Ｂｉｏ－Ｒａｄ）で読み取る。

【１２１９】

ＣＳＦ　Ａβ分析。上述のＭＳＤ技術を用い、ラットＣＳＦのＡβを決定する。ＴＡＧ

－Ｇ２－１０およびビオチン－４Ｇ８を用いてＡβ４０を測定し、Ｔａｇ－抗Ａβ４２（Ｍｅｓｏ　Ｓｃａｌｅ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ）およびビオチン－４Ｇ８の抗体の対を用いてＡβ４２を測定する。Ｓｅｃｔｏｒ　Ｉｍａｇｅｒ　２４００（Ｍｅｓｏ　Ｓｃａｌｅ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ）を用い、ＥＣＬシグナルを測定する。

【１２２０】

Ｖｏｙａｇｅｒ－ＤＥ　ＳＴＲ質量分析計（ＡＢＩ、Ｆｒａｍｉｎｇｈａｍ、ＭＡ）で、Ａβのマトリックス支援レーザー脱離／イオン化質量分析（ＭＡＬＤＩ　ＭＳ）を行う。この装置にパルス型の窒素レーザー（３３７ｎｍ）を取り付ける。加速電圧２０ｋＶを用いた線形モードで、質量スペクトルを得る。この研究で提示する各スペクトルは、２５６回のレーザーショットの平均をあらわす。サンプル－マトリックス溶液を調製するために、免疫沈降させたＡβサンプル１μＬを、飽和α－シアノ－４－ヒドロキシ桂皮酸の０．１％　ＴＦＡ／アセトニトリル溶液３μＬと混合する。次いで、サンプル－マトリックス溶液をサンプルプレートに塗布し、周囲温度で乾燥させた後、質量分析を行う。全てのスペクトルを、ウシインスリンおよびＡＣＴＨ（１８－３９クリップ）の混合物を用いて外部較正する。

【１２２１】

本発明を、上に記載した特定の実施形態と関連付けて記載してきたが、多くの変更、改変および他の変形例は、当業者には明らかであろう。このようなあらゆる変更、改変および変形例は、本発明の精神および範囲の範囲内にあるものである。

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月9日(2010.8.9)

【手続補正１】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００１０

【補正方法】変更

【補正の内容】

【００１０】

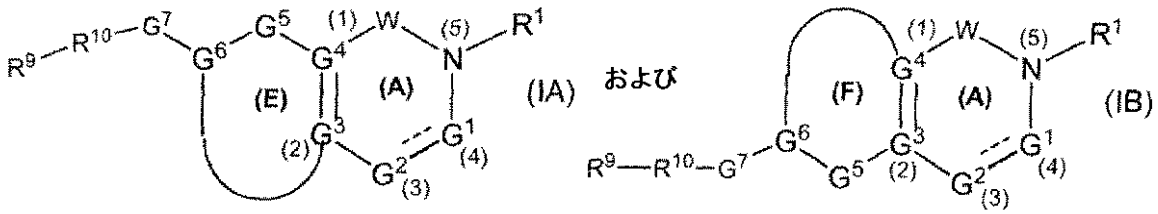
多くの実施形態において、本発明は、γ－セクレターゼモジュレーター（阻害剤、アンタゴニストなどを含む）としての新規な化合物クラス、そのような化合物を調製する方法、１つ以上のそのような化合物を含む医薬組成物、１つ以上のそのような化合物を含む医薬調合物を調製する方法、そのような化合物またはそのような医薬組成物を用い、Ａβに関連する１つ以上の疾患を処置、予防、阻害または軽減する方法を提供する。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

（項目１）

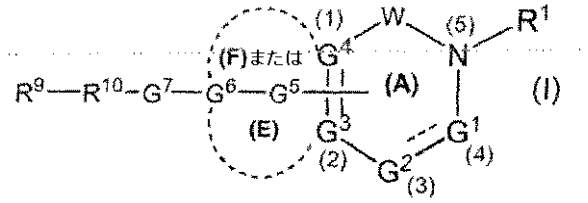
以下の化合物

【化２３６】



からなる群から選択される式（Ｉ）の化合物

【化２３５】



またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物：
〔式中、G^1、G^2、G^3、G^4、W、R^1、環（Ａ）、環（Ｅ）、環（Ｆ）、G^5、G^6、G^7、R^9、およびR^{10}は、独立して選択され；
式中の文字（Ａ）、（Ｅ）、および（Ｆ）は、前記環を特定するための参照文字であり；
G^1とG^2との間にある点線は、任意の結合をあらわし；
数字（１）、（２）、（３）、（４）および（５）は、環（Ａ）の位置を特定するための参照番号であり；G^4は、位置（１）にあり、G^3は、位置（２）にあり、G^2は、位置（３）にあり、G^1は、位置（４）にあり、Ｎは、位置（５）にあり；
G^5がG^4に結合している場合（式ＩＡ）、G^4は、－Ｃ－であり、G^5がG^3に結合している場合（式ＩＢ）、G^3は、－Ｃ－であり；
前記環（Ｅ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^3はＮであり、G^4はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｅ）に対して互変異性化し、
前記環（Ｆ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^4はＮであり、G^3はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｆ）に対して互変異性化し；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、４～１０員のヘテロアリール環、アリール環、シクロアルケニル環、またはヘテロシクロアルケニル環であり；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）がヘテロシクロアルケニル環またはヘテロアリール環である場合、前記環は、場合により、－NR^2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択される少なくとも１個の他のヘテロ原子を含み；
前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、場合により、１～６個の独立して選択されるR^{21}置換基で置換されており；
ｄは、０または１であり；
ｍは、０～６であり；
ｎは、１～５であり；
ｐは、０～５であり；
ｑは、０、１または２であり、ｑは、それぞれ独立して選択され；
ｒは、１～３であり；
ｔは、１または２であり、
Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；
G^1は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（R^{21}）$_q$－、－Ｎ（R^2）$_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$、－Ｃ（Ｎ（R^2）$_2$）－（R^2は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；但し、
（１）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在しない場合、G^1は、－Ｃ（Ｎ（R^2）$_2$）－ではなく；
（２）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（R^{21}）$_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、

（ｂ）－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－基のｄは、０であり（Ｇ^{1}とＧ^{2}との間にある二重結合によって、Ｎ上にＨは存在しない）、
（ｃ）Ｇ^{1}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$、－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_{2}$、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$）－（Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－からなる群から選択され；但し、
（１）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在しない場合、Ｇ^{2}は、－Ｃ（Ｎ（Ｒ^{2}）$_{2}$）－ではなく；
（２）Ｇ^{1}とＧ^{2}との間に、前記任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、
（ｂ）－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－基のｄは、０であり、
（ｃ）Ｇ^{2}は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
Ｇ^{5}は、直接結合、ＣＨ、－Ｃ（Ｒ^{21}）$_{q}$、－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^{2}）－、－ＣＨＲ^{3}－、Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）－、－ＣＲ^{4}（ＯＨ）－、－ＣＲ^{4}（ＯＲ^{4}）－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
Ｇ^{6}は、Ｃ、ＣＲ^{3}、およびＮからなる群から選択され；
Ｇ^{7}は、直接結合、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝ＮＲ^{2}）－、－ＣＨＲ^{3}－、Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$、－ＣＲ^{4}（ＯＨ）－、－ＣＲ^{4}（ＯＲ^{4}）－、－Ｃ＝Ｃ－、アルキニル、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$Ｎ（Ｒ^{2}）－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｎ（Ｒ^{2}）（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－Ｏ－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－Ｏ－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－Ｏ－、－Ｏ－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｏ－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｏ－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{5}（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$ＮＲ^{5}Ｓ（Ｏ）$_{t}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（ＣＨ$_{2}$）$_{r}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（ＣＨＲ^{4}）$_{r}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{t}$ＮＲ^{5}（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{r}$－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｓ（Ｏ）$_{t}$－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－ＮＲ^{5}－、－ＮＲ^{5}－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（＝ＮＲ^{2}）－ＮＲ^{5}－、－Ｃ（Ｒ^{4}）＝Ｎ－Ｏ－、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）－、－Ｏ－Ｃ（Ｒ^{4}）＝Ｎ－、－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）－Ｏ－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{2}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{2}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{2}$－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{3}$－、－（Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$）$_{3}$－、－（ＣＨＲ^{4}）$_{3}$－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
但し、Ｇ^{1}、Ｇ^{2}、Ｇ^{3}およびＧ^{4}部分のうち０～２個が－Ｎ（Ｒ^{2}）$_{d}$－であり、Ｒ^{2}は、それぞれ独立して選択され、ｄは、それぞれ独立して選択され、但し、環（Ａ）は、連続した３個の環窒素原子を有しておらず；
Ｒ^{1}は、アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロア

リールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、前記アルキル－、アルケニル－、およびアルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル－であるR^1基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^2は、それぞれ独立して、Ｈ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（OR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（OR^4）、－Ｓ（Ｏ）NHR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2NHR^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）NHR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^3は、Ｈ、－ＯＨ、ハロ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（R^4）、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（OR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（OR^4）、－Ｓ（Ｏ）NHR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2NHR^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）NHR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^4は、それぞれ独立して、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^2

^{1}基で置換されており；

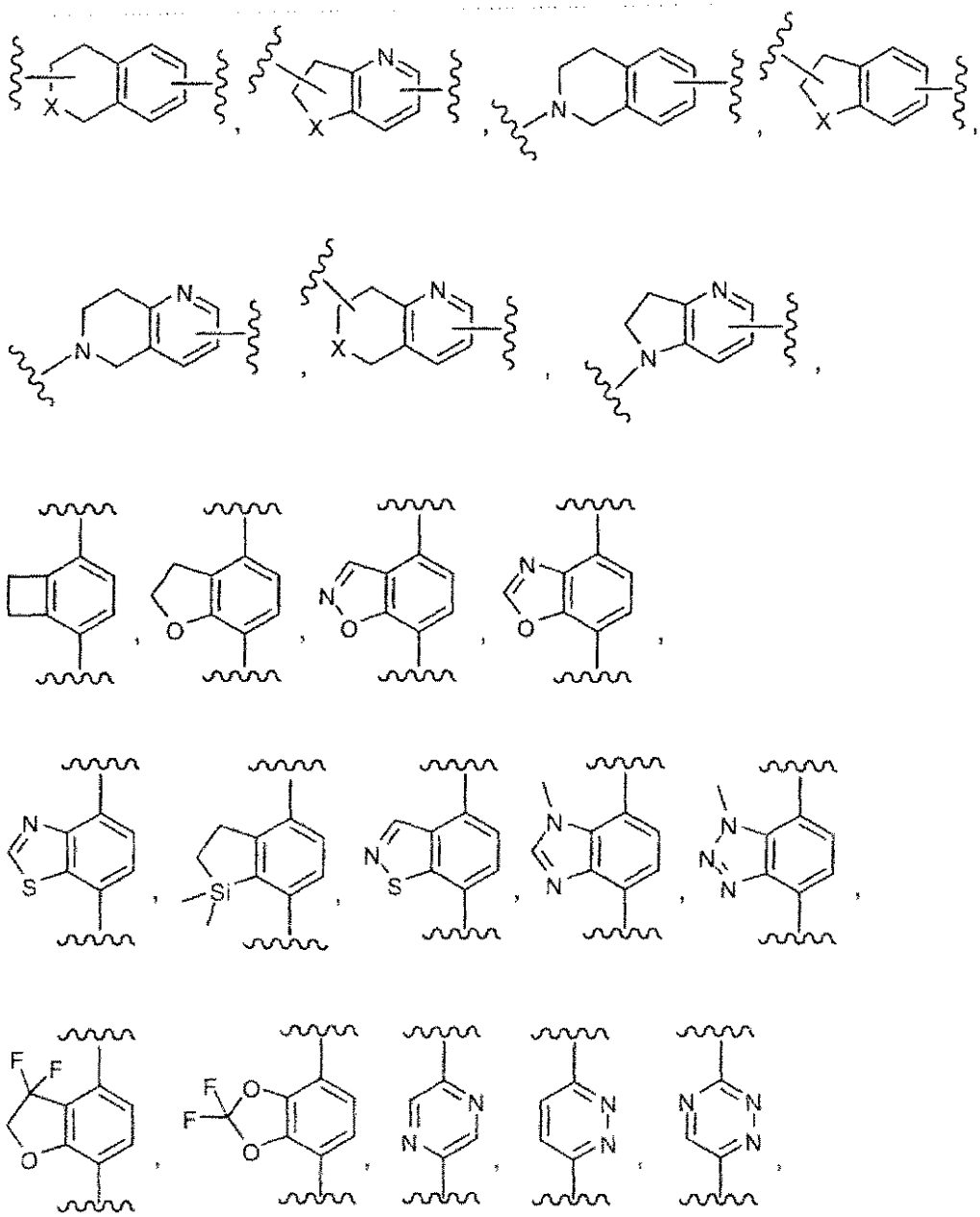
R^{5}は、それぞれ独立して、Ｈ、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群から選択され、前記置換基は、R^{2}から独立して選択される１個以上の（例えば、１～５個の）置換基で置換されており；

R^{6}は、それぞれ独立して、Ｈ、ハロ、－CF_{3}、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－Ｓ（Ｏ）R^{4}、－Ｓ（Ｏ）（OR^{4}）、－Ｓ（Ｏ）NHR^{4}、－Ｓ（Ｏ）$N(R^{4})_{2}$（R^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）$_{2}NH_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}NHR^{4}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}N(R^{4})_{2}$（R^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）$_{2}NH_{2}$、－Ｃ（＝NOR^{24}）R^{25}、および－Ｓ（Ｏ）$_{2}R^{24}$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_{2}R^{4}$、－Ｃ（Ｏ）NHR^{4}、－Ｃ（Ｏ）$N(R^{4})_{2}$（R^{4}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｃ（Ｏ）NH_{2}、－Ｃ（Ｏ）R^{4}、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

