

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年7月6日(2006.7.6)

【公表番号】特表2005-531574(P2005-531574A)

【公表日】平成17年10月20日(2005.10.20)

【年通号数】公開・登録公報2005-041

【出願番号】特願2004-506808(P2004-506808)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 239/42 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/4709 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/501 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/505 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/506 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/14 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 27/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 37/08 (2006.01)**  
**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 401/14 (2006.01)**  
**C 0 7 D 403/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 405/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 417/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 471/04 (2006.01)**

【F I】

**C 0 7 D 239/42 Z**  
**A 6 1 K 31/4709**  
**A 6 1 K 31/501**  
**A 6 1 K 31/505**  
**A 6 1 K 31/506**  
**A 6 1 K 31/5377**  
**A 6 1 P 1/00**  
**A 6 1 P 1/04**  
**A 6 1 P 9/00**

A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 13/00  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 17/14  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 25/02 1 0 1  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 37/08  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 401/14  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 405/12  
 C 0 7 D 417/12 C S P  
 C 0 7 D 471/04 1 1 4

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年5月17日(2006.5.17)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

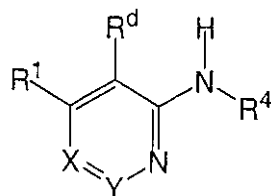
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式

【化1】



を有する化合物またはこれらの任意の医薬的に許容できる塩であって：

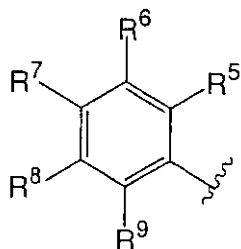
Xは = N - または = C ( R <sup>2</sup> ) - であり；

Yは = N - または = C ( R <sup>3</sup> ) - であり、ここで X および Y の少なくとも1つは = N -  
ではなく；

n は独立に、各場合において、0、1または2であり、

R <sup>1</sup> は

## 【化2】



であるか；

あるいは  $R^1$  は  $R^5$  から独立に選択される0、1、2または3個の置換基により置換されるナフチルであるか；あるいは

$R^1$  は  $R^5$  から独立に選択される1、2または3個の置換基により置換される  $R^b$  であり；

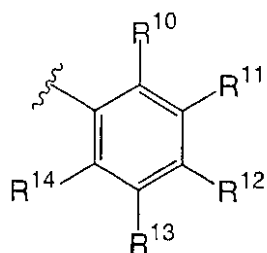
$R^2$  は、独立に、各場合においては、 $R^{10}$ 、 $R^{10}$  から選択される0、1または2個の置換基により置換される  $C_{1-8}$  アルキル、 $R^{10}$  から独立に選択される0、1、2または3個の置換基により置換される  $-(CH_2)_n$  フェニル、または

N、OおよびSから独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の5または6員のヘテロ環であって、前記環構成員の2個以下がOまたはSであり、前記ヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、且つ前記ヘテロ環または縮合フェニル環が  $R^{10}$  から独立に選択される0、1、2または3個の置換基により置換されているものであり；

$R^3$  は、独立に、各場合においては、H、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-NHC_{1-3}$  アルキル、 $-N(C_{1-3}$  アルキル) $C_{1-3}$  アルキル、または  $C_{1-3}$  アルキルであり；Xが  $=C(R^2)-$  であり、且つYが  $=C(R^3)-$  である場合には、 $R^2$  および  $R^3$  の少なくとも1つはH以外であり；

$R^4$  は

## 【化3】



であるか；あるいは

$R^4$  がO、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5あるいは6員のヘテロ環であって、OおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される0、1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3または4個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子が  $R^e$ 、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、 $-OR^f$ 、 $-S(=O)_n R^e$ 、 $-OC_{1-4}$  ハロアルキル、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $-OC_{1-6}$  アルキル  $C(=O)OR^e$ 、 $-NR^a R^f$ 、 $-NR^a C_{1-4}$  ハロアルキル、 $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-OC(=O)R^e$ 、 $-C(=O)NR^a R^f$  および  $-NR^a C(=O)R^e$  から独立に選択される0、1、2または3個の置換基により置換され；且つ不飽和炭素原子は  $=O$  により更に置換されてもよく；且つ前記ヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がH、 $-C_{1-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $R^e$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-C_{1-6}$

-<sub>3</sub> アルキル C(=O)OR<sup>e</sup>、-C<sub>1-3</sub> アルキル C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C<sub>1-3</sub> アルキル OC(=O)R<sup>e</sup>、-C<sub>1-3</sub> アルキル NR<sup>a</sup>C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)R<sup>c</sup> または -C<sub>1-3</sub> アルキル R<sup>c</sup> により置換されるものであるか；あるいは

R<sup>4</sup> は C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、-S(=O)<sub>n</sub>R<sup>e</sup>、-OC<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-OC<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>f</sup>、-OC<sub>1-6</sub> アルキル C(=O)OR<sup>e</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>f</sup>、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)OR<sup>e</sup>、-OC(=O)R<sup>e</sup> および -C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup> から独立に選択される 1、2 または 3 個の置換基により置換されるナフチルであるが；どの場合にも R<sup>4</sup> は 3、5 -ジトリフルオロメチルフェニルまたは 3 -トリフルオロメチル -4 -フルオロフェニル、-フェニル - (C<sub>1-8</sub> アルキル)、-フェニル - O - (C<sub>1-6</sub> アルキル)、-フェニル - NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup> または -フェニル - N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub> アルキル)ではないものであり；

