(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-517512
(P2025-517512A)
(43)公表日　令和7年6月5日(2025.6.5)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 405/12	*(2006.01)*	C07D	405/12	CSP　4C086
A61K 31/443	*(2006.01)*	A61K	31/443	
C07D 417/14	*(2006.01)*	C07D	417/14	
A61K 31/427	*(2006.01)*	A61K	31/427	
C07D 417/12	*(2006.01)*	C07D	417/12	

審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全160頁）　最終頁に続く

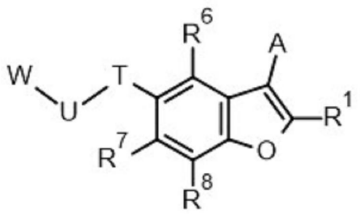
(21)出願番号　特願2024-569516(P2024-569516)
(86)(22)出願日　令和5年5月25日(2023.5.25)
(85)翻訳文提出日　令和7年1月16日(2025.1.16)
(86)国際出願番号　PCT/EP2023/063994
(87)国際公開番号　WO2023/227696
(87)国際公開日　令和5年11月30日(2023.11.30)
(31)優先権主張番号　22175506.9
(32)優先日　令和4年5月25日(2022.5.25)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV
最終頁に続く

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

(54)【発明の名称】　ＴＲＰＭ３媒介性障害を治療するための新たな誘導体

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

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



（Ｉ）

式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ａが、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は各場合において、非置換の、R^2で一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールを表し、
各R^2が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-C(=O)-OH$、$-S(=O)_2-OH$、$-R^{Y4}$、$-OR^{Y5}$、$-OC(=O)R^{Y5}$、$-NR^{Y5}R^Z$、$-NR^{Y5}C(=O)R^Z$、$-SR^{Y5}$、$-S(=O)R^{Y5}$、$-S(=O)_2R^{Y5}$、$-NR^{Y5}S(=O)_2R^Z$、$-C(=O)R^{Y5}$、$-C(=O)OR^{Y5}$、又は$-C(=O)NR^{Y5}R^Z$から互いに独立して選択され、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表すか、又はＴが、$-(CR^5R^{5'})_n-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^{Y4}$を表し、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-NO_2$、$-SF_5$、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｗが、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、$-C_1-C_6-$アルキル、$-C_2-C_6-$アルケニル、$-C_2-C_6-$アルキニル、を表し、
式中、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の$-C_1-C_6-$アルキル

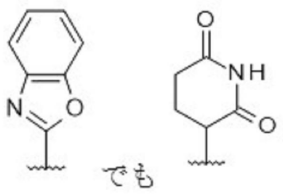
、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Ｙ４}、Ｒ^{Ｙ５}、及びＲ^{Ｚ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、前記６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、前記５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、

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

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

Ｒ^{1}が水素である場合、Ａが、

【化２】

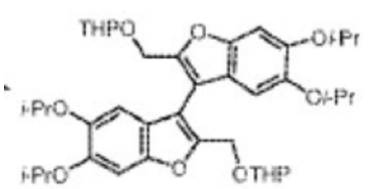


でも

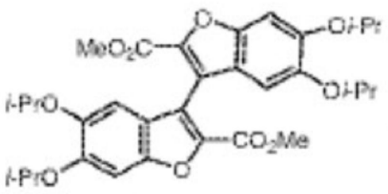
でもなく、かつ

前記化合物が、

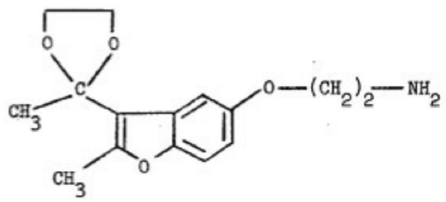
【化３】



、でも



、でも



でもない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

【請求項２】

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

【請求項３】
ｎが、１である、請求項１又は２に記載の化合物。
【請求項４】
Ａが、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員シクロアルキル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－

Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－

Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換又は多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

Ａが、

飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換又は三置換の、３～１０員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換又は三置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｎ

Ｈ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換又は三置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

Ｗが、

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

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

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

Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

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

【請求項７】

Ｗが、

飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$

－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、６～１２員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ

H_2、－S（＝O）$_2$－NH（C_{1-5}－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、－C_1－C_6－アルキル、を表す、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項８】

R^1が、－H、－F、－Cl、－Br、－I、－CN、－C_{1-6}－アルキル、－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－O－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-6}－アルキレン－CFH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－N（C_{1-6}－アルキレン）－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C（＝O）C_{1-6}－アルキル、－C（＝O）OC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NHC_{1-6}－アルキル、－C（＝O）NH_2、－C（＝O）N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－S（＝O）－C_{1-6}－アルキル、－S（＝O）$_2$－C_{1-6}－アルキル、－O－C_{1-6}－アルキル、非置換－シクロプロピル、非置換シクロブチル、非置換シクロペンチル、又は非置換シクロヘキシル、を表す、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項９】

R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、

－H、

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

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

飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、前記３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す、請求項１～８のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１０】

R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、

－H、－F、－Cl、－Br、－I、－OH、－SH、－SF_5、－CN、－NO_2、－C（＝O）OH、－NH_2、

－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、

－O－C_{1-6}－アルキル、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、

非置換、又は互いに独立して、－OH、＝O、－F、－Cl、－Br、－I、－SH、＝S、－CN、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－C（＝O）OH、－NH_2、及び－C（＝O）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－NHC_{1-6}－アルキル、

非置換、又は互いに独立して、－OH、＝O、－F、－Cl、－Br、－I、－SH、＝S、－CN、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－C（＝O）OH、－NH_2、及び－C（＝O）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－N（C_{1-6}－アルキル）$_2$、

非置換、又は互いに独立して、－OH、＝O、－F、－Cl、－Br、－I、－SH、＝S、－CN、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－C（＝O）OH、－NH_2、及び－C（＝O）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－C（＝O）OC_{1-6}－アルキル、

非置換、又は互いに独立して、－OH、＝O、－F、－Cl、－Br、－I、－SH、＝S、－CN、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－C（＝O）OH、－NH_2、及び－C（＝O）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－OC（＝O）C_{1-6}－アルキル、あ

るいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－CF_3、－CHF_2、－CH_2F、－OCF_3、－$OCHF_2$、－OCH_2F、SF_5、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、及び－Ｃ（＝Ｏ）NH_2から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－C_{1-6}－ヘテロアルキル、を表す、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１１】
化合物００１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタノール、
化合物００２－（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１，３－オキサゾール－５－イル）メタノール、
化合物００３－２－ヒドロキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド、
化合物００４－（１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロピル）メタノール、
化合物００５－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］シクロプロパンスルホンアミド、
化合物００６－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンスルホンアミド、
化合物００７－（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール、
化合物００８－３－メトキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］プロパンアミド、
化合物００９－２－ヒドロキシ－２－メチル－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］プロパンアミド、
化合物０１０－２－メトキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド、
化合物０１１－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボニトリル、
化合物０１２－２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝アセトアミド、
化合物０１３－１－シクロプロピル－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンスルホンアミド、
化合物０１４－１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－アミン、
化合物０１５－２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝プロパンアミド、
化合物０１６－１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンアミ

ン、
化合物０１７－２－ヒドロキシ－Ｎ－（１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロピル）アセトアミド、
化合物０１８－３－［（｛３－［４，４－ビス（ヒドロキシメチル）－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾール－２－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－５－イル｝オキシ）メチル］ピリジン－２－オール、
化合物０１９－１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル、
化合物０２０－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド、
化合物０２１－｛１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロピル｝メタノール、
化合物０２２－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド、
化合物０２３－５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－２Ｈ－１，２，３，４－テトラゾール、
化合物０２４－１－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２５－１－［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２６－１－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２７－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２８－５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－３－メチル－１，２，４－オキサジアゾール、
化合物０２９－２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－６－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピラジン、
化合物０３０－２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－４－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピリミジン、
化合物０３１－｛６－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピラジン－２－イル｝メタノール、
化合物０３２－｛２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピリミジン－４－イル｝メタノール、
及びそれらの生理学的に許容される塩、からなる群から選択される、請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１２】
請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項１３】
医薬としての使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。

【請求項１４】
疼痛又はてんかんの治療における使用のための、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物又は請求項１２に記載の薬学的組成物。

【請求項１５】
前記疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択され、好ましくは術後疼痛である、請求項１４に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。

【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、ＴＲＰＭ３媒介性障害、より具体的には、疼痛、てんかん及び炎症性過敏症から選択される障害の予防又は治療に有用な化合物に関する。本発明はまた、当該ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための方法に関する。
【背景技術】
【０００２】
ＴＲＰスーパーファミリーは、ホモ又はヘテロ四量体として組み立ててカチオン透過性イオンチャネルを形成する６つの膜貫通ドメイン（６ＴＭ）を有するタンパク質からなる。ＴＲＰという名称は、持続光への応答におけるハエ光受容体における一過性受容体電位を特徴とするＤｒｏｓｏｐｈｉｌａ　ｔｒｐ（一過性受容体電位）変異体に由来する。過去１５年間で、ｔｒｐ関連チャネルが、ヒトにおける２７個のＴＲＰを含む、酵母、寄生虫、昆虫、魚類、及び哺乳動物において確認されている。配列相同性に基づいて、ＴＲＰチャネルは、７つのサブファミリー：ＴＲＰＣ、ＴＲＰＶ、ＴＲＰＭ、ＴＲＰＡ、ＴＲＰＰ、ＴＲＰＭＬ、及びＴＲＰＮに分けることができる。
【０００３】
ＴＲＰスーパーファミリーのメンバーは、おそらく全ての哺乳動物の臓器や細胞型で発現しており、近年、その生理学的役割の理解において大きな進歩があった。ある特定のＴＲＰチャネルのカスタマイズされた選択性は、Ca^{2+}、Mg^{2+}、及び微量金属イオンの細胞取り込み及び／又は経上皮輸送において重要な役割を果たすことを可能にする。更に、幅広い化学的及び物理的刺激に対するＴＲＰチャネルの感度は、視覚から味覚、触覚までのプロセスに関与する専用の生物学的センサーとして機能することを可能にする。具体的には、ＴＲＰスーパーファミリーのいくつかのメンバーは、温度に対して非常に高い感度を示す。これらのいわゆるサーモＴＲＰは、感覚ニューロン及び／又は皮膚ケラチノサイトで高度に発現され、無害及び有害な（痛みを伴う）温度の検出のための主要なサーモセンサーとして機能する。
【０００４】
ＴＲＰチャネルの機能不全が、様々な遺伝性及び後天性疾患の病因に直接関与していることがますます明らかになりつつある。実際、ＴＲＰチャネル遺伝子の機能喪失及び機能獲得の両方の変異が、ブラキオール血症、二次性低カルシウム血症を伴う低マグネシウム血症、多嚢胞性腎臓病、ＩＶ型ムコリピドーシス、及び家族性巣状分節性糸球体硬化症を含む遺伝性疾患の直接的原因として特定されている。更に、ＴＲＰチャネルの機能／機能不全は、慢性疼痛、高血圧、がん、てんかん、及び神経変性障害を含む広範囲の病理学的状態に直接関連している。
【０００５】
ＴＲＰＭ３（一過性受容体電位メラスタチン３）は、有望な薬理学的標的を表す。ＴＲＰＭ３は、後根及び三叉神経節からの小径感覚ニューロンの大きなサブセットで発現し、熱感知に関与している。神経ステロイドである硫酸プレグネノロンは、ＴＲＰＭ３の強力な既知の活性化因子である（Ｗａｇｎｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，２００８）。神経ステロイドである硫酸プレグネノロンは、野生型マウスでは痛みを引き起こしたが、ノックアウトＴＲＰＭ３マウスでは痛みを引き起こさなかった。また、最近、ＴＲＰＭ３ノックアウトマウスにおいて、ＣＦＡ誘発炎症及び炎症性疼痛が排除されることも示された。したがって、ＴＲＰＭ３アンタゴニストは、炎症性疼痛などの疼痛に対抗するための鎮痛剤として使用され得る（ＶｒｉｅｎｓＪ．ｅｔ　ａｌ．Ｎｅｕｒｏｎ，Ｍａｙ　２０１１）。ＴＲＰＭ３はまた、脳を含むいくつかの他の組織で発現される；報告は、ＴＲＰＭ３における２つの変異が発達性及びてんかん性脳症と関連することを示している（Ｚｈａｏ，ｓ．，ｅｔ　ａｌ．Ｃｈａｎｎｅｌｓ（Ａｕｓｔｉｎ）．２０２１）。
【０００６】
いくつかのＴＲＰＭ３アンタゴニストが知られているが、それらのいずれも、本発明の

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

【０００７】

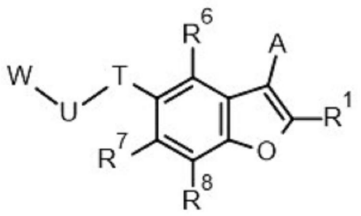
本発明は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニストであり、ＴＲＰＭ３媒介性障害のモジュレーターとして使用することができる新規の化合物類を提供する。

【発明の概要】

【０００８】

本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体であって、

【化１】



（Ｉ）

式中、

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

Ａが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は各場合において、非置換の、R^2で一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールを表し、

各R^2が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-C(=O)-OH$、$-S(=O)_2-OH$、$-R^{Y4}$、$-OR^{Y5}$、$-OC(=O)R^{Y5}$、$-NR^{Y5}R^Z$、$-NR^{Y5}C(=O)R^Z$、$-SR^{Y5}$、$-S(=O)R^{Y5}$、$-S(=O)_2R^{Y5}$、$-NR^{Y5}S(=O)_2R^Z$、$-C(=O)R^{Y5}$、$-C(=O)OR^{Y5}$、又は$-C(=O)NR^{Y5}R^Z$から互いに独立して選択され、

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

ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、

R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^{Y4}$を表し、

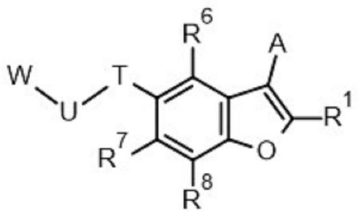
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-NO_2$、$-SF_5$、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、

Wが、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、を表し、
式中、
Ｒ^{W}及びＲ^{X}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Y4}、Ｒ^{Y5}、及びＲ^{Z}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1}$

－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ２、－ＮＯ、－ＮＯ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキ

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

【化２】



（Ｉ）

式中、

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

Ａが、

飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しく

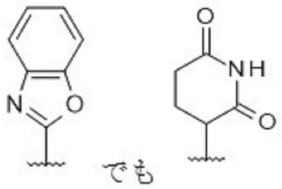
は多置換の５～１４員ヘテロアリールを表し、
各R^2が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－R^{Y4}、－OR^{Y5}、－ＯＣ（＝Ｏ）R^{Y5}、－$NR^{Y5}R^Z$、－NR^{Y5}Ｃ（＝Ｏ）R^Z、－SR^{Y5}、－Ｓ（＝Ｏ）R^{Y5}、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^{Y5}$、－NR^{Y5}Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Z$、－Ｃ（＝Ｏ）R^{Y5}、－Ｃ（＝Ｏ）OR^{Y5}、又は－Ｃ（＝Ｏ）$NR^{Y5}R^Z$から互いに独立して選択され、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（$CR^5R^{5'})_n$－を表すか、又はＴが、－（$CR^5R^{5'})_n$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、－R^{Y4}を表し、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－NO_2、－SF_5、－R^W、－OR^W、－ＯＣ（＝Ｏ）R^W、－NR^WR^X、－NR^WＣ（＝Ｏ）R^X、－SR^W、－Ｓ（＝Ｏ）R^W、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^W$、－Ｃ（＝Ｏ）R^W、－Ｃ（＝Ｏ）OR^W、又は－Ｃ（＝Ｏ）NR^WR^Xを表し、
Ｗが、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－C_1－C_6－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、を表し、
式中、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
R^{Y4}、R^{Y5}、及びR^Zが、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル、
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－C_1－C_6－アルキレン－又は－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若

しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ

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

Ｒ^{1}が水素である場合、Ａが、

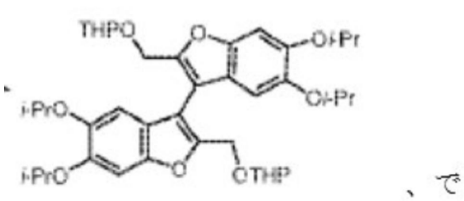
【化３】



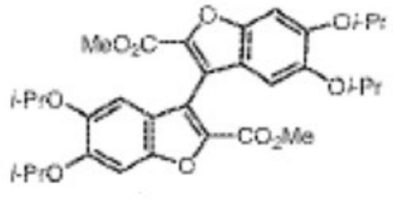
でも

でもなく、かつ
当該化合物が、

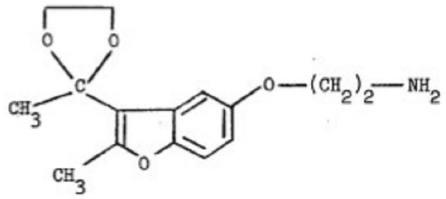
【化４】



、でも



、でも



でもない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又はその多形体を提供する。

【０００９】

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

【００１０】

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

【００１１】

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

【００１２】

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

【００１３】
本発明は更に、以下のステップを含む、第１の態様に記載の式（Ｉ）の化合物を調製するための方法を提供する：
－５－Ｏ－置換－ベンゾフラン－３－カルボキシレートエステル誘導体をその対応する５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－アセトニトリル誘導体に変換するステップ、
－以前に得られた５－Ｏ－置換ベンゾフラン－３－アセトニトリル誘導体を環化に供して、本発明の所望の誘導体を得るステップ。
【発明を実施するための形態】
【００１４】
本発明を説明する前に、本発明は、説明される特定のプロセス、方法及び化合物に限定されず、そのようなプロセス、方法及び化合物は、当然のことながら変動し得ることが理解されるべきである。また、本発明の範囲は添付の特許請求の範囲によってのみ限定されるため、本明細書で使用される用語は、限定することを意図していないことも理解されたい。
【００１５】
本発明の化合物及びプロセスを説明するとき、使用される用語は、文脈から別途指示されない限り、以下の定義に従って解釈されるべきである。
【００１６】
本明細書及び添付の特許請求の範囲で使用される場合、単数形の「ａ」、「ａｎ」、及び「ｔｈｅ」は、文脈上別段明らかに指示されない限り、単数形及び複数形の両方の指示対象を含む。例えば、「化合物」は、１つの化合物又は１つより多くの化合物を意味する。
【００１７】
本明細書で使用される「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「含む（ｉｎｃｌｕｄｉｎｇ）」、「含む（ｉｎｃｌｕｄｅｓ）」、又は「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｉｎｇ）」、「含有する（ｃｏｎｔａｉｎｓ）」と同義であり、包括的又は非限定的であり、列挙されていない追加の部材、要素、又は方法ステップを除外しない。「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｉｎｇ）」、「含む（ｃｏｍｐｒｉｓｅｓ）」、及び「で構成される（ｃｏｍｐｒｉｓｅｄ　ｏｆ）」という用語は、「からなる（ｃｏｎｓｉｓｔｉｎｇ　ｏｆ）」という用語を含む。
【００１８】
本明細書で使用される「約」という用語は、パラメータ、量、時間の長さ等の測定可能な値に言及する場合、指定された値の及び該値からの＋／－１０％以下、好ましくは＋／－５％以下、より好ましくは＋／－１％以下、更により好ましくは＋／－０．１％以下の変動を包含することを意味するが、ただし、開示される発明においてそのような変動を行うことが適切であるものとする。修飾語「約」が指す値は、それ自体も具体的にかつ好ましく開示されることを理解されたい。
【００１９】
本明細書で使用される場合、「及び／又は」という用語は、２つ以上の項目のリストにおいて使用されるとき、列記された項目のうちのいずれか１つを単独で採用することができること、又は列記された項目のうちの２つ以上の任意の組み合わせを採用することができることを意味する。例えば、リストが、群Ａ、Ｂ及び／又はＣを含むと説明されている場合、リストは、Ａのみ、Ｂのみ、Ｃのみ、Ａ及びＢの組み合わせ、Ａ及びＣの組み合わせ、Ｂ及びＣの組み合わせ、又はＡ、Ｂ及びＣの組み合わせを含み得る。
【００２０】
端点による数値範囲の列挙は、全ての整数、及び必要に応じて、その範囲内に含まれる分数を含む（例えば、１～５は、例えば、いくつかの要素を参照する場合、１、２、３、４を含み得、また、例えば、測定値を参照する場合、１．５、２、２．７５、及び３．８０を含み得る）。端点の列挙はまた、端点値自体を含む（例えば、１．０～５．０は、１

．０及び５．０の両方を含む）。本明細書に記載される任意の数値範囲は、その中に含まれる全ての部分的な範囲を含むことが意図される。

【００２１】

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

【００２２】

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

【００２３】

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

【００２４】

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

【００２５】

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

【００２６】

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

【００２７】

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

【００２８】

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

【００２９】

「保護基」という用語は、官能基の特性又は化合物全体の特性をマスク又は変更する化合物の部分を指す。保護基の化学的基礎構造は、大きく異なる。保護基のある機能は、親薬物物質の合成における中間体として役立つことにある。化学的保護基及び保護／脱保護のための戦略は、当該技術分野において周知である。”Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎ

ｅ（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９９１を参照されたい。保護基は、所望の化学反応の効率、例えば、規則正しく計画された様式で化学結合を形成及び破壊することを補助するために、ある特定の官能基の反応性をマスクするためにしばしば利用されている。化合物の官能基の保護は、極性、親油性（疎水性）、及び一般的な分析ツールによって測定することができる他の特性などの、保護された官能基の反応性以外の他の物理的特性を変える。化学的に保護された中間体は、それ自体が、生物学的に活性又は不活性であり得る。

【００３０】

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

【００３１】

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

【００３２】

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

【００３３】

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

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

【００３４】

本明細書で使用される「アルケニル」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、正常な、二次又は三次、直鎖又は分岐鎖の炭化水素を意味する。例としては、エチレン又はビニル（－ＣＨ＝CH_2）、アリル（－CH_2ＣＨ＝CH_2）、及び５－ヘキセニル（－$CH_2CH_2CH_2CH_2$ＣＨ＝CH_2）が挙げられるが、これらに限定されない。二重結合は、シス又はトランス配置であり得る。下付き文字が本明細書で炭素原子に続いて使用される場合、下付き文字は、命名された基が含有し得る炭素原子の数を指す。例えば、「C_{2-6}アルケニル」という用語は、１つ以上の炭素－炭素二重結合を含み、かつ２～６個の炭素原子を含む、直鎖又は分岐鎖であり得る不飽和ヒドロカルビル基を指す。例えば、C_{2-4}アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する全ての直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を含む。C_{2-6}アルケニル基の例は、エテニル、２－プロペニル、２－ブテニル、３－ブテニル、２－ペンテニル及びその異性体、２－ヘキセニル及びその異性体、２，４－ペンタジエニル等である。

【００３５】

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

【００３６】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のアルキレン」という用語は、飽和アルキレン、並びにアルケニレン、アルキニレン、アルケニニレン（ａｌｋｅｎｙｎｙｌｅｎｅ）などの不飽和アルキレンを包含する。本明細書で使用される「アルキレン」という用語は、

親アルカンの同じ又は２個の異なる炭素原子からの２個の水素原子の除去によって得られる２つの一価のラジカル中心を有する飽和、直鎖、又は分岐鎖の炭化水素ラジカルを意味する。典型的なアルキレンラジカルとしては、メチレン（－ＣＨ$_2$－）、エチレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－）、メチルメチレン（－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－）、１－メチル－エチレン（－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－ＣＨ$_2$－）、ｎ－プロピレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－）、２－メチルプロピレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－ＣＨ$_2$－）、３－メチルプロピレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－）、ｎ－ブチレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－）、２－メチルブチレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－）、４－メチルブチレン（－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ（ＣＨ$_3$）－）、ペンチレン及びその鎖異性体、ヘキシレン及びその鎖異性体が挙げられるが、これらに限定されない。

【００３７】

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

【００３８】

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

【００３９】

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

【００４０】

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

【００４１】

基又は基の一部としての「ハロＣ$_{1-6}$アルキル」という用語は、１個、２個又は３個の水素原子が本明細書で定義されるハロゲンで各々置き換えられる、先で定義される意味を有するＣ$_{1-6}$アルキル基を指す。そのようなハロＣ$_{1-6}$アルキル基の非限定的な例

としては、クロロメチル、１－ブロモエチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、１，１，１－トリフルオロエチルなどが挙げられる。

【００４２】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和ヘテロアルキル」という用語は、飽和ヘテロアルキル、並びにヘテロアルケニル、ヘテロアルキニルなどの不飽和ヘテロアルキルを包含する。本明細書で使用される「ヘテロアルキル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、ヘテロ原子、すなわち、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。これは、当該アルキルのうちの１つ以上の－CH_3が－NH_2によって置き換えられ得ること、及び／又は当該アルキルのうちの１つ以上の－CH_2－が、－ＮＨ－、－Ｏ－、若しくは－Ｓ－によって置き換えられ得ることを意味する。当該鎖中のＳ原子は、任意に、１個又は２個の酸素原子で酸化されて、スルホキシド及びスルホンをそれぞれ得ることができる。更に、本発明の化合物中のヘテロアルキル基は、安定な化合物をもたらす任意の炭素又はヘテロ原子にオキソ又はチオ基を含有することができる。例示的なヘテロアルキル基には、アルコール、アルキルエーテル（例えば、－メトキシ、－エトキシ、－ブトキシなど）、一級、二級、及び三級アルキルアミン、アミド、ケトン、エステル、アルキルスルフィド、及びアルキルスルホンが含まれるが、これらに限定されない。「ヘテロアルケニル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルケニルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。したがって、ヘテロアルケニルという用語は、イミン、－Ｏ－アルケニル、－ＮＨ－アルケニル、－Ｎ（アルケニル）$_2$、－Ｎ（アルキル）（アルケニル）、及び－Ｓ－アルケニルを含む。本明細書で使用される「ヘテロアルキニル」という用語は、直鎖又は分岐鎖のアルキニルを意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。したがって、ヘテロアルキニルという用語は、－シアノ、－Ｏ－アルキニル、－ＮＨ－アルキニル、－Ｎ（アルキニル）$_2$、－Ｎ（アルキル）（アルキニル）、－Ｎ（アルケニル）（アルキニル）、及び－Ｓ－アルキニルを含む。

【００４３】

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

【００４４】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、シクロアルキニルなどの不飽和シクロアルキルを含む。特に、本明細書で使用される「飽和又は不飽和のシクロアルキル」という用語は、飽和シクロアルキル、並びにシクロアルケニル、及びシクロアルキニルなどの不飽和非芳香

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

【００４５】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、飽和ヘテロシクロアルキル、並びに少なくとも１個のヘテロ原子、すなわち、環員としてＮ、Ｏ、又はＳを含む不飽和非芳香族ヘテロシクロアルキルを包含する。特に、「飽和又は不飽和のヘテロシクロアルキル」及び「飽和又は非芳香族不飽和のヘテロシクロアルキル」という用語は、同義語である。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルケニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルケニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。本明細書で使用される「ヘテロシクロアルキニル」という用語は、特に明記されていない限り、「シクロアルキニル」を意味し、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）は、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられ、当該鎖は、２個の隣接するＯ原子又は２個の隣接するＳ原子を含有してはならないことを条件とする。飽和及び不飽和のヘ

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

【００４６】

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

【００４７】

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

ジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンが挙げられるが、これらに限定されない。

【００４８】

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

【００４９】

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

【００５０】

置換基に関して本明細書で使用される場合、特に明記されていない限り、「一置換」、「二置換」、「三置換」、「多置換」などの用語は、本明細書で定義される化学構造を意味し、それぞれの部分は、１つ以上の置換基で置換され、当該部分の１個以上の水素原子は、各々独立して、置換基で置き換えられることを意味する。例えば、－Ｆで多置換され得る－$Ｃ_{1-6}$－アルキルが、－$ＣＨ_{2}Ｆ$、－$ＣＨＦ_{2}$、－$ＣＦ_{3}$、－$ＣＨ_{2}ＣＦ_{3}$、$ＣＦ_{2}ＣＦ_{3}$などに及ぶ。同様に、互いに独立して、－Ｆ及び－Ｃｌから選択される置換基で多置換され得る－$Ｃ_{1-6}$－アルキルは、－$ＣＨ_{2}Ｆ$、－$ＣＨＦ_{2}$、－$ＣＦ_{3}$、－$ＣＨ_{2}ＣＦ_{3}$、$ＣＦ_{2}ＣＦ_{3}$、－$ＣＨ_{2}Ｃｌ$、－$ＣＨＣｌ_{2}$、－$ＣＣｌ_{3}$、－$ＣＨ_{2}ＣＣｌ_{3}$、$ＣＣｌ_{2}ＣＣｌ_{3}$、－ＣＨＣｌＦ、－$ＣＣｌＦ_{2}$、－$ＣＣｌ_{2}ＣＦ_{3}$、－$ＣＦ_{2}ＣＣｌ_{3}$、－ＣＣｌＦＣＣ$ｌ_{2}$Ｆなどに及ぶ。本発明の化合物中の１つを超える部位に見出される任意の置換基の指定は、独立して、選択されるものとする。