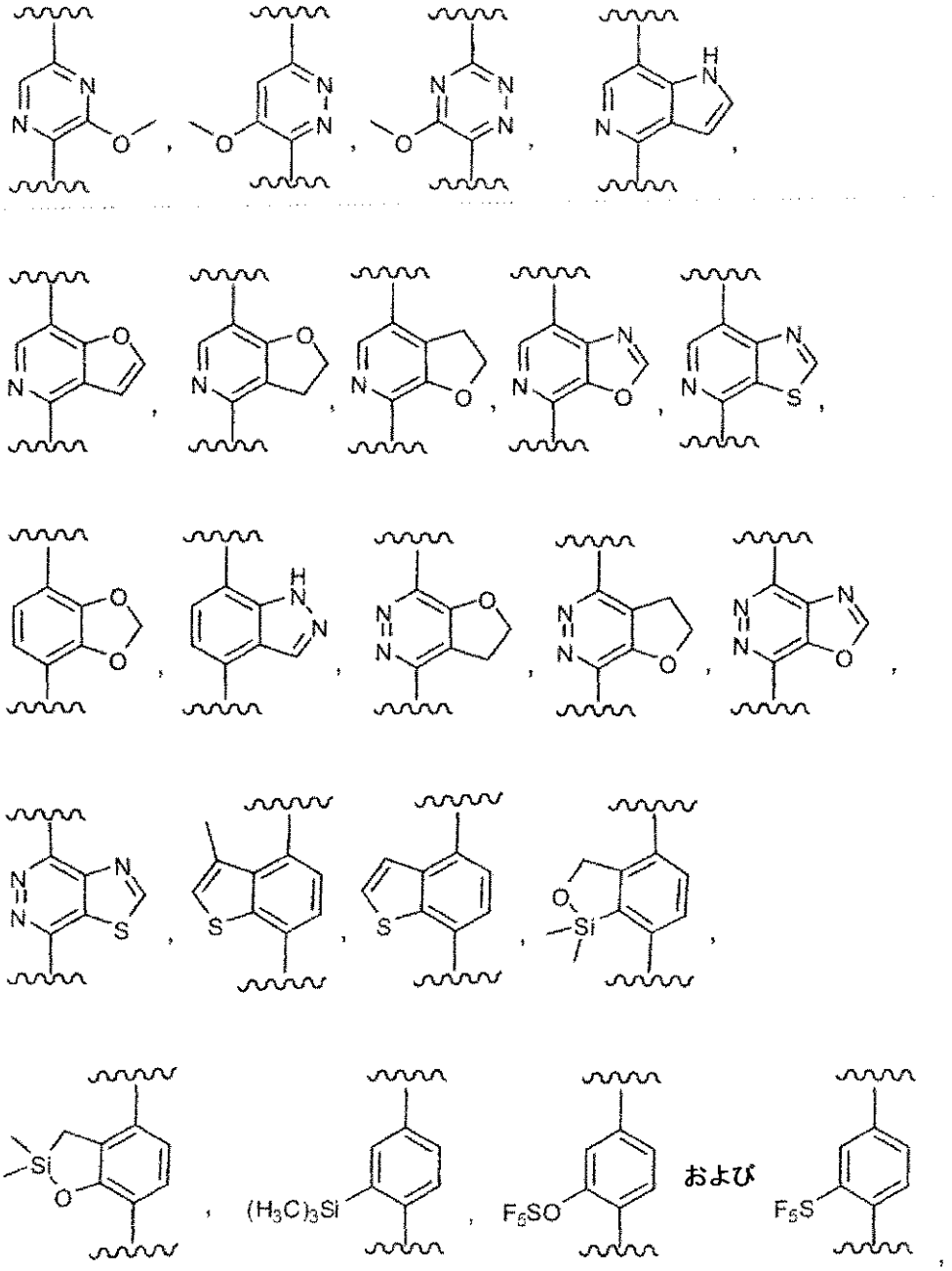
R^{9}は、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－である前記R^{9}は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^{10}は、アリール－（例えば、フェニル）、ヘテロアリール－（例えば、ピリジル）、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－、ヘテロシクリルアルケニル－、縮合ベンゾシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル－）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合シクロアルキルアリール（すなわち、シクロアルキル縮合アリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合アリール－）、縮合シクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、シクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、

【化２３７】



【化２３８】



からなる群から選択され、式中、Ｘは、Ｏ、－Ｎ（Ｒ１４）－および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｒ１０部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ２１基で場合により置換されているか；または

Ｒ９とＲ１０とが結合して、縮合三環系を形成し、Ｒ９およびＲ１０は、先に定義したとおりであり、Ｒ９とＲ１０とを結合する環は、アルキル環またはヘテロアルキル環またはアリール環またはヘテロアリール環またはアルケニル環またはヘテロアルケニル環であり（例えば、前記三環系は、Ｒ９とＲ１０の両方を結合している原子に隣接する原子を結合することによって形成され）；

Ｒ１４は、Ｈ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル－、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ１５、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ１５、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ１５）（Ｒ１６）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ１５）（Ｒ１６）、－Ｓ（Ｏ）２Ｎ（Ｒ１５）

（R^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯR^{15}）R^{16}、および－Ｐ（Ｏ）（ＯR^{15}）（ＯR^{16}）からなる群から選択され；

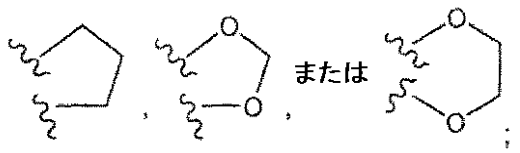
R^{15A}およびR^{16A}は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－アルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキルアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリルアルキル、（R^{18}）$_n$－アリール、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールおよび（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択されるか；または

R^{15}、R^{16}およびR^{17}は、独立して、Ｈ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－アルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキル、（R^{18}）$_n$－シクロアルキルアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリル、（R^{18}）$_n$－ヘテロシクリルアルキル、（R^{18}）$_n$－アリール、（R^{18}）$_n$－アリールアルキル、（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールおよび（R^{18}）$_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{18}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、－NO_2、ハロ、ヘテロアリール、ＨＯ－アルキルオキシアルキル、－CF_3、－ＣＮ、アルキル－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）R^{19}、－Ｃ（Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{19}、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^{20}、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）NH_2－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）（アリール）、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）（ヘテロアリール）、－ＳR^{19}、－Ｓ（Ｏ）$_2$$R^{20}$、－Ｓ（Ｏ）$NH_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＨ（アルキル）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（アルキル）（アルキル）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨ（アリール）、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NH_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ$R^{19}$、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ（ヘテロシクリル）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（アルキル）（アリール）、－ＯＣ$F_3$、－ＯＨ、－Ｏ$R^{20}$、－Ｏ－ヘテロシクリル、－Ｏ－シクロアルキルアルキル、－Ｏ－ヘテロシクリルアルキル、－NH_2、－ＮＨR^{20}、－Ｎ（アルキル）$_2$、－Ｎ（アリールアルキル）$_2$、－Ｎ（アリールアルキル）－（ヘテロアリールアルキル）、－ＮＨＣ（Ｏ）R^{20}、－ＮＨＣ（Ｏ）NH_2、－ＮＨＣ（Ｏ）ＮＨ（アルキル）、－ＮＨＣ（Ｏ）Ｎ（アルキル）（アルキル）、－Ｎ（アルキル）Ｃ（Ｏ）ＮＨ（アルキル）、－Ｎ（アルキル）Ｃ（Ｏ）Ｎ（アルキル）（アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_2$$R^{20}$、－ＮＨＳ（Ｏ）$_2$ＮＨ（アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_2$Ｎ（アルキル）（アルキル）、－Ｎ（アルキル）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ（アルキル）および－Ｎ（アルキル）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（アルキル）（アルキル）からなる群から選択されるか；または

隣接する炭素上にある２個のR^{18}部分が結合して、

【化２３９】



を形成し；

R^{19}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{20}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ置換アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{21}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、

シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、＝Ｏ、＝Ｎ－Ｒ^{2}、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ハロ、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｐ（Ｏ）（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－ＳＯ（＝ＮＲ^{15}）Ｒ^{16}－、－ＳＦ$_{5}$、－ＯＳＦ$_{5}$、－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_{3}$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＣＨ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_{2}$－Ｒ^{15}；－ＣＨ$_{2}$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}、＝ＮＯＲ^{15}、－Ｎ$_{3}$、－ＮＯ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{15A}、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）および－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^{4}）$_{2}$（Ｒ^{4}と、これらが結合する炭素原子とが一緒になって、５～１０員の環を形成し、前記環が、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－および－ＮＲ^{2}－からなる群から選択される１～３個のヘテロ原子を場合により含有する）からなる群から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルであるＲ^{21}基が、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{22}基で場合により置換されており；

Ｒ^{22}基は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－アルキル－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_{2}$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｎ$_{3}$、＝ＮＯＲ^{15}、－ＮＯ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}および－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{15A}からなる群から選択され、

但し、環（Ａ）は、環に、－Ｓ－Ｓ－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－結合、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に－Ｏ－Ｏ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｏ－Ｓ－結合、－Ｏ－Ｓ（Ｏ）－結合、または－Ｏ－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｓ－Ｎ－結合を有しておらず；

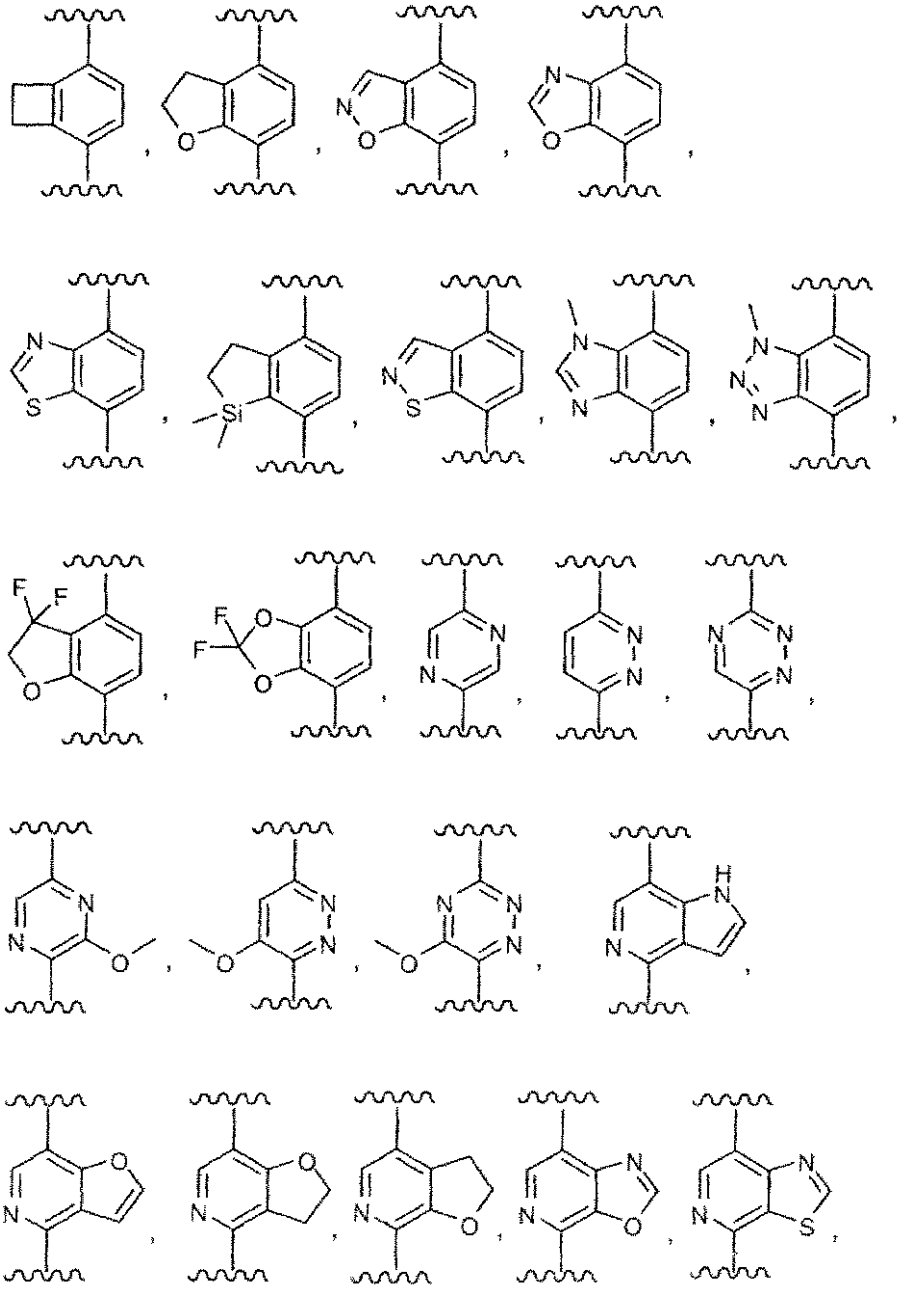
環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｏ－Ｎ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、隣接する３個の窒素原子を有していない］。