R<sup>5</sup> は独立に、各場合において、R<sup>f</sup>、R<sup>g</sup>、ハロ、ニトロ、シアノ、-OR<sup>e</sup>、-OR<sup>g</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>f</sup>、ナフチル、-CO<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>C(=O)R<sup>e</sup>、-NR<sup>f</sup>C(=O)R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>f</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-C<sub>1-8</sub> アルキル OR<sup>f</sup>、-C<sub>1-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-S(=O)<sub>n</sub>R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、R<sup>10</sup> から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは

R<sup>5</sup> は R<sup>10</sup> から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換される O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 または 6 員のヘテロ環であり；

R<sup>6</sup> は独立に、各場合において、H、C<sub>1-5</sub> アルキル、C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、ハロ、-OC<sub>1-6</sub> アルキル、-OC<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-OC<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup> または -NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-8</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(C<sub>1-6</sub> アルキル)、R<sup>10</sup> から独立に選択される 1、2、または 3 個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

R<sup>6</sup> は R<sup>10</sup> から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換される O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 または 6 員のヘテロ環であり；

R<sup>7</sup> は独立に、各場合において、H、非環状 C<sub>1-8</sub> アルキル、C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、ハロ、-OC<sub>1-6</sub> アルキル、-OC<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-OC<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-8</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup> または -S(C<sub>1-6</sub> アルキル)であるか；あるいは

R<sup>7</sup> は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の 4 あるいは 5 員のヘテロ環であって、この環がハロ、C<sub>1-2</sub> ハロアルキル および C<sub>1-3</sub> アルキル から独立に選択される 0、1 あるいは 2 個の置換基により置換されているものであり；

R<sup>8</sup> は独立に、各場合において、H、C<sub>1-5</sub> アルキル、C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、ハロ、-OC<sub>1-6</sub> アルキル、-OC<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-OC<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>1-4</sub> ハロアルキル、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-8</sub> アルキル OR<sup>a</sup>、-C<sub>1-6</sub> アルキル NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(C<sub>1-6</sub> アルキル)、R<sup>10</sup> から独立に選択される 1、2、または 3 個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

$R^8$  は  $R^{10}$  から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換される O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 または 6 員のヘテロ環であり；

$R^9$  は独立に、各場合において、 $R^f$ 、 $R^g$ 、ハロ、ニトロ、シアノ、 $-OR^e$ 、 $-OR^g$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $-NR^a R^f$ 、 $-NR^a R^g$ 、 $-NR^f C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-NR^f C_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、ナフチル、 $-CO_2 R^e$ 、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)NR^a R^f$ 、 $-C(=O)NR^a R^g$ 、 $-NR^f C(=O)R^e$ 、 $-NR^f C(=O)R^g$ 、 $-NR^f C(=O)NR^a R^f$ 、 $-NR^f CO_2 R^e$ 、 $-C_{1-8}$  アルキル  $OR^f$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、 $-S(=O)_n R^e$ 、 $-S(=O)_2 NR^a R^f$ 、 $-NR^a S(=O)_2 R^e$ 、 $-OC(=O)NR^a R^f$ 、 $R^{10}$  から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

$R^9$  は  $R^{10}$  から独立に選択される 0、1、2、または 3 個の置換基により置換される O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 または 6 員のヘテロ環であるか；あるいは

$R^9$  は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の 4 または 5 員のヘテロ環であって、前記環がハロ、 $C_{1-2}$  ハロアルキルおよび  $C_{1-3}$  アルキルから独立に選択される 0、1 または 2 個の置換基により置換され； $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  および  $R^9$  の少なくとも 1 つが  $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、 $-OC_{1-4}$  ハロアルキル、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-NR^a C_{1-4}$  ハロアルキル、 $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^a$ 、 $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-C_{1-8}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $NR^a R^a$  または  $-S(C_{1-6}$  アルキル) であり；

$R^{10}$  は独立に、各場合において、H、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^a R^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^a R^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)NR^a R^a$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^a R^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^a R^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^a$  および  $-NR^a C_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択されるか；あるいは

$R^{10}$  は N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5、6 あるいは 7 員の単環式または 6、7、8、9、10 または 11 員の二環式環であって、前記環が 0 または 1 個のベンゾ基並びに N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する 0 または 1 個の飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員のヘテロ環と縮合し；前記環の炭素原子が 0、1 または 2 個のオキソ基により置換され、前記環が  $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^a R^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^a R^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2 N(R^a)C(=O)NR^a R^a$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C$

(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>および-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択される0、1、2または3個の基により置換されているか；あるいは

R<sup>10</sup>はC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC(=O)N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>およびNR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択される0、1、2または3個の基により置換されるC<sub>1-4</sub>アルキルであり；

R<sup>11</sup>は独立に、各場合において、H、C<sub>1-8</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC(=O)N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>および-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択されるか；あるいは