【００５１】

本明細書で使用される場合、及び特に明記されていない限り、「溶媒和物」という用語は、アルコール、ケトン、エステル、エーテル、ニトリルなどであるが、これらに限定さ

れない、好適な無機溶媒（例えば、水和物）又は有機溶媒を有する、本発明の誘導体によって形成され得る任意の組み合わせを含む。

【００５２】

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

【００５３】

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

【００５４】

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

【００５５】

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

【００５６】

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

【００５７】

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

【００５８】

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

【００５９】

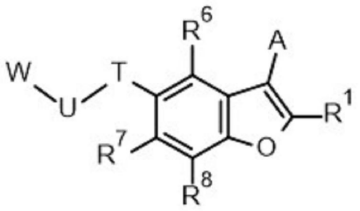
これより、本発明の化合物及び方法の好ましい陳述（特徴）及び実施形態を記載する。そのように定義された本発明の各陳述及び実施形態は、反対のことが明確に示されない限り、任意の他の陳述及び／又は実施形態と組み合わされ得る。特に、好ましい又は有利であると示される任意の特徴は、好ましい又は有利であると示される任意の他の１つ以上の特徴と組み合わせてもよい。

【００６０】

この発明の番号付けした陳述は、以下の通りである：

１．式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又

は多形体であって、
【化５】



（Ｉ）

式中、
Ｒ^{1}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ａが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、を表し、
各Ｒ^{2}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_{5}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｒ^{Ｙ４}、－ＯＲ^{Ｙ５}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｒ^{Ｚ}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｚ}、－ＳＲ^{Ｙ５}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｙ５}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｚ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｙ５}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｙ５}Ｒ^{Ｚ}から互いに独立して選択され、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５'}$）$_{ｎ}$－を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５'}$）$_{ｎ}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
Ｒ^{５}及びＲ$^{５'}$が、互いに独立して、－Ｒ^{Ｙ４}を表し、
Ｒ^{６}、Ｒ^{７}、及びＲ^{８}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＳＦ$_{5}$、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、を表し、
式中、
Ｒ^{Ｗ}及びＲ^{Ｘ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、

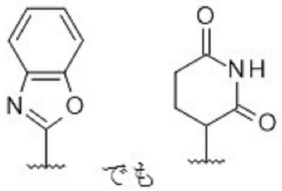
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Ｙ４}、Ｒ^{Ｙ５}、及びＲ^{Ｚ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレ

ン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ２、－ＮＯ、－ＮＯ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル

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

特に、Ｒ^{1}が水素である場合、Ａが、

【化６】

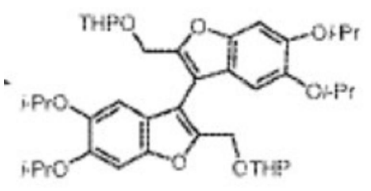


でも

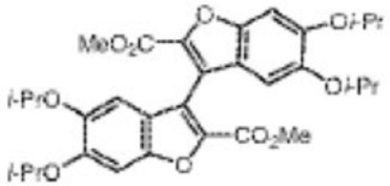
でもなく、かつ

当該化合物が、

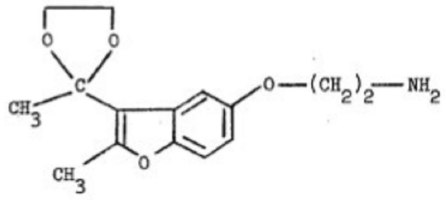
【化７】



、でも



、でも



でもない、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

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

３．ｎが、１である、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

４．Ａが、

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

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は

各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

５．Ｒ^{2}が、

－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$

－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

６．Ａが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－

アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ

Ｈ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、５～１４員ヘテロアリール、特に、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（３～８員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、５－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－（３～８員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

７．Ａが、
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の、シクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチルからなる群から選択される、３～１４員シクロアルキル、
アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキサゾリン、イソオキサゾリン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロ－シクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、－Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の－フェニル、又は
ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
８．Ａが、
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチルからなる群から選択される、３～１４員シクロアルキル、
アゼパン、アゼチジン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキサゾリン、イソオキサゾリン、オキセパン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロ－シクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペ

ンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換、－Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の－フェニル、又は
ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、１，２，３－オキサジアゾール、１，２，４－オキサジアゾール、１，２，５－オキサジアゾール、１，３，４－オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
９．Ａが、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換もしく多置換の、シクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチルからなる群から選択される、３～１４員シクロアルキル、特に、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル

、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、シクロプロピル、シクロプロパニル、シクロブチル、シクロブテニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニルシクロヘプチル、シクロヘプテニル、シクロオクチル、シクロオクテニル、１，３－シクロヘキサジエニル、１，４－シクロヘキサジエニル、１，５－シクロオクタジエニル、ビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２イル、（１Ｓ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｒ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｓ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、（１Ｒ，４Ｓ）－ノルボルナン－２－イル、デカリニル、アダマンチルからなる群から選択される、３～１４員シクロアルキル、

アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキサゾリン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換もしく多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、特に、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキサゾリン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾ

リジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換もしく多置換の、フェニル、特に、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ

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

ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換もしく多置換の、５～１４員ヘテロアリール、特に、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-5}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ

、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、５～１４ヘテロアリール、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１０．Ｒ^{1}が、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-}$Ｃ$_6$－ヘテロアルキル、

－ＯＨ、

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

－ＮＨ$_2$、

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

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

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

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

－ＳＨ、

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

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

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

－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、

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

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

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、又は
飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
１１．Ｒ^{1}が、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、又は
飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、

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

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

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

１４．Ｗが、

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

非置換の、一置換若しくは二置換の６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは二置換の５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１５．Ｗが、

非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の、３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル、

非置換の、一置換若しくは二置換の６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは二置換の５～１４員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１６．Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）

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

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

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

レン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

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

１７．Ｗが、

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

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

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１２員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シク

ロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－ＮＨ$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$ＮＨ_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－ＮＨ$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$ＮＨ_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－$Ｃ_1$－$Ｃ_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１８．Ｗが、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－$ＯＣ_{1-5}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－ＮＨ$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$ＮＨ_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－$ＯＣ_{1-5}$－アルキル、－$ＮＨ_2$、－ＮＨ$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$

－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1－5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、６～１２員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1－5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1－5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される一置換、二置換若しくは三置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1－5}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ$_{1－5}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1－5}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1－5}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ

Ｈ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-5}$－アルキル）、３～８員シクロアルキル、３～１０員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１０員ヘテロアリールから独立して選択される置換基で一置換、二置換若しくは三置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

１９．Ｗが、

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

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

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

アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、又は

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

２０．Ｗが、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、３～１０員シクロアルキル、

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは二置換の、３～１０員ヘテロシクロアルキル、

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

、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される一置換若しくは二置換の、５～１０員ヘテロアリール、又は

各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$から独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。

２１．Ｒ^{5}及びＲ^5’が、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

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

２２．ｎが、１、２、又は３から選択される整数であり、

Ｒ^{5}及びＲ^5’が、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

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

２３．Ｒ^{5}及びＲ^5’が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－

Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２４．Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２５．Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、
－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、
－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、あるいは
非置換、又は互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２６．Ｒ^{6}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２７．Ｒ^{6}が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２８．Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す、先行

陳述のいずれか１つに記載の化合物。
２９．R^7が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３０．R^8が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３１．R^8が、－Ｈを表さない、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３２．
（ｉ）R^6、R^7、及びR^8が各々、－Ｈを表すか、又は
（ｉｉ）R^6、R^7、及びR^8のうちの２つが、－Ｈを表し、R^6、R^7、及びR^8のうちの他方が、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－CH_3を表すか、又は
（ｉｉｉ）R^6、R^7、及びR^8のうちの１つが、－Ｈを表し、R^6、R^7、及びR^8のうちの他方が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－CH_3を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３３．本明細書で述べられている化合物００１～化合物０２８及びそれらの生理学的に許容される塩からなる群から選択される、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３４．本明細書で述べられている化合物００１～化合物０３２及びそれらの生理学的に許容される塩からなる群から選択される、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３５．R^1が、Ｈ、－CH_3、－CH_2F、－CHF_2、又は－CF_3を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（$CR^5R^{5'})_n$－を表し；
Ａが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、R^2で一置換、二置換若しくは三置換の５～１４員ヘテロアリール、を表し、
各R^2が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－R^{Y4}、－OR^{Y5}、－$OC(=O)R^{Y5}$、－$NR^{Y5}R^Z$、－$NR^{Y5}C(=O)R^Z$、－$S(=O)_2R^{Y5}$、－$NR^{Y5}S(=O)_2R^Z$、－$C(=O)OR^{Y5}$、又は－$C(=O)NR^{Y5}R^Z$から互いに独立して選択され、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、－Ｈ、－C_1－C_6－アルキル、又は－C_1－C_6－アルキレン－Ｎ（C_1－C_6－アルキル）$_2$を表し、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－C_1－C_6－アルキルを表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３６．R^1が、Ｈ、－CH_3、－CH_2F、－CHF_2、又は－CF_3を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（$CR^5R^{5'})_n$－を表し；
Ａが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の５～１４員ヘテロアリール、を表し、
各Ｒ^{2}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）から互いに独立して選択され、
Ｒ^{5}及びＲ^{5}’が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル）$_{2}$を表し、
Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表し、

Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、を表す、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物。
３７．Ｒ^{1}が、Ｈ、－ＣＨ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、又は－ＣＦ$_{3}$を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_{n}$－を表し；
Ａが、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換、二置換若しくは三置換の５～１４員ヘテロアリール、を表し、
各Ｒ^{2}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$

－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）から互いに独立して選択され、

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

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

Ｗが、

３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニルであって、当該群の各々が、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、

飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、

一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は

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

３８．先行陳述のいずれか１つに記載の化合物を含む、薬学的組成物又は医薬。

３９．医薬としての使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述３８に記載の薬学的組成物。

４０．疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛及びてんかん性脳症の治療における使用のための、先行陳述のいずれか１つに記載の化合物又は陳述３８に記載の薬学的組成物。

４１．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述４０に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。

４２．疼痛が、術後疼痛である、陳述４１に記載の使用のための化合物又は使用のための薬学的組成物。

４３．有効量の陳述１～３７のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項３８に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／又は治療の方法。

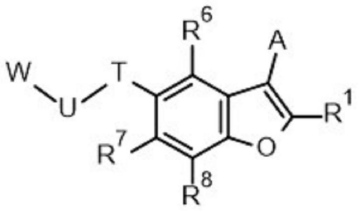
４４．有効量の陳述１～３７のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項３８に記載の薬学的組成物を対象に投与することを含む、疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛及びてんかん性脳症の予防及び／又は治療の方法。

４５．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される、陳述４４に記載の方法。

【００６１】

本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体を提供し、

【化８】



（Ｉ）

式中、
Ｒ^{1}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ａが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、又は
各場合において、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、を表し、
各Ｒ^{2}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_{5}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＨ、－Ｒ^{Ｙ４}、－ＯＲ^{Ｙ５}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｒ^{Ｚ}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｚ}、－ＳＲ^{Ｙ５}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｙ５}、－ＮＲ^{Ｙ５}Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｚ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｙ５}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｙ５}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｙ５}Ｒ^{Ｚ}から互いに独立して選択され、Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５'}$）$_{ｎ}$－を表すか、又はＴが、－（ＣＲ^{５}Ｒ$^{５'}$）$_{ｎ}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
ｎが、１、２、３、４、又は５から選択される整数であり、
Ｒ^{５}及びＲ$^{５'}$が、互いに独立して、－Ｒ^{Ｙ４}を表し、
Ｒ^{６}、Ｒ^{７}、及びＲ^{８}が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＳＦ$_{5}$、－Ｒ^{Ｗ}、－ＯＲ^{Ｗ}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}、－ＮＲ^{Ｗ}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｘ}、－ＳＲ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Ｗ}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Ｗ}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Ｗ}Ｒ^{Ｘ}を表し、
Ｗが、
飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、又は
各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換の、－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキル、－Ｃ$_{２}$－Ｃ$_{６}$－アルケニル、－Ｃ$_{２}$－Ｃ$_{６}$－アルキニル、を表し、
式中、
Ｒ^{Ｗ}及びＲ^{Ｘ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{１}$－Ｃ$_{６}$－アルキル、

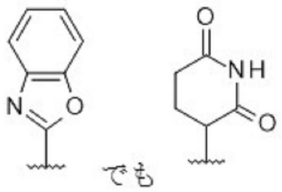
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Ｙ４}、Ｒ^{Ｙ５}、及びＲ^{Ｚ}が、互いに独立して、各場合において、独立して、
－Ｈ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、６～１４員アリール、あるいは
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表し、
「一置換若しくは多置換」が、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－

ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ２、－ＮＯ、－ＮＯ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル

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

特に、Ｒ^{1}が水素である場合、Ａが、

【化９】

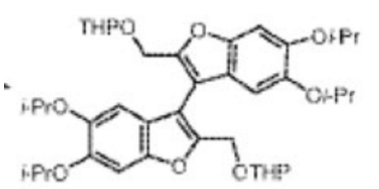


でも

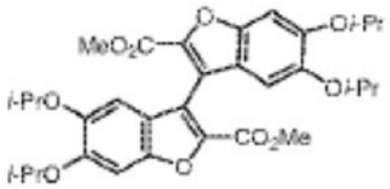
でもなく、かつ

当該化合物が、

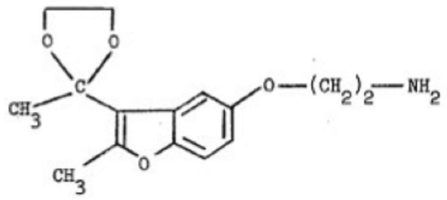
【化１０】



、でも



、でも



でもない。

【００６２】

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

【００６３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1}$－$_{6}$－アルキル、

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－を通して任意に接続され、各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す。
いくつかの実施形態において、Ｒ^{1}は、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、
－ＯＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、
－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロア

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

【００６４】

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

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

の、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＮＣ$_{1-6}$－アルキルＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
－ＳＨ、
各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｓ－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル、
非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－

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

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

しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、を表す。

【００６５】

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

【００６６】

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

【００６７】
好ましくは、R^1は、－Ｈ、－ＣＮ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、又は－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、より好ましくは、－Ｈ、－CH_3、又は－CF_2Hを表す。
【００６８】
いくつかの実施形態において、Ａは、
３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和又は不飽和の、各場合において、非置換の、R^2で一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、
３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、各場合において、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロ－シクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、R^2で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、－R^2で一置換若しくは多置換の－フェニル、
５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、R^2で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。
【００６９】
いくつかの実施形態において、Ａは、
３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、各場合において、飽和又は不飽和の、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－$CFCl_2$、－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－OCF_3、－OCF_2H、－$OCFH_2$、－OCF_2Cl、－$OCFCl_2$、－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（C_{1-6}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル

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

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

非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝

Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－フェニル、

５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００７０】

いくつかの実施形態において、Ａは、

飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレ

ン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、３～１４員シクロアルキル、特に、飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互い独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、３～１４員シクロアルキル、

３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、アゼタン、１，４－オキサゼパン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、ジアゼパン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、オキサゾリン、オキセタン、モルホリン、ピペラジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、キヌクリジン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサンから選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$

－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル、

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

非置換の－フェニル、

５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、オキサゾール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（

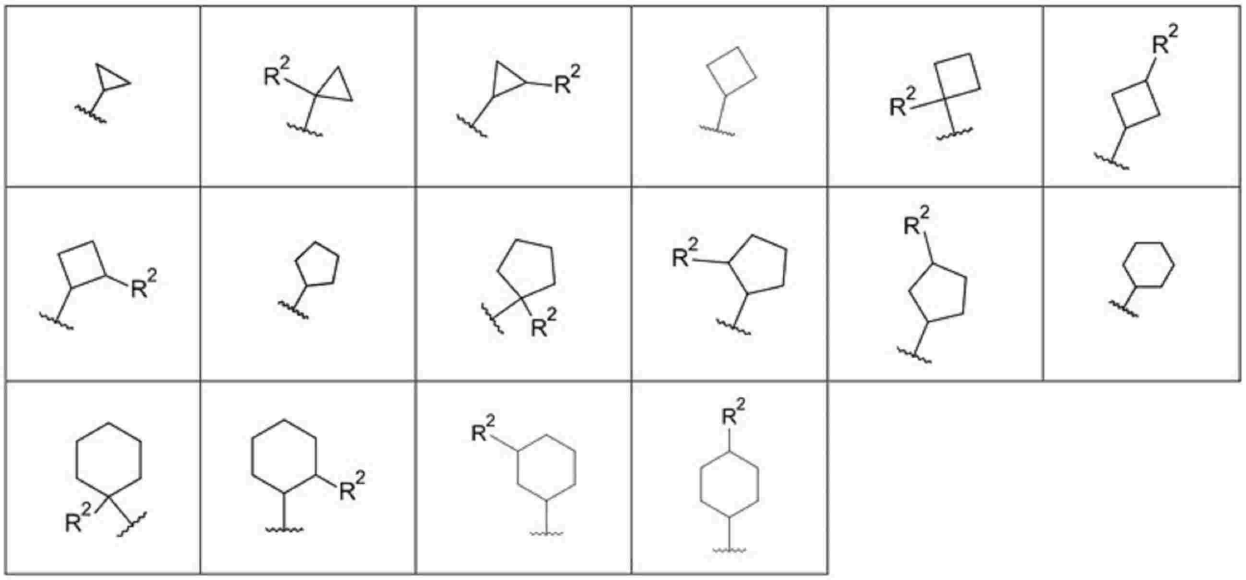
Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、５～１４員ヘテロアリール、５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、各場合において、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、オキサゾール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、各場合において、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦＣｌ２、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２からなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは二置換の、５～１４員ヘテロアリール、を表す。

【００７１】

いくつかの実施形態において、Ａは、

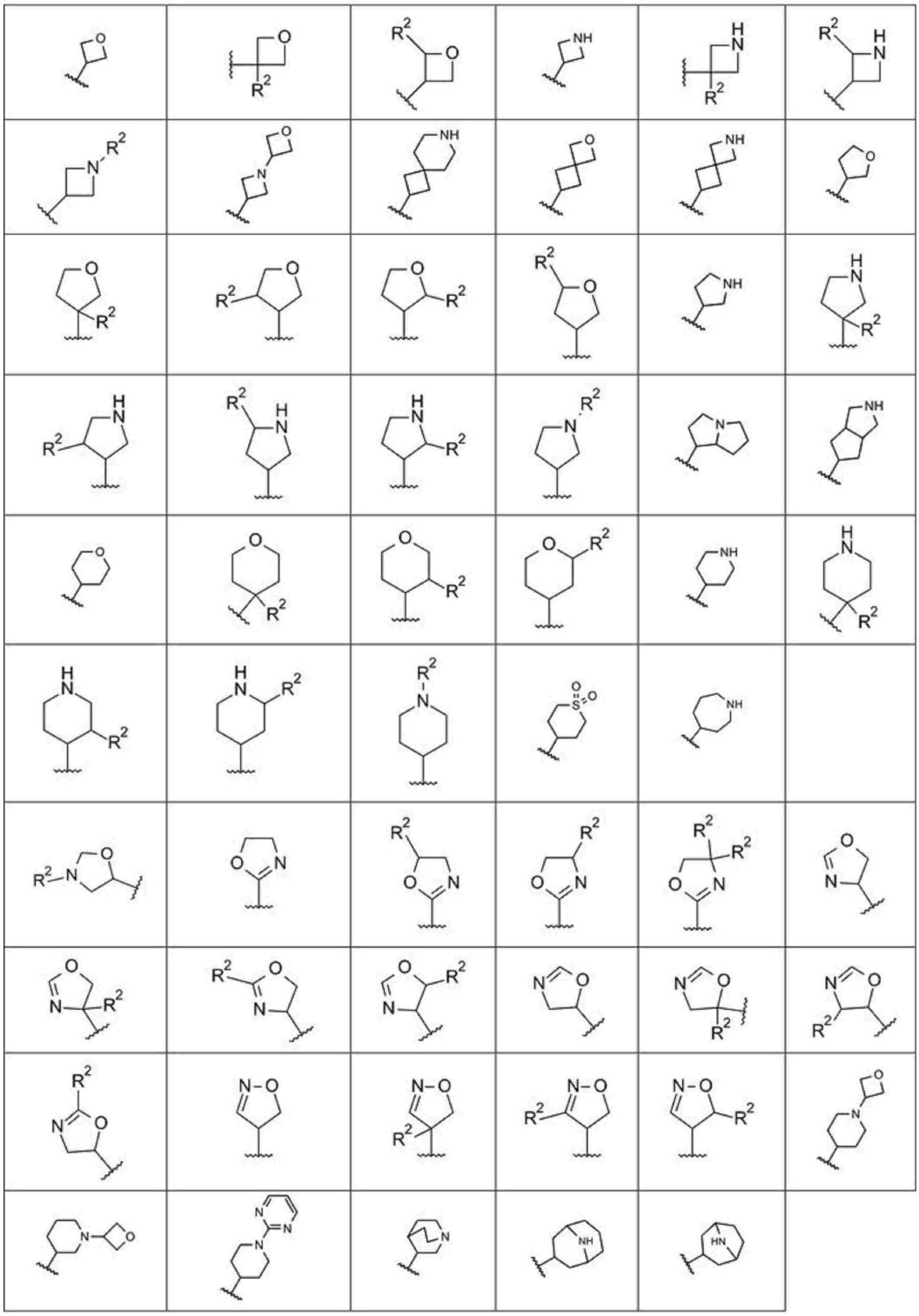
飽和の、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の３～１３員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の３～１１員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキルを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択されるシクロアルキル残基：

【表１】



又は
飽和の、不飽和の、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の３～１３員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の３～１１員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和の、不飽和の、非置換の、Ｒ^{2}で一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキルを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択されるヘテロシクロアルキル残基：

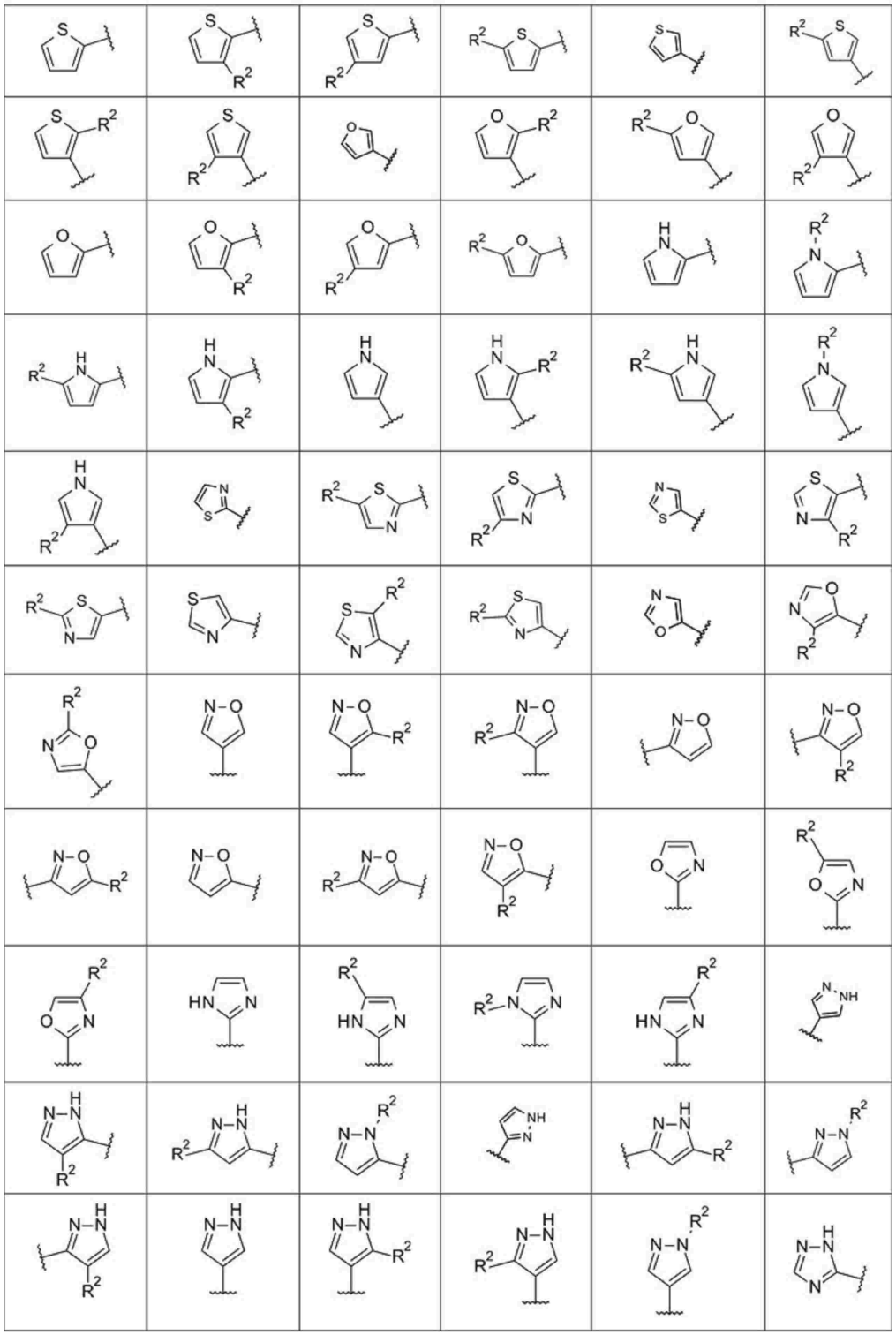
【表２】



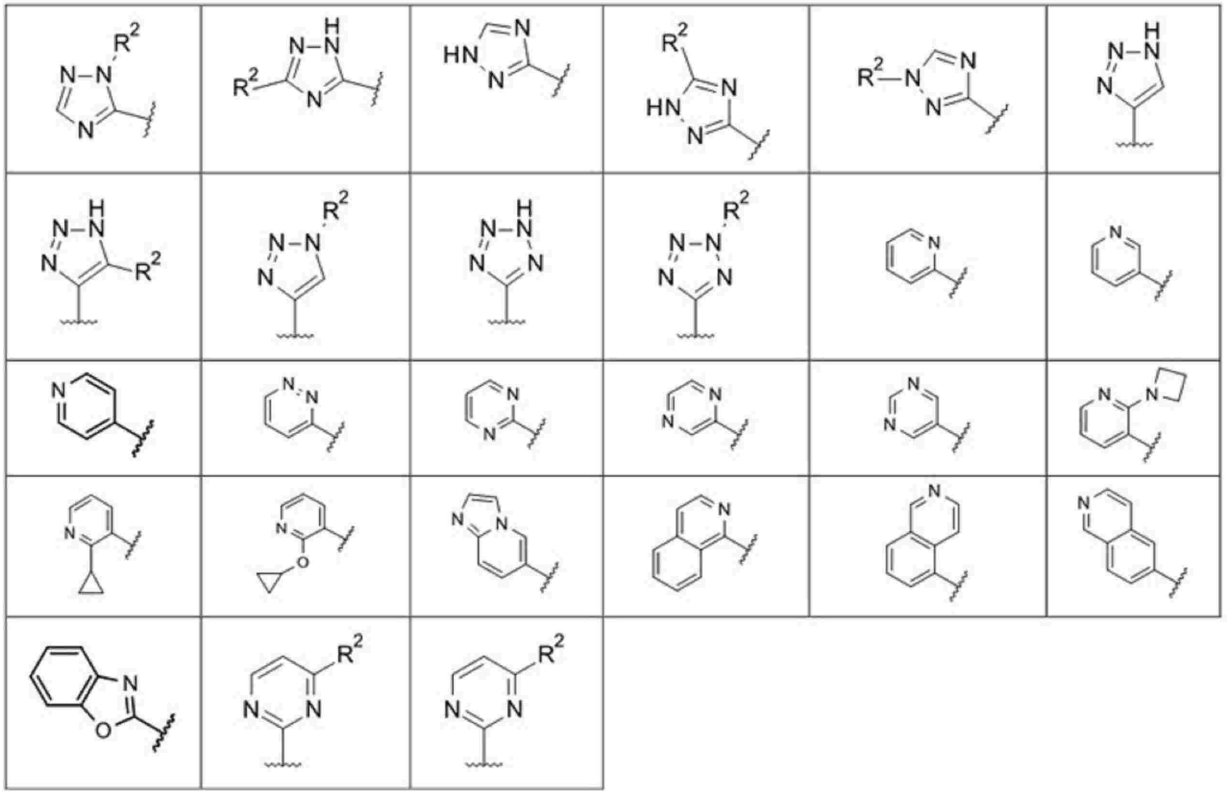
又は
非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の６～８員アリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換のフェニル、又は
非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、Ｒ２で一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、Ｒ

^{2}で一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択される残基を表す：

【表３－１】



【表３－２】



【００７２】

いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-6}－アルキレン－CFH_2、－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－OCF_3、－OCF_2H、－$OCFH_2$、－OCF_2Cl、－$OCFCl_2$、－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、Ｏ－（６～１４員アリール）、Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員環）シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（６～１４員アリール）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－

Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＳＨ、－ＳＣＦ３、－ＳＣＦ２Ｈ、－ＳＣＦＨ２、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ－（６～１４員アリール）、－Ｓ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）－（６～１４員アリール）、－Ｓ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（６～１４員アリール）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－（６～１４員アリール）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（６～１４員アリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（６～１４員アリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（３～１４員ヘテロシクロアルキル））、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）（３～１４員シクロアルキル）を表し、好ましくは、Ｒ２は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ２、＝Ｏ、－Ｃ１－６－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、

－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、Ｏ－（６～１４員アリール）、Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、Ｏ－（５～１４員）ヘテロアリール）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）

Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（６～１４員アリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－（６～１４員アリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）（３～１４員シクロアルキル）から選択され、好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、Ｏ－（６～１４員アリール）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員）シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル

）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）（３～１４員シクロアルキル）から選択され、好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）から選択され、好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル

、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦＨ２、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（６～１４員アリール）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）から選択され、好ましくは、Ｒ２は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ１－６－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＳＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－

Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$から選択され、好ましくは、Ｒ^{2}は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－ＣＮ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦＣｌ$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$から選択される。

【００７３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$は、互いに独立して、

－Ｈ、

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

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

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

【００７４】

好ましくは、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$は、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル）$_2$を示す。

【００７５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$のうちの少なくとも１つは、－Ｈではない。

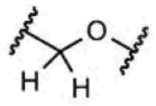
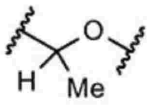
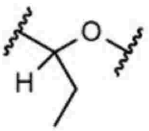
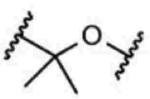
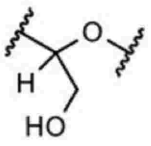
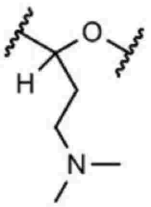
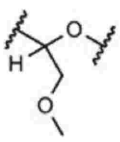
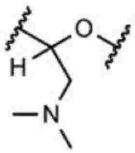
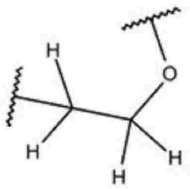
【００７６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$は、両方とも－Ｈである。

【００７７】

好ましい実施形態において、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$を表し、得られる部分－Ｏ－（ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$）$_n$－は、以下からなる群から選択される残基を表す。

【表４】

【００７８】
いくつかの実施形態において、R^5は、－Ｈを表し、$R^{5'}$は、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－C_{1-3}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－C_{1-3}－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－C_{1-3}－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、及び－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｈ又はC_{1-3}－アルキルからなる群から選択される残基を表す。

【００７９】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＮＨC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－ＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_{1-6}－ヘテロアルキル、を表す。

【００８０】
いくつかの実施形態において、R^6、R^7、及びR^8は、互いに独立して、
－Ｈ、
－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－SF_5、－ＣＮ、－NO_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－NH_2、
各場合において、飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯC_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－ア

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

－６－アルキル）２、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ１－６－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ１－６－アルキル、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－ＮＨ２、－ＮＨＣ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｃ１－６－アルキレン－ＮＨ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ１－６－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ２、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）２、－Ｓ（＝Ｏ）２Ｃ１－６－アルキル、－フェニル、－Ｃ１－６－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される置換基で一置換若しくは多置換の、－Ｃ１－６－ヘテロアルキル、を表す。
【００８１】
好ましくは、Ｒ６、Ｒ７、及びＲ８は、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＯＨ、－ＳＨ、－ＳＦ５、－ＣＮ、－ＮＯ２、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ２、

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

【００８２】

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

【００８３】

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

【００８４】

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

【００８５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{6}は、－Ｈを表さない。

【００８６】

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

【００８７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{7}は、－Ｈを表さない。

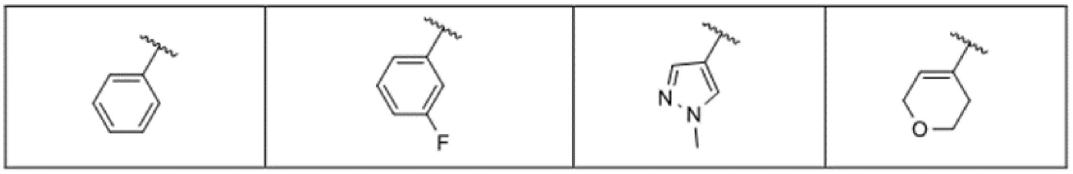
【００８８】

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

【００８９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}は、互いに独立して、－Ｈ、又は以下のものからなる群から選択される残基を表す：

【表５】



【００９０】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す。
【００９１】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈを表さない。
【００９２】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{8}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又はＣＨ$_{3}$、好ましくは、－Ｆからなる群から選択される残基を表す。
【００９３】
いくつかの実施形態において、
（ｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}は各々、－Ｈを表すか、又は
（ｉｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの２つは、－Ｈを表し、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの他方は、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_{3}$を表すか、又は
（ｉｉｉ）Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの１つは、－Ｈを表し、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}のうちの他方は、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、若しくは－ＣＨ$_{3}$を表す。
【００９４】
いくつかの実施形態において、Ｗは、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換であり、特に、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは非芳香族不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであり、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の、３～６員シクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の

６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、
－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルであって、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは二置換である、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す。
いくつかの実施形態において、Ｗは、
非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換、一置換若しくは多置換の３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員飽和シクロアルキル、５～６員シクロアルケニルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員飽和シクロアルキル、５～１４員シクロアルケニル、８～１４員シクロアルキニル、好ましくは、非置換、一置換若しくは多置換の３～１２員飽和シクロアルキル、５～１２員シクロアルケニル、８～１２員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員飽和シクロアルキル、５～１０員シクロアルケニル、８～１０員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員飽和シクロアルキル、５～８員シクロアルケニル、８員シクロアルキニル、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員飽和シクロアルキル、５～６員シクロアルケニル、

非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、
－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニルであって、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アルキル、アルケニル、若しくはアルキニルが、非置換、一置換若しくは二置換である、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$－アルキニル、を表す。

【００９５】

いくつかの実施形態において、Ｗは、
飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキルであって、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該シクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員シクロアルキル、好ましくは、飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員シクロアルキ

ル、
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリールであって、当該アリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該アリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキルであって、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロシクロアルキルが、非置換、一置換若しくは二置換である、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１２員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～８員ヘテロシクロアルキル、好ましくは、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～６員ヘテロシクロアルキル、
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリールであって、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは三置換であり、好ましくは、当該ヘテロアリールが、非置換、一置換若しくは二置換である、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～８員ヘテロアリール、
各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の、－C_1－C_6－アルキル、－C_2－C_6－アルケニル、－C_2－C_6－アルキニル、を表し、
置換基は、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－C_{1-6}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－CF_2Cl、－$CFCl_2$、－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－Ｃ（＝Ｏ）－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－OC_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－ＯＨ、＝Ｏ、－OC_{1-6}－アルキル、－NH_2、－ＮＨC_{1-6}－アルキル、－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ－C_{1-6}－アルキレン－CF_3、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-6}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$C_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NH_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$C_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$C_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員ヘテロシクロアルキル、非置換の－フェニル、５～１４員ヘテロアリールからなる群から互いに独立して選択される。
【００９６】

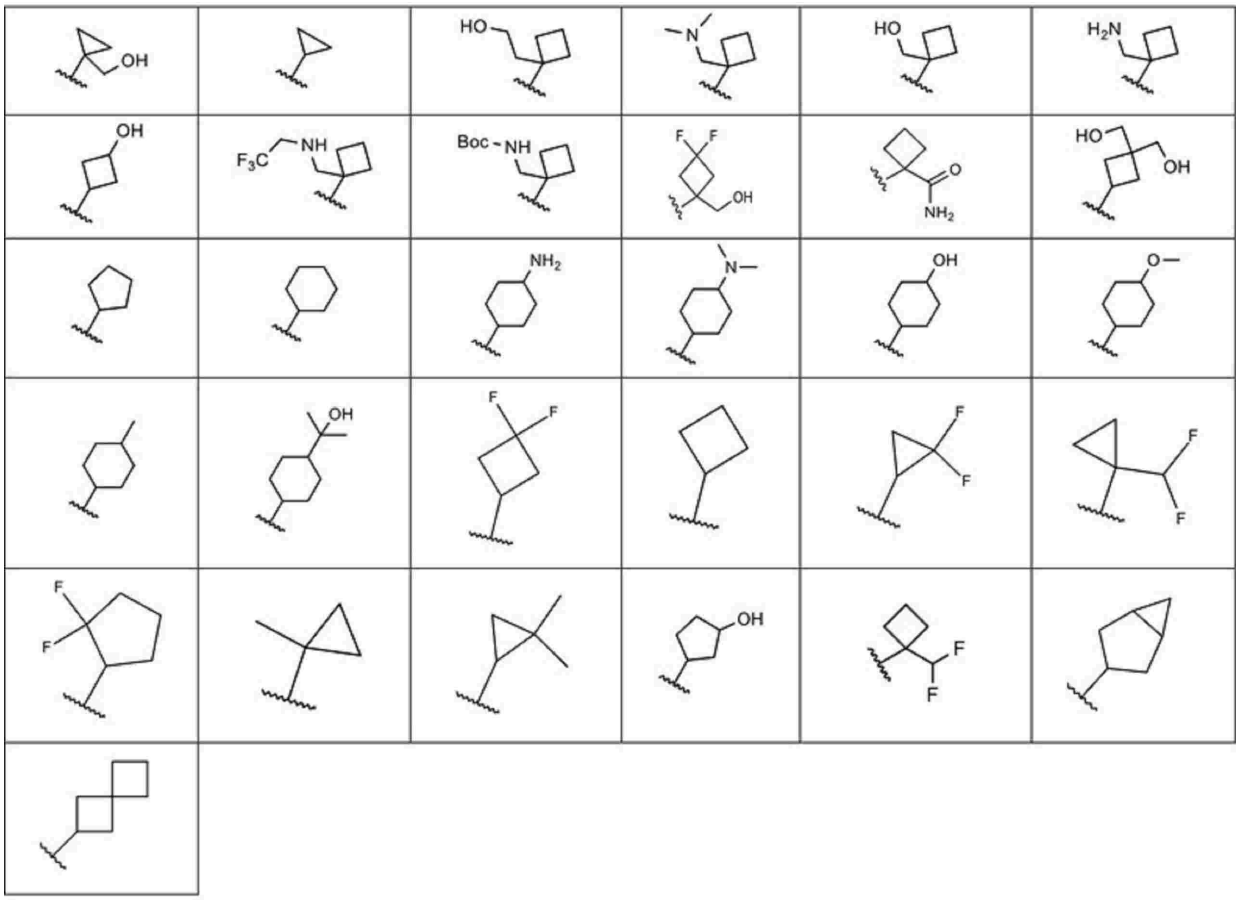
いくつかの実施形態において、Ｗは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルを表し、好ましくは、Ｗは、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和の、一置換若しくは多置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換若しくは二置換の５～１２員ヘテロアリール、又は各場合において、非置換の、一置換若しくは二置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルを表し、好ましくは、Ｗは、非置換の、一置換若しくは二置換の３～１０員シクロアルキル、非置換の、一置換若しくは二置換の６～１２員アリール、飽和若しくは不飽和、一置換若しくは二置換の３～１０員ヘテロシクロアルキル、一置換又は二置換の５～１２員ヘテロアリール、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル及びｔ－ブチル、ペンチル、ヘキシル－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－ＣＣｌ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＣｌ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す。

【００９７】

いくつかの実施形態において、Ｗは、

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

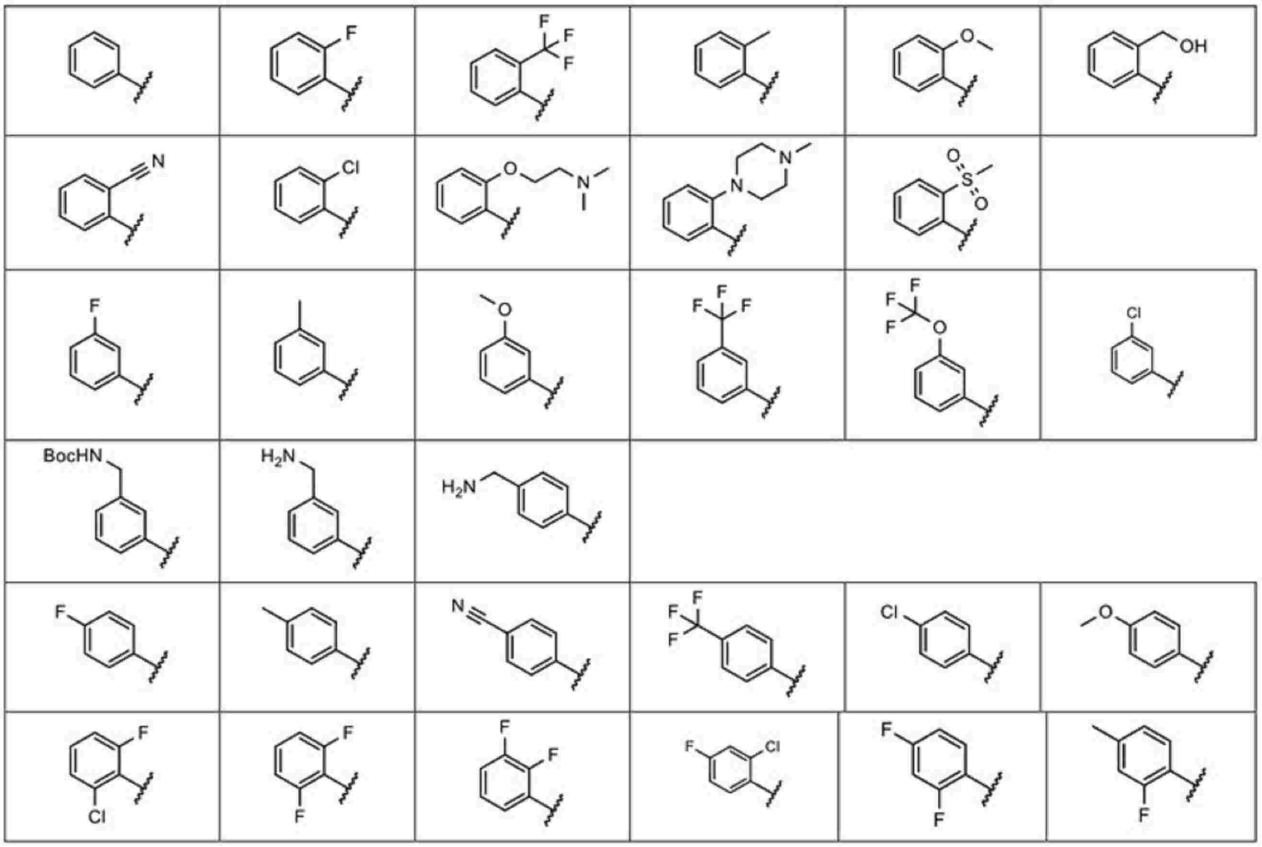
【表６】



非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール、好ましくは、非置換の、一置換

若しくは多置換の６～１２員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～１０員アリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の６～８員アリールを表し、好ましくは、以下のものからなる群から選択されるフェニル残基：

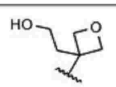
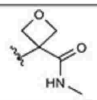
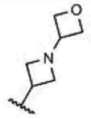
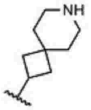
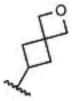
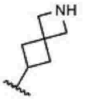
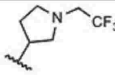
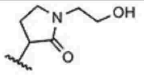
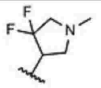
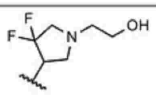
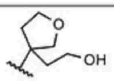
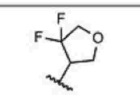
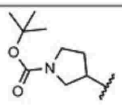
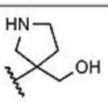
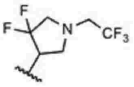
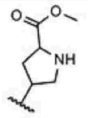
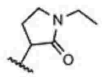
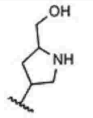
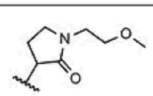
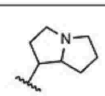
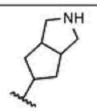
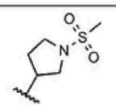
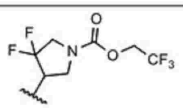
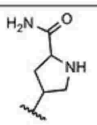
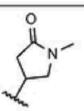
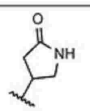
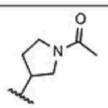
【表７】



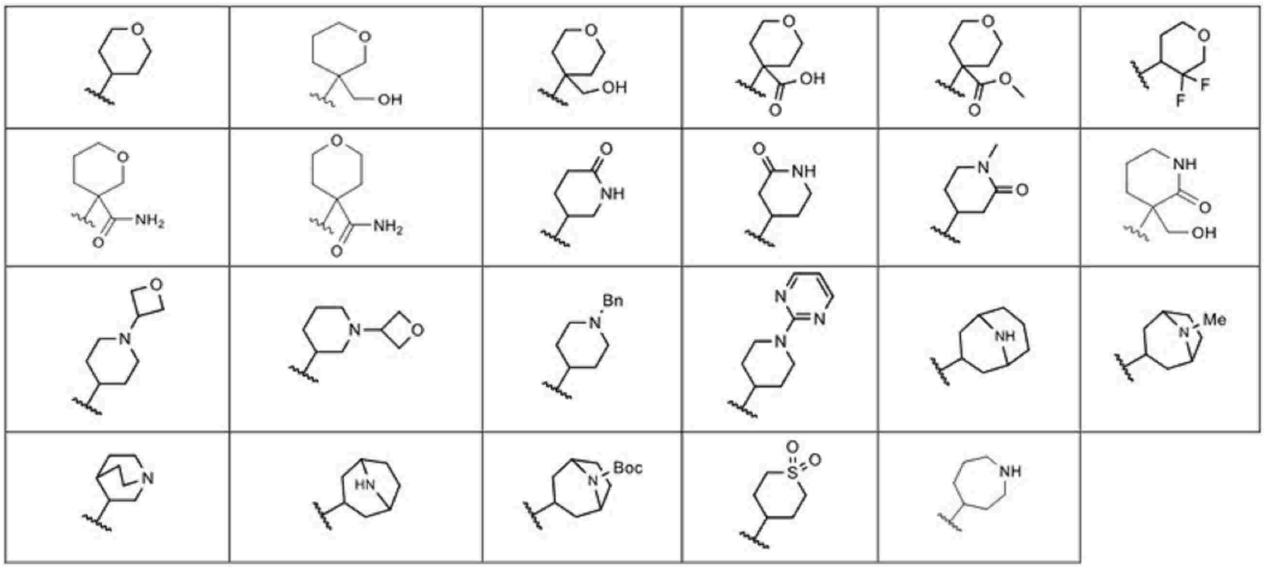
又は

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

【表８－１】

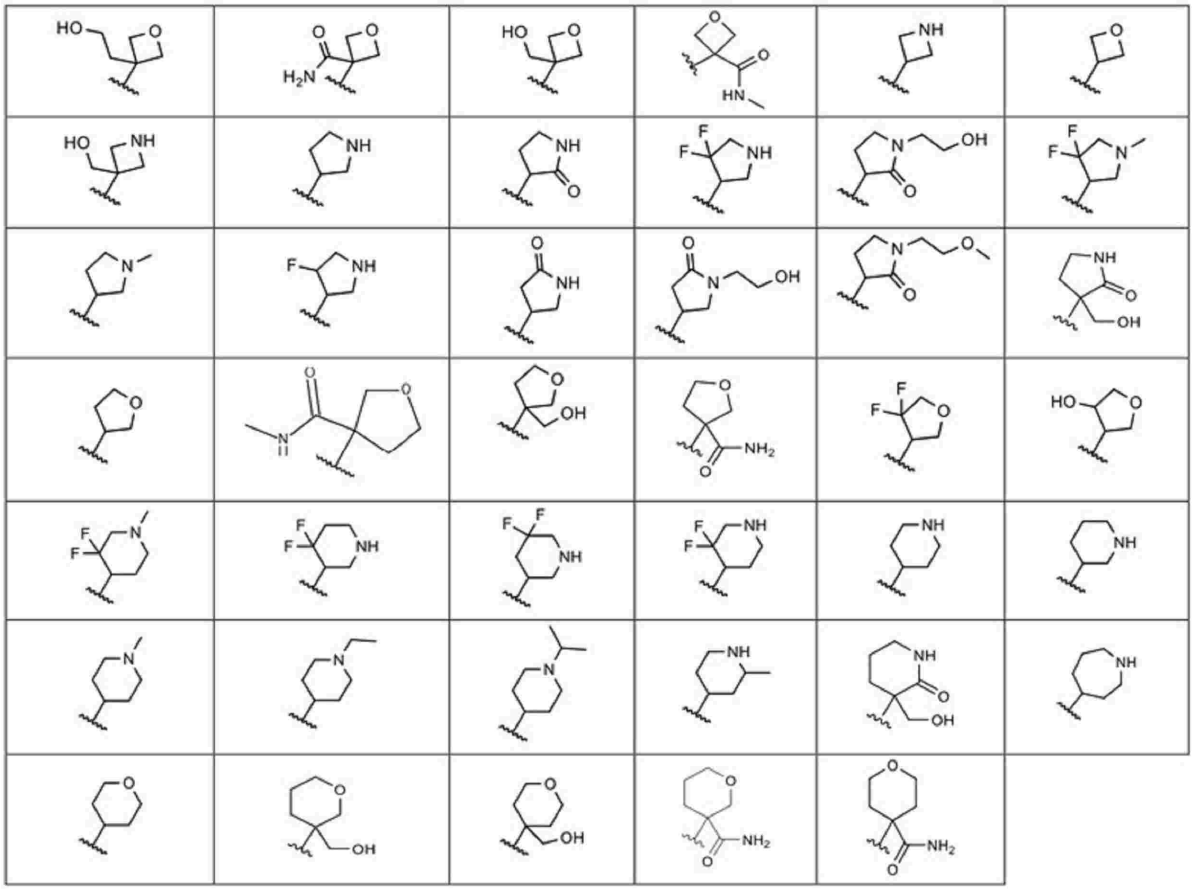
					
					
					
					
					
					
					

【表８－２】



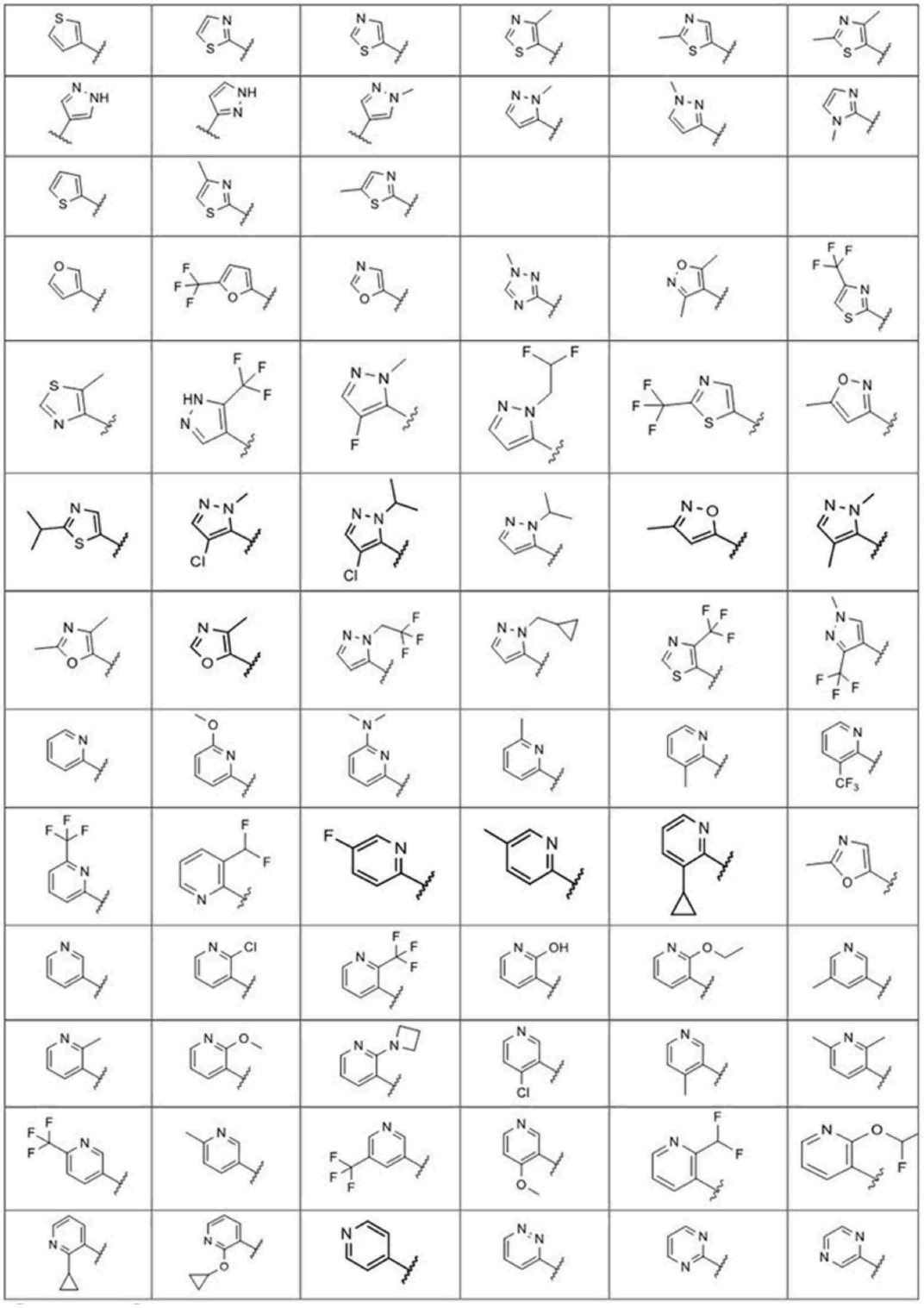
からなる群から選択される、より好ましくは、以下のもの：

【表９】

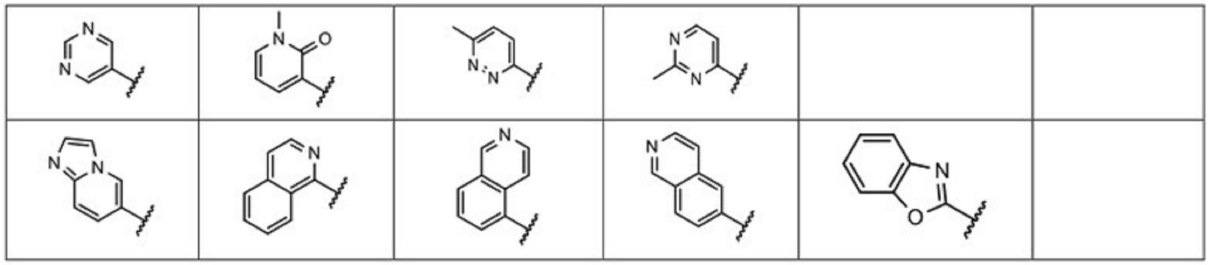


からなる群から選択されるヘテロシクロアルキル残基、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１２員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～１０員ヘテロアリール、好ましくは、非置換の、一置換若しくは多置換の５～９員ヘテロアリールを表し、より好ましくは、以下のもの：

【表１０－１】

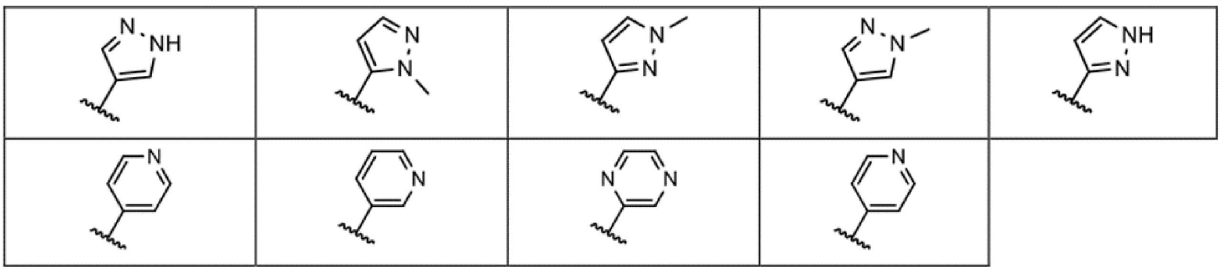


【表１０－２】



からなる群から選択される残基を表し、より好ましくは、以下のもの：

【表１１】



からなる群から選択される残基、又は

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

【００９８】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、カルバゾール、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インダゾール、インドール、インドリジン、イソベンゾフラン、イソインドール、ノリン、イソチアゾール、イソオキサゾール、ナフチリジン、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、フタラジン、プリン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キナゾリン、キノリン、キノキサリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、非置換、一置換若しくは多置換のベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ベンゾチアゾール、ベンゾチオフェン、シンノリン、ジベンゾフラン、フラン、チオフェン、フラザン、イミダゾール、イミダゾピリジン、インドール、イソベンゾフラン、イソインドール、イソキノリン、イソオキサゾール、オキサジアゾール、オキサゾール、オキシインドール、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピリジン、ピリミジン、ピロール、キノリン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオフェン、トリアジン、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリミジンから選択され、この定義は、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のフラン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、トリアゾール、ピリジン、イソキノリン、ベンゾチアゾール、ピリダジン、ピリミジン、イミダゾピリジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、非置換の、一置換若しくは多

置換のフラン－２－イル、フラン－３－イル、チオフェン－２－イル、チオフェン－３－イル、ピラゾール－５－イル、オキサゾール－５－イル、イソオキサゾール－４－イル、チアゾール－２－イル、チアゾール－５－イル、１，２，４－トリアゾール－３－イル、１，２，３－トリアゾール－４－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、イソキノリン－１－イル、イソキノリン－５－イル、ベンゾ［ｄ］チアゾール－２－イル、ピリダジン－３－イル、ピリミジン－５－イルイル、及びイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イルから選択される。