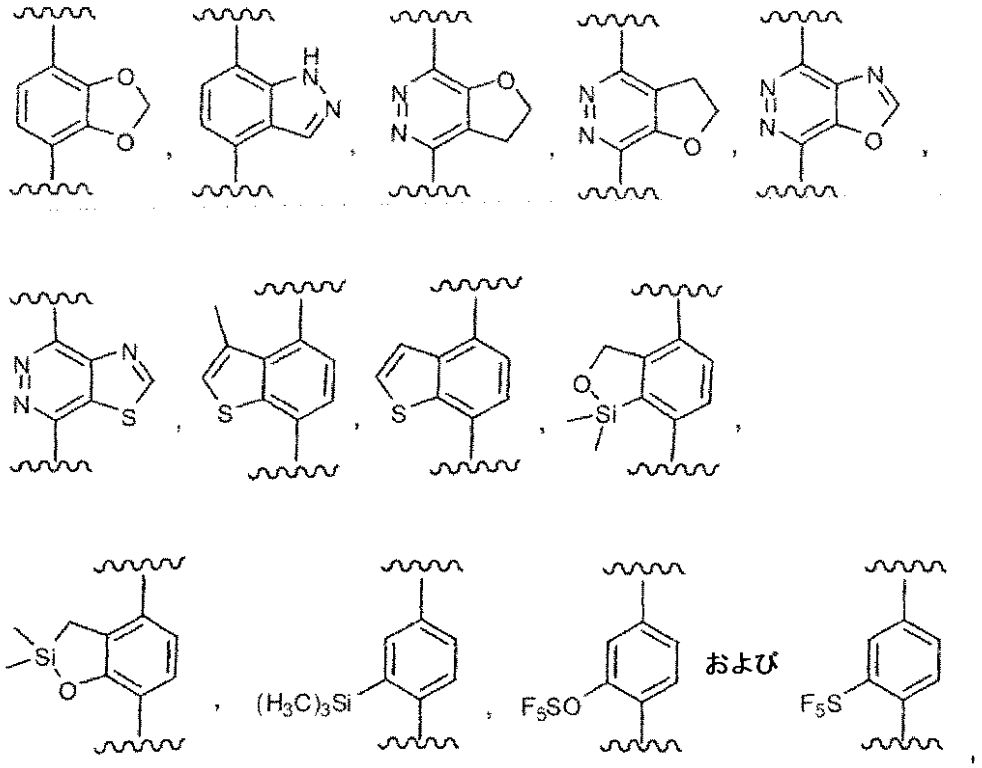
（項目２）

Ｒ^{10}が、

【化２４０】

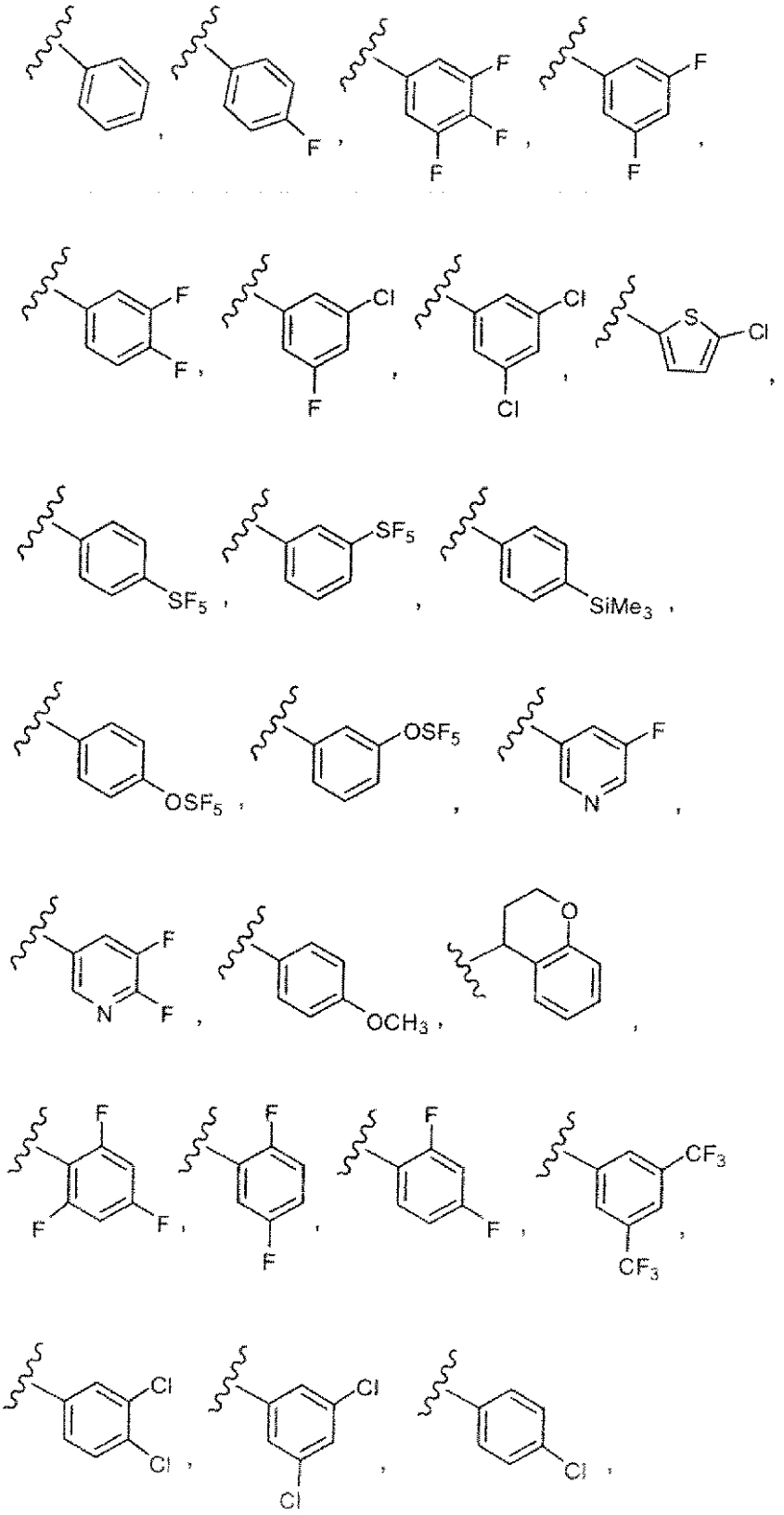


【化２４１】

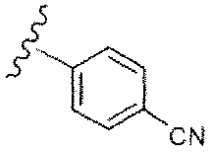


からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。
（項目３）
式（Ｉ）の化合物に、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）からなる群から選択される少なくとも１個の基が存在する、項目２に記載の化合物。
（項目４）
Ｒ^{9}が、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される、項目１に記載の化合物。
（項目５）
Ｒ^{9}が、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される、項目２に記載の化合物。
（項目６）
Ｒ^9－Ｒ^{10}－部分が、１ｂｂ～４０ｂｂからなる群から選択される、項目１に記載の化合物。
（項目７）
Ｒ^{1}が、

【化２４２】



【化２４３】

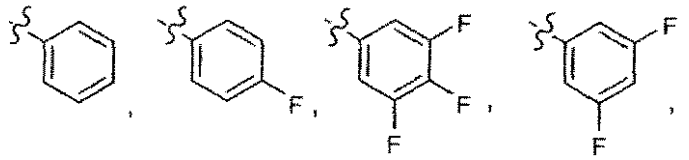
および 

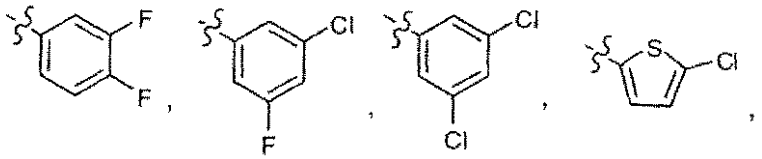
からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

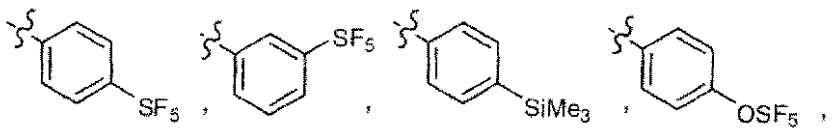
（項目８）

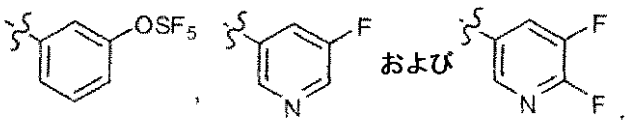
Ｒ^{1}が、

【化２４４】









からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目９）

Ｒ^{1}が、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}部分で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}部分が、－ＳＦ$_{5}$、－ＯＳＦ$_{5}$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_{3}$からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

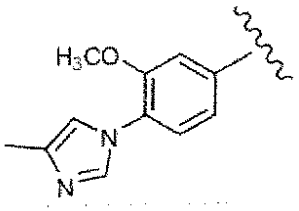
（項目１０）

Ｒ^{1}が、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}部分で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}部分が、－ＳＦ$_{5}$および－ＯＳＦ$_{5}$からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目１１）

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４５】

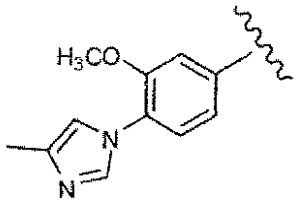


である、項目１に記載の化合物。

（項目１２）

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４６】

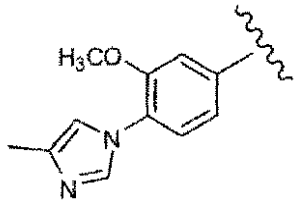


である、項目７に記載の化合物。

（項目１３）

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４７】

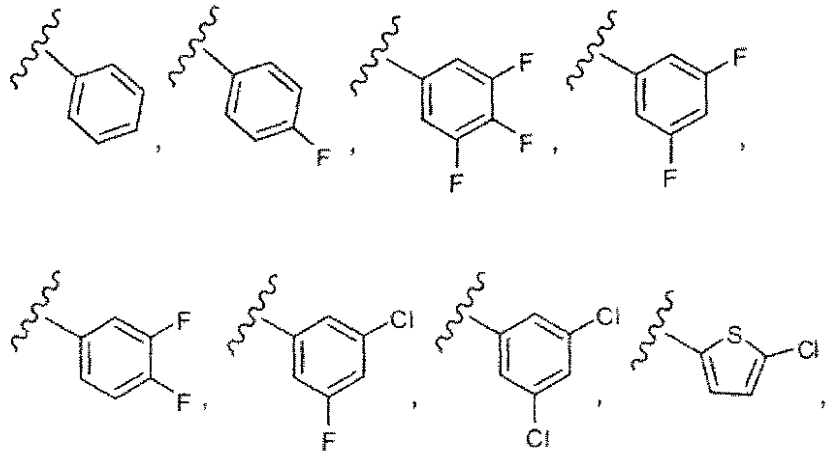


である、項目８に記載の化合物。

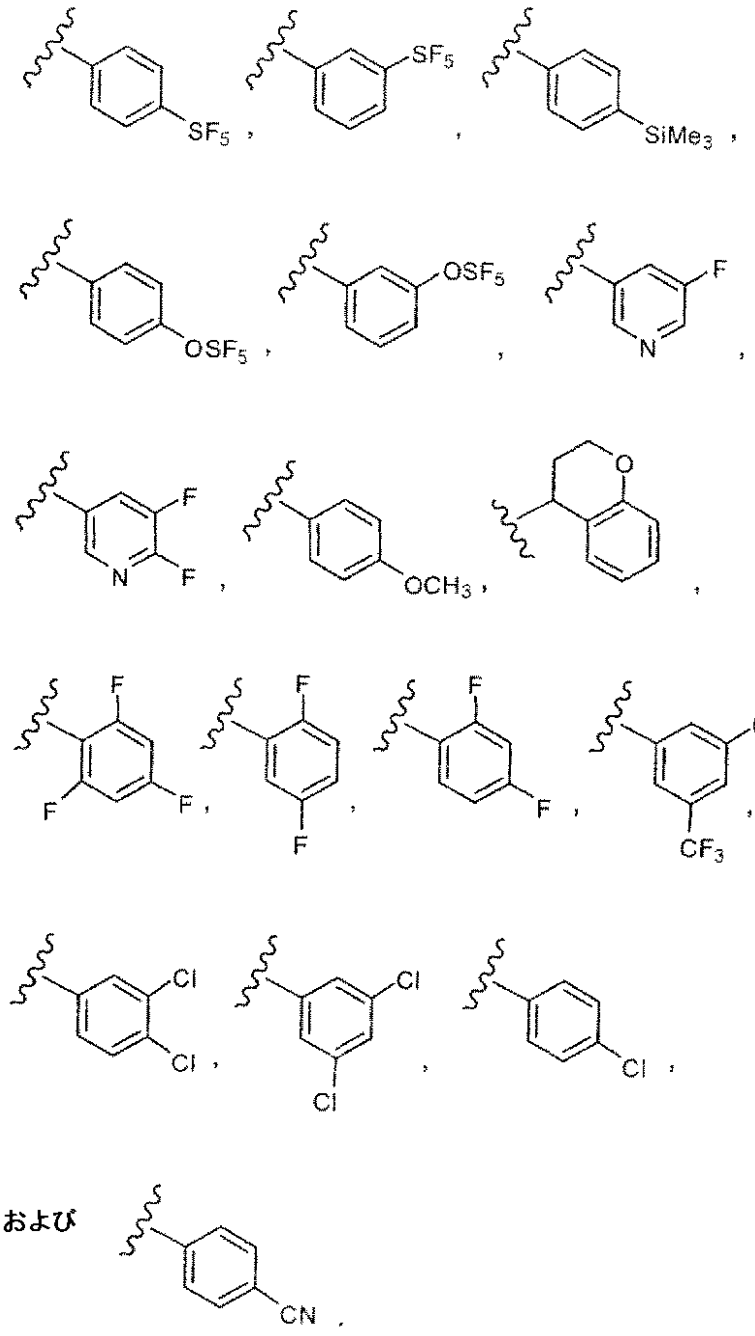
（項目１４）

Ｒ^{1}が、

【化２４８】



【化２４９】



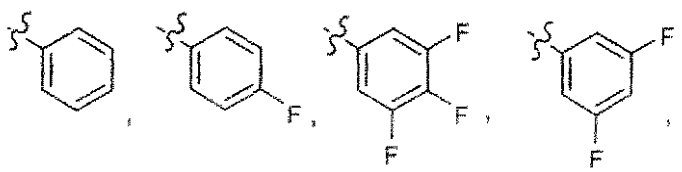
および

からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である、項目１に記載の化合物。

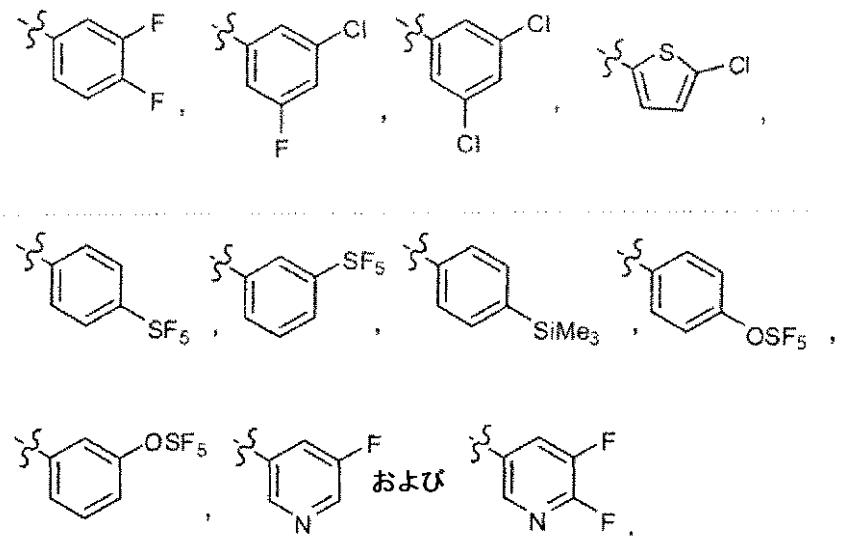
（項目１５）

Ｒ^{1}が、

【化２５０】



【化２５１】



からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である、項目１に記載の化合物。

（項目１６）

Ｒ[1]が、ＦおよびＣｌからなる群から独立して選択される１～３個のハロで置換されたフェニルで置換されたアルキル基である、項目１に記載の化合物。

（項目１７）

Ｒ[1]が、１～３個の独立して選択されるＲ[21]部分で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり、少なくとも１個のＲ[21]部分が、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ[15A]）$_3$からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目１８）

前記Ｒ[10]が、アリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記Ｒ[9]基が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択される、項目１に記載の化合物。

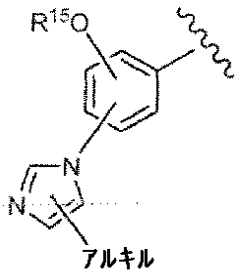
（項目１９）

前記Ｒ[10]が、１個のＲ[21]基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ[9]が、１個のＲ[21]基で置換されたイミダゾリルであり、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択される、項目１に記載の化合物。