R<sup>11</sup>はN、OおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5、6または7員の単環式あるいは6、7、8、9、10または11員の二環式の環であって、前記環が0または1個のベンゾ基並びにN、OおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する0または1個の飽和あるいは不飽和の5、6または7員のヘテロ環と縮合し；前記環の炭素原子が0、1または2個のオキソ基により置換され、前記環がC<sub>1-8</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC(=O)N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、および-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択される0、1、2または3個の基により置換されているか；あるいは

$R^{11}$  は  $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換されている  $C_{1-4}$  アルキルであるか；あるいは

$R^{10}$  および  $R^{11}$  は一緒になって O および S 原子の組み合わせが 2 以下である限り、N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の 3 または 4 個の原子の架橋であって、前記架橋が  $=O$ 、 $R^e$ 、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-C(=O)NR^aR^f$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-OR^f$ 、 $-OC(=O)R^e$ 、 $-OC(=O)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^f$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2R^e$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^f$  および  $-NR^fC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$  から選択される 0、1 または 2 個の置換基により置換されているものであり；

$R^{12}$  は独立に、各場合において、H、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$  から選択されるか；あるいは

$R^{12}$  は N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員の単環式あるいは 6、7、8、9、10 または 11 員の二環式の環であって、前記環が 0 または 1 個のベンゾ基並びに N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する 0 または 1 個の飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員のヘテロ環と縮合し；前記環の炭素原子が 0、1 または 2 個のオキソ基により置換され、前記環が  $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)

)、 $-OC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換されているか；あるいは

$R^{12}$  は  $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換される  $C_{1-4}$  アルキルであり；ここで、 $R^{11}$  または  $R^{13}$  が  $CF_3$  である場合には、 $R^{12}$  は F ではなく；あるいは  $R^{11}$  および  $R^{12}$  は一緒になって O および S 原子の組み合わせが 2 以下である限り、N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の 3 または 4 個の原子の架橋であって、前記架橋が  $=O$ 、 $R^e$ 、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-C(=O)NR^aR^f$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-OR^f$ 、 $-OC(=O)R^e$ 、 $-OC(=O)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^f$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル $OR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2R^e$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^f$  および  $-NR^fC_{2-6}$  アルキル $OR^f$  から選択される 0、1 または 2 個の置換基により置換されているものであり；ここで、 $R^3$  が  $NH_2$  である場合には、 $-R^{11}-R^{12}$  は  $-C=C-C=N-$  またはこれらのいかなる置換物でもなく；

$R^{13}$  は独立に、各場合において、H、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換されているか；ここで、 $R^3$  が  $NH_2$  である場合には、 $-R^{11}-R^{12}$  は  $-C=C-C=N-$  またはこれらのいかなる置換物でもなく；

$C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  
 $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択されるか；あるいは

$R^{1-3}$  は  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員の単環式あるいは 6、7、8、9、10 または 11 員の二環式の環であって、前記環が 0 または 1 個のベンゾ基並びに  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する 0 または 1 個の飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が 0、1 または 2 個のオキソ基により置換され、前記環が  $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換されているか；あるいは

$R^{1-3}$  は  $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択される 0、1、2 または 3 個の基により置換されている  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$R^{1-4}$  は独立に、各場合において、 $H$ 、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$  アルキル)、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $NR^aR^a$  および  $-NR^aC_{2-6}$  アルキル  $OR^a$  から選択されるか；あるいは

$R^{1-4}$  は  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5、6 または 7 員の単環式あるいは 6、7、8、9、10 または 11 員の二環式の環であって、前記環が 0 または 1 個のベンゾ基並びに  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される

1、2または3個の原子を含有する0または1個の飽和あるいは不飽和の5、6または7員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が0、1または2個のオキソ基により置換され、前記環がC<sub>1-8</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC(=O)N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>および-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択される0、1、2または3個の基により置換されているか；あるいは

R<sup>1-4</sup>はC<sub>1-4</sub>ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC(=O)N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)O(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1-8</sub>アルキル)、-N(R<sup>a</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>および-NR<sup>a</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>a</sup>から選択される0、1、2または3個の基により置換されているC<sub>1-4</sub>アルキルであり；ここで、R<sup>1-0</sup>、R<sup>1-1</sup>、R<sup>1-2</sup>、R<sup>1-3</sup>およびR<sup>1-4</sup>の少なくとも1つはH以外であり；

R<sup>a</sup>は独立に、各場合において、H、フェニル、ベンジルまたはC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

R<sup>b</sup>はチオフェン、ピロール、1,3-オキサゾール、1,3-チアゾール、1,3,4-オキサジアゾール、1,3,4-チアジアゾール、1,2,3-オキサジアゾール、1,2,3-チアジアゾール、1H-1,2,3-トリアゾール、イソチアゾール、1,2,4-オキサジアゾール、1,2,4-チアジアゾール、1,2,3,4-オキサトリアゾール、1,2,3,4-チアトリアゾール、1H-1,2,3,4-テトラアゾール、1,2,3,5-オキサトリアゾール、1,2,3,5-チアトリアゾール、フラン、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-5-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-5-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-5-イル、チオラン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、4,5-ジヒドロチオフェン、2-ピロリン、4,5-ジヒドロフラン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、ピリジン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロピラン、チアン、1,2-ジアザベルヒドロイン、1,3-ジアザベルヒドロイン、ピペラジン、1,3-オキサアザベルヒドロイン、モルホリン、1,3-チアザベルヒドロイン、1,4-チアザベルヒドロイン、ピペリジン、2H-3,4-ジヒドロピラン、2,3-ジヒドロ-4H-チイン、1,4,5,6-テトラヒドロピリジン、2H-5,6-ジヒドロピラン、2,3-ジヒドロ-6H-チイン、1,2,5