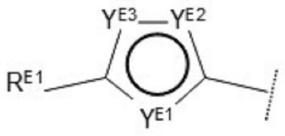
【００９９】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルは、各場合において、非置換の、一置換若しくは多置換のアゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、１，１－ジオキソチアシクロヘキサン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼパン、アゼチジン、アジリジン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、チアゾリジン、チオラン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、２－アザスピロ［３．３］ヘプタン、２－オキサスピロ［３．３］ヘプタン、７－アザスピロ［３．５］ノナン、ヘキサヒドロ－１Ｈ－ピロリジン、ヘキサヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、オクタヒドロシクロペンタ［ｃ］ピロール、及びオクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼパン、アゼチジン、アジリジン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、チアゾリ、ジン、チオラン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェンから選択され、好ましくは、この定義は、各場合において、一置換若しくは多置換のアゼチジン、ジオキサン、イミダゾリジン、イソキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－２－イル、テトラヒドロフラン－１－イル、テトラヒドロフラン－２－イル、テトラヒドロピラン－１－イル、テトラヒドロピラン－２－イル、テトラヒドロピラン－３－イル、テトラヒドロピラン－４－イル、チアゾリジン、チオラン、及びインドリンから選択される。

【０１００】

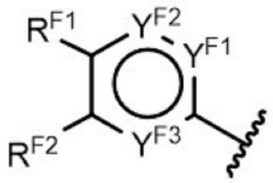
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｅ）による残基を表す：

【化１１】



（E）

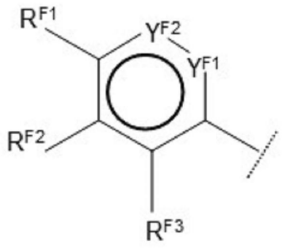
式中、
Y^{E1}は、－Ｎ＝、－ＮＲ^{E2}－、Ｓ、Ｏ、又は－ＣＲ^{E3}＝を表し、Y^{E2}は、－Ｎ＝、－ＮＲ^{E3}－、Ｓ、Ｏ、又は－ＣＲ^{E4}＝を表し、Y^{E3}は、－Ｎ＝、－ＮＲ^{E4}－、Ｓ、Ｏ、又は－ＣＲ^{E5}＝を表すが、Y^{E1}、Y^{E2}、及びY^{E3}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲ^{E3}＝、－ＣＲ^{E4}＝、及び－ＣＲ^{E5}＝ではないことを条件とする。
別の好ましい実施形態において、Ｗは、一般式（Ｅ）による残基を表し、
式中、ＹＥ１は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ２－、Ｓ、又は－ＣＲＥ３＝を表し、ＹＥ２は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ３－、Ｓ、又は－ＣＲＥ４＝を表し、ＹＥ３は、－Ｎ＝、－ＮＲＥ４－、Ｓ、又は－ＣＲＥ５＝を表すが、ＹＥ１、ＹＥ２、及びＹＥ３のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲＥ３＝、－ＣＲＥ４＝、及び－ＣＲＥ５＝ではないことを条件とする。
R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CH_2－シクロプロピル、－CH_2CF_3、－CH_2CHF_2、又は－CF_3を表し、より具体的には、R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、又は－CF_3を表すが、好ましくは、R^{E1}、R^{E2}、R^{E3}、及びR^{E4}のうちの１つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。
【０１０１】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｆ’）による残基を表す：
【化１２】



（F’）

式中、
Y^{F1}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F4}＝を表し、Y^{F2}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F5}＝を表し、Y^{F3}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F3}＝を表すが、Y^{F1}及びY^{F2}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲ^{F4}＝及び－ＣＲ^{F5}＝ではないことを条件として、
R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、又は－アゼチジニルを表すが、好ましくは、R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}のうちの１つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。
【０１０２】
いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｆ）による残基を表す：

【化１３】



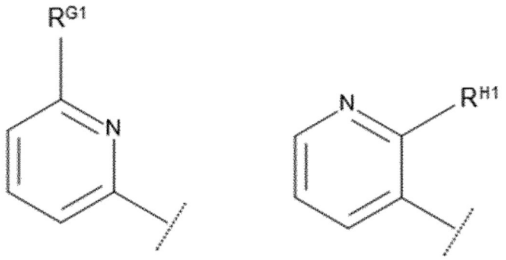
(F)

式中、
Y^{F1}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F4}＝を表し、Y^{F2}は、－Ｎ＝又は－ＣＲ^{F5}＝を表すが、Y^{F1}及びY^{F2}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－ＣＲ^{F4}＝及び－ＣＲ^{F5}＝ではないことを条件として、
R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}は、互いに独立して、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｃｌ、又は－アゼチジニルを表すが、好ましくは、R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}のうちの１つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。

【０１０３】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｇ）又は（Ｈ）による残基を表す：

【化１４】



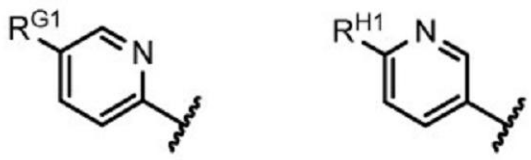
(G) (H)

式中、R^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｃｌ、アゼチジニル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、及び－ＣＨＦ$_2$からなる群から選択されるか、又はR^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｃｌ、及びアゼチジニルからなる群から選択される。

【０１０４】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、一般式（Ｇ’）又は（Ｈ’）による残基を表す：

【化１５】



(G') (H')

式中、R^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｃｌ、アゼチジニル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、及び－ＣＨＦ$_2$からなる群から選択されるか、又はR^{G1}及びR^{H1}は、－Ｈ、－ＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$、－Ｃｌ、及びアゼチジニルからなる群から選択される。

【０１０５】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、本明細書で先に定義される一般式（Ｅ）、（Ｆ）、（Ｆ’）、（Ｇ）、（Ｈ）、（Ｇ’）、又は（Ｈ’）による残基を表す。

【０１０６】

いくつかの実施形態において、「一置換若しくは多置換」という用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（ＯＨ）、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－

Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－フェニル、－Ｃ（＝Ｏ）－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、

－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＨ、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－ＳＣＦ$_3$、－ＳＣＦ$_2$Ｈ、－ＳＣＦＨ$_2$、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１４員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）、３～１４員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１４員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｏ－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｏ－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｏ－フェニル、－Ｏ－（５～１４員ヘテロアリール）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員シクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－フェニル、又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－（５～１４員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で

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

Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_2$Ｈ、－ＯＣＦＨ$_2$、－ＯＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ$_2$、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１２員シクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員シクロアルキル）、３～１２員ヘテロシクロアルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１２員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、５～１２員ヘテロアリール、－Ｃ$_{1-6}$－アル

キレン－（５～１２員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味し、好ましくは、この用語は、各場合において、独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＯＣ_{1-5}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－$ＮＨ_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）$_2$、－ＯＨ、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－ＯＨ、＝Ｏ、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－$ＮＨ_2$、－$ＮＯ_2$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－ＮＨ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－ＮＨ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）、－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）$_2$、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）$_2$、－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-5}$－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－$Ｃ_{1-5}$－アルキル、－ＳＨ、－Ｓ－$Ｃ_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$Ｃ_{1-5}$アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＨ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$ＮＨ_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＨ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、３～１０員シクロアルキル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員シクロアルキル）、３～１０員ヘテロシクロアルキル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－（３～１０員ヘテロシクロアルキル）、－フェニル、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－フェニル、５～１０員ヘテロアリール、－$Ｃ_{1-5}$－アルキレン－（５～１０員ヘテロアリール）から互いに独立して選択される１つ以上の置換基で置換されることを意味する。

【０１０７】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員シクロアルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_2Ｈ$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、及び－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－$ＣＨ_3$、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_3$、及び－$ＯＣＨ_3$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１０８】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の６～１４員アリールは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_2Ｈ$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、及び－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－$ＣＨ_3$、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_3$、及び－$ＯＣＨ_3$－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１０９】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の５～１４員ヘテロアリールは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－$ＣＦＨ_2$、－$ＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＣＦＣｌ_2$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦ_2Ｈ$、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－$ＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_3$、－$ＯＣＦ_2Ｈ$、－$ＯＣＦＨ_2$、－$ＯＣＦ_2Ｃｌ$、－$ＯＣＦＣｌ_2$、－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－Ｏ－$Ｃ_{1-3}$－アルキル、及び－$Ｃ_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－$ＣＨ_3$、－$ＣＦ_3$、－$ＣＦ_2Ｈ$、－ＣＦＨ

２、－ＯＣＦ３、及び－ＯＣＨ３－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１１０】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の－Ｃ１－Ｃ６－アルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ１－３－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－３－アルキル、及び－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ３、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＯＣＦ３、及び－ＯＣＨ３－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１１１】

いくつかの実施形態において、Ｗの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルは、非置換、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、Ｃ１－３－アルキル、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＣＦ２Ｃｌ、－ＣＦＣｌ２、－Ｃ１－３－アルキレン－ＣＦ３、－Ｃ１－３－アルキレン－ＣＦ２Ｈ、－Ｃ１－３－アルキレン－ＣＦＨ２、－ＯＣＦ３、－ＯＣＦ２Ｈ、－ＯＣＦＨ２、－ＯＣＦ２Ｃｌ、－ＯＣＦＣｌ２、－Ｏ－Ｃ１－３－アルキル、－Ｃ１－３－アルキレン－Ｏ－Ｃ１－３－アルキル、及び－Ｃ１－３－アルキレン－ＯＨ、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＣＨ３、－ＣＦ３、－ＣＦ２Ｈ、－ＣＦＨ２、－ＯＣＦ３、及び－ＯＣＨ３－からなる群から選択される置換基で一置換又は二置換である。

【０１１２】

本発明のいくつかの実施形態において、化合物は、以下のものからなる群から選択される：

化合物００１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタノール、

化合物００２－（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１，３－オキサゾール－５－イル）メタノール、

化合物００３－２－ヒドロキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド、

化合物００４－（１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロピル）メタノール、

化合物００５－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］シクロプロパンスルホンアミド、

化合物００６－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンスルホンアミド、

化合物００７－（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール、

化合物００８－３－メトキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］プロパンアミド、

化合物００９－２－ヒドロキシ－２－メチル－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］プロパンアミド、

化合物０１０－２－メトキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド、

化合物０１１－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボニトリル、
化合物０１２－２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝アセトアミド、
化合物０１３－１－シクロプロピル－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンスルホンアミド、
化合物０１４－１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－アミン、
化合物０１５－２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝プロパンアミド、
化合物０１６－１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンアミン、
化合物０１７－２－ヒドロキシ－Ｎ－（１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロピル）アセトアミド、
化合物０１８－３－［（｛３－［４，４－ビス（ヒドロキシメチル）－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾール－２－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－５－イル｝オキシ）メチル］ピリジン－２－オール、
化合物０１９－１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル、
化合物０２０－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド、
化合物０２１－｛１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロピル｝メタノール、
化合物０２２－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド、
化合物０２３－５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－２Ｈ－１，２，３，４－テトラゾール、
化合物０２４－１－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２５－１－［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２６－１－｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２７－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－アミン、
化合物０２８－５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－３－メチル－１，２，４－オキサジアゾール、
化合物０２９－２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－６－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピラジン、
化合物０３０－２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－４－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピリミジン、
化合物０３１－｛６－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピラジン－２－イル｝メタノール、
化合物０３２－｛２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－

イル］ピリミジン－４－イル｝メタノール、
及びそれらの生理学的に許容される塩。
【０１１３】
本発明はまた、本発明の少なくとも１つの化合物を含む薬学的組成物を包含する。本発明はまた、本発明の少なくとも１つの化合物と、薬学的目的で許容される少なくとも１つの担体、賦形剤又は希釈剤と、を含む、薬学的組成物を包含する。
【０１１４】
いくつかの実施形態において、本発明は、疼痛又はてんかん、好ましくは疼痛又はてんかん性脳症の予防及び／又は治療（のための組成物の調製）における、式（Ｉ）の少なくとも１つの化合物、又はその任意のサブグループの使用に関する。
【０１１５】
いくつかの実施形態において、本発明は、代謝性疼痛の予防及び／又は治療の方法であって、疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択され、好ましくは術後疼痛である、方法に関する。
【０１１６】
好ましい置換基を含むＡ、Ｔ、Ｕ、Ｗ、R^1、R^2、R^5、$R^{5'}$、ｎ、R^6、R^7、R^8の全ての定義、好ましい実施形態、及び好ましい意味は、本発明による化合物にも同様に適用するが、これらは、必ずしも疼痛又はてんかんの治療に使用することに限定されない。したがって、本発明のこの態様は、本発明の化合物それ自体、本発明の化合物を含む組成物、本発明の化合物を含む医薬、並びに疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症などのＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／又は治療における使用のための、並びに／又は疼痛、てんかん及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するための本発明の化合物に関する。好ましくは、疼痛は、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される。より好ましくは、疼痛は、術後疼痛である。
【０１１７】
本発明のいくつかの実施形態において、化合物は、上述の化合物００１～化合物０３２と、それらの生理学的に許容される塩と、からなる群から選択される。
【０１１８】
本発明の別の態様は、上記の本発明による化合物を含む薬学的組成物又は医薬に関する。
【０１１９】
本発明の化合物は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニストであることが示されており、したがって、本発明は、化合物それ自体、医薬として使用するための、より具体的には、治療有効量の本発明の化合物を有する対象におけるＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療における医薬としての使用のための化合物を提供する。
【０１２０】
いくつかの実施形態において、本発明の化合物は、治療のために投与される唯一の薬理学的に活性な化合物である。本発明の別の実施形態において、本発明の化合物は、ＴＲＰＭ３媒介性障害の治療又は予防のために他の治療剤と組み合わせて使用され得る。したがって、本発明はまた、
－本明細書の式及び実施形態のうちの１つ以上の化合物、及び
－ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のために、同時、別個又は連続的使用のための複合調製物の形態で生物学的に活性な薬剤として使用される１つ以上の更なる治療剤又は予防剤、を含む組成物の使用に関する。
【０１２１】
本発明による薬学的組成物又は複合調製物は、企図される使用及び調製物の期待される効果に応じて、広い含有量範囲にわたって本発明の化合物を含有し得る。一般に、複合調製物の本発明の化合物の含有量は、０．１～９９．９重量％、好ましくは１～９９重量％、より好ましくは５～９５重量％の範囲内である。
【０１２２】

いくつかの活性成分が組み合わせて使用される場合、それらが治療される哺乳動物において必ずしも同時にそれらの関節治療効果を直接発揮するとは限らないという事実を考慮して、対応する組成物はまた、別個であるが、隣接する保管庫又は区画内の２つの成分を含有する医療キット又はパッケージの形態であり得る。したがって、後者の文脈では、各活性成分は、他の成分の投与経路とは異なる投与経路に好適な方法で製剤化され得、例えば、それらのうちの一方は、経口又は非経口製剤の形態であり得るのに対して、他方は、静脈内注射用のアンプル又はエアロゾルの形態であり得る。

【０１２３】

当業者はまた、本発明の化合物が、とりわけそれらの環境のｐＨに応じて、多くの異なるプロトン化状態で存在し得ることを認識するであろう。本明細書に提供される構造式は、いくつかの可能なプロトン化状態のうちの１つのみの化合物を示すが、これらの構造は、例示的なものであり、本発明は、任意の特定のプロトン化状態に限定されず、化合物の任意の及び全てのプロトン化形態は、本発明の範囲内に入ることが意図されることが理解されるであろう。

【０１２４】

本明細書で使用される「薬学的に許容される塩」という用語は、本明細書の式の化合物が形成することができる治療活性の非毒性塩形態を意味する。したがって、本発明の化合物は、任意に、本明細書の化合物の塩、特に、例えば、Na^+、Li^+、K^+、Ca^{2+}、及びMg^{2+}を含有する薬学的に許容される非毒性塩を含む。そのような塩は、適切なカチオン、例えば、アルカリ及びアルカリ土類金属イオン、又はアンモニウム及び四級アミノイオンと、酸性アニオン部分、典型的にはカルボン酸との組み合わせによって誘導されるものを含み得る。本発明の化合物は、複数の正電荷又は負電荷を有し得る。本発明の化合物の正味電荷は、正又は負のいずれかであり得る。任意の関連する対イオンは、典型的には、化合物が得られる合成方法及び／又は単離方法によって決定される。典型的な対イオンには、アンモニウム、ナトリウム、カリウム、リチウム、ハロゲン化物、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩など、及びそれらの混合物が含まれるが、これらに限定されない。任意の関連する対イオンの同一性は、本発明の重要な特徴ではなく、本発明は、任意のタイプの対イオンと会合する化合物を包含することが理解されるであろう。更に、化合物は、様々な異なる形態で存在し得るため、本発明は、対イオンと会合する化合物の形態（例えば、乾燥塩）だけでなく、対イオンと会合しない形態（例えば、水溶液又は有機溶液）も包含することが意図される。金属塩は、典型的には、金属水酸化物を本発明の化合物と反応させることによって調製される。このような方法で調製される金属塩の例は、Li^+、Na^+、及びK^+を含有する塩である。より可溶性の低い金属塩は、好適な金属化合物の添加によって、より可溶性の高い塩の溶液から沈殿し得る。加えて、塩は、塩基の中心、典型的にはアミン、又は酸性基へのある特定の有機酸及び無機酸の酸付加から形成され得る。そのような適切な酸の例としては、例えば、ヒドロハロゲン酸、例えば、塩酸若しくは臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸などの無機酸、又は例えば、酢酸、プロパン酸、ヒドロキシ酢酸、２－ヒドロキシプロパン酸、２－オキソプロパン酸、乳酸、ピルビン酸、シュウ酸（すなわち、エタンジオ酸）、マロン酸、コハク酸（すなわち、ブタンジオ酸）、マレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、シクロヘキサンスルファミン酸、サリチル（すなわち、２－ヒドロキシベンゾ）酸、ｐ－アミノサリチル酸などの有機酸が挙げられる。更に、この用語はまた、本明細書の式の化合物並びにそれらの塩が形成することができる溶媒和物、例えば、水和物、アルコラートなども含む。最後に、本明細書の組成物は、それらの非イオン化された本発明の化合物、並びに両性イオン形態、及び水和物の場合には化学量論量の水との組み合わせを含むことを理解されたい。

【０１２５】

１つ以上のアミノ酸、特にタンパク質成分として見出される天然アミノ酸を有する親化合物の塩もまた、本発明の範囲内に含まれる。アミノ酸は、典型的には、塩基性若しくは酸性の基、例えば、リジン、アルギニン若しくはグルタミン酸、又はグリシン、セリン、

スレオニン、アラニン、イソロイシン、若しくはロイシンなどの中性基を有する側鎖を有するものである。

【０１２６】

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

【０１２７】

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

【０１２８】

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

【０１２９】

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

【０１３０】

立体異性体の分離は、当業者に既知の標準的な方法によって達成される。本発明の化合物の１つのエナンチオマーは、光学活性な分解剤を使用したジアステレオマーの形成などの方法により、その反対側のエナンチオマーを実質的に含まないように分離することができる（”Ｓｔｅｒｅｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｃａｒｂｏｎ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，”（１９６２）ｂｙ Ｅ．Ｌ．Ｅｌｉｅｌ，ＭｃＧｒａｗ Ｈｉｌｌ、Ｌｏｃｈｍｕｌｌｅｒ，Ｃ．Ｈ．，（１９７５）Ｊ．Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒ．，１１３：（３）２８３－３０

２）。混合物中の異性体の分離は、（１）キラル化合物によるイオン性ジアステレオマー塩の形成及び分別結晶又は他の方法による分離、（２）キラル誘導体化試薬によるジアステレオマー化合物の形成、ジアステレオマーの分離、及び純粋なエナンチオマーへの変換、又は（３）エナンチオマーがキラル条件下で直接を分離され得る、を含む、任意の好適な方法によって達成することができる。方法（１）において、ジアステレオマー塩は、ブルシン、キニン、エフェドリン、ストリキニン、ａ－メチル－ｂ－フェニルエチルアミン（アンフェタミン）などの鏡像異性的に純粋なキラル塩基と、カルボン酸及びスルホン酸などの酸性官能性を有する非対称化合物との反応によって形成することができる。ジアステレオマー塩は、分別結晶又はイオンクロマトグラフィーによって分離するように誘導され得る。アミノ化合物の光学異性体の分離のために、カンファースルホン酸、酒石酸、マンデル酸、又は乳酸などのキラルカルボン酸又はスルホン酸の添加は、ジアステレオマー塩の形成をもたらし得る。代替的に、方法（２）によって、分解される基質をキラル化合物の１つのエナンチオマーと反応させて、ジアステレオマー対を形成し得る（Ｅｌｉｅｌ，Ｅ．ａｎｄ Ｗｉｌｅｎ，Ｓ．（１９９４）Ｓｔｅｒｅｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，ｐ．３２２）。ジアステレオマー化合物は、非対称化合物を、メンチル誘導体などの鏡像異性的に純粋なキラル誘導体化試薬と反応させ、続いてジアステレオマーの分離及び加水分解によって形成して、遊離の鏡像異性的に濃縮された化合物を得ることができる。光学純度を決定する方法は、ラセミ混合物のキラルエステル、例えば、メンチルエステル又はＭｏｓｈｅｒエステル、ａ－メトキシ－ａ－（トリフルオロメチル）フェニルアセテート（Ｊａｃｏｂ ＩＩＩ．（１９８２）Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．４７：４１６５）を作製することと、２つのアトロプ異性ジアステレオマーの存在に関して、ＮＭＲスペクトルを分析することと、を伴う。安定なジアステレオマーは、アトロプ異性ナフチル－イソキノリンの分離のための方法に従って、正相及び逆相クロマトグラフィーによって分離し、単離することができる（Ｈｏｙｅ，Ｔ．，ＷＯ９６／１５１１１）。方法（３）の下で、２つの非対称エナンチオマーのラセミ混合物は、キラル固定相を使用してクロマトグラフィーによって分離される。好適なキラル固定相は、例えば、多糖類、特にセルロース又はアミロース誘導体である。市販の多糖類ベースのキラル固定相は、ＣｈｉｒａｌＣｅｌ（登録商標）ＣＡ、ＯＡ、ＯＢ５、ＯＣ５、ＯＤ、ＯＦ、ＯＧ、ＯＪ、及びＯＫ、並びにＣｈｉｒａｌｐａｋ（登録商標）ＡＤ、ＡＳ、ＯＰ（＋）及びＯＴ（＋）である。当該多糖類キラル固定相と組み合わせて使用するための適切な溶離液又は移動相は、ヘキサンなどであり、エタノール、イソプロパノールなどのアルコールで修飾される。（”Ｃｈｉｒａｌ Ｌｉｑｕｉｄ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ”（１９８９）Ｗ．Ｊ．Ｌｏｕｇｈ，Ｅｄ．Ｃｈａｐｍａｎ ａｎｄ Ｈａｌｌ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ、Ｏｋａｍｏｔｏ，（１９９０）”Ｏｐｔｉｃａｌ ｒｅｓｏｌｕｔｉｏｎ ｏｆ ｄｉｈｙｄｒｏｐｙｒｉｄｉｎｅ ｅｎａｎｔｉｏｍｅｒｓ ｂｙ Ｈｉｇｈ－ｐｅｒｆｏｒｍａｎｃｅ ｌｉｑｕｉｄ ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒａｐｈｙ ｕｓｉｎｇ ｐｈｅｎｙｌｃａｒｂａｍａｔｅｓ ｏｆ ｐｏｌｙｓａｃｃｈａｒｉｄｅｓ ａｓ ａ ｃｈｉｒａｌ ｓｔａｔｉｏｎａｒｙ ｐｈａｓｅ”，Ｊ．ｏｆ Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒ．５１３：３７５－３７８）。

【０１３１】

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

【０１３２】

化合物が溶液又はスラリーから結晶化される場合、これは、異なる空間的格子配置で結晶化され（この特性は「多形性」と呼ばれる）、異なる結晶形態を有する結晶を形成することができ、これらの各々が「多形体」として知られている。したがって、本明細書で使用される「多形体」という用語は、式（Ｉ）の化合物の結晶形態を指し、分子は、三次元格子部位に局在される。式（Ｉ）の化合物の異なる多形体は、溶解度及び溶解速度、真の

比重、結晶形態、蓄積モード、流動性、及び／又は固体状態の安定性などの１つ以上の物理的特性において、互いに異なり得る。

【０１３３】

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

【０１３４】

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

【０１３５】

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

【０１３６】

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

【０１３７】

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

【０１３８】

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

【０１３９】

当該薬学的組成物及びその製剤で使用するための好適な薬学的担体は、当業者に周知であり、本発明内でのそれらの選択に、特に制限はない。これらはまた、同様のものが、薬学的実施、すなわち、哺乳動物に対して永続的な損傷をもたらさない担体及び添加剤と一致するという条件で、湿潤剤、分散剤、ステッカー、接着剤、乳化剤、表面活性剤、溶媒、コーティング、抗菌剤及び抗真菌剤、等張剤などの添加剤を含み得る。本発明の薬学的組成物は、任意の既知の方法で、例えば、ワンステップ又はマルチステップの手順で、選択された担体材料、及び必要に応じて、表面活性剤などの他の添加剤と、活性成分を均一に混合、コーティング、及び／又は粉砕することによって調製することができる。また、

例えば、活性成分の制御又は持続放出のためのマイクロカプセルの製造のために、通常約１～１０ｇｍの直径を有するマイクロスフィアの形態でそれらを得るために、マイクロナイゼーションによって調製され得る。

【０１４０】

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

【０１４１】

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

【０１４２】

錠剤は、任意に１種以上の副成分とともに、圧縮又は成形によって製造することができる。圧縮錠剤は、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、保存剤、表面活性剤、又は分散剤と任意に混合された、粉末又は顆粒などの自由流動形態で、活性成分を、好適な機械において圧縮することによって調製され得る。成形錠剤は、不活性液体希釈剤で湿らせた粉末化合物の混合物を好適な機械で成形することにより作製することができる。錠剤は、任意に、コーティング又はスコアリングされ得、その中に、活性成分の徐放又は制御放出を提供するように製剤化され得る。眼又は他の外部組織、例えば、口及び皮膚の感染症の場合、製剤は、例えば、０．０７５～２０ｗ／ｗ％（０．６ｗ／ｗ％、０．７ｗ／ｗ％などの０．１ｗ／ｗ％の増分で０．１％～２０％の範囲の活性成分（複数可）を含む）、好ましくは０．２～１５ｗ／ｗ％、最も好ましくは０．５～１０ｗ／ｗ％の量で、活性成分（複数可）を含有する局所軟膏又はクリームとして、任意に適用される。軟膏に製剤化される場合、活性成分は、パラフィン系又は水混和性軟膏基剤のいずれかとともに使用され得る。代替的に、活性成分は、水中油性クリーム基剤を有するクリーム中で製剤化され得る。所望される場合、クリーム基剤の水相は、例えば、少なくとも３０ｗ／ｗ％の多価アルコール、すなわち、プロピレングリコール、ブタン１，３－ジオール、マンニトール、ソルビトール、グリセロール、及びポリエチレングリコール（ＰＥＧ４００を含む）などの２つ以上のヒドロキシル基を有するアルコール、及びこれらの混合物を含み得る。局所製剤は、皮膚又は他の患部を通る活性成分の吸収又は浸透を増強する化合物を含むことが望ましい場合がある。そのような皮膚浸透増強剤の例としては、ジメチルスルホキシド及び関連する類似体が挙げられる。

【０１４３】

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

【０１４４】
製剤に好適な油又は脂肪の選択は、薬学的エマルション製剤に使用される可能性が高いほとんどの油における活性化合物の溶解度が非常に低いため、所望の化粧特性を達成することに基づく。したがって、クリームは、任意に、チューブ又は他の容器からの漏れを避けるために、好適な一貫性を有する非脂肪性、非汚染性及び洗濯可能な生成物であるべきである。ココナツ脂肪酸のジイソアジパート、ステアリン酸イソセチル、プロピレングリコールジエステル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸デシル、パルミチン酸イソプロピル、ステアリン酸ブチル、２－エチルヘキシルパルミテート、又はクロダモル（Ｃｒｏｄａｍｏｌ）ＣＡＰとして知られている分岐鎖エステルのブレンドなどの直鎖又は分岐鎖の、一塩基性又は二塩基性のアルキルエステルが使用され得、最後の３つが好ましいエステルである。これらは、必要とされる性質に応じて、単独で又は組み合わせで使用され得る。代替的に、白色軟質パラフィン及び／又は液体パラフィン又は他の鉱油などの高融点脂質が、使用され得る。

【０１４５】
眼への局所投与に好適な製剤には、活性成分が好適な担体、特に活性成分のための水性溶媒に溶解又は懸濁される点眼剤も含まれる。活性成分は、任意に、そのような製剤中に、０．５～２０％、有利には０．５～１０％、特に約１．５ｗ／ｗ％の濃度で存在する。口腔内の局所投与に好適な製剤としては、香味ベースの通常はスクロース及びアカシア若しくはトラガカント中に活性成分を含むロゼンジ錠、不活性ベースで例えばゼラチン及びグリセリン、又はスクロース及びアカシア中に活性成分を含む香錠、並びに好適な液体担体中に活性成分を含むマウスウォッシュが挙げられる。