（項目２０）

Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

【化２５２】

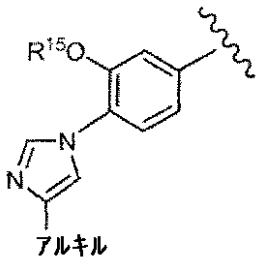


である、項目１に記載の化合物。

（項目２１）

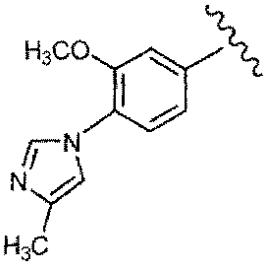
Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

【化２５３】



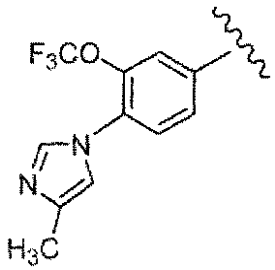
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５４】



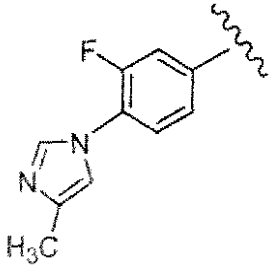
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５５】



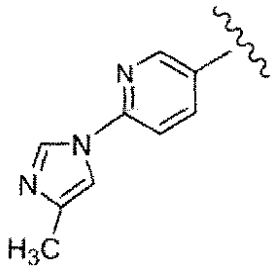
であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５６】

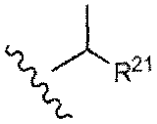


であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５７】

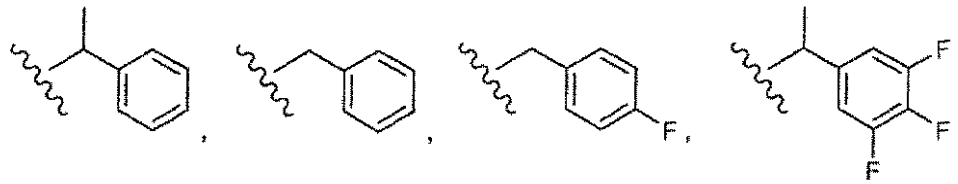


である、項目１に記載の化合物。
（項目２２）
前記Ｒ[1]基が、
【化２５８】

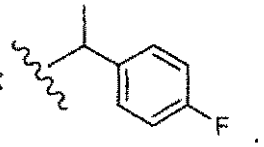


であり、Ｒ[21]が、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ[22]基で置換される、項目１に記載の化合物。
（項目２３）
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリールがフェニルであり、前記アルキル基が、メチルまたはエチルであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ[22]基で置換されており、各Ｒ[22]基が、同じハロであるか、または異なるハロであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ[22]基で置換されており、ハロがＦであるか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ[22]基で置換されているか；または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ[22]基で置換されており、ハロがＦである、項目１に記載の化合物。
（項目２４）
前記Ｒ[1]が、

【化２５９】



および



からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目２５）

前記Ｒ^{10}が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、前記Ｒ^{9}基が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ^{21}が、それぞれ独立して選択される、項目１に記載の化合物。

（項目２６）

（１）Ｒ^{1}が、１個のＲ^{21}基で置換されたアルキル基であるか、または

Ｒ^{1}が、１個のＲ^{21}基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ^{21}基が、１個以上の独立して選択されるＲ^{22}基で置換されており、

Ｒ^{10}が、アリール、および１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたアリールからなる群から選択され、

Ｒ^{9}が、ヘテロアリール、および１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択されるか；または

（２）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であるか、または

Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるＲ^{22}基で置換されており、

Ｒ^{10}が、フェニル、および１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、

Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（３）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるハロで置換されており、

Ｒ^{10}が、フェニル、および１個以上の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、

Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（４）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、

Ｒ^{10}が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}がアルキルであり、

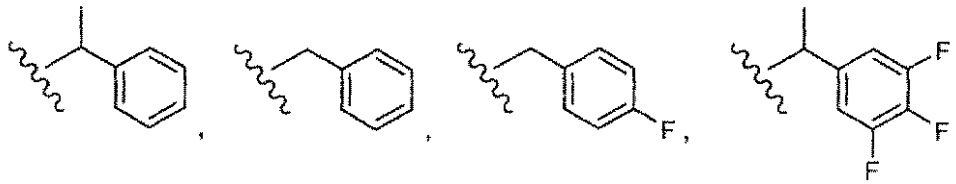
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（５）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

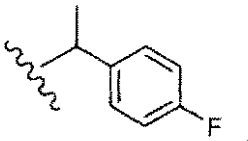
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが

、１個または２個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（６）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（７）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（８）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（９）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個の－ＯＲ^{15}基で置換されたフェニルであり、Ｒ^{15}がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１０）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、およびハロである１個または２個の独立して選択されるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１１）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のハロであるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１２）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のハロであるＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記Ｒ^{21}基がＦであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換

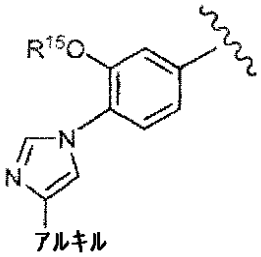
されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１３）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、フェニル、および１個のＲ^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記Ｒ^{21}基が－ＯＲ^{15}基であり、Ｒ^{15}が（Ｒ^{18}）$_{n}$アルキル基であり、Ｒ^{18}がハロであり、ｎが１～３であり、ハロがそれぞれ独立して選択され、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１４）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個のＲ^{21}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{21}が－ＯＲ^{15}基であり、Ｒ^{15}が（Ｒ^{18}）$_{n}$アルキル基であり、Ｒ^{18}がＦであり、ｎが３であり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１５）Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ^{1}が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ^{10}が、１個のＲ^{21}基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ^{21}基が－ＯＲ^{15}基であり、Ｒ^{15}が（Ｒ^{18}）$_{n}$アルキル基であり、Ｒ^{18}がＦであり、ｎが３であり、アルキル基がメチルであり、
Ｒ^{9}が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１６）Ｒ^{1}が、
【化２６０】



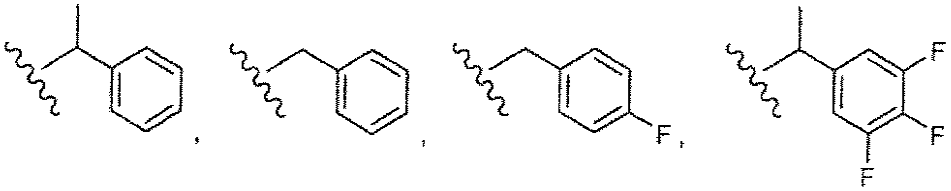
および



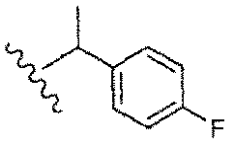
からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２６１】



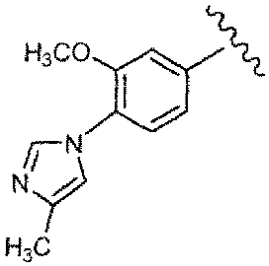
であるか；または
（１７）Ｒ[1]が、
【化２６２】



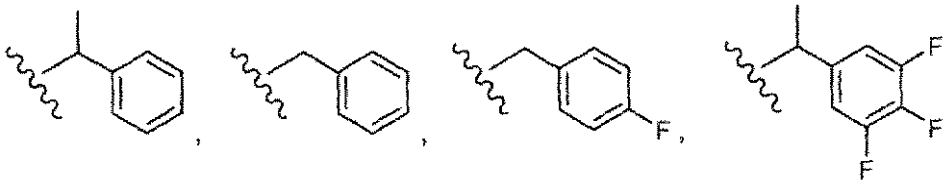
【化２６３】

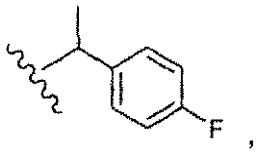
および 

からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、
【化２６４】



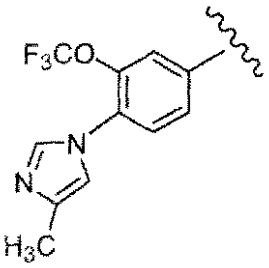
であるか；または
（１８）Ｒ[1]が、
【化２６５】



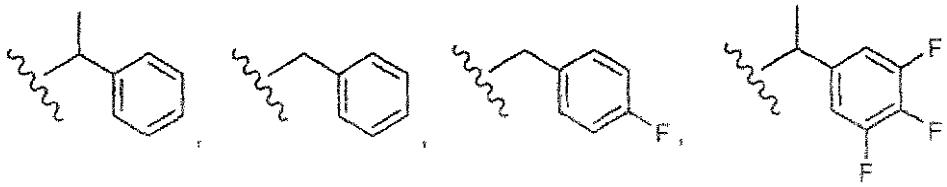
および 

からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、

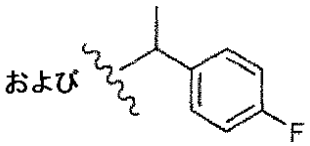
【化２６６】



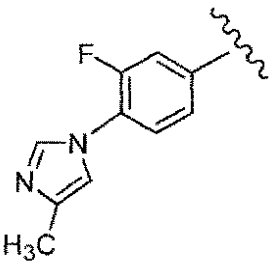
であるか；または
（１９）Ｒ[1]が、
【化２６７】



【化２６８】

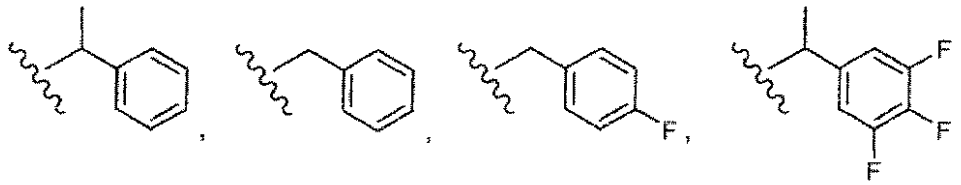


からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、
【化２６９】

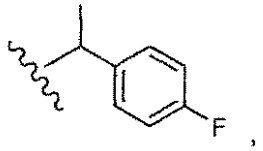


であるか；または
（２０）Ｒ[1]が、

【化２７０】

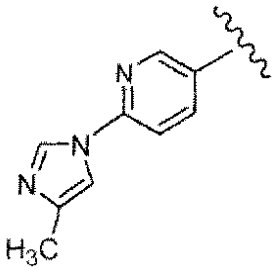


および



からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２７１】



である、項目１に記載の化合物。

（項目２７）

Ｇ^{5}が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目２８）

Ｇ^{5}が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｇ^{6}が、ＣおよびＣＨからなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目２９）

ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３０）

４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３１）

ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、およびＩＢからなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３２）

４３Ａ～５４Ａからなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３３）

４３～５４からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３４）

８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、項目１に記載の化合物。

（項目３５）

前記化合物が８５．１である、項目１に記載の化合物。

（項目３６）

前記化合物が８８．１である、項目１に記載の化合物。
（項目３７）
前記化合物が９１．１である、項目１に記載の化合物。
（項目３８）
前記化合物が１００である、項目１に記載の化合物。
（項目３９）
前記化合物が１０１である、項目１に記載の化合物。
（項目４０）
前記化合物が１０２である、項目１に記載の化合物。
（項目４１）
前記化合物が１０３である、項目１に記載の化合物。
（項目４２）
前記化合物が１０４である、項目１に記載の化合物。
（項目４３）
前記化合物が１０５である、項目１に記載の化合物。
（項目４４）
前記化合物が１０６である、項目１に記載の化合物。
（項目４５）
前記化合物が１０７である、項目１に記載の化合物。
（項目４６）
前記化合物が１０８である、項目１に記載の化合物。
（項目４７）
前記化合物が１０９である、項目１に記載の化合物。
（項目４８）
前記化合物が１１０である、項目１に記載の化合物。
（項目４９）
前記化合物が１１１である、項目１に記載の化合物。
（項目５０）
前記化合物が１１２である、項目１に記載の化合物。
（項目５１）
前記化合物が１１３である、項目１に記載の化合物。
（項目５２）
前記化合物が１１４である、項目１に記載の化合物。
（項目５３）
前記化合物が１１５である、項目１に記載の化合物。
（項目５４）
前記化合物が１１６である、項目１に記載の化合物。
（項目５５）
前記化合物が１１７である、項目１に記載の化合物。
（項目５６）
前記化合物が１１８である、項目１に記載の化合物。
（項目５７）
前記化合物が１１９である、項目１に記載の化合物。
（項目５８）
前記化合物が１２０である、項目１に記載の化合物。
（項目５９）
前記化合物が１２１である、項目１に記載の化合物。
（項目６０）
前記化合物が１２２である、項目１に記載の化合物。
（項目６１）

前記化合物が１２３である、項目１に記載の化合物。
（項目６２）
前記化合物が１２４である、項目１に記載の化合物。
（項目６３）
式（ＩＡ）を有する、項目１に記載の化合物。
（項目６４）
式（ＩＢ）を有する、項目１に記載の化合物。
（項目６５）
純粋で単離された形態である、項目１に記載の化合物。
（項目６６）
純粋で単離された形態である、項目３４に記載の化合物。
（項目６７）
項目１に記載の化合物の医薬的に許容される塩。
（項目６８）
項目３４に記載の化合物の医薬的に許容される塩。
（項目６９）
項目１に記載の化合物の溶媒和物。
（項目７０）
項目３４に記載の化合物の溶媒和物。
（項目７１）
項目１に記載の化合物の医薬的に許容されるエステル。
（項目７２）
項目３４に記載の化合物の医薬的に許容されるエステル。
（項目７３）
治療有効量の項目１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む、医薬組成物。
（項目７４）
治療有効量の項目３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアとを含む、医薬組成物。
（項目７５）
治療有効量の項目１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む、医薬組成物。
（項目７６）
治療有効量の項目３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む、医薬組成物。
（項目７７）
治療有効量の項目１に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む、医薬組成物。
（項目７８）
治療有効量の項目３４に記載の化合物と、医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む、医薬組成物。
（項目７９）

（１）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物、または
（２）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、（ａ）アルツハイマー病の処置に有用な薬物、（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質（例えば、アミロイドβタンパク質）が沈着するのを阻害するのに有用な薬物、（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有用な薬物、および（ｄ）γ－セクレターゼを阻害するのに有用な薬物からなる群から選択される、有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する薬物とを含む医薬組成物、または
（３）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む医薬組成物、または
（４）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤とを含む医薬組成物、または
（５）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤とを含む医薬組成物、または
（６）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤とを含む医薬組成物、または
（７）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤とを含む医薬組成物、または
（８）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の塩酸ドネペジルとを含む医薬組成物、または
（９）治療有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物と、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の塩酸ドネペジルとを含む医薬組成物。
（項目８０）
有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、γ－セクレターゼを調節する方法。
（項目８１）
有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む