, 6 - テトラヒドロピリジン、 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリジン、 4 H - ピラン、  
 4 H - チイン、 1 , 4 - ジヒドロピリジン、 1 , 4 - ジチアン、 1 , 4 - ジオキサン、 1  
 , 4 - オキサチアン、 1 , 2 - オキサゾリジン、 1 , 2 - チアゾリジン、 ピラゾリジン、  
 1 , 3 - オキサゾリジン、 1 , 3 - チアゾリジン、 イミダゾリジン、 1 , 2 , 4 - オキサ  
 ジアゾリジン、 1 , 3 , 4 - オキサジアゾリジン、 1 , 2 , 4 - チアジアゾリジン、 1 ,  
 3 , 4 - チアジアゾリジン、 1 , 2 , 4 - トリアゾリジン、 2 - イミダゾリン、 3 - イミ  
 ダゾリン、 2 - ピラゾリン、 4 - イミダゾリン、 2 , 3 - ジヒドロイソチアゾール、 4 ,  
 5 - ジヒドロイソオキサゾール、 4 , 5 - ジヒドロイソチアゾール、 2 , 5 - ジヒドロイ  
 ソオキサゾール、 2 , 5 - ジヒドロイソチアゾール、 2 , 3 - ジヒドロイソオキサゾール  
 、 4 , 5 - ジヒドロオキサゾール、 2 , 3 - ジヒドロオキサゾール、 2 , 5 - ジヒドロオ  
 キサゾール、 4 , 5 - ジヒドロチアゾール、 2 , 3 - ジヒドロチアゾール、 2 , 5 - ジヒ  
 ドロチアゾール、 1 , 3 , 4 - オキサチアゾリジン、 1 , 4 , 2 - オキサチアゾリジン、  
 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール、 2 , 5 - ジヒドロ - 1 H - [ 1  
 , 2 , 3 ] トリアゾール、 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール、 2 ,  
 3 - ジヒドロ - 1 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール、 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - [ 1 , 2  
 , 4 ] トリアゾール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール、 2 , 5 - ジ  
 ヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール、 4 , 5 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジア  
 ザール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール、 2 , 5 - ジヒドロ - [ 1 ,  
 2 , 4 ] チアジアゾール、 4 , 5 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール、 2 , 5 -  
 ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] オキサ  
 ジアゾール、 4 , 5 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール、 2 , 5 - ジヒドロ -  
 [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール、 4  
 , 5 - ジヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 3 , 4 ] オ  
 キサジアゾール、 2 , 3 - ジヒドロ - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾール、 [ 1 , 4 , 2 ] オ  
 キサチアゾール、 [ 1 , 3 , 4 ] オキサチアゾール、 1 , 3 , 5 - トリアザペルヒドロイ  
 ン、 1 , 2 , 4 - トリアザペルヒドロイン、 1 , 4 , 2 - ジチアザペルヒドロイン、 1 ,  
 4 , 2 - ジオキサアザペルヒドロイン、 1 , 3 , 5 - オキサジアザペルヒドロイン、 1 ,  
 2 , 5 - オキサジアザペルヒドロイン、 1 , 3 , 4 - チアジアザペルヒドロイン、 1 , 3  
 , 5 - チアジアザペルヒドロイン、 1 , 2 , 5 - チアジアザペルヒドロイン、 1 , 3 , 4  
 - オキサジアザペルヒドロイン、 1 , 4 , 3 - オキサチアザペルヒドロイン、 1 , 4 , 2  
 - オキサチアザペルヒドロイン、 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリダジン、 1 , 2 , 3  
 , 4 - テトラヒドロピリダジン、 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリダジン、 1 , 2 , 5  
 , 6 - テトラヒドロピリミジン、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン、 1 , 4 , 5  
 , 6 - テトラヒドロピリミジン、 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピラジン、 1 , 2 , 3 ,  
 4 - テトラヒドロピラジン、 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - [ 1 , 2 ] オキサジン、 5 , 6 -  
 ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ] オキサジン、 3 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ] オキサジ  
 ン、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ] オキサジン、 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - [ 1 ,  
 2 ] チアジン、 5 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ] チアジン、 3 , 6 - ジヒドロ - 2 H  
 - [ 1 , 2 ] チアジン、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ] チアジン、 5 , 6 - ジヒド  
 ロ - 2 H - [ 1 , 3 ] オキサジン、 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - [ 1 , 3 ] オキサジン、 3  
 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 3 ] オキサジン、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 3 ] オ  
 キサジン、 3 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 4 ] オキサジン、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H -  
 [ 1 , 4 ] オキサジン、 5 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 3 ] チアジン、 5 , 6 - ジヒド  
 ロ - 4 H - [ 1 , 3 ] チアジン、 3 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 3 ] チアジン、 3 , 4  
 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 3 ] チアジン、 3 , 6 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 4 ] チアジン  
 、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [ 1 , 4 ] チアジン、 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロ - [ 1  
 , 2 , 4 ] トリアジン、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、 1  
 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン、 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒド  
 ロ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - [ 1 , 2 , 4 ] トリア  
 ジン、 5 , 6 - ジヒドロ - [ 1 , 4 , 2 ] ジオキサジン、 5 , 6 - ジヒドロ - [ 1 , 4 ,