【０１４６】
直腸投与のための製剤は、例えば、カカオバター又はサリチレートを含む好適な塩基を有する座薬として提示されてもよい。担体が固体である、経鼻投与のために好適な製剤は、嗅がれる様式で、すなわち、鼻に近づけて維持した粉末の容器からの経鼻経路を介した迅速な吸入によって投与される、例えば、２０～５００ミクロンの範囲の粒子サイズを有する（３０ミクロン、３５ミクロンなどの５ミクロン単位で２０～５００ミクロンの範囲の粒子サイズを有する）粗い粉末を含む。担体が液体である好適な製剤は、例えば、鼻スプレーとして、又は点鼻薬として投与するために、活性成分の水性又は油性溶液を含む。エアロゾル投与に好適な製剤は、従来の方法に従って調製され得、他の治療剤とともに送達され得る。

【０１４７】
膣投与に好適な製剤は、活性成分に加えて、適切であることが当該技術分野で知られているような担体を含有するペッサリー、タンポン、クリーム、ゲル、ペースト、フォーム、又はスプレー製剤として提示され得る。

【０１４８】
非経口投与に好適な製剤には、酸化防止剤、緩衝剤、静菌剤、及び意図するレシピエントの血液と等張性にする溶質を含有し得る水性及び非水性の滅菌注射液、並びに懸濁剤及び増粘剤を含み得る水性及び非水性の滅菌懸濁液が挙げられる。製剤は、単位用量又は複数用量の容器（例えば、密封されたアンプル及びバイアル）で提示され得、使用直前に滅菌液体担体（例えば、水）の添加のみを必要とするフリーズドライ（すなわち、凍結乾燥）状態で保存され得る。即時注射溶液及び懸濁液は、前述の種類の滅菌粉末、顆粒及び錠剤から調製され得る。

【０１４９】
好ましい単位用量製剤は、本明細書に記載されているように、活性成分の１日用量若しくは１日単位サブ用量、又はその適切な画分を含有するものである。

【０１５０】
特に上述の成分に加えて、本発明の製剤は、問題の製剤の種類を考慮して当該技術分野の従来の他の薬剤を含み得ること（例えば、経口投与に好適なものが香味剤を含み得ること）を理解されたい。

【０１５１】
本発明の化合物を使用して、活性成分として本発明の１つ以上の化合物を含有する制御放出薬学的製剤（「制御放出製剤」）を提供することができ、活性成分の放出は、より少ない頻度の投与を可能にするか、又は所与の本発明の化合物の薬物動態又は毒性プロファイルを改善するように制御及び調節され得る。別個の単位が本発明の１つ以上の化合物を含む経口投与に適合された制御放出製剤が、従来の方法に従って調製され得る。
【０１５２】
本発明の別の実施形態は、本発明の化合物の様々な前駆体又は「プロドラッグ」形態に関する。本発明の化合物を、それ自体が有意に生物活性ではないが、動物、哺乳動物、又はヒトに送達されるときに、体の正常な機能によって触媒される化学反応、とりわけ、胃又は血清中に存在する酵素によって触媒される化学反応を受ける化学種の形態で製剤化することが望ましくあり得、当該化学反応は、本明細書に定義される化合物を放出する効果を有する。したがって、「プロドラッグ」という用語は、インビボで活性薬学的成分に変換されるこれらの種に関する。
【０１５３】
本発明の化合物のプロドラッグは、製剤化剤に好適な任意の形態を有し得、例えば、エステルは、非限定的な一般的なプロドラッグ形態である。しかしながら、この場合において、プロドラッグは、必然的に、標的遺伝子座に存在する酵素の作用により共有結合が切断される形態で存在し得る。例えば、Ｃ－Ｃ共有結合は、当該標的遺伝子座における１つ以上の酵素によって選択的に切断され得、したがって、容易に加水分解可能な前駆体、とりわけ、エステル、アミドなど以外の形態のプロドラッグが使用され得る。プロドラッグ中の活性薬学的成分の対応物は、当該技術分野で知られているアミノ酸又はペプチド構造、アルキル鎖、糖部分などの異なる構造を有することができる。
【０１５４】
本発明の目的のために、「治療的に好適なプロドラッグ」という用語は、「単一又は複数の生物学的変換によって、プロドラッグが投与された動物、哺乳動物、又はヒトの組織と接触した際に、過度の毒性、刺激、又はアレルギー反応なしに、インビボで治療活性形態に変換されるように修飾され、意図された治療成果を達成する化合物」として本明細書で定義される。
【０１５５】
より具体的には、本明細書で使用される「プロドラッグ」という用語は、化合物の薬理学的に活性な形態を放出するために、体内で自発的又は酵素変換反応を受ける、本明細書に記載される構造式によって表されるような化合物の不活性又は有意に活性が低い誘導体に関する。総合的な検討のために、ＲａｕｔｉｏＪ．ｅｔ ａｌ．（“Ｐｒｏｄｒｕｇｓ：ｄｅｓｉｇｎ ａｎｄ ｃｌｉｎｉｃａｌ ａｐｐｌｉｃａｔｉｏｎｓ”Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ，２００８，ｄｏｉ：１０．１０３８／ｎｒｄ２４６８）を参照されたい。
【０１５６】
本発明の代表的な化合物は、以下に記載される一般的な合成方法に従って合成することができ、以下のスキームに例示される。スキームは例示であるため、本発明は、スキーム及び実施例に記載される特定の化学反応及び特定の条件によって制限されると解釈されるべきではない。スキームで使用される様々な出発物質は、市販されているか、又は当業者によく知られた方法によって調製され得る。変数は、本明細書で定義されるように、かつ当業者の技量の範囲内である。
【実施例】
【０１５７】
以下の実施例は、本発明を更に例示するために提供され、決して本発明の範囲を限定することを意図するものではない。
【０１５８】
本発明の代表的な化合物は、以下に記載する一般的な合成方法に従って合成することが

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

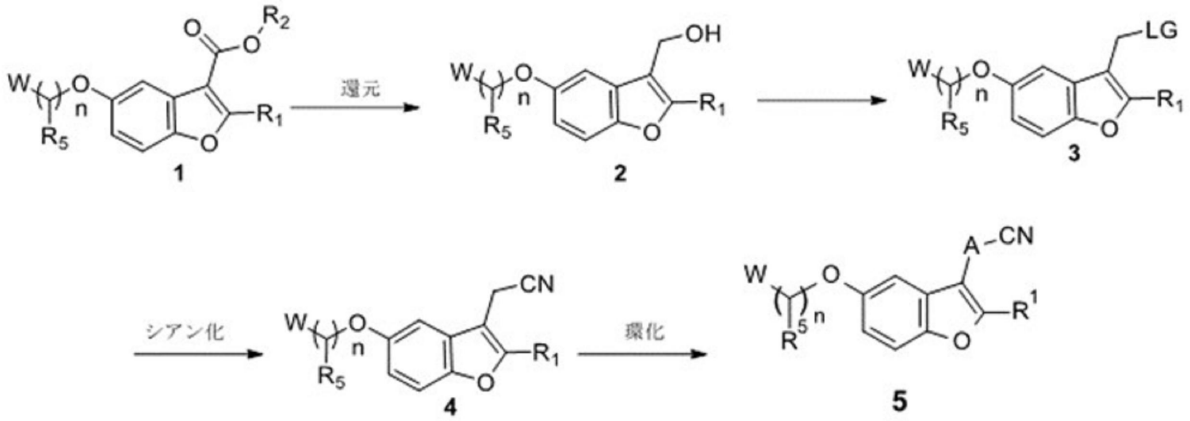
【０１５９】

本明細書において、特にスキーム及び実施例において使用される略語は、以下の通りである。ＡＢＣ－重炭酸アンモニウムの水溶液、ＡＣＮ－アセトニトリル、ＡｃＯＨ－酢酸、ＡＤＤＰ－１，１’－（アゾジカルボニル）ジピペリジド、ａｑ．－水性、ＡＩＢＮ－アゾビスイソブチロニトリル、ＣＡＮ－硝酸セリウムアンモニウム、ＣＯＭＵ－（１－シアノ－２－エトキシ－２－オキソエチリデンアミノオキシ）ジメチルアミノ－モルホリノ－カルベニウムヘキサフルオロホスフェート、ＤＡＢＣＯ－１，４－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン、ＤＡＳＴ－ジエチルアミノサルファートリフルオリド、ＤＢＵ－１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン、ＤＣＣ－Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミド、ＤＣＭ－ジクロロメタン、ＤＥＡＤ－ジエチルアゾジカルボキシレート、ＤＩＡ－ジアステレオマー、ＤＩＡＤ－アゾジカルボン酸ジイソプロピル、ＤＥＡ－ジエチルアミン、ＤＩＰＥＡ－ジイソプロピル－エチルアミン、ＤＭＥ－１，２－ジメトキシエタン、ＤＭＦ－Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ＤＭＳＯ－ジメチルスルホキシド、ＤＴＢＡＤ－ｔｅｒｔ－ブチルアゾジカルボキシレート、ＤＴＢＰＦ－１，１’－ビス（ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィノ）フェロセン、ＥＤＣＩ又はＥＤＣ－１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド、Ｅｎ－エナンチオマー、Ｅｔ２Ｏ－ジエチルエーテル、ＥｔＯＨ－エタノール、ＥｔＯＡｃ－酢酸エチル、Ｅｑ．－当量、ＦＡ－ギ酸、ＦＣＣ－フラッシュカラムクロマトグラフィー、ｈ－時間、ＨＡＴＵ－Ｏ－（７－アザベンゾトリアゾール－１－イル）－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート、ＨＰＬＣ－高性能液体クロマトグラフィー、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＬＡＨ－水素化アルミニウムリチウム、ＬＤＡ－リチウムジイソプロピルアミド、ＬＧ－離脱基、ＬｉＨＭＤＳ－リチウムビス（トリメチルシリル）アミド、ＭｅＯＨ－メタノール、$MgSO_4$－硫酸マグネシウム、ｍｉｎ．－分、Ｍｓ－メタンスルホニル、Na_2SO_4－硫酸ナトリウム、ＮＢＳ－Ｎ－ブロモスクシンイミド、ＮＭＰ－１－メチル－２－ピロリジノン、Ｐｄ（ＰＰｈ３）４－テトラキス－（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）、Ｐｄ２（ｄｂａ）３－トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム、Ｐｅｔエーテル－石油エーテル、ＰＰｈ３－トリフェニルホスフィン、ＰＳ－ＤＩＥＡ－ポリスチレン担持ジイソプロピル－エチルアミン、ＰＳ－ＰＰｈ３－ポリスチレン担持トリフェニルホスフィン、ＰｙＢｏｐ－ベンゾトリアゾール－１－イル－オキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、Ｐｙｒ－ピリジン、ＰＴＳＡ－ｐ－トルエンスルホン酸、ＲＦ：フロンティア比、ＲＭ－反応混合物、ＲＰ－逆相、ＲＴ－室温、ｓａｔ．－飽和、ＳＥＭ－［２－（トリメチルシリル）エトキシ］メチルアセタール、ＳＦＣ－超臨界流体クロマトグラフィー、ＳＰＥ－固相抽出、ＴＢＤＭＳ－Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルエーテル、ＴＢＡＦ－水酸化テトラブチルアンモニウム、ＴＢＡＩ－ヨウ化テトラブチルアンモニウム、ＴＥＡ－トリエチルアミン、ＴＨＦ－テトラヒドロフラン、ＴＦＡ－トリフルオロ酢酸、ＴＬＣ－薄膜クロマトグラフィー、ＴＰＰ－トリフェニルホスフィン、Ｔｓ－トルエンスルホニル基、ＴＭＳ－トリメチルシリル、Ｔ３Ｐ－プロピルホスホン酸無水物。

【０１６０】

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

【化１６】



スキーム１：ｎ、Ａ、Ｗ、Ｒ１、及びＲ５は全て、本発明の化合物について記載されている通りであり、R_2は、エステル保護基（例えば、メチル、エチル、ｔ－Ｂｕ等）である。

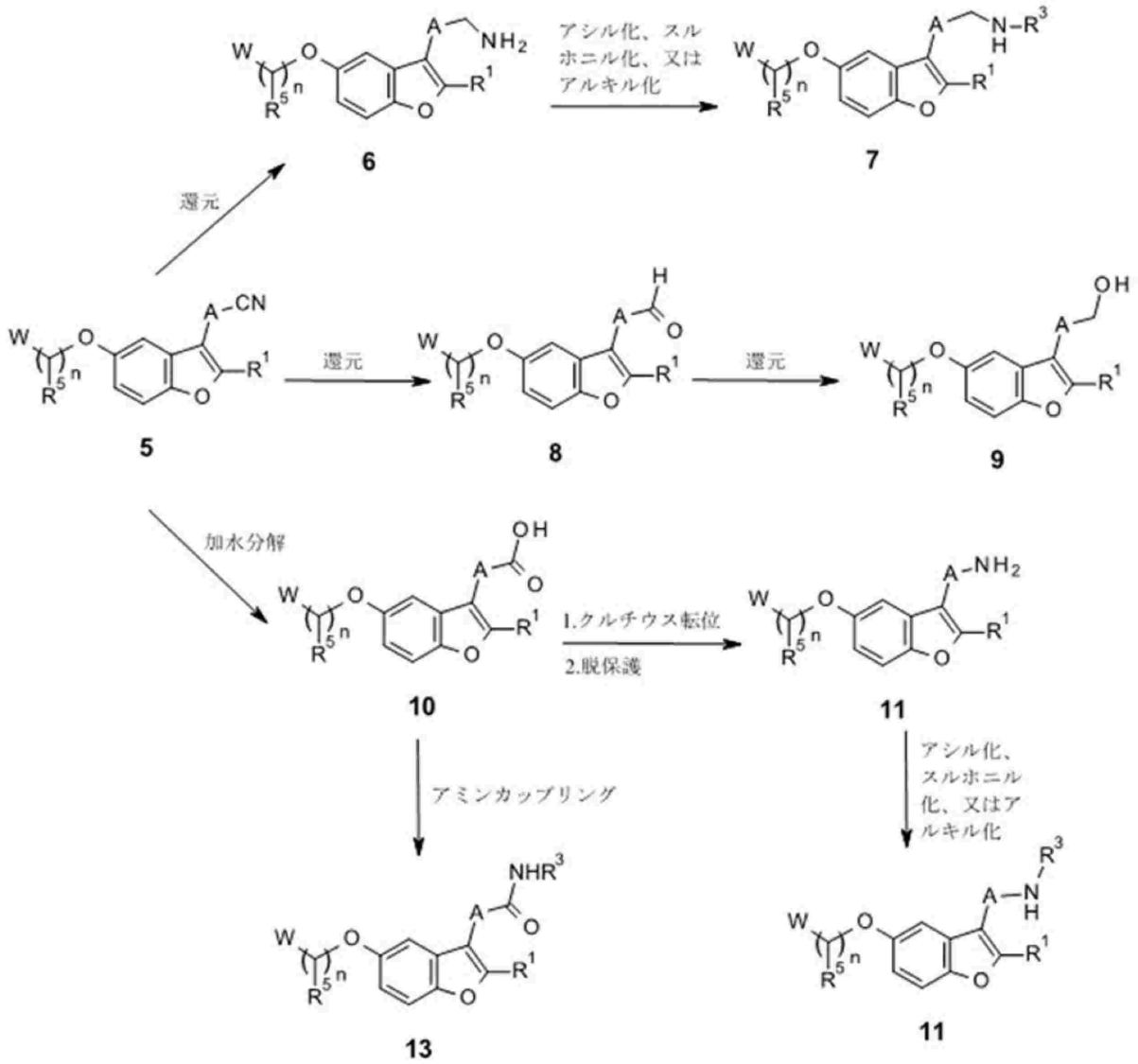
【０１６１】

式１のエステル誘導体（市販されているか、又は当業者に知られている手順によって合成される）は、ＬＡＨでベンゾフラン誘導体２に還元され得る。中間体２のヒドロキシ官能基は、式３のベンゾフランを提供するために、０～１００℃の範囲の温度で、塩基（例えば、ＴＥＡ、Cs_2CO_3等）及び塩化スルホニル試薬（例えば、ＭｓＣｌ、ＴｓＣｌ等）（市販されているか、又は当業者に知られている手順によって合成される）の存在下、溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＡＣＮ等）中で、メシレート又はトシレート等の離脱基に変換させることができる。次いで、式３の中間体は、０～１００℃の範囲の温度で、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰ等）中、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６等）の有無にかかわらず、シアン化試薬（例えば、ＮａＣＮ等）を使用して、求核置換を介して式４の所望の化合物に変換させることができる。式５の所望のベンゾフランは、非プロトン性溶媒（例えば、ＴＨＦ、エーテル等）中の塩基（例えば、ＬＤＡ、ＬｉＨＭＤＳ等）によって媒介される中間体４における環化ステップを介して、ジハロゲン化アルキル誘導体（市販されているか、又は当業者に知られている手順によって合成される）を添加して得ることができる。

【０１６２】

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

【化１７】



スキーム２：ｎ、Ａ、Ｗ、Ｒ１、及びＲ５は全て、本発明の化合物について記載されている通りであり、Ｒ３は、本明細書に記載のＲ^{X}に対応する。

【０１６３】

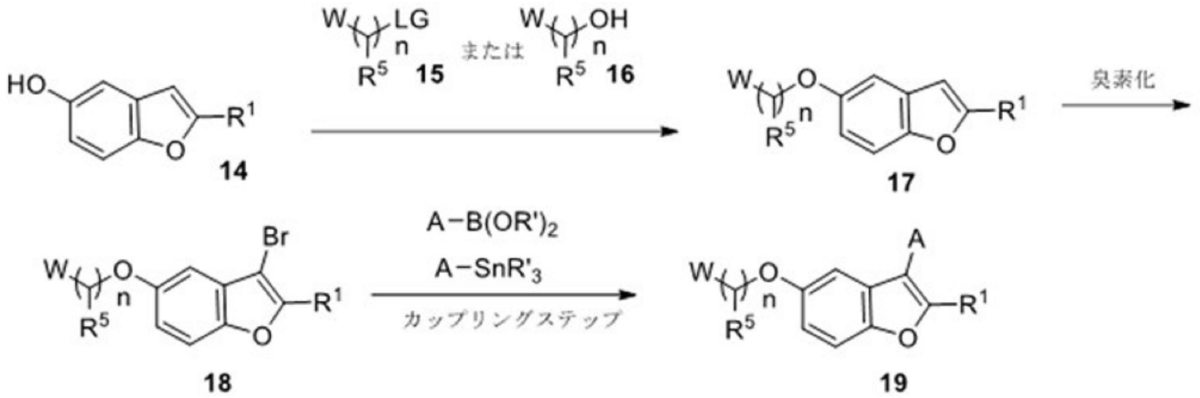
２－（ベンゾフラン－３－イル）アセトニトリル誘導体５を、溶媒（例えば、ＴＨＦ、Ｅｔ$_2$Ｏ等）中の還元剤（例えば、ＬＡＨ等）と反応させて、一般式６の所望のアミンを提供することができる。式６の一級アミンは、カップリング剤（例えば、ＨＡＴＵ等）の有無にかかわらず、塩基（例えば、ＴＥＡ、Ｐｙｒ．、Ｃｓ$_2$ＣＯ$_3$等）の存在下で、アルキル化（Ｒ^3＝Ｒ’－ＬＧ）、アシル化（Ｒ^3＝Ｒ’ＣＯＯＨ又はＲ’－Ｃ（Ｏ）－ＬＧ）、又はスルホン化（Ｒ^3＝Ｒ’－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｃｌ）を介して、所望の二級アミン７に変換させることができる。代替的に、２－（ベンゾフラン－３－イル）アセトニトリル誘導体５を、溶媒（例えば、ＴＨＦ、Ｅｔ$_2$Ｏ等）中の還元剤（例えば、ＤＩＢＡＬ－Ｈ等）と反応させて、式８の中間体を提供することができる。中間体８は、極性溶媒（例えば、ＭｅＯＨ、ＥｔＯＨ等）中の還元剤（例えば、ＮａＢＨ$_4$等）を用いて、所望のヒドロキシ誘導体９に変換させることができる。代替的に、２－（ベンゾフラン－３－イル）アセトニトリル誘導体５を、メタノール中のメタノレートの溶液と反応させ、続いて、水の添加によって加水分解して、酸性中間体１０を提供することができる。所望の一級アミン１１は、クルチウス転位、続いて、アミン脱保護を介して得ることができる。式１１の一級アミンは、カップリング剤（例えば、ＨＡＴＵ等）の有無にかかわらず、塩基（例えば、

ＴＥＡ、Ｐｙｒ．、Cs_2CO_3等）の存在下で、アルキル化（R^3＝Ｒ’－ＬＧ）、アシル化（R^3＝Ｒ’ＣＯＯＨ又はＲ’－Ｃ（Ｏ）－ＬＧ）、又はスルホン化（R^3＝Ｒ’－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｃｌ）を介して、所望の二級アミン１２に変換させることができる。代替的に、酸誘導体１０は、溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦ等）中のカップリング剤（例えば、ＨＡＴＵ等）の有無にかかわらず、塩基（例えば、ＴＥＡ、ＤＢＵ等）によって媒介される酸又はアシルの縮合を介して、一般式１３の所望のアミドに変換させることができる。

【０１６４】

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

【化１８】



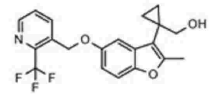
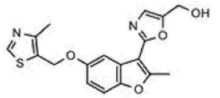
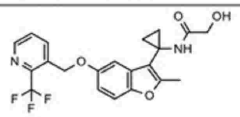
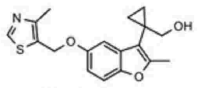
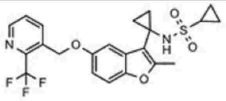
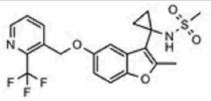
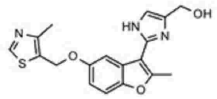
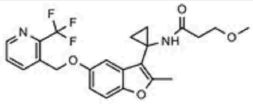
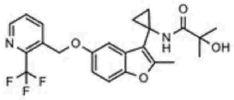
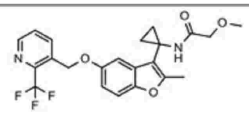
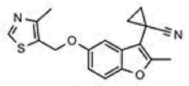
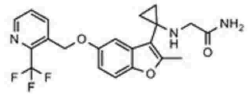
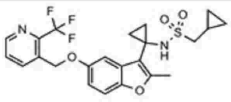
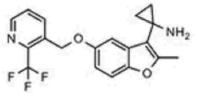
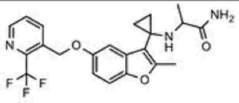
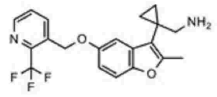
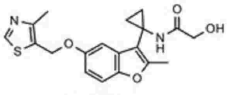
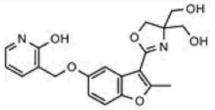
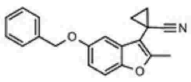
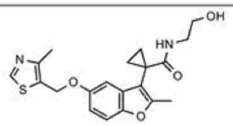
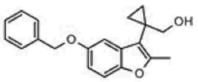
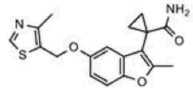
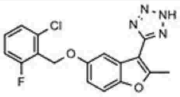
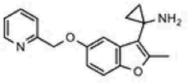
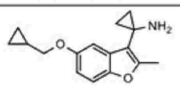
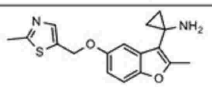
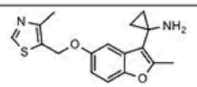
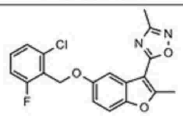
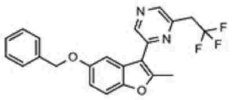
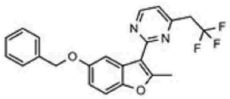
スキーム３：ｎ、Ａ、Ｗ、R^1、及びR^5は全て、本発明の化合物について記載されている通りであり、R^3は、本明細書に記載のR^Xに対応する。

【０１６５】

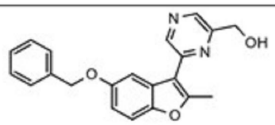
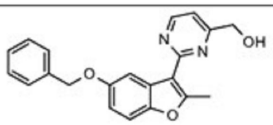
式１４の中間体は、式１５の中間体（市販されているか、又は合成されている）を使用して、求核置換を介して、０～１００℃の温度範囲で、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）の有無にかかわらず、極性溶媒（例えば、ＡＣＮ、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中の基剤（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下で、式１７の所望の化合物（式中、ＬＧは、離脱基である）に変換させることができる。代替的に、式１４の中間体はまた、０～１００℃の温度範囲で、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中のアゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホシン、ＴＰＰなど）の存在下で、式１６の中間体（市販されているか、又は合成されている）と反応させて、式１７の所望の化合物を得ることもできる。ベンゾフラン誘導体１７を、溶媒（例えば、クロロホルム、水等）中の好適なハロゲン化剤（例えば、臭素、Ｎ－ブロモスクシンイミド等）でハロゲン化させて、所望の中間体１８を提供することができる。式１８の３－ブロモベンゾフランを、０～１００℃の範囲の温度で、溶媒（例えば、ＤＭＦ、トルエン、ジオキサン、水等）中のパラジウム触媒（例えば、Ｐｄ（PPh_3）$_4$、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2等）及び塩（例えば、ＫＦ、K_3PO_4、Na_2CO_3等）の存在下で、ボロン酸、ボロン酸エステル、又はスズ誘導体（市販されているか、又は当業者に既知の手順によって合成される）とカップリングして、式１９の所望の化合物を提供することができる。

実施例

【表１２－１】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 001	 化合物 002	 化合物 003
 化合物 004	 化合物 005	 化合物 006
 化合物 007	 化合物 008	 化合物 009
 化合物 010	 化合物 011	 化合物 012
 化合物 013	 化合物 014	 化合物 015
 化合物 016	 化合物 017	 化合物 018
 化合物 019	 化合物 020	 化合物 021
 化合物 022	 化合物 023	 化合物 024
 化合物 025	 化合物 026	 化合物 027
 化合物 028	 化合物 029	 化合物 030

【表１２－２】

構造及び化合物コード	構造及び化合物コード	構造及び化合物コード
 化合物 031	 化合物 032	

【０１６６】

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

【０１６７】

パートＡは、化合物の調製を表し、パートＢは、薬理学的実施例を表す。

【０１６８】

パートＡ

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

【０１６９】

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

【０１７０】

「当量」（「ｅｑ．」又は「ｅｑ」又は「ｅｑｕｉｖ．」）という表示は、モル当量を意味し、「ＲＴ」又は「ｒｔ」は、室温Ｔ（２３±７℃）を意味し、「Ｍ」は、ｍｏｌ／ｌにおける濃度の表示であり、「ｓｏｌ．」は、溶液を意味し、「ｃｏｎｃ．」は、濃度を意味する。溶媒の混合比は、通常、体積／体積比で表される。

【０１７１】

主要な分析的特徴付けは、全ての例示的な化合物及び選択された中間生成物について、^{1}Ｈ－ＮＭＲ分光法及び／又は質量分析（ＭＳ、［Ｍ＋Ｈ］$^+$及び／又は［Ｍ－Ｈ］$^-$におけるｍ／ｚ）によって実施された。ある特定の場合において、例えば、位置異性体及び／又はジアステレオマーが形成され得る場合において、例えば、^{13}Ｃ　ＮＭＲ及びＮＯＥ（核オーバーハウザー効果）ＮＭＲ実験などの追加の分析が、いくつかの場合において行われた。

【０１７２】

使用された分析機器は、例えば、ＮＭＲ分析のために、ＢＲＵＫＥＲ　４００ＭＨｚ又はＢＲＵＫＥＲ　５００ＭＨｚ機械（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｔｏｐｓｐｉｎ）であり、代替的に、ＢＲＵＫＥＲ　ＡＶＡＮＣＥ　３００ＭＨｚ及び４００Ｍｈｚを使用した。ＬＣ／ＭＳ分析のために、例えば、Ａｇｉｌｅｎｔ　１２９０　ｉｎｆｉｎｉｔｙ，Ｍａｓｓ：６１５０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）又はＡｇｉｌｅｎｔ　１２００　ＳＥＲＩＥＳ，Ｍａｓｓ：６１３０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）を用いた。分析用ＨＰＬＣは、例えば、Ｗａｔｅｒｓ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｅｍｐｏｗｅｒ）、Ａｇｉｌｅｎｔ－１２００－ＥＬＳＤ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）、又はＡｇｉｌｅｎｔ－１２６０（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　ＯｐｅｎＬＡＢ）で測定した。分析的ＳＦＣを、例えば、ＰＩＣ溶液（Ｓｏｆｔｗａｒｅ：ＳＦＣ　ＰＩＣＬＡＢ　ＯＮＬＩＮＥ）、ＷＡＴＥＲＳ－Ｘ５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　ＭＡＳＳＬＹＮＸ）、又はＷＡＴＥＲＳ－ＵＰＣ２（Ｅｍｐｏｗｅｒ）で実施した。

【０１７３】

分取ＨＰＬＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ　２９９８（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｅｍｐｏｗｅｒ）又はＹＭＣ（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｋ－Ｐｒｅｐ）で実施した。分取ＳＦＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－２００（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｃｈｒｏｍｓｃｏｐｅ若しくはＳｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－８０（Ｓｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）