、１つ以上の神経変成疾患を処置する方法。
（項目８２）
有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害する方法。
（項目８３）
有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８４）
有効量の項目３４に記載の１つ以上の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８５）
有効量の項目１に記載の１種の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８６）
有効量の項目３４に記載の１種の化合物を、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８７）
（１）有効量の項目１に記載の少なくとも１つの化合物と、
（２）ＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上の他の医薬活性を有する成分とを、処置の必要な患者に投与する工程を含む、（ａ）γ－セクレターゼを調節する方法、または（ｂ）１つ以上の神経変性疾患を処置する方法、または（ｃ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害する方法、または（ｄ）アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８８）
有効量の項目１に記載の１種類の化合物と、Ａβ抗体阻害剤、γ－セクレターゼ阻害剤およびβ－セクレターゼ阻害剤から選択される有効量の１つ以上の化合物とを、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目８９）
有効量の項目１に記載の１種類の化合物と、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを、処置が必要な患者に投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法。
（項目９０）
（１）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（３）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１種類の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（４）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１種類の化合物を、有効量の塩酸

ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（５）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のリバスティグミンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（６）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のタクリンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（７）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のＴａｕキナーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（８）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、ＧＳＫ３β阻害剤、ｃｄｋ５阻害剤、ＥＲＫ阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上のＴａｕキナーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（９）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１種類の抗－Ａβワクチン接種と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１０）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＡＰＰリガンドと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１１）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、インスリン分解酵素および／またはネプリライシンをアップレギュレーションする有効な量の１つ以上の薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１２）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のコレステロール値低下剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１３）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、アトルバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、シンバスタチン、およびエゼチミブからなる群から選択される有効量の１つ以上のコレステロール値低下薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１４）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のフィブラートと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１５）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、クロフィブラート、クロフィブリド、エトフィブラート、アルミニウムクロフィブラートからなる群から選択される有効量の１つ以上のフィブラートと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１６）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＬＸＲアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１７）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＬＲＰ模倣物と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

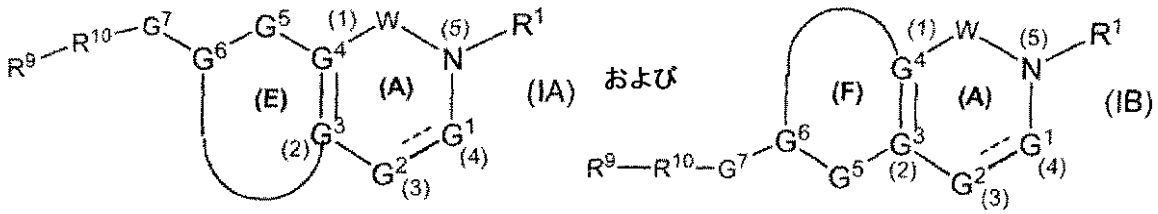
（１８）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または

（１９）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のニコチン性受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイ

マー病を処置する方法、または
（２０）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＨ３受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２１）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のヒストンデアセチラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２２）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｈｓｐ９０阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２３）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｍ１ムスカリン受容体アゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２４）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上の５－ＨＴ６受容体アンタゴニストｍＧｌｕＲ１またはｍＧｌｕＲ５のポジティブアロステリックモジュレーターまたはアゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２５）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のｍＧｌｕＲ２／３アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２６）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、神経炎症を減らすことが可能な有効量の１つ以上の抗炎症剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２７）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のプロスタグランジンＥＰ２受容体アンタゴニストと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２８）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のＰＡＩ－１阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（２９）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、Ａβ流出を誘導することが可能な有効量の１つ以上の薬剤と組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（３０）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量のゲルゾリンと組み合わせて投与する工程を含む、アルツハイマー病を処置する方法、または
（３１）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３２）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１種類の化合物を投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３３）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３４）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３５）処置が必要な患者に、有効量の１つ以上の項目１に記載の１種類の化合物を、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤と組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または
（３７）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１種類の化合物を、有効量の塩酸ドネペジルと組み合わせて投与する工程を含む、ダウン症候群を処置する方法、または

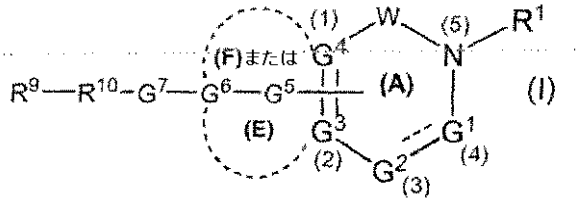
（３８）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、軽度認知障害を処置する方法、または
（３９）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、緑内障を処置する方法、または
（４０）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、脳アミロイド血管症を処置する方法、または
（４１）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、卒中を処置する方法、または
（４２）本発明は、処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、認知症を処置する方法を提供するか、または
（４３）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、小膠細胞症を処置する方法、または
（４４）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、脳の炎症を処置する方法、または
（４５）処置が必要な患者に、有効量の項目１に記載の１つ以上の化合物を投与する工程を含む、嗅覚機能の低下を処置する方法。
（項目９１）
別個の容器に入れられ、１個の包装に入れられた、組み合わせて使用するための医薬組成物を含み、１つの容器は、医薬的に許容されるキャリアに有効量の項目１に記載の１種類の化合物を加えたものを含み、別の容器は、有効量の別の医薬活性を有する成分を含み、項目１に記載の化合物と、他の医薬活性を有する成分とを合わせた量が、（ａ）アルツハイマーを処置するのに有効であるか、または（ｂ）神経組織内部、神経組織表面または神経組織周囲にアミロイドタンパク質が沈着するのを阻害するのに有効であるか、または（ｃ）神経変性疾患を処置するのに有効であるか、または（ｄ）γ－セクレターゼ活性を調節するのに有効である、キット。

【手続補正２】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
以下の化合物
【化２３６】



からなる群から選択される式（Ｉ）の化合物

【化２３５】



またはその医薬的に許容される塩、エステルまたは溶媒和物：

〔式中、G^1、G^2、G^3、G^4、W、R^1、環（Ａ）、環（Ｅ）、環（Ｆ）、G^5、G^6、G^7、R^9、およびR^{10}は、独立して選択され；

式中の文字（Ａ）、（Ｅ）、および（Ｆ）は、前記環を特定するための参照文字であり；

G^1とG^2との間にある点線は、任意の結合をあらわし；

数字（１）、（２）、（３）、（４）および（５）は、環（Ａ）の位置を特定するための参照番号であり；G^4は、位置（１）にあり、G^3は、位置（２）にあり、G^2は、位置（３）にあり、G^1は、位置（４）にあり、Ｎは、位置（５）にあり；

G^5がG^4に結合している場合（式ＩＡ）、G^4は、－Ｃ－であり、G^5がG^3に結合している場合（式ＩＢ）、G^3は、－Ｃ－であり；

前記環（Ｅ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^3はＮであり、G^4はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｅ）に対して互変異性化し、

前記環（Ｆ）において、（ａ）G^3はＣであり、G^4はＣであるか、または（ｂ）G^4はＮであり、G^3はＣであり、G^3とG^4との間にある二重結合は、環（Ｆ）に対して互変異性化し；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、４～１０員のヘテロアリール環、アリール環、シクロアルケニル環、またはヘテロシクロアルケニル環であり；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）がヘテロシクロアルケニル環またはヘテロアリール環である場合、前記環は、場合により、－NR^2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－および－$S(O)_2$－からなる群から選択される少なくとも１個の他のヘテロ原子を含み；

前記環（Ｅ）または前記環（Ｆ）は、場合により、１～６個の独立して選択されるR^{21}置換基で置換されており；

ｄは、０または１であり；

ｍは、０～６であり；

ｎは、１～５であり；

ｐは、０～５であり；

ｑは、０、１または２であり、ｑは、それぞれ独立して選択され；

ｒは、１～３であり；

ｔは、１または２であり、

Ｗは、－Ｃ（Ｏ）－、－$S(O)_2$－、－Ｓ（Ｏ）－および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；

G^1は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－$C(R^{21})_q$－、－$N(R^2)_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、$S(O)_2$、－$C(N(R^2)_2)$－（R^2は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；但し、

（１）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在しない場合、G^1は、－$C(N(R^2)_2)$－ではなく；

（２）G^1とG^2との間に、任意の結合が存在する場合、

（ａ）－$C(R^{21})_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、

（ｂ）－$N(R^2)_d$－基のｄは、０であり（G^1とG^2との間にある二重結合によ

って、Ｎ上にＨは存在しない）、
（ｃ）G^1は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝NR^2）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
G^2は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（R^{21}）$_q$、－Ｎ（R^2）$_d$－、－Ｃ（Ｏ）－、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$、－Ｃ（Ｎ（R^2）$_2$）－（R^2は、それぞれ独立して選択される）、および－Ｃ（＝NR^2）－からなる群から選択され；但し、
（１）G^1とG^2との間に、前記任意の結合が存在しない場合、G^2は、－Ｃ（Ｎ（R^2）$_2$）－ではなく；
（２）G^1とG^2との間に、前記任意の結合が存在する場合、
（ａ）－Ｃ（R^{21}）$_q$基のｑは、０または１であり（ｑが０の場合、炭素上にＨが存在し）、
（ｂ）－Ｎ（R^2）$_d$－基のｄは、０であり、
（ｃ）G^2は、直接結合、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（＝NR^2）－）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、または－Ｓ（Ｏ）－ではなく；
G^5は、直接結合、ＣＨ、－Ｃ（R^{21}）$_q$、－Ｎ（R^2）$_d$、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_t$、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝NR^2）－、－CHR^3－、Ｃ（R^4）$_2$、－CF_2－、－Ｎ（R^2）－、－CR^4（ＯＨ）－、－CR^4（OR^4）－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
G^6は、Ｃ、CR^3、およびＮからなる群から選択され；
G^7は、直接結合、－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ＝NR^2）－、－CHR^3－、Ｃ（R^4）$_2$、－CF_2－、－Ｎ（R^2）－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）$_t$、－CR^4（ＯＨ）－、－CR^4（OR^4）－、－Ｃ＝Ｃ－、アルキニル、－（CH_2）$_r$Ｎ（R^2）－、－（CHR^4）$_r$Ｎ（R^2）－、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$Ｎ（R^2）－、－Ｎ（R^2）（CH_2）$_r$－、－Ｎ（R^2）（CHR^4）$_r$－、－Ｎ（R^2）（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－、－（CH_2）$_r$－Ｏ－、－（CHR^4）$_r$－Ｏ－、－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－Ｏ－、－Ｏ－（CH_2）$_r$－、－Ｏ－（CHR^4）$_r$－、－Ｏ－（Ｃ（R^4）$_2$）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）NR^5－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－NR^5－、－NR^5Ｃ（Ｏ）－、－（CH_2）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－、－（$CHR^4$）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－、－（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_r$$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）$NR^5$（$CH_2$）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）$NR^5$（$CHR^4$）$_r$－、－Ｃ（Ｏ）$NR^5$（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_r$－、－$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（$CH_2$）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（$CHR^4$）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－、－（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_r$$NR^5$Ｓ（Ｏ）$_t$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$（$CH_2$）$_r$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$（$CHR^4$）$_r$－、－Ｓ（Ｏ）$_t$$NR^5$（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_r$－、－$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－$NR^5$－Ｃ（Ｏ）－$NR^5$－、－$NR^5$－Ｓ（Ｏ）$_t$－$NR^5$－、－$NR^5$－Ｃ（＝$NR^2$）－$NR^5$－、－$NR^5$－Ｃ（＝$NR^2$）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（＝$NR^2$）－$NR^5$－、－Ｃ（$R^4$）＝Ｎ－Ｏ－、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（$R^4$）－、－Ｏ－Ｃ（$R^4$）＝Ｎ－、－Ｎ＝Ｃ（$R^4$）－Ｏ－、－（$CH_2$）$_2$－、－（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_2$－、－（$CHR^4$）$_2$－、－（$CH_2$）$_3$－、－（Ｃ（$R^4$）$_2$）$_3$－、－（$CHR^4$）$_3$－、シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルからなる群から選択され；
但し、G^1、G^2、G^3およびG^4部分のうち０～２個が－Ｎ（R^2）$_d$－であり、R^2は、それぞれ独立して選択され、ｄは、それぞれ独立して選択され、但し、環（Ａ）は、連続した３個の環窒素原子を有しておらず；
R^1は、アルキル－、アルケニル－、アルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテ

ロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、前記アルキル－、アルケニル－、およびアルキニル－、アリール－、アリールアルキル－、アルキルアリール－、シクロアルキル－、シクロアルケニル－、シクロアルキルアルキル－、縮合ベンゾシクロアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル、縮合シクロアルキルアリール、縮合ヘテロシクロアルキルアリール、縮合シクロアルキルヘテロアリール、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール、縮合ベンゾシクロアルキルアルキル、縮合ベンゾヘテロシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールシクロアルキルアルキル、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキルアルキル、縮合シクロアルキルアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルアリールアルキル、縮合シクロアルキルヘテロアリールアルキル、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリールアルキル、ヘテロアリール－、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル－であるR^1基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^2は、それぞれ独立して、Ｈ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^3は、Ｈ、－ＯＨ、ハロ、－Ｏ－アルキル、－Ｏ－（ハロ置換アルキル）、－ＮＨ（R^4）、－Ｎ（R^4）$_2$、－NH_2、－Ｓ（R^4）、－Ｓ（Ｏ）R^4、－Ｓ（Ｏ）（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｓ（Ｏ）$_2$（ＯR^4）、－Ｓ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）NH_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨR^4、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^4）$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2NH_2$、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）$_2R^4$、－Ｃ（Ｏ）ＮＨR^4、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^4）$_2$、－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（Ｏ）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