2 ] ジオキサジン、5, 6 - ジヒドロ - [ 1, 4, 2 ] ジチアジン、2, 3 - ジヒドロ - [ 1, 4, 2 ] ジオキサジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 4 ] オキサジアジン、3, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 4 ] オキサジアジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 5 ] オキサジアジン、3, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 5 ] オキサジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] オキサジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 4H - [ 1, 2, 5 ] オキサジアジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 4 ] チアジアジン、3, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 4 ] チアジアジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 3, 5 ] チアジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] チアジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 4H - [ 1, 2, 5 ] チアジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 3 ] オキサジアジン、3, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] オキサジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 4H - [ 1, 3, 4 ] オキサジアジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] オキサジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 3 ] チアジアジン、3, 6 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] チアジアジン、5, 6 - ジヒドロ - 4H - [ 1, 3, 4 ] チアジアジン、3, 4 - ジヒドロ - 2H - [ 1, 2, 5 ] チアジアジン、5, 6 - ジヒドロ - [ 1, 4, 3 ] オキサチアジン、5, 6 - ジヒドロ - [ 1, 4, 2 ] オキサチアジン、2, 3 - ジヒドロ - [ 1, 4, 3 ] オキサチアジン、2, 3 - ジヒドロ - [ 1, 4, 2 ] オキサチアジン、4, 5 - ジヒドロピリジン、1, 6 - ジヒドロピリジン、5, 6 - ジヒドロピリジン、2H - ピラン、2H - チイン、3, 6 - ジヒドロピリジン、2, 3 - ジヒドロピリダジン、2, 5 - ジヒドロピリダジン、4, 5 - ジヒドロピリダジン、1, 2 - ジヒドロピリダジン、2, 3 - ジヒドロピリミジン、2, 5 - ジヒドロピリミジン、5, 6 - ジヒドロピリミジン、3, 6 - ジヒドロピリミジン、4, 5 - ジヒドロピラジン、5, 6 - ジヒドロピラジン、3, 6 - ジヒドロピラジン、4, 5 - ジヒドロピラジン、1, 4 - ジヒドロピラジン、1, 4 - ジチイン、1, 4 - ジオキシン、2H - 1, 2 - オキサジン、6H - 1, 2 - オキサジン、4H - 1, 2 - オキサジン、2H - 1, 3 - オキサジン、4H - 1, 3 - オキサジン、6H - 1, 3 - オキサジン、2H - 1, 4 - オキサジン、4H - 1, 4 - オキサジン、2H - 1, 3 - チアジン、2H - 1, 4 - チアジン、4H - 1, 2 - チアジン、6H - 1, 3 - チアジン、4H - 1, 4 - チアジン、2H - 1, 2 - チアジン、6H - 1, 2 - チアジン、1, 4 - オキサチイン、2H, 5H - 1, 2, 3 - トリアジン、1H, 4H - 1, 2, 3 - トリアジン、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 3 - トリアジン、1H, 6H - 1, 2, 3 - トリアジン、1, 2 - ジヒドロ - 1, 2, 3 - トリアジン、2, 3 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - トリアジン、3H, 6H - 1, 2, 4 - トリアジン、1H, 6H - 1, 2, 4 - トリアジン、3, 4 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - トリアジン、1H, 4H - 1, 2, 4 - トリアジン、5, 6 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - トリアジン、4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - トリアジン、2H, 5H - 1, 2, 4 - トリアジン、1, 2 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - トリアジン、1H, 4H - 1, 3, 5 - トリアジン、1, 4, 2 - ジチアジン、1, 4, 2 - ジオキサジン、2H - 1, 3, 4 - オキサジアジン、2H - 1, 3, 5 - オキサジアジン、6H - 1, 2, 5 - オキサジアジン、4H - 1, 3, 4 - オキサジアジン、4H - 1, 3, 5 - オキサジアジン、4H - 1, 2, 5 - オキサジアジン、2H - 1, 3, 5 - チアジアジン、6H - 1, 2, 5 - チアジアジン、4H - 1, 3, 4 - チアジアジン、4H - 1, 3, 5 - チアジアジン、4H - 1, 2, 5 - チアジアジン、2H - 1, 3, 4 - チアジアジン、6H - 1, 3, 4 - チアジアジン、6H - 1, 3, 4 - オキサジアジンおよび 1, 4, 2 - オキサチアジンの群から選択されるヘテロ環であって、前記ヘテロ環がN、OおよびSから独立に選択される0、1または2個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5、6または7員の環と場合によっては隣接して縮合しているものであり；

R<sup>c</sup> は独立に、各場合においては、八口、C<sub>1-4</sub> アルキル、C<sub>1-3</sub> ハロアルキル、-OR<sup>a</sup> および -NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup> から選択される0、1または2個の基により置換されているフェニルであるか；あるいは