、又はＰＩＣ、ＰＩＣ－１７５（Ｓｏｆｔｗａｒｅ　Ｓ１０－１００）で実施した。

【０１７４】

立体中心を含む例示的な化合物の構造は、既知の場合、絶対立体化学で描き表され、命名される。未知の絶対立体化学の場合、化合物は、ラセミ、ジアステレオマーの混合物、未知の立体化学の純粋なジアステレオマー、又は未知の立体化学の純粋なエナンチオマーのいずれかであり得る。Ｄｉａ１及びＤｉａ２は、ジアステレオソマーが分離されたが、立体化学が不明であることを意味する。Ｅｎ１及びＥｎ２は、両方のエナンチオマーが分離されたが、絶対配置が不明であることを意味する。化合物の化学名が正確な立体化学を特定しない限り、化合物コードの後に接尾辞が付されていない場合は、それぞれ、立体中心を含む化合物がラセミ混合物又はジアステレオマーの混合物として得られたことを意味する。

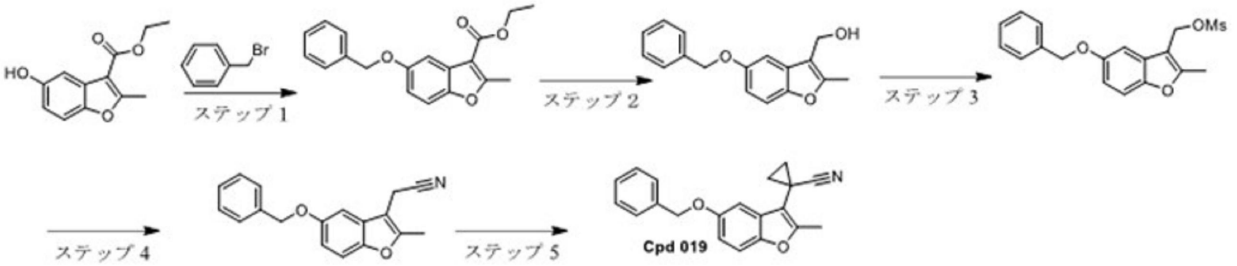
【０１７５】

実験部分で言及したＬＣ／ＭＳ分析は、ＥＳＩモードの質量分析計Ｗａｔｅｒｓ　３１００質量検出器に接続されたＡｌｌｉａｎｃｅ　Ｗａｔｅｒｓ　ＨＰＬＣ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計Ｍａｓｓ　ＳＱＤ２検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で、又はＥＳＩモードの質量分析計Ｍａｓｓ　Ｘｅｖｏ　ＴＱＳ検出器に接続されたＡｃｑｕｉｔｙ　ＵＰＬＣ　Ｗａｔｅｒｓ（ＰＤＡ検出器を装備）で実施した。Ｃｏｌｕｍｎ　Ａｃｑｕｉｔｙ　ＢＥＨ（５０ｍｍ×２．１ｍｍ）１．７μｍを、水中の０．０５％ギ酸又は水中の０．０５％ＴＦＡの移動相Ａ、及びＭｅＣＮ中の０．０５％ギ酸又はＭｅＣＮ中の０．０５％ＴＦＡの移動相Ｂとともに使用した。又は、カラムＸ　ｂｒｉｄｇｅ　Ｃ１８（７５ｍｍ×４．６ｍｍ）３．５μｍを、水中の５ｍＭの重炭酸アンモニウムの移動相Ａ及びＭｅＣＮの移動相Ｂとともに使用した。

【０１７６】

１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１９）の合成。

【化１９】



ステップ１：ＡＣＮ（５００ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸エチルエステル（３０ｇ、０．１３６ｍｏｌ）の撹拌溶液に、K_2CO_3（５６．３８ｇ、０．４０８ｍｏｌ）、続いて、ＢｎＢｒ（３４．８９ｇ、０．２０４ｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを焼結を通して濾過した。組み合わせた濾液を濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカ１００～２００及び溶離液としての１０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンを使用）によって精製して、５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３－カルボン酸エチルエステル（３０ｇ、７１％）を黄色の液体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）ｄ［ｐｐｍ］：７．５１－７．４６（ｍ，３Ｈ），７．４２－７．３７（ｍ，３Ｈ），７．３４－７．３０（ｍ，１Ｈ），７．０１－６．９８（ｄｄ，１Ｈ），５．１４（ｓ，２Ｈ），４．３４－４．２９（ｑ，２Ｈ），２．７０（ｓ，３Ｈ），１．３４－１．３２（ｔ，３Ｈ）。

【０１７７】

ステップ２：ＴＨＦ（５００ｍｌ）中のＬＡＨ粉末（９．１２ｇ、０．２４ｍｏｌ）の懸濁液に、ＴＨＦ（１００ｍｌ）中の５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３

－カルボン酸エチルエステル（３０ｇ、０．０９６ｍｏｌ）溶液を０℃で添加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを飽和Na_2SO_4（５０ｍｌ）溶液でクエンチした。得られた懸濁液を室温で１時間撹拌した。ＲＭを、セライトを通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（２×５００ｍｌ）で洗浄した。濾液を無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、（５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－メタノール（２５ｇ、６６％）を黄色の粘性物質として得た。

【０１７８】

ステップ３：ＤＣＭ（５００ｍｌ）中の（５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－メタノール（２５ｇ、０．０９ｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＥＡ（８７．３ｍｌ、０．６３ｍｏｌ）、続いて、ＭｓＣｌ（３４．８ｍｌ、０．４５ｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。ＳＭの完成後に、ＲＭを水（２×２５０ｍｌ）、続いて、ブライン（２５０ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）メチルメタンスルホネート（３０ｇ）を黄色の液体として得た。

【０１７９】

ステップ４：ＤＭＦ（３００ｍｌ）中の（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）メチルメタンスルホネート（３０ｇ、０．０８ｍｏｌ）の溶液に、ＮａＣＮ（９．８ｇ、０．２ｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを７０℃に１６時間加熱した。出発物質の完成後に、ＲＭを氷水（１Ｌ）に注ぎ、得られた水相をＭＴＢＥ（２×１．２Ｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２×８００ｍｌ）、ブライン（８００ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカ１００～２００及び溶離液としての１０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンを使用）によって精製して、（５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－アセトニトリル（９ｇ、３つのステップで３２％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ Ｍｚ，ＤＭＳＯ－d_6）ｄ［ｐｐｍ］：７．４９－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．４３－７．３７（ｍ，３Ｈ），７．３４－７．２７（ｍ，２Ｈ），６．９５－６．９３（ｍ，１Ｈ），５．１２（ｓ，２Ｈ），４．０３（ｓ，２Ｈ），２．４４（ｓ，３Ｈ）。

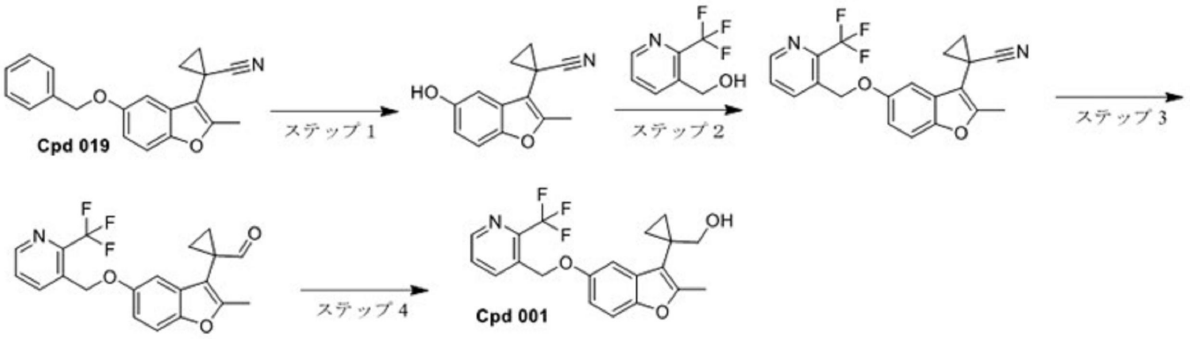
【０１８０】

ステップ５：ＴＨＦ（１８０ｍｌ）中の（５－ベンジルオキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－アセトニトリル（１０ｇ、０．０３６ｍｏｌ）撹拌溶液に、ＬＤＡ（３７．８ｍｌ、０．０７５ｍｏｌ、ＴＨＦ中の２Ｍ）を０℃で滴加し、１５分間撹拌した。ＲＭに、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の１，２ジブロモエタン（１０．１４ｇ、０．０５４ｍｏｌ）の溶液を０℃で滴加した。ＲＭを０℃で１時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを水性飽和NH_4Cl溶液（５０ｍｌ）でクエンチした。得られた水相をＥｔＯＡｃ（２×１５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（１５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ、溶離液としての１０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンを使用）によって精製して、１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１９）（５ｇ、４６％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０１８１】

［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタノール（化合物００１）の合成。

【化２０】



ステップ１：ＥｔＯＡｃ（５０ｍｌ）中の１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１９）（２ｇ、６．６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１０％Ｐｄ／Ｃ（４００ｍｇ）を室温で添加した。ＲＭを、（バルーンを使用した）水素雰囲気下、室温で８時間撹拌した。ＲＭを、セライト床上で濾過し、ＭｅＯＨ（１００ｍｌ）で洗浄した。組み合わせた濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ及び溶離液としての２０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンを使用）によって精製して、１－（５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－シクロプロパンカルボニトリル（１．１ｇ、７８％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）ｄ［ｐｐｍ］：９．２７（ｓ，１Ｈ），７．３１－７．２８（ｄ，１Ｈ），６．９１（ｍ，１Ｈ），６．７１－６．６９（ｄｄ，１Ｈ），２．４４（ｓ，３Ｈ），１．７５－１．７２（ｍ，２Ｈ），１．３２－１．２９（ｍ，２Ｈ）。

【０１８２】

ステップ２：ＴＨＦ（２５ｍｌ）中の１－（５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－シクロプロパンカルボニトリル（６００ｍｇ、２．８１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イル）－メタノール（７４６ｍｇ、４．２１ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭに、ＡＤＤＰ（１．４１ｇ、５．６２ｍｍｏｌ）、続いて、ｎ－トリブチルホスフィン（１．１３ｇ、５．６２ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを、冷水でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（３５ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュのシリカゲルを使用、溶離液としてのヘキサン中の２５％ＥｔＯＡｃ中）によって精製し、続いて、ＭＴＢＥ／ヘキサン中で粉砕して、１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボニトリル（６００ｍｇ、５７％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０１８３】

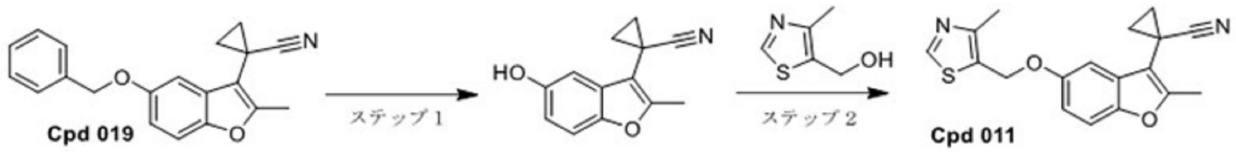
ステップ３：ＴＨＦ（１０ｍｌ）中の１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボニトリル（３００ｍｇ、０．８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＢＡＬ－Ｈ（１．６ｍｌ、２．４ｍｍｏｌ、トルエン中の１．５Ｍ）を０℃で滴加した。ＲＭを同じ温度で３時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを０℃で飽和NH_4Cl溶液でクエンチし、沈殿物が形成された。沈殿物を、セライトパッドを通して濾過した。濾液をＥｔＯＡｃで抽出した。組み合わせた有機層を、ブラインで洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュのシリカゲル及び溶離液としてのヘキサン中の２５％ＥｔＯＡｃ）によって精製して、１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルバルデヒド（２３０ｍｇ）をオフホワイト色の固体として得た。

【０１８４】
ステップ４：ＭｅＯＨ（５ｍｌ）中１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルバルデヒド（２３０ｍｇ、０．６１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$NaBH_4$（３４．６ｍｇ、０．９１５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で３時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを濃縮し、ＤＣＭ（１５ｍｌ）で希釈し、NH_4Clの水性飽和溶液（１５ｍｌ）でゆっくりと０℃でクエンチした。水層をＤＣＭ（１５ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（２０ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ及び溶離液としての３０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンを使用）によって精製し、続いて、ＭＴＢＥを使用して粉砕して、［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタノール（化合物００１）（８３ｍｇ、３６％）を白色の固体として得た。

【０１８５】
以下の化合物を、化合物００１について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００４。

【０１８６】
１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１１）の合成。

【化２１】



ステップ１：酢酸エチル（５０ｍｌ）中の１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１９）（２ｇ、６．６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１０％Ｐｄ／Ｃ（４００ｍｇ）を室温で添加した。ＲＭを、（バルーンを使用した）水素雰囲気下、室温で８時間撹拌した。ＲＭを、セライト床上で濾過し、ＭｅＯＨ（１００ｍｌ）で洗浄した。組み合わせた濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ及び溶離液としての２０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンを使用）によって精製して、１－（５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－シクロプロパンカルボニトリル（１．１ｇ、７８％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）ｄ［ｐｐｍ］：９．２７（ｓ，１Ｈ），７．３１－７．２８（ｄ，１Ｈ），６．９１（ｍ，１Ｈ），６．７１－６．６９（ｄｄ，１Ｈ），２．４４（ｓ，３Ｈ），１．７５－１．７２（ｍ，２Ｈ），１．３２－１．２９（ｍ，２Ｈ）。

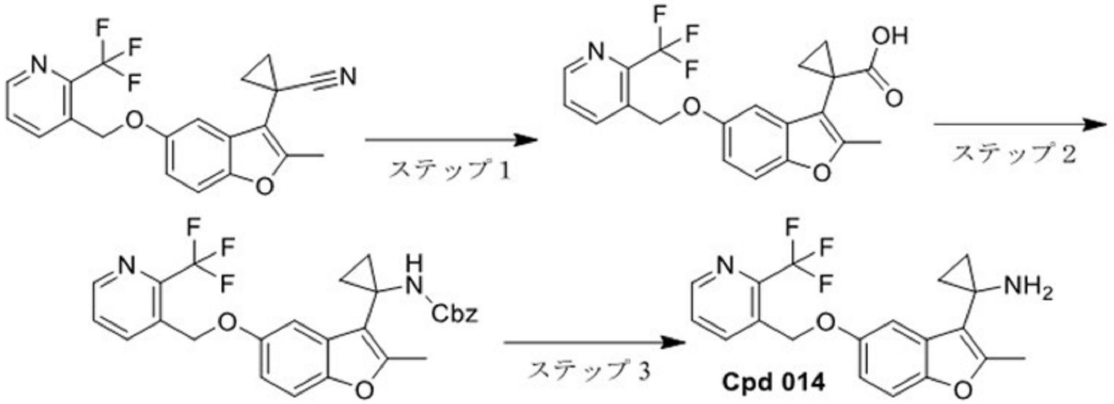
【０１８７】
ステップ２：ＴＨＦ（２５ｍｌ）中の１－（５－ヒドロキシ－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－シクロプロパンカルボニトリル（６００ｍｇ、２．８１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、（４－メチル－チアゾール－５－イル）－メタノール（４７２ｍｇ、３．６５ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭに、ＡＤＤＰ（１．４１ｇ、５．６２ｍｍｏｌ）、続いて、ｎ－トリブチルホスフィン（１．１３ｇ、５．６２ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。出発物質の完成後に、ＲＭを、冷水でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍｌ）で抽出した。組み合わせた有機層を、ブライン（３５ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（１００～２００メッシュのシリカゲル及び溶離液としてのヘキサン中の２５％ＥｔＯＡｃを使用）によって精製し、続いて、ＭＴＢＥ／ヘキサンで粉砕して

、１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１１）（６００ｍｇ、６５％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０１８８】

１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－アミン（化合物０１４）の合成。

【化２２】



ステップ１：ＮａＯＭｅ（８０ｍｌ、ＭｅＯＨ中の２５％溶液）中の１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボニトリル［化合物００１の合成に記載の合成手順］（４ｇ、１０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液を１６時間還流した。水（６ｍｌ）をＲＭに添加した。ＲＭを１６時間還流した。出発物質の完成後に、ＲＭを濃縮した。残渣を、水で希釈し、０℃でＨＣｌ（６Ｎ）で酸性化した。得られた酸性水溶液をＥｔＯＡｃ（３×１３０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボン酸（３．５ｇ）を褐色の粘性物質として得た。

【０１８９】

ステップ２：トルエン（７０ｍｌ）中の１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボン酸（３．５ｇ、８．９４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ジフェニルホスホリルアジド（４．０２ｇ、１０．７２８ｍｍｏｌ）、続いて、ＴＥＡ（１．３ｍｌ、９．３８７ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃で３０分間撹拌した。次いで、ベンジルアルコール（１．８５ｍｌ、１７．８８ｍｍｏｌ）をＲＭに添加した。ＲＭを１１０℃で１６時間加熱した。反応完了後に、ＲＭを、室温に冷却し、ＥｔＯＡｃ（１２０ｍｌ）で希釈し、１０％クエン酸溶液、飽和$NaHCO_3$溶液、及びブラインで洗浄した。組み合わせた有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（２３０～４００メッシュのシリカゲル及び溶離液としてのＤＣＭ中の１％ＭｅＯＨを使用）によって精製して、｛１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロピル｝－カルバミン酸ベンジルエステル（４ｇ）をオフホワイト色の固体として得た。

【０１９０】

ステップ３：ＭｅＯＨ（８０ｍｌ）中の｛１－［２－メチル－５－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロピル｝－カルバミン酸ベンジルエステル（４ｇ、８．０５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、１０％Ｐｄ／Ｃ（８００ｍｇ）を室温で添加した。ＲＭを、（バルーンを使用した）水素雰囲気下、室温で１時間撹拌した。ＲＭを、セライト床上で濾過し、ＭｅＯＨ（１００ｍｌ）で洗浄

した。組み合わせた濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル１００～２００メッシュ及び溶離液としての２％ＭｅＯＨ－ＤＣＭを使用）によって精製し、続いて、ＭＴＢＥ／ＤＣＭを使用して粉砕して、１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－アミン（化合物０１４）（１．９ｇ、３つのステップで５５％）をオフホワイト色の固体として得た。

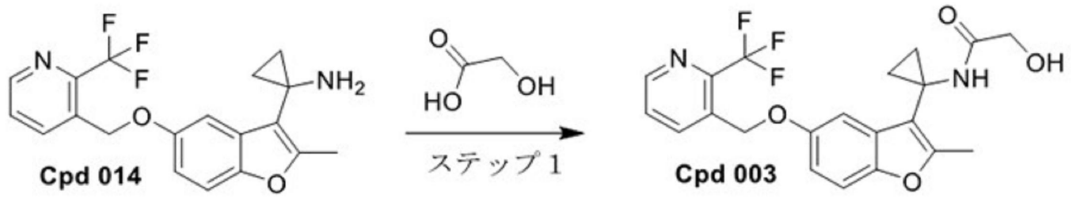
【０１９１】

以下の化合物を、化合物０１４について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０２４、化合物０２５、化合物０２６、及び化合物０２７。

【０１９２】

２－ヒドロキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド（化合物００３）の合成。

【化２３】



ステップ１：ＤＭＦ（１．４ｍｌ）中の１－［２－メチル－５－［［２－（トリフルオロメチル）－３－ピリジル］メトキシ］ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパンアミン（化合物０１４）（５０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）、２－ヒドロキシ酢酸（２１ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（３６ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（１０５ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを、室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、$NaHCO_3$の水性飽和溶液で希釈し、ＤＣＭで抽出した。有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、シクロヘキサン中のＥｔＯＡｃの勾配（１０～１００％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、２－ヒドロキシ－Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アセトアミド（化合物００３）（２７ｍｇ、４６％）を得た。

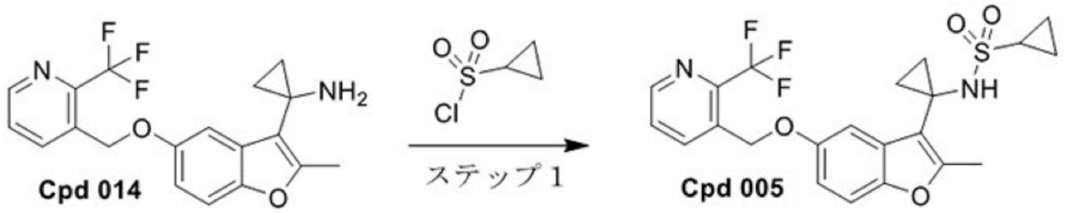
【０１９３】

以下の化合物を、化合物００３について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００８、化合物００９、化合物０１０、及び化合物０１７。

【０１９４】

Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］シクロプロパンスルホンアミド（化合物００５）の合成。

【化２４】



ステップ１：０℃で、ＴＥＡ（６９．８ｍｇ、０．６９ｍｍｏｌ）を、ＤＣＭ（１．４ｍＬ）中の１－［２－メチル－５－［［２－（トリフルオロメチル）－３－ピリジル］メトキシ］ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパンアミン（化合物０１４）（５０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）の溶液にゆっくりと添加した。ＲＭを０℃で１０分間撹拌した。次いで、シクロプロパンスルホニルクロリド（５８ｍｇ、０．４１ｍｍｏｌ）をＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、$NaHCO_3$の水性飽和溶液で希釈し、ＤＣＭで抽出した。有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、シクロヘキサン中のＥｔＯＡｃの勾配（２０～４５％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、Ｎ－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］シクロプロパンスルホンアミド（化合物００５）（２８ｍｇ、４３％）を得た。

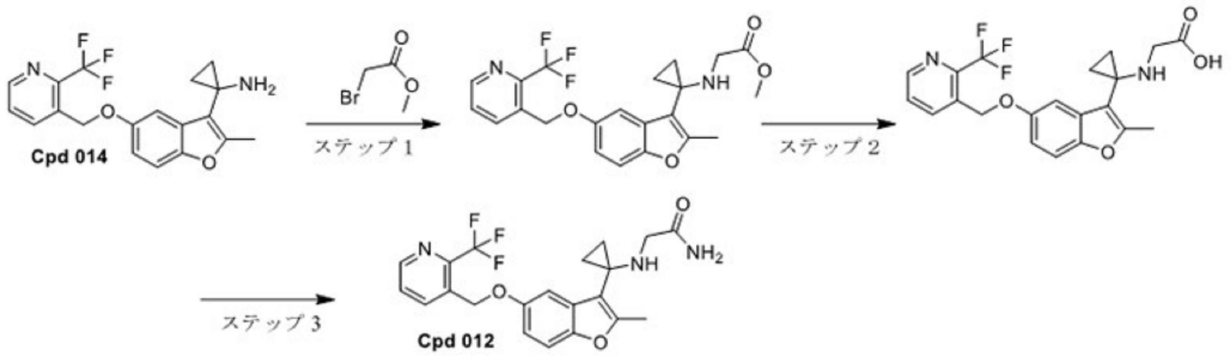
【０１９５】

以下の化合物を、化合物００５について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物００６及び化合物０１３。

【０１９６】

２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝アセトアミド（化合物０１２）の合成。

【化２５】



ステップ１：ブロモ酢酸メチル（３８０ｍｇ、２．３ｍｍｏｌ）を、１，４－ジオキサン（５．５ｍｌ）中の１－［２－メチル－５－［［２－（トリフルオロメチル）－３－ピリジル］メトキシ］ベンゾフラン－３－イル］シクロプロパンアミン（化合物０１４）（３００ｍｇ、０．８３ｍｍｏｌ）及びＤＢＵ（５０４ｍｇ、３．３ｍｍｏｌ）の溶液に添加した。ＲＭを６０℃で４日間撹拌した。ＲＭを、$NaHCO_3$の水性飽和溶液で希釈し、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機層を、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、シクロヘキサン中のＥｔＯＡｃの勾配（５～１００％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、メチル（１－（２－メチル－５－（（２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル）グリシネート（１３５ｍｇ、３７％）を得た。

【０１９７】

ステップ２：ＮａＯＨ（２Ｎ）（０．４６ｍｌ、０．９ｍｍｏｌ）の水溶液を、ＭｅＯＨ（１ｍｌ）と１，４－ジオキサン（０．５ｍｌ）との混合物中のメチル（１－（２－メチル－５－（２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル）グリシネート（１３３ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）の溶液に添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、ＨＣｌ（４Ｎ）の水溶液で酸性化し、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機層を、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を更に精製することなく次のステップで使用した。

【０１９８】

ステップ３：ＤＭＦ（１．７ｍｌ）中の１２－［［１－［２－メチル－５－［［２－（

トリフルオロメチル）－３－ピリジル］メトキシ］ベンゾフラン－３－イル］シクロプロピル］アミノ］酢酸（１４３ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）及びＤＩＰＥＡ（２２０ｍｇ、１．７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（２５９ｍｇ、０．６８ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１５分間撹拌した。次いで、酢酸アンモニウム（７８．７ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）をＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、$NaHCO_3$の水性飽和溶液で希釈し、ＤＣＭで抽出した。有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、シクロヘキサン中のＥｔＯＡｃの勾配（１０～３０％）、続いて、ＥｔＯＡｃ中のＥｔＯＨの勾配（０～４５％）を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、２－｛［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］アミノ｝アセトアミド（化合物０１２）を得た。

【０１９９】

以下の化合物を、化合物０１２について記載されるのと同様の方法（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物０１５。

【０２００】

１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンアミン（化合物０１６）の合成。

【化２６】

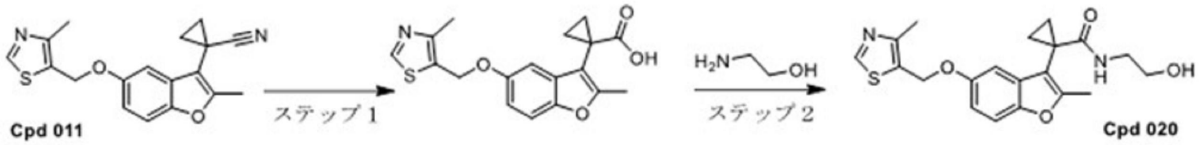


ステップ１：ＬＡＨ（ＴＨＦ中の１Ｍ）（１．０７ｍＬ、１．０７ｍｍｏｌ）を、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の１－（２－メチル－５－（（２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボニトリル［化合物００１の合成に記載の合成手順］（０．２ｇ、０．５３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ａｒ下、０℃で添加した。ＲＭを０℃で１時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、飽和Na_2SO_4溶液（５ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）で希釈し、セライト床を通して濾過した。セライト床をＥｔＯＡｃ（１０ｍＬ）で洗浄した。組み合わせた濾液を、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗化合物を、溶離液として水及びＡＣＮ中の０．１％ＦＡを使用するＧＲＡＣＥフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、１－［１－（２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－１－ベンゾフラン－３－イル）シクロプロピル］メタンアミン（化合物０１６）（４８．３ｍｇ、３０％）を淡黄色の粘性物質として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．１．

【０２０１】

Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド（化合物０２０）の合成。

【化２７】



ステップ１：ＭｅＯＨ（３０ｍｌ）中の１－［２－メチル－５－（４－メチル－チアゾール－５－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボニトリル（化合物０１１）（３ｇ、９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ（４Ｎ）水溶液（１５ｍｌ）を室温で添加した。ＲＭを９０℃に１６時間加熱した。開始完了後に、ＲＭを濃縮した。残渣を、水で希釈し、０℃でＨＣｌ（６Ｎ）の水溶液を使用することによって酸性化した。得られた酸性水溶液をＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ（３×１３０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、１－［２－メチル－５－（４－メチル－チアゾール－５－イルメトキシ）－ベンゾフラン－３－イル］－シクロプロパンカルボン酸（２．５ｇ）を褐色の粘性物質として得た。

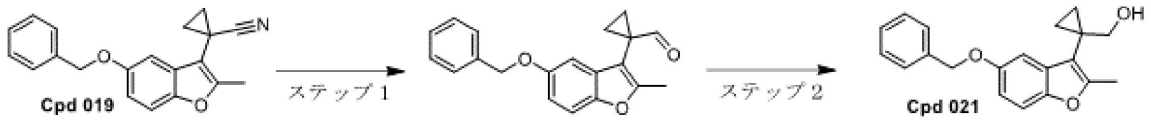
【０２０２】

ステップ２：ＤＭＦ（６．０ｍＬ）中の１－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボン酸（０．２７ｇ、０．７８ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（０．７４ｇ、１．９６ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（０．４ｍＬ、２．３６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２－アミノエタン－１－オール（０．０７２ｇ、１．１８ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、ブライン（２５ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド（化合物０２０）（２３ｍｇ、８％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．３．

【０２０３】

｛１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロピル｝メタノール（化合物０２１）の合成。

【化２８】



ステップ１：ＤＩＢＡＬ－Ｈ（３．５ｍＬ、８．９１ｍｍｏｌ）を、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の１－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１９）（９００ｍｇ、２．９７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に０℃で滴加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、NH_4Cl溶液（２０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、１－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルバルデヒド（６００ｍｇ、粗物）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔ－エーテル中の４０％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．３．

【０２０４】

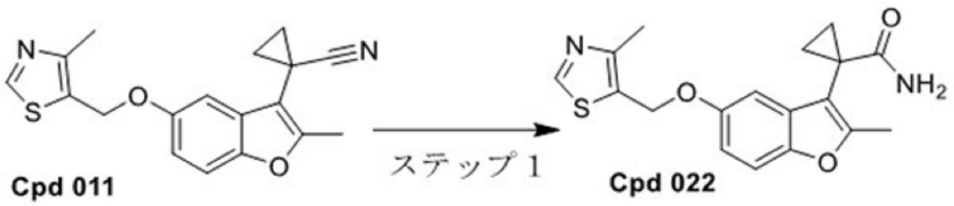
ステップ２：$NaBH_4$（１４９ｍｇ、３．９２ｍｍｏｌ）を、ＭｅＯＨ（１０ｍＬ）とＴＨＦ（１０ｍＬ）との混合物中の１－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾ

フラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルバルデヒド（６００ｍｇ、１．９６ｍｍｏｌ）の予め撹拌した溶液に０℃で少しずつ添加した。ＲＭを室温で３時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（３０ｍＬ）、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、｛１－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］シクロプロピル｝メタノール（化合物０２１）（２３０ｍｇ、３８％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔ－エーテル中の４０％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．２．

【０２０５】

１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド（化合物０２２）の合成。

【化２９】

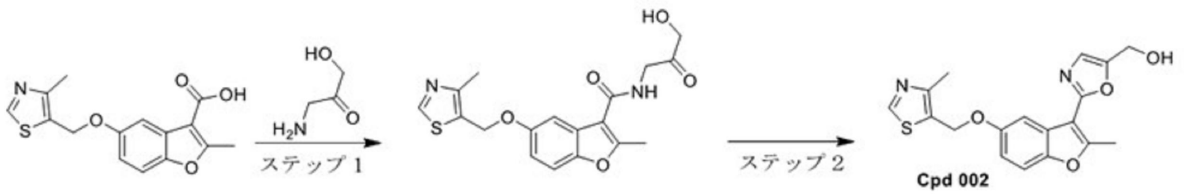


ステップ１：H_2O_2（３０％水溶液）（１０ｍＬ）を、１－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）シクロプロパン－１－カルボニトリル（化合物０１１）（６００ｍｇ）、水性ＫＯＨ溶液（５ｍＬの水中で１．０ｇ）、及びＤＭＳＯ（１０ｍＬ）の撹拌溶液に１０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、氷冷水（５０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、水（２×１００ｍＬ）、ブライン（２×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗生成物を、ＲＰ分取ＨＰＬＣ（Ｘ－ＳＥＬＥＣＴ－Ｃ１８（１５０*１９ｍｍ）５μｍ、移動相Ａ：H_2O中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、時間（分）／Ｂ（％）：０／２０、８／７０、８．１／９８、１１／９８、１１．１／２０、１３／２０、流量：１８ｍｌ／分）によって精製して、１－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝シクロプロパン－１－カルボキサミド（化合物０２２）（３５ｍｇ）を淡黄色の固体として得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．２５．

【０２０６】

（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１，３－オキサゾール－５－イル）メタノール（化合物００２）の合成。

【化３０】



ステップ１：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボン酸（１．０ｇ、３．３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（２．５ｇ、６．６ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（２．９ｍＬ、１６．５ｍ

ｍｏｌ）、及び１－アミノ－３－ヒドロキシプロパン－２－オンヒドロクロリド（０．６２ｇ、４．９５ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを、室温に温め、４時間撹拌した。反応の進行をＴＬＣによって監視し、ＲＭを、水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、水（２×２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗化合物を得た。粗化合物を、溶離液としてＡＣＮ中の０．１％水性ＦＡを使用するＲＰフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、Ｎ－（３－ヒドロキシ－２－オキソプロピル）－２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキサミド（０．５ｇ、４０％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の１０％ＭｅＯＨ、ＲＦ：０．３．

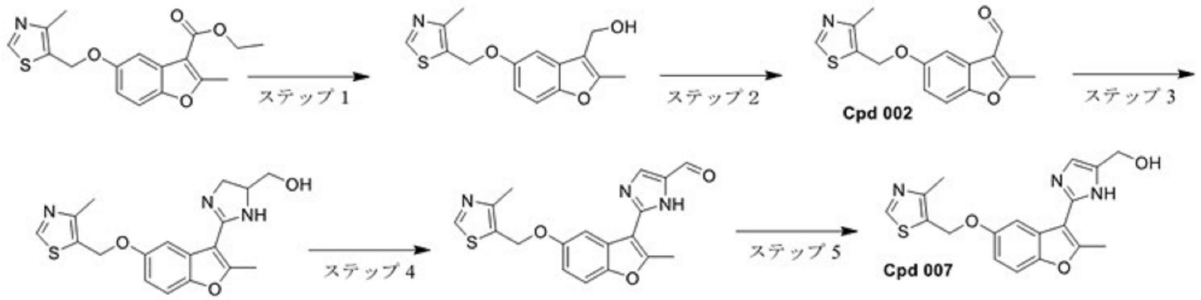
【０２０７】

ステップ２：$POCl_3$（１５ｍＬ）中のＮ－（３－ヒドロキシ－２－オキソプロピル）－２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキサミド（５００ｍｇ、１．３３６ｍｍｏｌ）の溶液を９０℃に加熱した。ＲＭを９０℃で４時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣に飽和$NaHCO_3$溶液（３０ｍＬ）を添加し、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和$NaHCO_3$溶液（２×２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗化合物を得た。粗化合物を、溶離液としてＡＣＮ中の０．１％水性ＦＡを使用するＲＰフラッシュクロマトグラフィーによって、更に、分取ＨＰＬＣ（ＫＲＯＭＯＳＩＬ－Ｃ１８（１５０*２５ｍｍ）１０μｍ、移動相Ａ：H_2O中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、時間（分）／Ｂ（％）：０／３０、８／７０、８．１／９８、１０／９８、１０．１／３０、１３／３０、流量：２０ｍｌ／分）によって精製して、（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１，３－オキサゾール－５－イル）メタノール（化合物００２）（３５ｍｇ、７％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の１０％メタノール、ＲＦ：０．５．

【０２０８】

（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール（化合物００７）の合成。

【化３１】



ステップ１：ＴＨＦ中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルボキシレート（４．８ｇ、１４．５０１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＨＦ（１Ｍ、５０ｍＬ）中のＬＡＨ溶液を０℃で滴加した。ＲＭを室温で２時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、飽和Na_2SO_4溶液でクエンチし、ＴＨＦ（５０ｍＬ）で希釈し、セライト床を通して濾過した。セライトベッドをＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨで洗浄した。濾液を減圧下で濃縮して、（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）メタノール（４．０ｇ、８９％）をオフホワイト色の粘性物質として得た；ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル

中の２０％ＥｔＯＡｃ、Ｒｆ：０．４２．

【０２０９】

ステップ２：ＤＣＭ（５０ｍＬ）中の（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）（４．０ｇ、１３．７９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、デス・マーチンペルヨージナン（８．７ｇ、２０．６８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、ＤＣＭ（５０ｍＬ）で希釈し、セライト床を通して濾過し、セライト床をＤＣＭで洗浄した。濾液を、飽和$NaHCO_3$溶液（３×２００ｍＬ）、水（１００ｍＬ）、ブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルバルデヒド（３．５ｇ）を褐色の固体として得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の５０％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．４１．

【０２１０】

ステップ３：ｔ－ＢｕＯＨ：ＭｅＯＨ（２：１、２１ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－カルバルデヒド（１ｇ、３．４８４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、２，３－ジアミノプロパン－１－オール（３１４ｍｇ、３．４８４ｍｍｏｌ）を室温で添加し、３０分間撹拌し、次いで、K_2CO_3（４８０ｍｇ、３．４８４ｍｍｏｌ）及びヨウ素（８８１ｍｇ、３．４８４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを７５℃で３時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、氷冷水（５０ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ（３×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、水（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰカラムクロマトグラフィーによって精製し、（２－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）－４，５－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール（１００ｍｇ）を褐色の固体として得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．１５．

【０２１１】

ステップ４：１，４－ジオキサン（５ｍＬ）及びＭｅＯＨ（２ｍＬ）中の（２－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）－４，５－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール（１００ｍｇ、０．２８０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、MnO_2（２４３ｍｇ、２．８０１ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを１２０℃で２４時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、セライト床を通して濾過し、セライト床をＭｅＯＨで洗浄した。濾液を減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、溶離液として水中の０．１％ＦＡ及びＡＣＮを使用するＲＰカラムクロマトグラフィーによって精製して、２－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）－１Ｈ－イミダゾール－４－カルバルデヒド（３０ｍｇ）を褐色の固体として得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ；Ｒｆ：０．５２．

【０２１２】

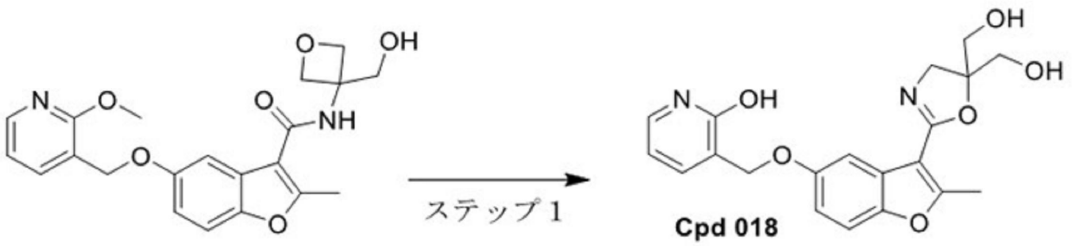
ステップ５：ＭｅＯＨ（５ｍＬ）中の２－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）ベンゾフラン－３－イル）－１Ｈ－イミダゾール－４－カルバルデヒド（３０ｍｇ、０．０８４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$NaBH_4$（１５ｍｇ、０．４２４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌し、反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、氷冷水（３０ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた抽出物を、水（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗物を得た。粗物を、分取ＨＰＬＣ精製（Ｘ－ＳＥＬＥＣＴ－Ｃ１８（１５０*１９ｍｍ）５μｍ、移動相Ａ：H_2O中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＭｅＣＮ、時間（分）／Ｂ（％）：０／１０、８／５０、９／５０、９．１／９８、１３／９８、１３．１／１０、１５／１０、流量：１７ｍｌ／分）によって精製して、（２－｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チ

アゾール－５－イル）メトキシ］－１－ベンゾフラン－３－イル｝－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）メタノール（化合物００７）（６．２ｍｇ）を白色の固体として得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．３６．

【０２１３】

３－［（｛３－［４，４－ビス（ヒドロキシメチル）－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾール－２－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－５－イル｝オキシ）メチル］ピリジン－２－オール（化合物０１８）の合成。

【化３２】

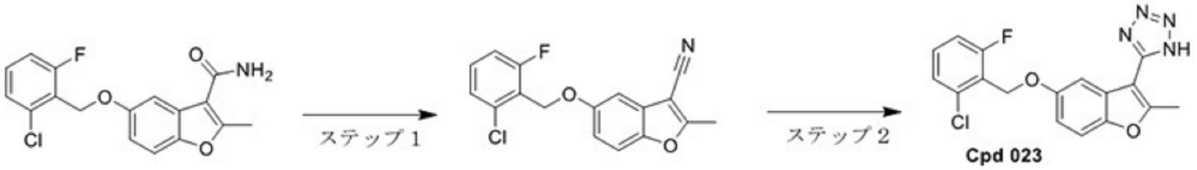


ステップ１：ＴＭＳ－Ｃｌ（１２２．４ｍｇ、１．１２７ｍｍｏｌ）を、ＡＣＮ（１５ｍＬ）中のＮ－（３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル）－５－（（２－メトキシピリジン－３－イル）メトキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド（０．３ｇ、０．７５ｍｍｏｌ）及びＮａＩ（１６８．８ｍｇ、１．１２７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温でゆっくりと添加し、ＲＭを６０℃に２時間加熱した。反応の進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを、室温に冷却し、ジエチルエーテル（２０ｍＬ）で希釈し、沈殿した固体化合物を濾過によって収集した。固体を、ブライン（１０．０ｍＬ）に添加し、３０分間撹拌し、濾過し、水で洗浄し、減圧下で乾燥させて、３－［（｛３－［４，４－ビス（ヒドロキシメチル）－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾール－２－イル］－２－メチル－１－ベンゾフラン－５－イル｝オキシ）メチル］ピリジン－２－オール（化合物０１８）（１２０ｍｇ、４０％）をオフホワイト色の固体として得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ；Ｒｆ：０．３．

【０２１４】

５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－２Ｈ－１，２，３，４－テトラゾール（化合物０２３）の合成。

【化３３】



ステップ１：５－（（２－クロロ－６－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキサミド（８２ｍｇ、０．２７６ｍｍｏｌ）を$POCl_3$（３３９１ｍｇ、２２．１１ｍｍｏｌ）に懸濁した。ＲＭを８０℃で５時間撹拌した。ＲＭを、冷却し、減圧下で濃縮した。残渣を、ＤＣＭ（８０ｍＬ）中で希釈し、水及びブラインで洗浄し、次いで、硫酸マグネシウム及び濾過ガラスで乾燥させた。溶媒を減圧下で除去した。残渣を、水中のＡＣＮの勾配（４０％～１００％）を使用してＣ１８ゲル上のＳＰＥによって精製して、５－（（２－クロロ－６－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボニトリル（７１ｍｇ、９０％）を白色の固体として得た。^{1}ＨＮＭＲ（ＤＭＳＯ－d_6，３００ ＭＨｚ）：ｄ ｐｐｍ ７．６３（ｄ，２Ｈ）；７．５７－７．４０（ｍ，４Ｈ）；７．０６（ｄｄ，１Ｈ）５．２３（ｄ，２Ｈ）；２．６６（ｓ，３Ｈ）。

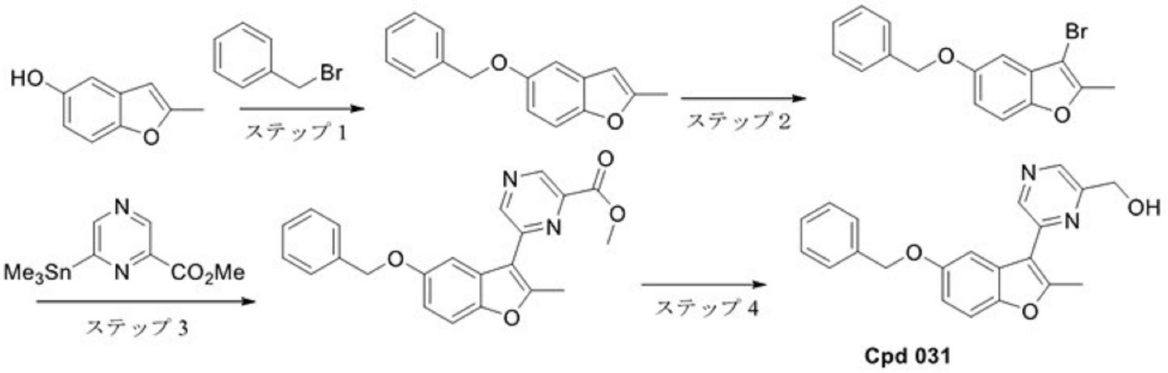
【０２１５】

ステップ２：５－（（２－クロロ－６－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボニトリル（６８．７ｍｇ、０．２１８ｍｍｏｌ）、アジ化ナトリウム（１５．５６ｍｇ、０．２３９ｍｍｏｌ）、及び塩化アンモニウム（１２．８ｍｇ、０．２３９ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（０．５ｍｌ）中に懸濁し、密封チューブ内で、１２０℃で３０時間撹拌した。ＲＭを、室温に冷却し、減圧下で濃縮した。残渣を、ＥｔＯＡｃ中で希釈し、ＨＣｌ（６Ｎ）、水、及びブラインの水溶液で洗浄した。有機層を、硫酸マグネシウムで乾燥させ、フリットガラスで濾過した。溶媒を減圧下で除去して、緑色がかったワックスを得た。最初に、残渣を、水中のＡＣＮの勾配（０％～６５％）を使用してＣ１８ゲル上のＳＰＥによって精製して、５－｛５－［（２－クロロ－６－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル｝－２Ｈ－１，２，３，４－テトラゾール（化合物０２３）（２９．７ｍｇ、３８％）をベージュ色の固体として得た。

【０２１６】

｛６－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピラジン－２－イル｝メタノール（化合物０３１）の合成。

【化３４】



ステップ１：ＤＭＦ（３０．０ｍＬ）中の２－メチルベンゾフラン－５－オール（８．０ｇ、５３．９９ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＨ（６０％）（２．６０ｇ、１０７．９９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを３０分間撹拌した。ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の（ブロモメチル）ベンゼン（６．７９ｍＬ、５３．９９ｍｍｏｌ）を０℃でＲＭにゆっくりと添加した後に、ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、氷冷水（１５０ｍＬ）で希釈し、３０分間撹拌した。固体を、濾過し、水で洗浄し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体（１０ｇ）として得た。残渣を、ｐｅｔ－エーテル中の２％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン（６．０ｇ、４７％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ　ｐｐｍ：７．４４－７．４２（ｍ，２Ｈ），７．３８（ｔ，２Ｈ），７．３３－７．３１（ｍ，１Ｈ），７．２９－７．２５（ｍ，１Ｈ），７．０１（ｄ，１Ｈ），６．８６（ｄｄ，１Ｈ），６．２９（ｓ，１Ｈ），５．０８（ｓ，２Ｈ），２．４２（ｓ，３Ｈ）．

【０２１７】

ステップ２：ＴＨＦ（４０ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン（６．０ｇ、２５．１８ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮＢＳ（４．４８ｇ、２５．１８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、Ｈ$_{2}$Ｏ（４０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×２０ｍＬ）で抽出した。有機層を、分離し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、溶離液として１００％のＡＣＮを用いるＲＰクロマトグラフィーによって精製して、５－（ベンジルオキシ）－３－ブロモ－２－メチルベンゾフランをオフホワイト色の固体（３．５ｇ、４３．８２％）として得た、^{1}ＨＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ　ｐｐｍ：７．６３－７．４５（ｍ，２Ｈ），７．４２－３７（ｍ，２Ｈ），７．３５－７．３１（ｍ，１Ｈ），７．２９－７．２５（ｍ，１Ｈ），６．９７－６．９０（ｍ，２Ｈ），５．１０（ｓ，２Ｈ），２．４４（ｓ，

３Ｈ）。

【０２１８】

ステップ３：ジオキサン（３０ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－３－ブロモ－２－メチルベンゾフラン（８００ｍｇ、２．５２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、メチル６－（トリメチルスタンニル）ピラジン－２－カルボキシレート（１．１３ｇ、３．７８ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭをアルゴンで５分間脱気した。次いで、$Pd_2(dba)_3$（２３０．９６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）及びＤＴＢＰＦ（１１９．６７ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを１２０℃で１６時間撹拌した。次いで、ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）で洗浄し、濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製して、固体を得た。固体を、ｎ－ペンタン中の１０％Et_2Oで粉砕し、室温で１０分間撹拌した。固体を、濾過し、ｎ－ペンタンで洗浄し、真空下で乾燥させて、メチル６－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピラジン－２－カルボキシレート（２５０ｍｇ、２６．４７％）をオフホワイト色の固体として得た、^1H ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ｐｐｍ：９．２４（ｓ，１Ｈ），９．１３（ｓ，１Ｈ），７．８４（ｄ，１Ｈ），７．５５－７．５１（ｍ，１Ｈ），７．５０－７．４９（ｍ，２Ｈ），７．４０（ｔ，２Ｈ），７．３５－７．３１（ｍ，１Ｈ），７．０２（ｄｄ，１Ｈ），５．１７（ｓ，２Ｈ），３．９８（ｓ，３Ｈ），２．８０（ｓ，３ Ｈ）。

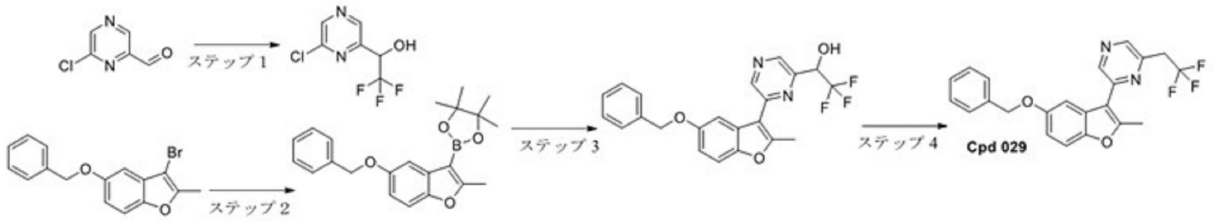
【０２１９】

ステップ４：ＥｔＯＨ（２５．０ｍＬ）中の６－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピラジン－２－カルボキシレート（３００ｍｇ、０．８０ｍｍｏｌ）の溶液に、$NaBH_4$（４５．４７ｍｇ、１．２０ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で５時間撹拌した。次いで、ＲＭを、飽和水性NH_4Cl溶液（３０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×１５ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲル上のＦＣＣによって精製した。残渣を、分取ＨＰＬＣ．［分取ＨＰＬＣ条件：移動相Ａ：１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＵＮＩＨＹＢＲＩＤ ｃ１８（１５０*２５）８μｍ、流量：２０ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／５０、２／５０、１０／８０、１０．５／８０、１０．６／１００、１４．０／１００、１４．１／５０、１８／５０、溶解度：ＡＣＮ＋ＴＨＦ＋水、温度：周囲］によって再精製した。所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、｛６－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピラジン－２－イル｝メタノール（化合物０３１）（９．７０ｍｇ、３．４９％）を得た。

【０２２０】

２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－６－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピラジン（化合物０２９）の合成。

【化３５】



ステップ１：ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の６－クロロピラジン－２－カルバルデヒド（３）（２．０ｇ、１４．０３ｍｍｏｌ）及びモレキュラーシーブ４Ａの溶液に、トリフルオロメチルトリメチルシラン（２．３９ｍＬ、１６．８３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で３０分間撹拌した。次いで、K_2CO_3（０．１９４ｇ、１．４０ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。ＲＭを、H_2O（２５ｍＬ）で希釈

し、ＥｔＯＡｃ（３×１５ｍＬ）で抽出した。有機層を、分離し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、勾配としてｐｅｔ－エーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、１－（６－クロロピラジン－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（４）（８００ｍｇ、２６．７８％）をオフホワイト色の粘性のある固体として得た、^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　ｐｐｍ：８．５９（ｓ，１Ｈ），８．８５（ｓ，１Ｈ），７．４３（ｄ，１Ｈ），５．３９－５．３２（ｍ，１Ｈ）。

【０２２１】

ステップ２：１，４－ジオキサン（５０ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－３－ブロモ－２－メチルベンゾフラン（５．０ｇ、１５．７６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ビス（ピナコラト）ジボロン（８．００ｇ、３１．５２ｍｍｏｌ）及び酢酸カリウム（３．０９４ｇ、３１．５２ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを窒素で１０分間脱気した。次いで、$Pd(OAc)_2$（０．０３５ｇ、０．１５ｍｍｏｌ）及びトリシクロヘキシルホスフィン（０．１３３ｇ、０．４７ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを７５℃に１６時間加熱した。ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣は、１００％ＡＣＮの勾配を使用するＲＰクロマトグラフィーによってであり、メチル２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロランをオフホワイト色の固体（３．５０ｇ、６０．９６％）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　ｐｐｍ：７．４９－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．４１－７．３６（ｍ，３Ｈ），７．３３－７．２９（ｍ，１Ｈ），７．２７－７．２５（ｍ，１Ｈ），６．８４（ｄｄ，１Ｈ），５．１０（ｓ，２Ｈ），２．５９（ｓ，３Ｈ），１．３４（ｓ，１２Ｈ）。

【０２２２】

ステップ３：１，４－ジオキサン（２０ｍＬ）中の１－（６－クロロピラジン－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（７００ｍｇ、３．２９ｍｍｏｌ）の溶液に、水（５．０ｍＬ）中の２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン（１．４３ｇ、３．９５ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（９１０．３２ｍｇ、６．５８ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを窒素で１０分間脱気し、続いて、$Pd(PPh_3)_4$（３８．０３ｍｇ、０．０３３ｍｍｏｌ）を添加し、密封チューブ内で更に５分間脱気した。ＲＭを９０℃に１６時間加熱した。ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（３０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、溶離液としてＰｅｔ．エーテル中の２０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、１－（６－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピラジン－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オールを淡黄色の粘性物質（２００ｍｇ、１４．６６％）として得た、^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：８．９４（ｓ，１Ｈ），８．６７（ｓ，１Ｈ），７．４７－７．４５（ｍ，２Ｈ），７．４１－３７（ｍ，４Ｈ），７．３４－７．３０（ｍ，１Ｈ），７．０２－７．００（ｄｄ，１Ｈ），５．２３－５．１７（ｍ，１Ｈ），５．１０（ｓ，２Ｈ），４．６４（ｄ，１Ｈ），２．７２（ｓ，３Ｈ）。

【０２２３】

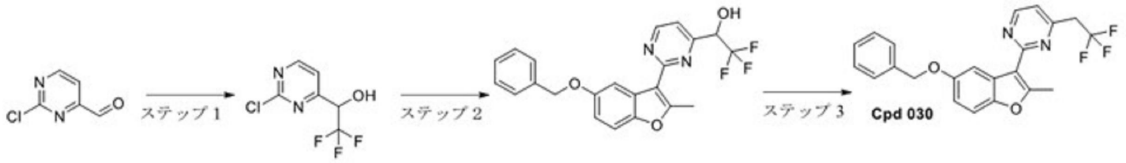
ステップ４：ＤＣＭ（５．０ｍＬ）中の１－（６－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピラジン－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（１００ｍｇ、０．２４ｍｍｏｌ）の溶液に、トリエチルシラン（３３．６７ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）及びＴＦＡ（０．３ｍＬ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを、H_2O（２０ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ（２×１０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、ブライン（１０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。化合物を、分取ＨＰＬＣ．［分取ＨＰＬＣ条件：移動相：水中の１０ｍＭのＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＬＵＮＡ　Ｃ１８（２１．２×２５０）５μｍ、流量：１７ｍｌ／分、方法：（分でのＴ／Ｂの％）：０／７０、２／７０、

１０／９０、１３／９０、１３．１／１００、１９／１００、１９．１／７０、２４／７０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］によって精製した。所望の画分を、蒸発させ、凍結乾燥させて、２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－６－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピラジン（化合物０２９）（８．７０ｍｇ、９．０５％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０２２４】

２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－４－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピリミジン（化合物０３０）の合成。

【化３６】



ステップ１：ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の２－クロロピリミジン－４－カルバルデヒド（２．０ｇ、１４．０３ｍｍｏｌ）、モレキュラーシーブ４Ａ°（５００ｍｇ）の懸濁液に、トリフルオロメチルトリメチルシラン（２．４９ｍＬ、１６．８３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で３０分間撹拌した。次いで、K_2CO_3（０．１９４ｇ、１．４０ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。ＲＭを、H_2O（２５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×１５ｍＬ）で抽出した。有機層を、分離し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、勾配としてｐｅｔ－エーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、１－（２－クロロピリミジン－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（１．２０ｇ、４０．３２％）を無色の粘性物質として得た、^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：８．７３（ｄ，１Ｈ），７．４４（ｄ，１Ｈ），５．０７－５．０４（ｍ，１Ｈ），４．４３（ｄ，１Ｈ）。

【０２２５】

ステップ２：１，４－ジオキサン（２０ｍＬ）中の１－（２－クロロピリミジン－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（３００ｍｇ、１．４１ｍｍｏｌ）の溶液に、水（５．０ｍＬ）中の２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン（６１６．９１ｍｇ、１．６９ｍｍｏｌ）及びK_2CO_3（３９０．１３ｍｇ、２．８２ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを窒素で１０分間脱気し、続いて、Ｐｄ（PPh_3）$_4$（１６．３０ｍｇ、０．０１４ｍｍｏｌ）を添加し、密封チューブ内で更に５分間脱気した。ＲＭを９０℃に１６時間加熱した。ＲＭを、セライトパッドを通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（３０ｍＬ）で洗浄し、濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、溶離液としてＰｅｔ．エーテル中の２０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、１－（２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オールを淡黄色の粘着性の固体（２８．８０ｍｇ）として得た、^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　ｐｐｍ：９．０２５（ｄ，１Ｈ），８．０５（ｄ，１Ｈ），７．５８（ｄ，１Ｈ），７．５１－７．４８（ｍ，３Ｈ），７．４２－７．３１（ｍ，４Ｈ），６．９９（ｄｄ，１Ｈ），５．３３－５．２７（ｍ，１Ｈ），５．１５（ｓ，２Ｈ），２．９０（ｓ，３Ｈ）。

【０２２６】

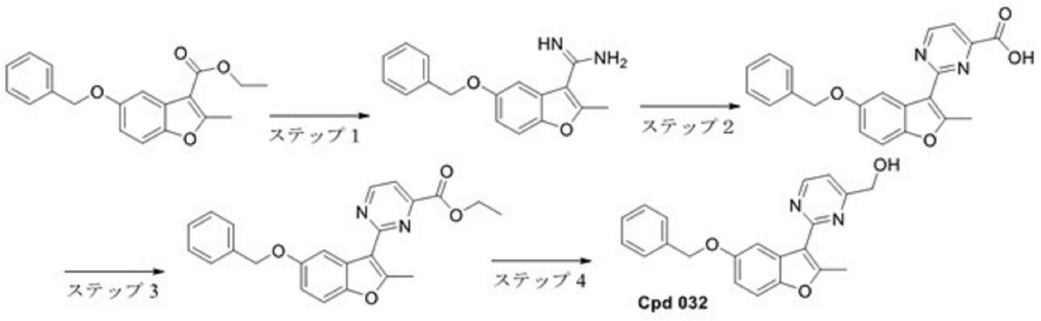
ステップ３：ＴＨＦ（１５．０ｍＬ）中の１－（２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（１３０ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）の溶液に、ヨウ素（９５．５５０ｍｇ、０．３７ｍｍｏｌ）及びイミダゾール（２５．６３ｍｇ、０．３７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。次いで、ＴＰＰ（１２３．３３８ｍｇ、０．４７１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを６５℃で１６時間撹拌した。ＲＭを、室温に冷却し、H_2O（２０ｍＬ）で