R^4は、それぞれ独立して、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

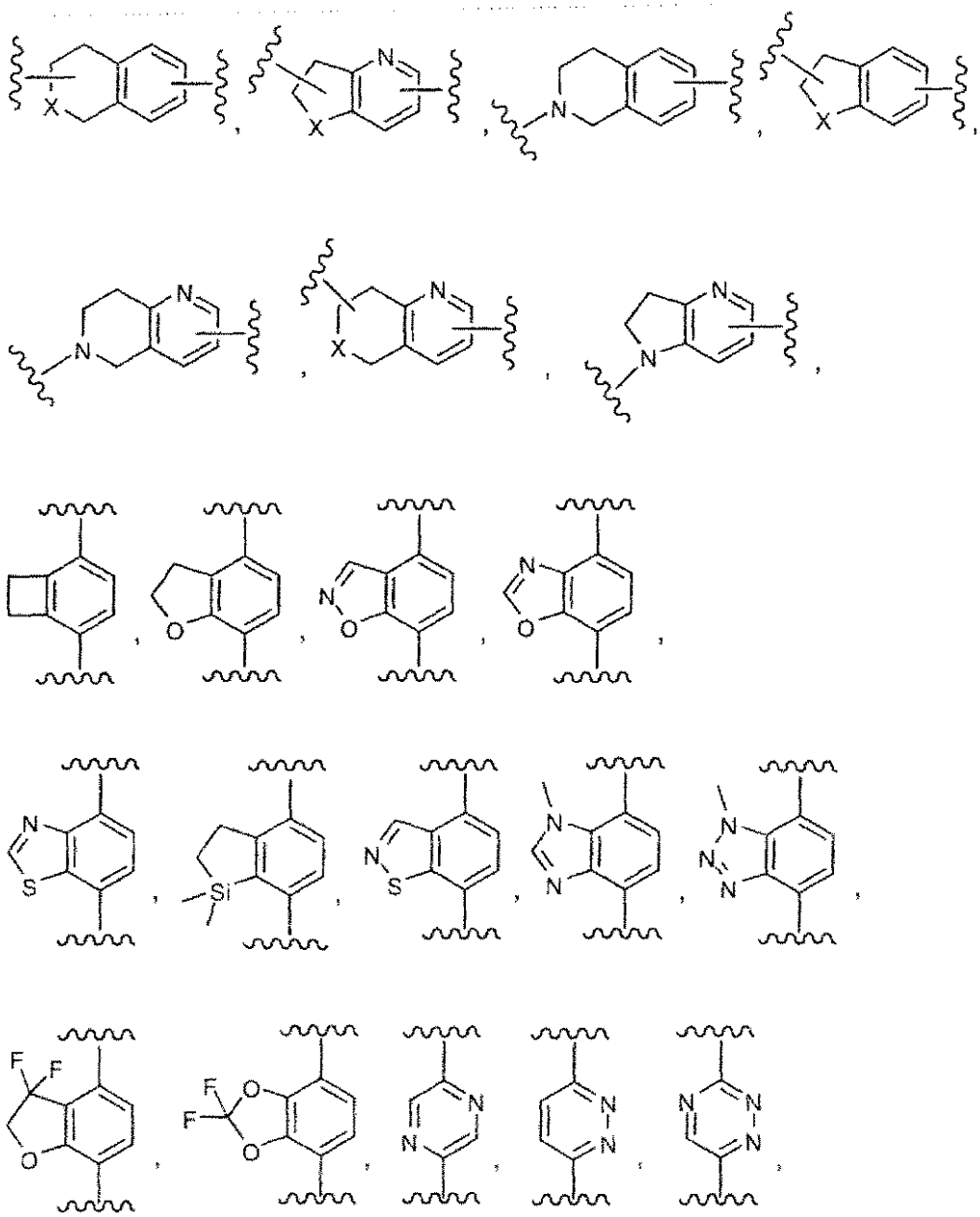
R^5は、それぞれ独立して、H、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、置換シクロアルキル、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールからなる群から選択され、前記置換基は、R^2から独立して選択される１個以上の（例えば、１～５個の）置換基で置換されており；

R^6は、それぞれ独立して、H、ハロ、－CF_3、－O－アルキル、－O－（ハロ置換アルキル）、－S（O）R^4、－S（O）（OR^4）、－S（O）NHR^4、－S（O）$N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－S（O）NH_2、－S（O）$_2NHR^4$、－S（O）$_2N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－S（O）$_2NH_2$、－C（＝NOR^{24}）R^{25}、および－S（O）$_2R^{24}$、－CN、－C（O）$_2R^4$、－C（O）NHR^4、－C（O）$N(R^4)_2$（R^4は、それぞれ独立して選択される）、－C（O）NH_2、－C（O）R^4、非置換アリール、置換アリール、非置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、非置換アルキル、置換アルキル、非置換アリールアルキル－、置換アリールアルキル－、非置換ヘテロアリールアルキル－、置換ヘテロアリールアルキル－、非置換アルケニル、置換アルケニル、非置換アルキニル、置換アルキニル、非置換シクロアルキル、および置換シクロアルキルからなる群から選択され、前記置換アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、アルケニル基、アルキニル基およびシクロアルキル基は、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で置換されており；

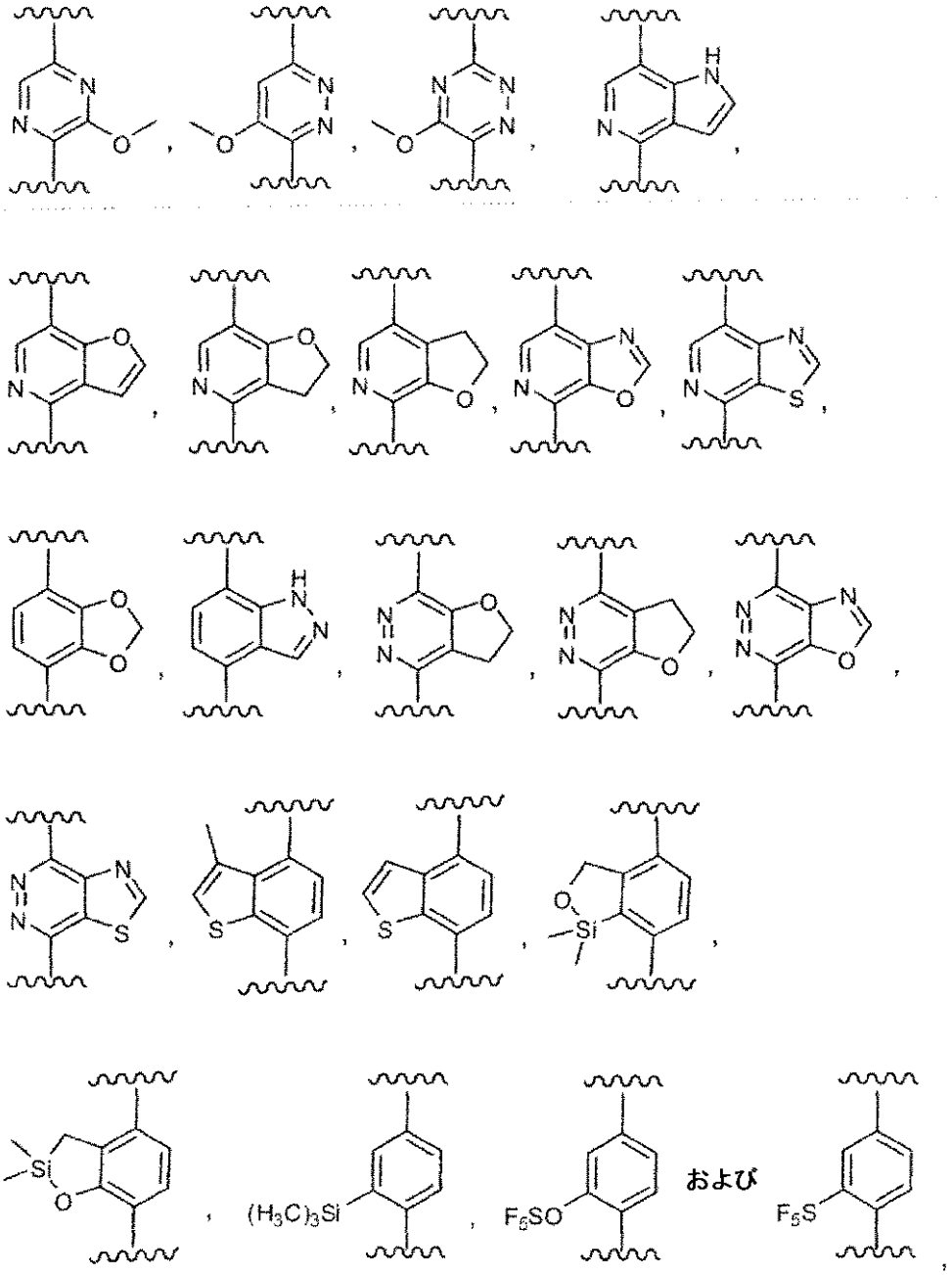
R^9は、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－からなる群から選択され、アリールアルコキシ－、ヘテロアリールアルコキシ－、アリールアルキルアミノ－、ヘテロアリールアルキルアミノ－、アリール、アリールアルキル－、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル－、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、およびヘテロシクリルアルキル－である前記R^9は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるR^{21}基で場合により置換されており；

R^{10}は、アリール－（例えば、フェニル）、ヘテロアリール－（例えば、ピリジル）、シクロアルキル－、シクロアルケニル、シクロアルキルアルキル－、ヘテロシクリル－、ヘテロシクレニル－、ヘテロシクリルアルキル－、ヘテロシクリルアルケニル－、縮合ベンゾシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合シクロアルキル－）、縮合ベンゾヘテロシクロアルキル－（すなわち、ベンゾ縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合シクロアルキル－）、縮合ヘテロアリールヘテロシクロアルキル－（すなわち、ヘテロアリール縮合ヘテロシクロアルキル－）、縮合シクロアルキルアリール（すなわち、シクロアルキル縮合アリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合アリール－）、縮合シクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、シクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、縮合ヘテロシクロアルキルヘテロアリール－（すなわち、ヘテロシクロアルキル縮合ヘテロアリール－）、

【化２３７】



【化２３８】



からなる群から選択され、式中、Ｘは、Ｏ、－Ｎ（Ｒ^{14}）－および－Ｓ－からなる群から選択され、Ｒ^{10}部分は、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{21}基で場合により置換されているか；または

Ｒ^{9}とＲ^{10}とが結合して、縮合三環系を形成し、Ｒ^{9}およびＲ^{10}は、先に定義したとおりであり、Ｒ^{9}とＲ^{10}とを結合する環は、アルキル環またはヘテロアルキル環またはアリール環またはヘテロアリール環またはアルケニル環またはヘテロアルケニル環であり（例えば、前記三環系は、Ｒ^{9}とＲ^{10}の両方を結合している原子に隣接する原子を結合することによって形成され）；

Ｒ^{14}は、Ｈ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクレニル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル－、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、および－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）

からなる群から選択され；

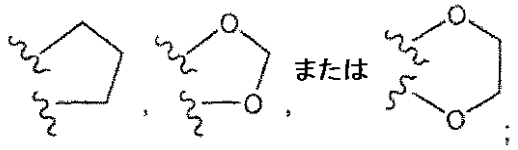
R^{15A}およびR^{16A}は、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－アルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキルアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリルアルキル、$(R^{18})_n$－アリール、$(R^{18})_n$－アリールアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロアリールおよび$(R^{18})_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択されるか；または

R^{15}、R^{16}およびR^{17}は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールシクロアルキル、アリールヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－アルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキル、$(R^{18})_n$－シクロアルキルアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリル、$(R^{18})_n$－ヘテロシクリルアルキル、$(R^{18})_n$－アリール、$(R^{18})_n$－アリールアルキル、$(R^{18})_n$－ヘテロアリールおよび$(R^{18})_n$－ヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{18}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、$-NO_2$、ハロ、ヘテロアリール、HO－アルキルオキシアルキル、$-CF_3$、－CN、アルキル－CN、$-C(O)R^{19}$、$-C(O)OH$、$-C(O)OR^{19}$、$-C(O)NHR^{20}$、$-C(O)NH_2$、$-C(O)NH_2-C(O)N$（アルキル）$_2$、$-C(O)N$（アルキル）（アリール）、$-C(O)N$（アルキル）（ヘテロアリール）、$-SR^{19}$、$-S(O)_2R^{20}$、$-S(O)NH_2$、$-S(O)NH$（アルキル）、$-S(O)N$（アルキル）（アルキル）、$-S(O)NH$（アリール）、$-S(O)_2NH_2$、$-S(O)_2NHR^{19}$、$-S(O)_2NH$（ヘテロシクリル）、$-S(O)_2N$（アルキル）$_2$、$-S(O)_2N$（アルキル）（アリール）、$-OCF_3$、$-OH$、$-OR^{20}$、－O－ヘテロシクリル、－O－シクロアルキルアルキル、－O－ヘテロシクリルアルキル、$-NH_2$、$-NHR^{20}$、$-N$（アルキル）$_2$、$-N$（アリールアルキル）$_2$、$-N$（アリールアルキル）－（ヘテロアリールアルキル）、$-NHC(O)R^{20}$、$-NHC(O)NH_2$、$-NHC(O)NH$（アルキル）、$-NHC(O)N$（アルキル）（アルキル）、$-N$（アルキル）C（O）NH（アルキル）、$-N$（アルキル）C（O）N（アルキル）（アルキル）、$-NHS(O)_2R^{20}$、$-NHS(O)_2NH$（アルキル）、$-NHS(O)_2N$（アルキル）（アルキル）、$-N$（アルキル）$S(O)_2NH$（アルキル）および－N（アルキル）$S(O)_2N$（アルキル）（アルキル）からなる群から選択されるか；または

隣接する炭素上にある２個のR^{18}部分が結合して、

【化２３９】



を形成し；

R^{19}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{20}は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ置換アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；

R^{21}は、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、＝O、$=N-R^2$、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテ

ロアリールアルキル、ハロ、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｐ（Ｏ）（ＣＨ$_3$）$_2$、－ＳＯ（＝ＮＲ^{15}）Ｒ^{16}－、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_3$（Ｒ^{15A}は、それぞれ独立して選択される）、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＣＨ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｒ^{15}；－ＣＨ$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}、＝ＮＯＲ^{15}、－Ｎ$_3$、－ＮＯ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{15A}、－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）$_2$（Ｒ^{4}は、それぞれ独立して選択される）および－Ｏ－Ｎ＝Ｃ（Ｒ^4）$_2$（Ｒ^{4}と、これらが結合する炭素原子とが一緒になって、５～１０員の環を形成し、前記環が、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－ＮＲ^2－からなる群から選択される１～３個のヘテロ原子を場合により含有する）からなる群から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルであるＲ^{21}基が、それぞれ、１～５個の独立して選択されるＲ^{22}基で場合により置換されており；

Ｒ^{22}基は、それぞれ独立して、アルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロ、－ＣＦ$_3$、－ＣＮ、－ＯＲ^{15}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－アルキル－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｃ（＝ＮＯＲ^{15}）Ｒ^{16}、－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ^{15}）（ＯＲ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－アルキル－Ｎ（Ｒ^{15}）（Ｒ^{16}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｒ^{16}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{16A}、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｓ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ^{16}）（Ｒ^{17}）、－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｒ^{15}）Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－Ｎ$_3$、＝ＮＯＲ^{15}、－ＮＯ$_2$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15A}および－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ^{15A}からなる群から選択され、

但し、環（Ａ）は、環に、－Ｓ－Ｓ－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）－結合、－Ｓ（Ｏ）－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に－Ｏ－Ｏ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｏ－Ｓ－結合、－Ｏ－Ｓ（Ｏ）－結合、または－Ｏ－Ｓ（Ｏ）$_2$－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｓ－Ｎ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、－Ｎ－Ｏ－Ｎ－結合を有しておらず；