R<sup>c</sup> はN、OおよびSから独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する

飽和あるいは不飽和の5または6員のヘテロ環であって、前記環構成員の2以下はOまたはSであり、前記ヘテロ環はフェニル環と場合によっては縮合し、且つ前記ヘテロ環の炭素原子は0、1または2個のオキソ基により置換され、前記ヘテロ環または縮合フェニル環は八口、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-3}$ 八口アルキル、 $-OR^a$ および $-NR^aR^a$ から選択される0、1、2または3個の置換基により置換されるものであり；

$R^d$  は水素または  $-CH_3$  であり；

$R^e$  は独立に、各場合においては、八口、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)R^b$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(=O)R^b$ 、 $-OC(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2R^b$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^a$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(=O)R^b$ 、 $-S(=O)_2R^b$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)OR^b$ 、 $-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=O)R^b$ 、 $-N(R^a)C(=O)OR^b$ 、 $-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2R^b$ 、 $-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^a$ および $-NR^aC_{2-6}$ アルキル $OR^a$ から選択される0、1、2、3または4個の置換基により置換される $C_{1-9}$ アルキルであって；且つ前記 $C_{1-9}$ アルキルは $R^g$ から独立に選択される0または1個の基により更に置換されているものであり；

$R^f$  は独立に、各場合においては、 $R^e$  または H であり；

$R^g$  は独立に、各場合においては、OおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、N、OおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5-または6員の単環式環であって、前記環の炭素原子が0または1個のオキソ基により置換されている化合物。

【請求項2】

Xが $=C(R^2)-$ であり；Yが $=C(R^3)-$ であり；且つ $R^3$ がHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Xが $=C(R^2)-$ であり；且つYが $=N-$ である、請求項1に記載の化合物。

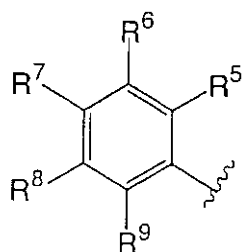
【請求項4】

Xが $=N-$ であり；且つYが $=C(R^3)-$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

$R^1$ が

【化4】



である、請求項1に記載の化合物。

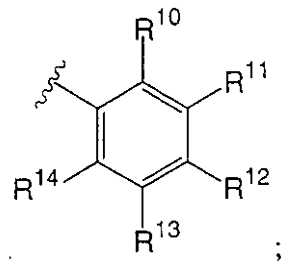
【請求項6】

$R^1$ が $R^5$ から独立に選択される1、2または3個の置換基により置換される $R^b$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

$R^4$ が

## 【化5】



であるが、どの場合にも  $R^4$  は 3, 5 - ジトリフルオロメチルフェニルまたは 3 - トリフルオロメチル - 4 - フルオロフェニル、- フェニル - ( $C_{1-8}$  アルキル)、- フェニル - O - ( $C_{1-6}$  アルキル)、- フェニル -  $NR^a R^a$  または - フェニル - N ( $R^a$ ) C (=O) ( $C_{1-8}$  アルキル) ではない、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^4$  が O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 あるいは 6 員のヘテロ環であって、O および S 原子の組み合わせが 2 以下である限り、O、N および S から選択される 0、1、2 または 3 個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の 3 または 4 個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子が  $R^e$ 、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、-  $OR^f$ 、-  $S(=O)_n R^e$ 、-  $OC_{1-4}$  ハロアルキル、-  $OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $OC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、-  $OC_{1-6}$  アルキル C (=O)  $OR^e$ 、-  $NR^a R^f$ 、-  $NR^a C_{1-4}$  ハロアルキル、-  $NR^a C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $NR^a C_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、-  $C(=O) R^e$ 、-  $C(=O) O R^e$ 、-  $OC(=O) R^e$ 、-  $C(=O) NR^a R^f$  および -  $NR^a C(=O) R^e$  から独立に選択される 0、1、2 または 3 個の置換基により置換され；且つ不飽和炭素原子が =O により更に置換されてもよく；且つ前記ヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子が H、-  $C_{1-6}$  アルキル  $OR^f$ 、 $R^e$ 、-  $C_{1-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $C_{1-3}$  アルキル C (=O)  $OR^e$ 、-  $C_{1-3}$  アルキル C (=O)  $NR^a R^f$ 、-  $C_{1-3}$  アルキル  $OC(=O) R^e$ 、-  $C_{1-3}$  アルキル  $NR^a C(=O) R^e$ 、-  $C(=O) R^c$  または -  $C_{1-3}$  アルキル  $R^c$  により置換されるものである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^5$  が独立に、各場合において、 $R^f$ 、 $R^g$ 、ハロ、ニトロ、シアノ、-  $OR^e$ 、-  $OR^g$ 、-  $OC_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $OC_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、-  $NR^a R^f$ 、-  $NR^a R^g$ 、-  $NR^f C_{2-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $NR^f C_{2-6}$  アルキル  $OR^f$ 、ナフチル、-  $CO_2 R^e$ 、-  $C(=O) R^e$ 、-  $C(=O) NR^a R^f$ 、-  $C(=O) NR^a R^g$ 、-  $NR^f C(=O) R^e$ 、-  $NR^f C(=O) R^g$ 、-  $NR^f C(=O) NR^a R^f$ 、-  $NR^f CO_2 R^e$ 、-  $C_{1-8}$  アルキル  $OR^f$ 、-  $C_{1-6}$  アルキル  $NR^a R^f$ 、-  $S(=O)_n R^e$ 、-  $S(=O)_2 NR^a R^f$ 、-  $NR^a S(=O)_2 R^e$ 、-  $OC(=O) NR^a R^f$ 、 $R^{10}$  から独立に選択される 0、1、2、あるいは 3 個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは  $R^5$  が  $R^{10}$  から独立に選択される 0、1、2、あるいは 3 個の置換基により置換されている、O、N および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の 5 あるいは 6 員のヘテロ環である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