希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機相を、ブライン（１０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、溶離液としてＰｅｔ．エーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］－４－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピリミジン（化合物０３０）（９．８０ｍｇ、７．８４％）をオフホワイト色の固体として得た。

【０２２７】

｛２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピリミジン－４－イル｝メタノール（化合物０３２）の合成。

【化３７】



ステップ１：トルエン（４０ｍＬ）中のエチル５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシレート（２ｇ、６．４４４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＨＦ中の塩化アンモニウム（１．７２４ｇ、３２．２２２ｍｍｏｌ）及び２ＭのＬＡＨ（１６．１１１ｍＬ、３２．２２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。次いで、ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを、０℃に冷却し、２０ｍｌのメタノールでクエンチした。ＲＭを室温で１時間撹拌した。濾過後に、固体をメタノールで数回洗浄し、溶液を減圧下で濃縮した。残渣を、勾配としてＤＣＭ中の５％ＭｅＯＨを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシイミダミド（６００ｍｇ、３３．２１％）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＭｅＯＤ）δ　ｐｐｍ：７．４７（ｄ，３Ｈ），７．３９－７．３７（ｍ，２Ｈ），７．３５（ｄ，１Ｈ），７．２０（ｄ，１Ｈ），７．０８－７．０５（ｍ，１Ｈ），５．１４（ｓ，２Ｈ），２．６４（ｓ，３Ｈ）。

【０２２８】

ステップ２：ＥｔＯＨ（１０ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－カルボキシイミドアミド（５００ｍｇ、１．７８４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、エタノール（０．４１９ｍＬ、５．３５１ｍｍｏｌ）及びエチル（Ｅ）－４－（ジメチルアミノ）－２－オキソブタ－３－エノエート（３６６．４２１ｍｇ、２．１４０ｍｍｏｌ）中の２１重量％のナトリウムエトキシドを室温で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを、室温に冷却し、減圧下で濃縮した。残渣を、０℃に冷却し、飽和クエン酸溶液（ｐＨ約４）で酸性化し、沈殿した固体を、濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、乾燥させた。残渣を、勾配としてＤＣＭ中の５％ＭｅＯＨを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－カルボン酸を褐色の固体として得た（３１０ｍｇ、４８．２３％）。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　ｐｐｍ：１３．９７（ｓ，１Ｈ），９．１３（ｄ，１Ｈ），８．２５（ｄ，１Ｈ），７．８０（ｄ，１Ｈ），７．５２－７．４８（ｍ，３Ｈ），７．４１－７．３７（ｍ，２Ｈ），７．３４－７．３０（ｍ，１Ｈ），７．０１－６．９９（ｍ，１Ｈ），５．１６（ｓ，２Ｈ），２．９６（ｓ，３Ｈ）。

【０２２９】

ステップ３：ＥｔＯＨ（５ｍＬ）中の２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－カルボン酸（１７０ｍｇ、０．４７２ｍｍｏｌ）

の撹拌溶液に、塩化チオニル（０．０６９ｍＬ、０．９４３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを、室温に冷却し、減圧下で濃縮した。残渣を、０℃に冷却し、飽和$NaHCO_3$溶液（６ｍＬ）で塩基化し、次いで、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、エチル２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－カルボキシレートをオフホワイト色の固体（１４０ｍｇ、７６．４％）として得た。^1H ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ｐｐｍ：９．１８（ｄ，１Ｈ），８．２４（ｄ，１Ｈ），７．８６（ｄ，１Ｈ），７．５２（ｄ，３Ｈ），７．４２－７．３９（ｍ，２Ｈ），７．３５－７．３２（ｍ，１Ｈ），７．０３－７．００（ｍ，１Ｈ），５．１６（ｓ，２Ｈ），４．４６－４．４１（ｍ，２Ｈ），２．９６（ｓ，３Ｈ），１．３７（ｍ，３Ｈ）。

【０２３０】

ステップ４：ＥｔＯＨ（５．０ｍＬ）中の２－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチルベンゾフラン－３－イル）ピリミジン－４－カルボキシレート（１４０ｍｇ、０．３６０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＢＨ４（４０．９０５ｍｇ、１．０８１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、水（１０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わせた有機層を、飽和塩化ナトリウム溶液（１０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、勾配としてＤＣＭ中の５％ＭｅＯＨを使用するシリカゲル上のＦＣＣで精製して、｛２－［５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－１－ベンゾフラン－３－イル］ピリミジン－４－イル｝メタノール（化合物０３２）をオフホワイト色の固体（４０ｍｇ、３２．０４％）として得た。

【表１３－１】

分析データ

化合物	[M+H]+（m/z）：	^{1}H NMR（δ ppm）
化合物001	378.13	(400 Mz, DMSO-d_6) d [ppm]:8.72-8.71 (m, 1H), 8.26-8.24 (d, 1H), 7.77-7.75 (t, 1H), 7.36-7.33 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 6.88-6.86 (d, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.64-4.63 (t, 1H), 3.39-3.38 (d, 2H), 2.40 (s, 3H), 0.84 (m, 2H), 0.59 (m, 2H).
化合物002	357.1	(500 MHz, DMSO-d_6) : δ 8.92 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.03 (dd, 1H), 5.48 (bs, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.45 (s, 3H)
化合物003	420.1	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.732 (dd, 1H), 8.494 (s, 1H), 8.292 (d, 1H), 7.785 (dd, 1H), 7.617 (d, 1H), 7.317 (d, 1H), 6.860 (dd, 1H), 5.311 (s, 2H), 3.690 (d, 2H), 2.556 (s, 3H), 1.176－1.111 (m, 2H), 0.978－0.907 (m, 2H).
化合物004	330.1	(400 MHz, DMSO-d_6) : δ 8.97 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.83 (dd, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.65 (t, 1H), 3.40 (d, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 0.89－0.84 (m, 2H), 0.63－0.60 (m, 2H).
化合物005	466.1	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.734 (dd, 1H), 8.308－8.254 (m, 1H), 8.124 (s, 1H), 7.784 (dd, 1H), 7.478 (d, 1H), 7.359 (d, 1H), 6.900 (dd, 1H), 5.346－5.306 (m, 2H), 2.488 (s, 3H), 1.303－1.246 (m, 2H), 0.981－0.918 (m, 2H).
化合物006	440.1	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.730 (dd, 1H), 8.294－8.244 (m, 1H), 8.137 (s, 1H), 7.782 (dd, 1H), 7.429 (d, 1H), 7.384 (d, 1H), 6.916 (dd, 1H), 5.321 (d, 2H), 2.487 (s, 3H), 2.450 (s, 3H), 1.288－1.198 (m, 2H), 0.950－0.894 (m, 2H).
化合物007	356.1	(400 MHz, DMSO-d_6) : δ 11.91 (s, 1H), 8.98 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.10－6.95 (m, 2H), 5.34 (s, 2H), 4.84 (t, 1H), 4.48 (dd, 2H), 2.67 (d, 3H), 2.43 (s, 3H).
化合物008	448.1	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.730 (dd, 1H), 8.551 (s, 1H), 8.278 (d, 1H), 7.781 (dd, 1H), 7.451 (d, 1H), 7.322 (d, 1H), 6.871 (dd, 1H), 5.305 (d, 2H), 3.431 (t, 2H), 3.120 (s, 3H), 2.523 (s, 3H), 2.183 (t, 2H), 1.113－1.038 (m, 2H), 0.961－0.870 (m, 2H).
化合物009	448.161	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.727 (dd, 1H), 8.346 (s, 1H), 8.290 (dd, 1H), 7.777 (dd, 1H), 7.627 (d, 1H), 7.309 (d, 1H), 6.852 (dd, 1H), 5.311 (d, 2H), 5.193 (s, 1H), 2.550 (s, 3H), 1.128 (s, 6H), 1.116 (d, 2H), 0.953－0.897 (m, 2H).
化合物010	434.14	(600 MHz, DMSO-d_6) d 8.731 (dd, 1H), 8.555 (s, 1H), 8.289 (dd, 1H), 7.782 (dd, 1H), 7.603 (d, 1H), 7.317 (d, 1H), 6.861 (dd, 1H), 5.305 (d, 2H), 3.679 (s, 2H), 3.215 (s, 2H), 2.545 (s, 3H), 1.252 (dd, 1H), 1.167－1.111 (m, 2H), 0.963－0.907 (m, 2H).
化合物011	325.1	(500 MHz, DMSO-d_6) : δ 8.98 (s, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.93 (dd, 1H), 5.37 (s, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 1.78-1.74 (m, 2H), 1.37-1.32 (m, 2H).

【表１３－２】

化合物	[M+H]+（m/z）：	1H NMR（δ ppm）
化合物012	419.1457	(600 MHz, DMSO-d6) d 8.721（dd, 1H), 8.298－8.239（m, 1H), 7.773（dd, 1H), 7.363（d, 1H), 7.260（d, 1H), 7.084－7.040（m, 1H), 6.926－6.859（m, 2H), 5.335（d, 2H), 2.991（s, 2H), 2.443（s, 3H), 1.015－0.956（m, 2H), 0.695－0.636（m, 2H).
化合物013	480.1331	(600 MHz, DMSO-d6) d 8.731（dd, 1H), 8.293－8.238（m, 1H), 8.173（s, 1H), 7.779（dd, 1H), 7.452（d, 1H), 7.379（dd, 1H), 6.912（dd, 1H), 5.311（d, 2H), 2.481（s, 3H), 2.447（d, 2H), 1.313－1.216（m, 2H), 0.949－0.889（m, 2H), 0.708（dddd, 1H), 0.366－0.284（m, 2H), -0.034（dt, 2H).
化合物014	363.3	(400 MHz, MeOD) d [ppm]:8.73-8.72（m, 1H), 8.28-8.26（m, 1H), 7.79-7.76（m, 1H), 7.35-7.33（m, 1H), 7.27-7.26（m, 1H), 6.89-6.86（m, 1H), 5.33（s, 2H), 2.43（s, 3H), 2.23（bs, 2H), 0.88-0.85（m, 2H), 0.67-0.64（m, 2H).
化合物015	433.1613	(600 MHz, DMSO-d6) d 8.719（dd, 1H), 8.291－8.239（m, 1H), 7.769（dd, 1H), 7.336（d, 1H), 7.285（d, 1H), 7.029（s, 1H), 6.870（dd, 1H), 6.771－6.731（m, 1H), 5.331（s, 2H), 3.029（q, 1H), 2.417（s, 3H), 1.056（ddd, 1H), 0.981（d, 3H), 0.971－0.912（m, 1H), 0.684－0.574（m, 2H).
化合物016	377.2	(400 MHz, DMSO-d6)：δ 8.71（d, 1H), 8.25（d, 1H), 7.80－7.75（m, 1H), 7.35（d, 1H), 7.11（d, 1H), 6.87（dd, 1H), 5.32（s, 2H), 2.58（s, 2H), 2.41（s, 2H), 2.03（brs, 1H), 0.83－0.79（m, 2H), 0.60－0.54（m, 2H).
化合物017	372.1144	(600 MHz, DMSO-d6) d 8.973（d, 1H), 8.493（s, 1H), 7.623－7.580（m, 1H), 7.344－7.270（m, 1H), 6.847（ddd, 1H), 5.306（d, 2H), 3.692（d, 2H), 2.572－2.523（m, 3H), 2.433（d, 3H), 2.065（d, 1H), 1.171－1.082（m, 2H), 0.996－0.912（m, 2H).
化合物018	385.1	(400 MHz, DMSO-d6)：δ 7.63-7.60（m, 1H), 7.57-7.53（m, 2H), 7.40-7.38（m, 1H), 7.03（dd, 1H), 6.23（t, 1H), 4.91（s, 2H), 4.51（s, 2H), 3.58（s, 4H), 2.75（s, 3H).
化合物019	304.21	(500 MHz, DMSO-d6)：δ 7.51－7.49（m, 2H), 7.44－7.37（m, 3H), 7.35－7.31（m, 1H), 7.21（d, 1H), 6.95（dd, 1H), 5.16（s, 2H), 2.48（s, 3H), 1.78－1.73（m, 2H), 1.35－1.30（m, 2H).
化合物020	387.2	(400 MHz, DMSO-d6)：δ 8.96（s, 1H), 7.39（d, 1H), 7.05－6.99（m, 2H), 6.87（dd, 1H), 5.31（s, 2H), 4.51（t, 1H), 3.30－3.25（m, 2H), 3.09－3.03（m, 2H), 2.40（s, 3H), 2.37（s, 3H), 1.48－1.43（m, 2H), 0.92－0.89（m, 2H).
化合物021	309.2	(500 MHz, DMSO-d6)：δ 7.48（d, 2H), 7.39（t, 2H), 7.35－7.29（m, 2H), 7.12（d, 1H), 6.85（dd, 1H), 5.10（s, 2H), 4.65（t, 1H), 3.40（d, 2H), 2.40（s, 3H), 0.86（t, 2H), 0.60（t, 2H).

【表１３－３】

化合物	[M+H]+（m/z）：	1H NMR（δ ppm）
化合物022	343.1	(500 MHz, DMSO-d_6)：δ 8.96（s, 1H), 7.37（d, 1H), 7.04（d, 1H), 6.93（s, 1H), 6.86（dd, 1H), 6.65（s, 1H), 5.32（s, 2H), 2.41（s, 3H), 2.38（s, 3H), 1.48-1.40（m, 2H), 0.91-0.87（m, 2H).
化合物027	449	(400 Mz, DMSO-d_6) d［ppm]:8.97（s, 1H), 8.16（s, 1H), 7.44（m, 1H), 7.33-7.29（m, 6H), 6.87-6.85（m, 1H), 5.29（s, 2H), 4.92（s, 2H), 2.42（s, 3H), 1.12-1.07（m, 2H), 0.97-0.9（m, 2H).
化合物029	399.2	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm:8.99（s, 1 H), 8.66（s, 1 H), 7.63（d, 1 H), 7.52（d, 1 H), 7.47－7.45（m, 2 H), 7.39（t, 2 H), 7.34－7.30（m, 1 H), 7.005（dd, 1 H), 5.14（s, 2 H), 4.08－4.00（m, 2 H), 2.74（s, 3 H).
化合物030	399.2	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm:8.94（d, 1 H), 8.05（d, 1 H), 7.51－7.48（m, 3 H), 7.42（d, 1 H), 7.39（t, 2 H), 7.35－7.31（m, 1 H), 6.99（dd, 1 H), 5.15（s, 2 H), 4.01（q, 2 H), 2.91（s, 3 H).
化合物031	375.01	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm:9.24（s, 1 H), 9.13（s, 1 H), 7.84（d, 1 H), 7.55－7.51（m, 1 H), 7.50－7.49（m, 2 H), 7.40（t, 2 H), 7.35－7.31（m, 1 H), 7.02（dd, 1 H), 5.17（s, 2 H), 3.98（s, 3 H), 2.80（s, 3 H).
化合物032	347.2	(400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm:8.89（d, 1 H), 8.04（d, 1 H), 7.51-7.46（m, 3 H), 7.42-7.38（m, 3 H), 7.34-7.31（m, 1 H), 7.00－6.97（m, 1 H), 5.69－5.66（m, 1 H), 5.16（s, 2 H), 4.66（d, 2 H), 2.89（s, 3 H)

【０２３１】

パートＢ

ＴＲＰＭ３イオンチャネル駆動型Ca^{2+}取り込みのモニタリング

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

【０２３２】

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

【０２３３】

細胞播種の前に（黒色の３８４ウェルプレート（Ｇｒｅｉｎｅｒ）への±２０００細胞／ウェル）、希釈された化合物を、カルシウムを含むＫｒｅｂｓ緩衝液に溶解したＰＳとともに、アッセイプレートに添加した。これにより、２．４ｍＭ　Ca^{2+}アッセイ溶液が得られた。細胞添加の直後に、プレートを、４８５ｎＭの励起及び５３５ｎＭの放出によってＥｎｖｉｓｉｏｎ蛍光リーダ（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）上で読み取った。

【０２３４】

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

ルの存在下で決定されたＲＦＵ－陽性対照阻害剤を有する試料に対して決定されたＲＦＵ）］＊１００。

【０２３５】

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

【表１４】

化合物	IC_{50}
化合物 001	A
化合物 002	A
化合物 003	A
化合物 004	A
化合物 005	A
化合物 006	A
化合物 007	A
化合物 008	A
化合物 009	A
化合物 010	A
化合物 011	A
化合物 012	A
化合物 013	A
化合物 014	B
化合物 015	B
化合物 016	B

化合物	IC_{50}
化合物 017	B
化合物 018	B
化合物 019	B
化合物 020	B
化合物 021	B
化合物 022	B
化合物 023	B
化合物 024	B
化合物 025	C
化合物 026	C
化合物 027	C
化合物 028	C
化合物 029	C
化合物 030	C
化合物 031	C
化合物 032	C

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063994

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A61P25/04 A61P29/00 C07D307/83 C07D405/12 C07D413/12
C07D417/12 A61K31/343 A61K31/44 A61K31/4178 A61K31/41
A61K31/422 A61K31/427 A61K31/4245
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)
A61P C07D

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	PERVARAM S ET AL: "Synthesis and Anticancer Activity of 1,2,4-Oxadiazole Fused Benzofuran Derivatives", RUSSIAN JOURNAL OF GENERAL CHEMISTRY, PLEIADES PUBLISHING, MOSCOW, vol. 88, no. 6, 6 August 2018 (2018-08-06) , pages 1219-1223, XP036562818, ISSN: 1070-3632, DOI: 10.1134/S1070363218060282 [retrieved on 2018-08-06] page 1220; examples 11a-11j ----- -/--	1-15

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

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

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
22 June 2023	30/06/2023

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

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063994

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 2011, Karale, B. K.; Chaudhari, C. S.; Jadhav, R. K.; Akolkar, H. N.: "Synthesis and biological screening of some novel 2-hetaryl chromones", XP002807705, Database accession no. 2011:946707 1333408-72-2, 1333408-73-3, 1333408-75-5, 1333408-76-6 & KARALE, B. K.; CHAUDHARI, C. S.; JADHAV, R. K.; AKOLKAR, H. N.: "Synthesis and biological screening of some novel 2-hetaryl chromones", INDIAN JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, vol. 20, no. 4, 2011, - 2011, pages 377-380, -----	1-15
A	YANG LING-YI ET AL: "The First Total Synthesis of Kynapcin-24 by Palladium Catalysis", SYNTHESIS , vol. 2009, no. 07 1 April 2009 (2009-04-01), pages 1175-1179, XP055969339, STUTTGART, DE. ISSN: 0039-7881, DOI: 10.1055/s-0028-1087998 Retrieved from the Internet: URL:https://www.thieme-connect.de/products/ejournals/pdf/10.1055/s-0028-1087998.pdf page 1176; compounds 16, 17 -----	1-15
A	JP 2022 059593 A (NISSAN CHEMICAL CORP) 13 April 2022 (2022-04-13) page 144; compounds 9-122 to 9-124, 9-127 to 9-131, 9-135, 9-136 -----	1-15
A	WO 2021/185291 A1 (MEDSHINE DISCOVERY INC [CN]) 23 September 2021 (2021-09-23) page 89; compounds BB-15-3, BB-15 page 93; compounds BB-19-4, BB-19 page 97; compounds BB-23-4, BB-23 -----	1-15
A	WO 2021/047674 A1 (MEDSHINE DISCOVERY INC) 18 March 2021 (2021-03-18) Claim 10: 2nd, 3rd, 5th compound in 3rd row claim 10: 2nd to 5th compound in 4th row -----	1-15
	-/--	

2

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063994

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2019/195720 A1 (BIOCRYST PHARM INC [US]) 10 October 2019 (2019-10-10) page 1004; compounds 459f,459g	1-15
A	US 2013/203775 A1 (YEUNG KAP-SUN [US] ET AL) 8 August 2013 (2013-08-08) 5th and 6th compound in the scheme; page 12	1-15
A	FR 2 431 491 A1 (DELALANDE SA [FR]) 15 February 1980 (1980-02-15) page 4; compound VI	1-15
A	STRAUB ISABELLE ET AL: "Flavanones That Selectively Inhibit TRPM3 Attenuate Thermal Nociception In Vivo", MOLECULAR PHARMACOLOGY , vol. 84, no. 5 7 November 2013 (2013-11-07), pages 736-750, XP055777082, US ISSN: 0026-895X, DOI: 10.1124/mol.113.086843 Retrieved from the Internet: URL:http://dx.doi.org/10.1124/mol.113.086843 cited in the application the whole document	1-15
A	XIONG W.-H. ET AL: "Voriconazole, an Antifungal Triazol That Causes Visual Side Effects, Is an Inhibitor of TRPM1 and TRPM3 Channels", INVESTIGATIVE OPHTHALMOLOGY & VISUAL SCIENCE, vol. 56, no. 2, 25 February 2015 (2015-02-25), pages 1367-1373, XP055969139, US ISSN: 0146-0404, DOI: 10.1167/iovs.14-15270 the whole document	1-15

-/--

2

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063994

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	SUZUKI HIROKA ET AL: "3 isoforms", PHARMACOLOGY RESEARCH & PERSPECTIVES , vol. 4, no. 3 1 June 2016 (2016-06-01), page 232, XP055909852, GB ISSN: 2052-1707, DOI: 10.1002/prp2.232 Retrieved from the Internet: URL:https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC4876142/pdf/PRP2-4-e00232.pdf the whole document -----	1-15
A	KRÜGEL UTE ET AL: "Primidone inhibits TRPM3 and attenuates thermal nociception in vivo", PAIN , vol. 158, no. 5 1 May 2017 (2017-05-01), pages 856-867, XP055892729, NL ISSN: 0304-3959, DOI: 10.1097/j.pain.0000000000000846 Retrieved from the Internet: URL:https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC5402713/pdf/jop-158-856.pdf the whole document -----	1-15
X	US 4 143 154 A (SCHERRER ROBERT A ET AL) 6 March 1979 (1979-03-06) Ethyl-4-[(2-bromo-3-phenyl-5-benzofuranyl) methoxy]-phenyl acetate (RN70273-68-6); example 8 -----	1,3-10, 13
X	WO 98/55454 A2 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES LTD [JP]; OHKAWA SHIGENORI [JP] ET AL.) 10 December 1998 (1998-12-10) 5-[(4-methoxyphenyl)methoxy]-2,4,6,7-tetramethyl-3-[4-(1-methylethyl)phenyl]-benzofuran (RN 2116989-41-2); example 27 ----- -/--	1-10,13

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/063994

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PRASAD SURE SIVA ET AL: "One-pot access to 2-amino-3-arylbenzofurans: direct entry to polyheterocyclic chemical space", ORGANIC & BIOMOLECULAR CHEMISTRY, vol. 18, no. 40, 21 October 2020 (2020-10-21), pages 8119-8140, XP093056784, ISSN: 1477-0520, DOI: 10.1039/D0OB01715A Retrieved from the Internet: URL:https://pubs.rsc.org/en/content/articlepdf/2020/ob/d0ob01715a> page 8129; compound 4n -----	1-10
X	KIM DAWON ET AL: "Orally Administered Benzofuran Derivative Disaggregated A[beta] Plaques and Oligomers in the Brain of 5XFAD Alzheimer Transgenic Mouse", ACS CHEMICAL NEUROSCIENCE, vol. 12, no. 1, 17 December 2020 (2020-12-17), pages 99-108, XP093056789, US ISSN: 1948-7193, DOI: 10.1021/acschemneuro.0c00606 page 104; compounds YB-2 -----	1-10,13
X	WO 2021/072198 A1 (BIOCRYST PHARM INC [US]) 15 April 2021 (2021-04-15) pagd 778: first compound in last row -----	1-10,13
X	KUMAR TARUN ET AL: "Regiospecific synthesis of arenofurans via cascade reactions of arenols with Morita-Baylis-Hillman acetates of nitroalkenes and total synthesis of isopa", TETRAHEDRON, ELSEVIER SIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 69, no. 24, 10 April 2013 (2013-04-10), pages 4964-4972, XP028533914, ISSN: 0040-4020, DOI: 10.1016/J.TET.2013.04.023 page 4068; compounds 13e, 15, 16 -----	1-10

2

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/063994

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2022059593 A	13-04-2022	NONE	
WO 2021185291 A1	23-09-2021	CN 115380026 A	22-11-2022
		EP 4122925 A1	25-01-2023
		JP 2023517393 A	25-04-2023
		US 2023158152 A1	25-05-2023
		WO 2021185291 A1	23-09-2021
WO 2021047674 A1	18-03-2021	CN 114401962 A	26-04-2022
		EP 4043455 A1	17-08-2022
		JP 7209897 B2	20-01-2023
		JP 2022537605 A	26-08-2022
		WO 2021047674 A1	18-03-2021
WO 2019195720 A1	10-10-2019	AR 115033 A1	18-11-2020
		AU 2019247471 A1	19-11-2020
		BR 112020019183 A2	05-01-2021
		CA 3095628 A1	10-10-2019
		CL 2020002578 A1	12-03-2021
		CN 112272553 A	26-01-2021
		CO 2020013840 A2	29-01-2021
		DK 3687506 T3	30-08-2021
		EA 202092383 A1	10-02-2021
		EP 3687506 A1	05-08-2020
		EP 3939658 A1	19-01-2022
		ES 2891123 T3	26-01-2022
		HR P20211405 T1	10-12-2021
		HU E055307 T2	29-11-2021
		IL 277787 A	30-11-2020
		JP 2021521104 A	26-08-2021
		KR 20210005619 A	14-01-2021
		LT 3687506 T	10-09-2021
		MA 51627 A	02-06-2021
		MD 3687506 T2	31-12-2021
		PE 20210398 A1	02-03-2021
		PH 12020551589 A1	13-09-2021
		PL 3687506 T3	20-12-2021
		PT 3687506 T	24-09-2021
		RS 62370 B1	29-10-2021
		SG 11202008972W A	29-10-2020
		SI 3687506 T1	31-12-2021
		TW 202010742 A	16-03-2020
		US 2019345135 A1	14-11-2019
		US 2021221786 A1	22-07-2021
		US 2022356166 A1	10-11-2022
		US 2023072867 A1	09-03-2023
		US 2023099716 A1	30-03-2023
		UY 38174 A	29-11-2019
		WO 2019195720 A1	10-10-2019
US 2013203775 A1	08-08-2013	EP 2812325 A1	17-12-2014
		US 2013203775 A1	08-08-2013
		WO 2013119499 A1	15-08-2013
FR 2431491 A1	15-02-1980	NONE	
US 4143154 A	06-03-1979	NONE	

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/063994

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9855454 A2	10-12-1998	AU 7550398 A	21-12-1998
		CA 2291026 A1	10-12-1998
		EP 0988289 A2	29-03-2000
		US 7008950 B1	07-03-2006
		WO 9855454 A2	10-12-1998
WO 2021072198 A1	15-04-2021	AR 120173 A1	02-02-2022
		AU 2020361600 A1	28-04-2022
		BR 112022006572 A2	28-06-2022
		CA 3156287 A1	15-04-2021
		CL 2022000875 A1	11-11-2022
		CN 114502168 A	13-05-2022
		CO 2022005999 A2	29-07-2022
		CR 20220199 A	26-08-2022
		CU 20220024 A7	07-11-2022
		EC SP22036502 A	31-08-2022
		EP 4041238 A1	17-08-2022
		IL 291942 A	01-06-2022
		JP 2022552185 A	15-12-2022
		KR 20220100585 A	15-07-2022
		PE 20221270 A1	01-09-2022
		TW 202128637 A	01-08-2021
		UY 38912 A	31-05-2021
		WO 2021072198 A1	15-04-2021

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

フロントページの続き

(51)国際特許分類	FI		テーマコード（参考）
Ｃ０７Ｄ 413/14 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	413/14	
Ｃ０７Ｄ 307/83 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	307/83	
Ａ６１Ｋ 31/343 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/343	
Ｃ０７Ｄ 405/04 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	405/04	
Ａ６１Ｋ 31/41 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/41	
Ｃ０７Ｄ 413/04 (2006.01)	Ｃ０７Ｄ	413/04	
Ａ６１Ｋ 31/4245(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/4245	
Ａ６１Ｋ 31/497 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/497	
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/506	
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	29/00	
Ａ６１Ｐ 25/08 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	25/08	
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)	Ａ６１Ｐ	43/00	１１１

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

ルトラ、ロード・タウン、ピー・オー・ボックス１７３、リッター・ハウス
(74)代理人 100145403
弁理士 山尾 憲人
(74)代理人 100156144
弁理士 落合 康
(72)発明者 マルシャン，アルノー
ベルギー３３６０ビールベーク、ライスブルークストラート５９アー
(72)発明者 ファンヘルク，ジャン－クリストフ
ベルギー３００１ヘフェルレー、ズワールウェンラーン４８
(72)発明者 ライヒ，メラニー
ドイツ５２０７２アーヘン、ティッタルツフェルト５３
(72)発明者 クリューガー，ゼバスティアン
ドイツ５２０６２アーヘン、ベルクドリーシュ２２
(72)発明者 フーツ，トーマス
ベルギー３０１０ケッセル－ロー、ティーンセステーンウェッヒ１４９
(72)発明者 フリーンス，ヨーリス
ベルギー３１５０ワッケルゼール、ケルフスストラート９４

Ｆターム（参考） 4C086 AA01 AA02 AA03 BA06 BC17 BC42 BC48 BC62 BC71 BC82
GA02 GA07 GA08 GA09 GA10 MA01 MA04 NA14 ZA06 ZA08 ZC02