環（Ａ）は、環に、隣接する３個の窒素原子を有していない〕。

【請求項２】

Ｒ^{9}が、１ｇｇ～１３ｇｇからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

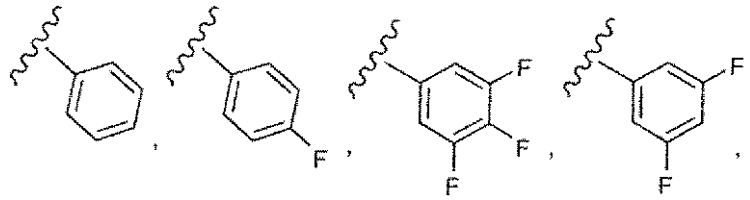
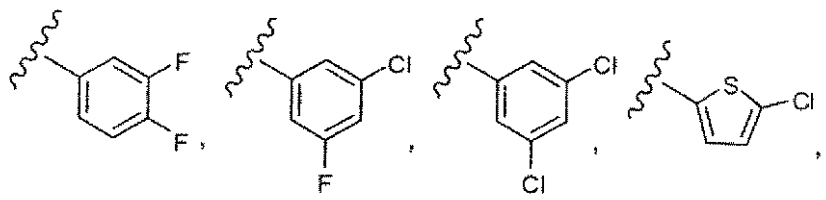
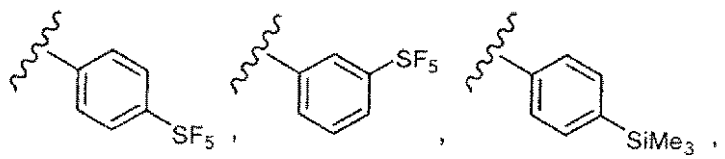
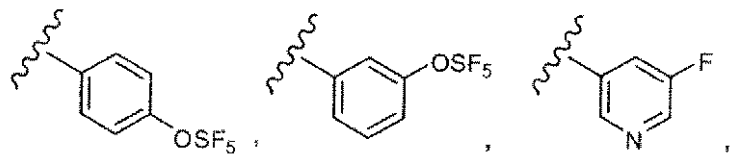
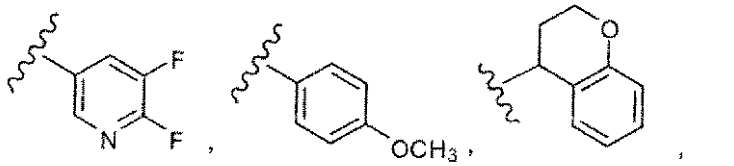
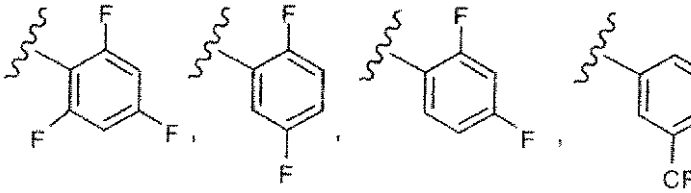
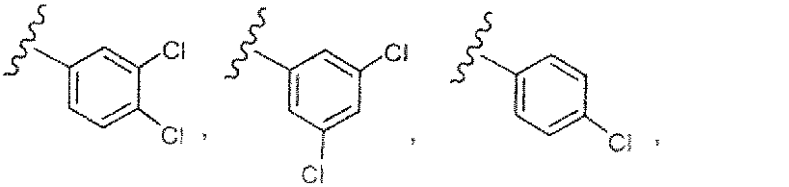
【請求項３】

Ｒ^9－Ｒ^{10}－部分が、１ｂｂ～４０ｂｂからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

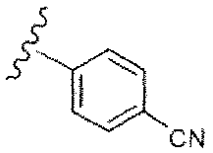
【請求項４】

R^1が、

【化２４２】

【化２４３】

および 

からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

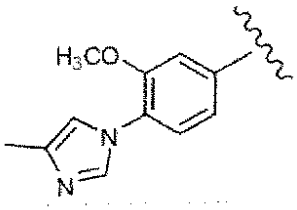
【請求項５】

Ｒ^{1}が、１～３個の独立して選択されるＲ^{21}部分で置換されたフェニルであり、少なくとも１個のＲ^{21}部分が、－ＳＦ$_{5}$、－ＯＳＦ$_{5}$および－Ｓｉ（Ｒ^{15A}）$_{3}$からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項６】

Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２４５】

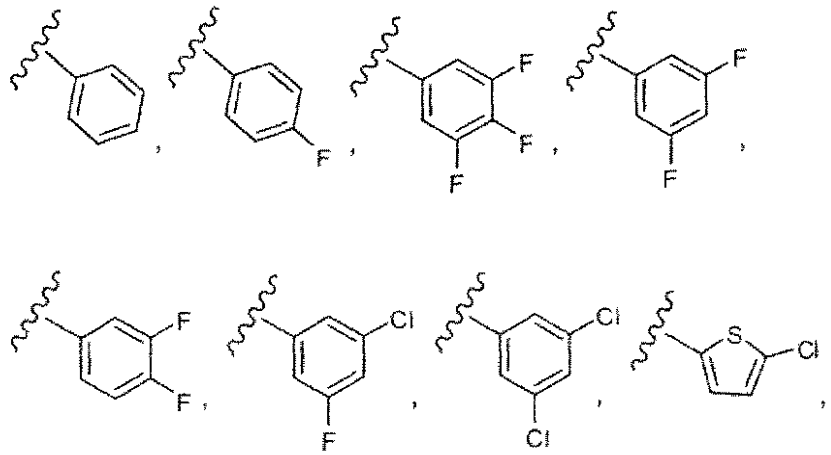


である、請求項１に記載の化合物。

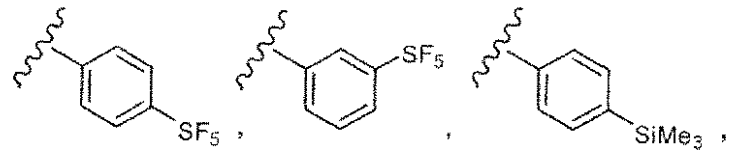
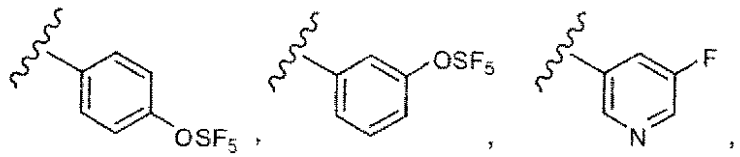
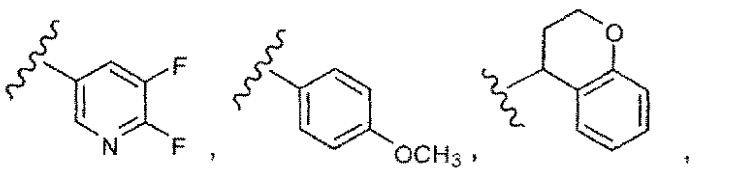
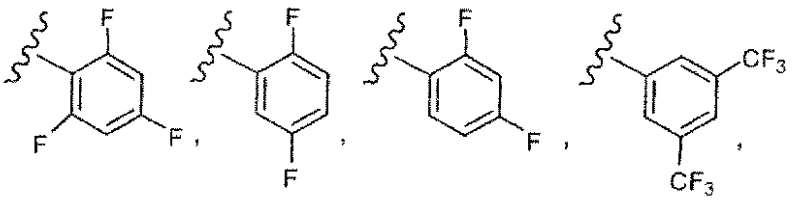
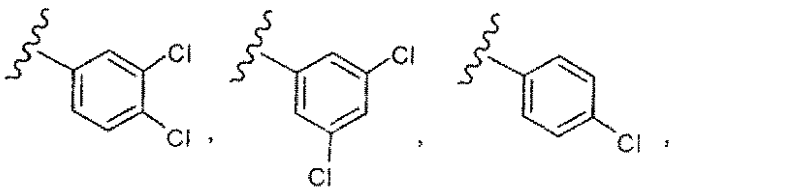
【請求項７】

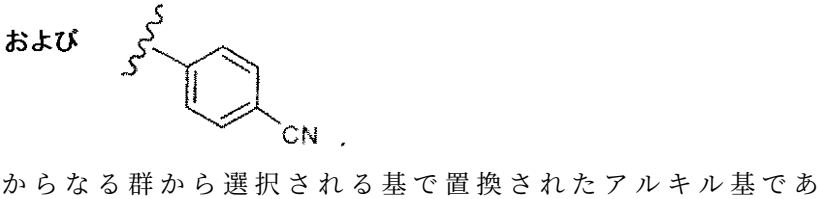
Ｒ^{1}が、

【化２４８】



【化２４９】



および

からなる群から選択される基で置換されたアルキル基である、請求項１に記載の化合物。

【請求項８】

Ｒ[1]が、ＦおよびＣｌからなる群から独立して選択される１～３個のハロで置換されたフェニルで置換されたアルキル基であるか；または

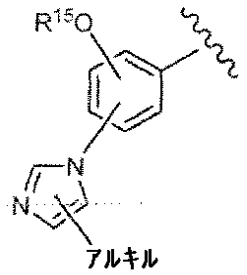
Ｒ[1]が、１～３個の独立して選択されるＲ[21]部分で置換されたフェニルで置換されたアルキル基であり、少なくとも１個のＲ[21]部分が、－ＳＦ$_5$、－ＯＳＦ$_5$、および－Ｓｉ（Ｒ[15A]）$_3$からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項９】

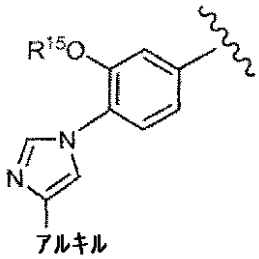
前記Ｒ[10]が、アリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたアリールからなる群から選択され、前記Ｒ[9]基が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択されるか；または

前記Ｒ[10]が、１個のＲ[21]基で置換されたフェニルであり、前記Ｒ[9]が、１個のＲ[21]基で置換されたイミダゾリルであり、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択される、請求項

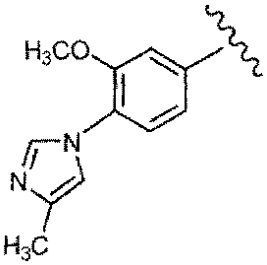
１に記載の化合物。
【請求項１０】
Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２５２】



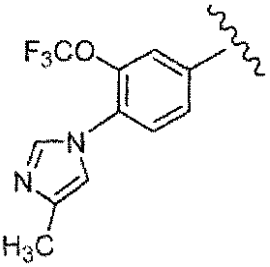
であるか；またはＲ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２５３】



であるか、またはＲ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２５４】

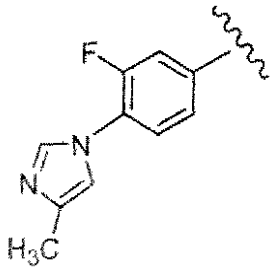


であるか、またはＲ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、
【化２５５】



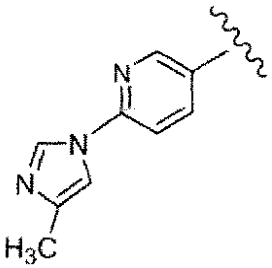
であるか、またはＲ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２５６】



であるか、またはＲ９－Ｒ１０－部分が、

【化２５７】

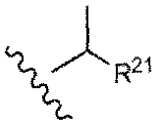


である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１１】

前記Ｒ１基が、

【化２５８】



であり、Ｒ２１が、置換されていないか、または１個以上の独立して選択されるＲ２２基で置換されるか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であるか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリールがフェニルであり、前記アルキル基が、メチルまたはエチルであるか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ２２基で置換されているか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、１個以上のＲ２２基で置換されており、各Ｒ２２基が、同じハロであるか、または異なるハロであるか；または

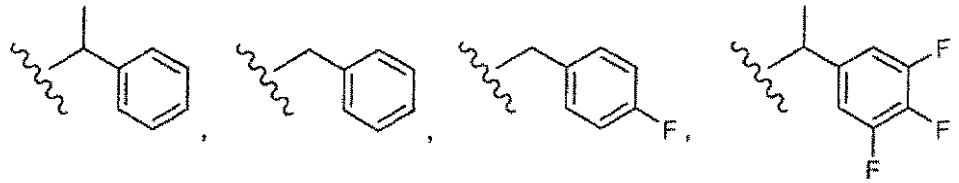
Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ２２基で置換されているか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである１個または２個のＲ２２基で置換されており、ハロがＦであるか；または

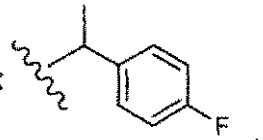
Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ２２基で置換されているか；または

Ｒ１が、１個のＲ２１基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ２１基が、アリール基であり、前記アリール基が、ハロである３個のＲ２２基で置換されており、ハロがＦである、請求項１に記載の化合物。

【請求項１２】
前記Ｒ[1]が、
【化２５９】



および



からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１３】
前記Ｒ[10]が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、前記Ｒ[9]基が、ヘテロアリール、および１個以上のＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ[21]が、それぞれ独立して選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１４】
（１）Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であるか、または
Ｒ[1]が、１個のＲ[21]基で置換されたアルキル基であり、前記Ｒ[21]基が、１個以上の独立して選択されるＲ[22]基で置換されており、
Ｒ[10]が、アリール、および１個以上の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたアリールからなる群から選択され、
Ｒ[9]が、ヘテロアリール、および１個以上の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたヘテロアリールからなる群から選択されるか；または
（２）Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であるか、または
Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたアルキル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるＲ[22]基で置換されており、
Ｒ[10]が、フェニル、および１個以上の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ[9]が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるＲ[21]基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（３）Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個以上の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ[10]が、フェニル、および１個以上の独立して選択される－ＯＲ[15]基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
Ｒ[9]が、イミダゾリル、および１個以上の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（４）Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
Ｒ[10]が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－ＯＲ[15]基で置換されたフェニルからなる群から選択され、Ｒ[15]がアルキルであり、
Ｒ[9]が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（５）Ｒ[1]が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個または２個の独立して選択される－ＯR^{15}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（６）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－ＯR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（７）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－ＯR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（８）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－ＯR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（９）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、３個のＦで置換されており、
R^{10}が、１個の－ＯR^{15}基で置換されたフェニルであり、R^{15}がメチルであり、
R^9が、イミダゾリル、および１個のメチル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１０）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
R^{10}が、フェニル、およびハロである１個または２個の独立して選択されるR^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１１）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個のハロであるR^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または
（１２）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、
R^{10}が、フェニル、および１個のハロであるR^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記R^{21}基がＦであり、

R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１３）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、

R^{10}が、フェニル、および１個のR^{21}基で置換されたフェニルからなる群から選択され、前記R^{21}基が－OR^{15}基であり、R^{15}が$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}がハロであり、ｎが１～３であり、ハロがそれぞれ独立して選択され、