$R^7$  が独立に、各場合において、 $C_{3-5}$  アルキルまたは  $C_{1-2}$  ハロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

$R^{10}$  および  $R^{11}$  が一緒になって O および S 原子の組み合わせが 2 以下である限り、N、O および S から選択される 1、2 または 3 個の原子を含有し、残りの原子が炭素であ

る飽和あるいは不飽和の3あるいは4個の原子の架橋であって、前記架橋が = O、R<sup>e</sup>、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)OR<sup>e</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OR<sup>f</sup>、-OC(=O)R<sup>e</sup>、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC(=O)N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup>、-SR<sup>f</sup>、-S(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup> および -NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup> から選択される0、1または2個の置換基により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> が一緒になってOおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、前記架橋が = O、R<sup>e</sup>、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)OR<sup>e</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OR<sup>f</sup>、-OC(=O)R<sup>e</sup>、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC(=O)N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup>、-SR<sup>f</sup>、-S(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup> および -NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup> から選択される0、1または2個の置換基により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項13】

R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> が一緒になってOおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3あるいは4個の原子の架橋であって、前記架橋が R<sup>e</sup>、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)OR<sup>e</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OR<sup>f</sup>、-OC(=O)R<sup>e</sup>、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC(=O)N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup>、-SR<sup>f</sup>、-S(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)OR<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup> および -NR<sup>f</sup>C<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup> から選択される1または2個の置換基により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> が一緒になってOおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3あるいは4個の原子の架橋であって、前記架橋が = O、R<sup>e</sup>、ハロ、シアノ、ニトロ、-C(=O)R<sup>e</sup>、-C(=O)OR<sup>e</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-C(=NR<sup>a</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OR<sup>f</sup>、-OC(=O)R<sup>e</sup>、-OC(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC(=O)N(R<sup>f</sup>)S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルNR<sup>a</sup>R<sup>f</sup>、-OC<sub>2-6</sub>アルキルOR<sup>f</sup>、-SR<sup>f</sup>、-S(=O)R<sup>e</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>e</sup>、-

$S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ および $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ から選択される0、1または2個の置換基により置換されているものであり；ここで、 $R^3$ が $NH_2$ である場合には、 $-R^{11}$  -  $R^{12}$ は $-C=C=N$  - またはこれらのいかなる置換物でもない、請求項1に記載の化合物。

【請求項15】

$R^{11}$ および $R^{12}$ が一緒になってOおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、前記架橋が $=O$ 、 $R^e$ 、ハロ、シアノ、ニトロ、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-C(=O)NR^aR^f$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-OR^f$ 、 $-OC(=O)R^e$ 、 $-OC(=O)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2R^e$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ および $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ から選択される0、1または2個の置換基により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項16】

$R^{11}$ および $R^{12}$ が一緒になってN、OおよびSから選択される1または2個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、前記架橋が $R^e$ 、 $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-C(=O)NR^aR^f$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-OR^f$ 、 $-OC(=O)R^e$ 、 $-OC(=O)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2R^e$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ または $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項17】

$R^{11}$ および $R^{12}$ が一緒になってO、NおよびSから選択される1または2個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、前記架橋が $-C(=O)R^e$ 、 $-C(=O)OR^e$ 、 $-C(=O)NR^aR^f$ 、 $-C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)NR^aR^f$ 、 $-OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ 、 $-OC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ 、 $-SR^f$ 、 $-S(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2R^e$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=O)R^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)OR^e$ 、 $-N(R^f)C(=O)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$ 、 $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $NR^aR^f$ または $-NR^fC_{2-6}$ アルキル $OR^f$ により置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

- ( 1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - インダゾール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - インドール - 4 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - インドール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - インドール - 6 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 H - インドール - 7 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 1 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - ( 6 - フェニルピリミジン - 4 - イル ) アミン ;
- ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 , 3 - ジメチル - 1 H - インドール - 7 - イル ) - [ 6 - ( 4 - ( トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ) アミン ;
- ( 2 - クロロピリジン - 3 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 - クロロキノリン - 7 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 - クロロキノリン - 8 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 - メトキシキノリン - 7 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - アミン ;
- ( 2 - メチルアミノキノリン - 7 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン二塩酸塩 ;
- ( 2 - メチルベンゾチアゾール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 2 R ) - { 6 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] - 2 H , 3 H - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 2 - イル } メタノール ;
- ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 3 - クロロ - 2 - メチルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 3 H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 3 - メタンシルホニルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 3 - メチルベンゾ [ d ] イソチアゾール - 5 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;