R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１４）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、

R^{10}が、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}が－OR^{15}基であり、R^{15}が$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}がＦであり、ｎが３であり、

R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１５）R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であるか、または

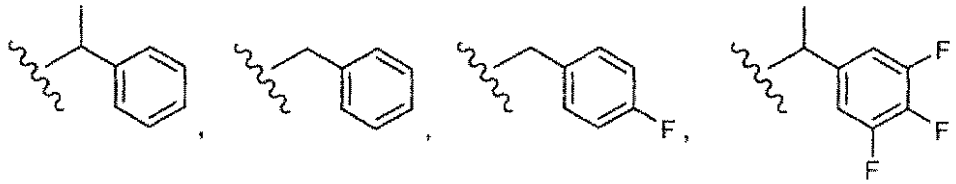
R^1が、１個のフェニルで置換されたメチル基またはエチル基であり、前記フェニルが、１個または２個の独立して選択されるハロで置換されており、

R^{10}が、１個のR^{21}基で置換されたフェニルであり、前記R^{21}基が－OR^{15}基であり、R^{15}が$(R^{18})_n$アルキル基であり、R^{18}がＦであり、ｎが３であり、アルキル基がメチルであり、

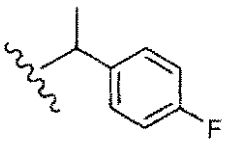
R^9が、イミダゾリル、および１個または２個の独立して選択されるアルキル基で置換されたイミダゾリルからなる群から選択されるか；または

（１６）R^1が、

【化２６０】

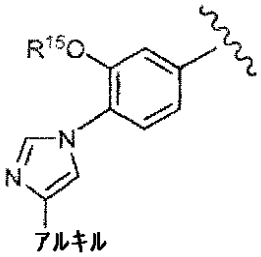


および

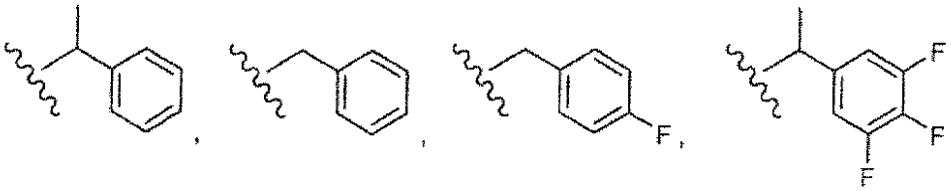


からなる群から選択され、R^9－R^{10}－部分が、

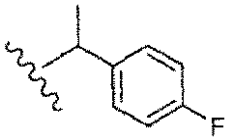
【化２６１】



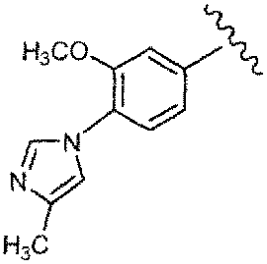
であるか；または
（１７）Ｒ[1]が、
【化２６２】



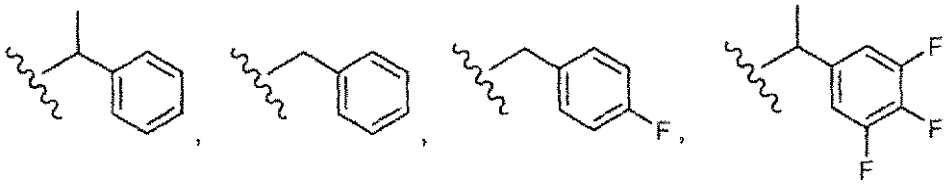
【化２６３】

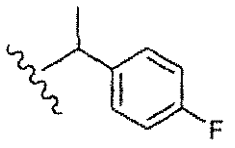
および 

からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、
【化２６４】

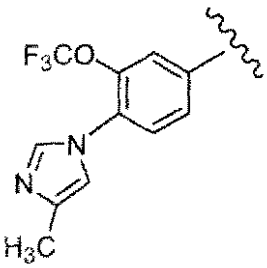


であるか；または
（１８）Ｒ[1]が、
【化２６５】



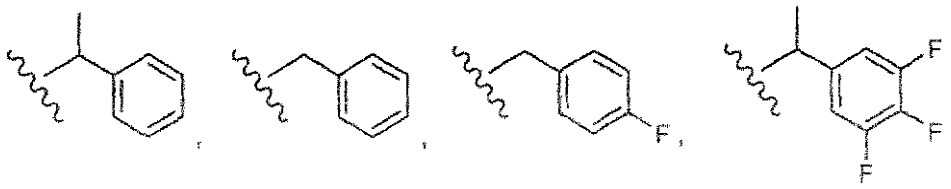
および 

からなる群から選択され、Ｒ[9]－Ｒ[10]－部分が、
【化２６６】

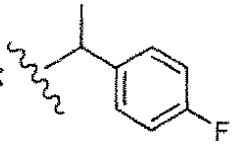


であるか；または
（１９）Ｒ[1]が、

【化２６７】

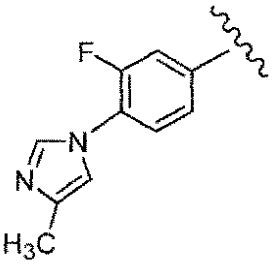


【化２６８】

および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

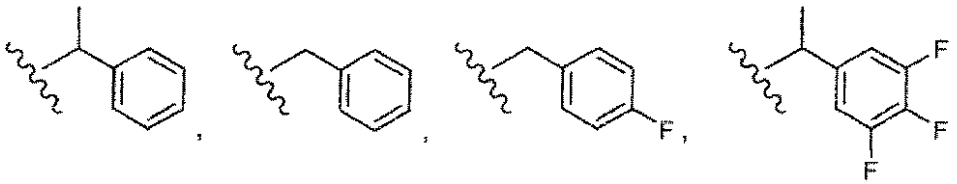
【化２６９】

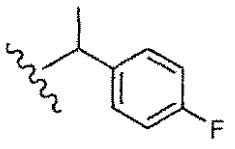


であるか；または

（２０）Ｒ^{1}が、

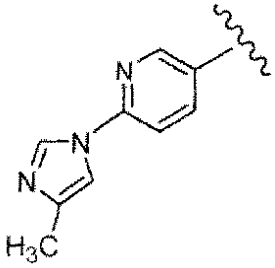
【化２７０】



および 

からなる群から選択され、Ｒ^{9}－Ｒ^{10}－部分が、

【化２７１】



である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１５】

Ｇ^{5}が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択され

るか；または
G^5が、－ＣＨ－、－ＮＨ－、－Ｎ＝、－Ｏ－、および－Ｓ－からなる群から選択され、G^6が、ＣおよびＣＨからなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１６】
ＩＡ、ＩＢ、ＩＡ．１、ＩＢ、４３Ａ～５４Ａ、４３～５４、８５．１、８８．１、９１．１、および１００～１２４からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１７】
（１）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物、または
（２）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のＢＡＣＥ阻害剤とを含む医薬組成物、または
（３）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の１つ以上のコリンエステラーゼ阻害剤とを含む医薬組成物、または
（４）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、ＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤からなる群から選択される有効量の１つ以上の医薬活性を有する成分とを含む医薬組成物、または
（５）治療有効量の請求項１に記載の少なくとも１つの化合物、またはその医薬的に許容される塩、溶媒和物またはエステルと、少なくとも１つの医薬的に許容されるキャリアと、有効量の塩酸ドネペジルとを含む医薬組成物。
【請求項１８】
少なくとも１つの請求項１に記載の化合物を含む、アルツハイマー病を処置するための組成物であって、前記組成物は、必要に応じてＢＡＣＥ阻害剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。
【請求項１９】
（１）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、アルツハイマー病を処置するための組成物であって、該組成物は、ＢＡＣＥ阻害剤、ムスカリンアンタゴニスト、コリンエステラーゼ阻害剤；γ－セクレターゼ阻害剤；γ－セクレターゼモジュレーター；ＨＭＧ－ＣｏＡレダクターゼ阻害剤；非ステロイド系抗炎症剤；Ｎ－メチル－Ｄ－アスパラギン酸受容体アンタゴニスト；抗アミロイド抗体；ビタミンＥ；ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト；ＣＢ１受容体逆作動薬またはＣＢ１受容体アンタゴニスト；抗生物質；成長ホルモン分泌促進薬；ヒスタミンＨ３アンタゴニスト；ＡＭＰＡアゴニスト；ＰＤＥ４阻害剤；$GABA_A$逆作動薬；アミロイド凝集阻害剤；グリコーゲン合成酵素キナーゼβ阻害剤；α－セクレターゼ活性の促進剤；ＰＤＥ－１０阻害剤およびコレステロール吸収阻害剤からなる群から選択される１つ以上の医薬活性を有する成分と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物；または
（２）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、ダウン症候群を処置するための組成物；または
（３）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、軽度認知障害を処置するための組成物；または

（４）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、緑内障を処置するための組成物；または
（５）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、脳アミロイド血管症を処置するための組成物；または
（６）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、脳卒中を処置するための組成物；または
（７）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、認知症を処置するための組成物；または
（８）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、小膠細胞症を処置するための組成物；または
（９）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、脳の炎症を処置するための組成物；または
（１０）１つ以上の請求項１に記載の化合物を含む、嗅覚機能の低下を処置するための組成物。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2008/086058

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D471/04 C07D487/04 A61K31/5025 A61P25/28

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 A61K 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 practical, search terms used)
EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN 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.
X	WO 2007/120454 A (IRM LLC [US]; HE XIAOHUI [US]; YANG KUNYONG [US]; LIU HONG [US]; ELLIS) 25 October 2007 (2007-10-25) examples	1-91
X	WO 03/042214 A (CV THERAPEUTICS INC [US]) 22 May 2003 (2003-05-22) examples	1-91
A	US 2006/004013 A1 (KIMURA TEIJI [JP] ET AL) 5 January 2006 (2006-01-05) cited in the application claims; examples	1-91
A	WO 03/002122 A (ELAN PHARM INC [US]; UPJOHN CO [US]; JOHN VARGHESE [US]; HOM ROY [US];) 9 January 2003 (2003-01-09) claims; examples	1-91

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier document 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
24 February 2009	05/03/2009

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	Fazzi, Raffaella

1

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/US2008/086058

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2007120454 A	25-10-2007	AU 2007239033 A1	25-10-2007
		CA 2645967 A1	25-10-2007
		EP 1999132 A1	10-12-2008
WO 03042214 A	22-05-2003	AU 2002359365 A2	26-05-2003
		CA 2466477 A1	22-05-2003
		CN 1585769 A	23-02-2005
		EP 1444233 A2	11-08-2004
		HU 0401925 A2	28-01-2005
		JP 2005509036 T	07-04-2005
		KR 20050044361 A	12-05-2005
		MX PA04004388 A	16-05-2005
		NZ 532816 A	25-11-2005
		RU 2318824 C2	10-03-2008
US 2006004013 A1	05-01-2006	AU 2005247746 A1	08-12-2005
		BR PI0511504 A	22-01-2008
		CA 2566094 A1	08-12-2005
		EP 1757591 A1	28-02-2007
		WO 2005115990 A1	08-12-2005
		JP 4101852 B2	18-06-2008
		KR 20070026648 A	08-03-2007
		US 2008070902 A1	20-03-2008
WO 03002122 A	09-01-2003	BR 0210721 A	20-07-2004
		CA 2452039 A1	09-01-2003
		EP 1401452 A1	31-03-2004
		JP 2005500319 T	06-01-2005
		MX PA04000140 A	03-06-2004

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI		テーマコード（参考）
Ａ６１Ｋ 31/5025	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 487/04	１４０	
Ａ６１Ｋ 31/437	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 471/04	１０７Ｋ	
Ａ６１Ｋ 31/522	*(2006.01)*	Ａ６１Ｋ 31/5025		
Ｃ０７Ｄ 473/18	*(2006.01)*	Ａ６１Ｋ 31/437		
Ａ６１Ｋ 45/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｋ 31/522		
Ａ６１Ｋ 31/445	*(2006.01)*	Ｃ０７Ｄ 473/18		
Ａ６１Ｐ 25/28	*(2006.01)*	Ａ６１Ｋ 45/00		
Ａ６１Ｐ 43/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｋ 31/445		
Ａ６１Ｐ 27/06	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 25/28		
Ａ６１Ｐ 25/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 43/00	１１１	
Ａ６１Ｐ 9/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 27/06		
Ａ６１Ｐ 29/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 25/00		
Ａ６１Ｐ 27/16	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 9/00		
Ａ６１Ｐ 31/18	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 43/00	１０５	
Ａ６１Ｐ 25/16	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 29/00		
Ａ６１Ｐ 21/00	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 27/16		
Ａ６１Ｐ 27/02	*(2006.01)*	Ａ６１Ｐ 43/00	１２１	
		Ａ６１Ｐ 31/18		
		Ａ６１Ｐ 25/16		
		Ａ６１Ｐ 21/00		
		Ａ６１Ｐ 27/02		

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

(72)発明者 ファン, シャンハイ
アメリカ合衆国 ニュージャージー ０７０５９, ウォーレン, ヘムロック サークル １６
(72)発明者 パラニ, アナンダン
アメリカ合衆国 ニュージャージー ０８８０７, ブリッジウォーター, ラインハート ウェイ ２５
(72)発明者 アスラニアン, ロバート ジー.
アメリカ合衆国 ニュージャージー ０７８６６, ロッカウェイ, フィリップ ドライブ １４４

Ｆターム(参考) 4C050 AA01 BB04 BB05 BB08 CC08 CC16 EE02 EE03 EE04 FF01 GG03 HH04
4C065 AA05 BB04 BB06 CC01 DD02 DD03 EE02 HH09 JJ04 KK04 LL01 PP03 PP09
4C072 AA01 BB02 CC03 CC11 CC16 EE03 EE13 FF08 GG07 HH02 HH07 UU01
4C084 AA19 MA13 MA16 MA17 MA22 MA23 MA28 MA31 MA34 MA35 MA41 MA43 MA52 MA55 MA59 MA60 MA63 MA66 NA05 NA14 ZA011 ZA012 ZA021 ZA022 ZA161 ZA162 ZA331 ZA332 ZA341 ZA342 ZA361 ZA362 ZA941 ZA942 ZB111 ZB112 ZB211 ZB212 ZC201 ZC202

ZC551 ZC552 ZC751 ZC752
4C086 AA01 AA02 AA03 BC21 CB05 CB07 CB22 CB27 MA01 MA02
MA04 NA05 NA14 ZA01 ZA02 ZA16 ZA33 ZA34 ZA36 ZA94
ZB11 ZB21 ZC20 ZC55 ZC75

【要約の続き】
を用い、Ａβに関連する１つ以上の疾患を処置、予防、阻害または軽減する方法を提供する。