- ( 3 - メチルスルファニルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 4 - クロロフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ [ 1 , 8 ] ナフチリジン - 2 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ( 6 - メトキシピリジン - 3 - イル ) - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- [ ( 2 - モルホリン - 4 - イル ) キノリン - 7 - イル ] - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン 塩酸塩 ;
- [ 2 - アミノ - 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) アミン 塩酸塩 ;
- [ 5 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) - 6 - フェニル - ピリダジン - 3 - イル ] - ( 1 H - インドール - 5 - イル ) - アミン ;
- [ 5 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) - 6 - フェニルピリダジン - 3 - イル ] - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 2 - アミノ - 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] ベンゾチアゾール - 6 - イルアミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) - 2 - クロロピリミジン - 4 - イル ] - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ] - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 1 H - インドール - 4 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 1 H - インドール - 5 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - ( 3 - メトキシフェニル ) アミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] ナフトレン - 1 - イルアミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] フェニルアミン ;
- [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニルピリミジン - 4 - イル ) キノリン - 3 - イルアミン ;
- { 1 ' - アセチルスピロ [ シクロプロパン - 1 , 3 ' - インドリン - 6 ' - イル ] } - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) - ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- { 7 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] - 1 H - インドール - 2 - イル } メタノール ;
- { スピロ [ シクロプロパン - 1 , 3 ' - インドリン - 6 ' - イル ] } - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- 1 - { 3 , 3 - ジメチル - 6 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] - 2 , 3 - ジヒドロインドール - 1 - イル } エタノン ;
- 2 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] キノリン - 8 - オール ;

- 2 - { 5 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ]  
ピリジン - 2 - イルオキシ } エタノール ;
- 3 , 4 - ジヒドロ - 7 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 -  
イルアミノ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン ;
- 4 - メチル - 7 - { [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル  
] アミノ } キノリン - 2 - オール , ヒドロクロリド ;
- 6 - [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] - 3 , 4 - ジヒ  
ドロ - 2 H - ナフタレン - 1 - オン ;
- 7 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] キノリ  
ン - 2 - オール ;
- 7 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ] - 1 ,  
3 - ジヒドロインドール - 2 - オン ;
- ベンゾチアゾール - 5 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン  
- 4 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 5 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) - 6 - フェニルピリ  
ダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 5 , 6 - ビス - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル )  
ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ( 2 - シクロヘキシルメチルアミノ - 4 - トリフ  
ルオロメチルフェニル ) - ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ( 2 - ナフチル ) - 5 - ( 4 - トリフルオロメチ  
ルフェニル ) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 5 - ( 4 - トリフル  
オロメチルフェニル ) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イ  
ル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン  
- 4 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - クロロ - 5 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル  
) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - フェニル - 5 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニ  
ル ) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ピリジン - 3 - イル - 5 - ( 4 - トリフルオロメ  
チルフェニル ) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- ベンゾチアゾール - 6 - イル - [ 6 - ピリジン - 4 - イル - 5 - ( 4 - トリフルオロメ  
チルフェニル ) ピリダジン - 3 - イル ] アミン ;
- N - { 4 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ]  
- 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル } アセトアミド ;
- N - { 4 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ]  
ベンゾチアゾール - 2 - イル } アセトアミド ;
- N - { 4 - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イルアミノ ]  
フェニル } アセトアミド ;
- N<sup>4</sup> - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] - 1 H - ベ  
ンゾイミダゾール - 2 , 4 - ジアミン ;
- N<sup>4</sup> - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] ベンゾチア  
ゾール - 2 , 4 - ジアミン ;
- N<sup>4</sup> - ベンゾチアゾール - 6 - イル - 6 - ( 4 - t - ブチルフェニル ) ピリミジン - 2  
 , 4 - ジアミン 塩酸塩 ;
- N<sup>7</sup> - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] キノリン -  
2 , 7 - ジアミン ;

N<sup>8</sup> - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] キノリン - 2 , 8 - ジアミン ;  
ナフタレン - 1 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
ナフタレン - 2 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
o - トリル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
フェニル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
p - トリル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
キノリン - 3 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
キノリン - 5 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
キノリン - 6 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ;  
キノリン - 8 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン ; および  
キノリル - 7 - イル - [ 6 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) ピリミジン - 4 - イル ] アミン

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

請求項 1、2 または 3 のいずれか一項に記載の化合物および医薬的に許容できる希釈剤あるいはキャリアを含む医薬組成物。

【請求項 20】

請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物の医薬としての使用。

【請求項 21】

急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リウマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を含む皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続性痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性の領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療するための医薬の製造における、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 22】

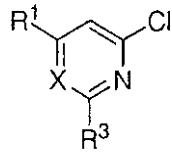
急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、並びに交感神経性持続性痛みを治療するための医薬の製造における、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 23】

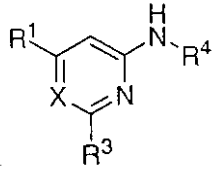
急性、炎症性および神経因性の痛みを治療するための医薬の製造における、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 24】

【化6】

と  $R^4NH_2$  とを反応させて、

【化7】



を形成する工程を含む、請求項1に記載の化合物を製造する方法。