(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-518048
(P2025-518048A)
(43)公表日　令和7年6月12日(2025.6.12)

(51)国際特許分類		FI			テーマコード（参考）
C07D 231/56	*(2006.01)*	C07D	231/56	C	4C086
C07D 417/14	*(2006.01)*	C07D	417/14	CSP	
C07D 403/12	*(2006.01)*	C07D	403/12		
C07D 401/14	*(2006.01)*	C07D	401/14		
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248頁）　最終頁に続く

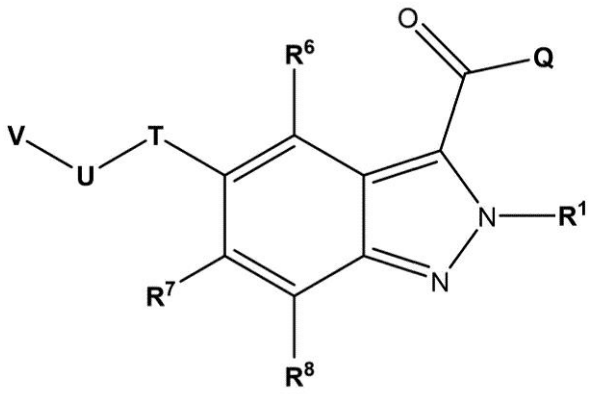
(21)出願番号　特願2024-569518(P2024-569518)
(86)(22)出願日　令和5年5月25日(2023.5.25)
(85)翻訳文提出日　令和7年1月21日(2025.1.21)
(86)国際出願番号　PCT/US2023/067443
(87)国際公開番号　WO2023/230540
(87)国際公開日　令和5年11月30日(2023.11.30)
(31)優先権主張番号　63/345,458
(32)優先日　令和4年5月25日(2022.5.25)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),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インダゾール誘導体

(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である化合物に関する。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、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体であって、
【化１】



（Ｉ）

式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、
R^2が、$-R^Y$を表し、
R^3が、－ＯＨ又は$-R^Y$を表し、
R^4が、$-R^Y$又は$-S(=O)_2R^Y$を表すか、
あるいはR^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-CR^5R^{5'}-$を表すか、又はＴが、$-CR^5R^{5'}-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^Y$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、
Ｖが、飽和又は不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、C_1-C_6アルキル又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-CF_3$、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換又は多置換されており、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－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、前記３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、

Ｒ^{Y}及びＲ^{Z}が、互いに独立して、いずれの場合も独立して、

－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、前記３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は

非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、前記５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表すか、

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

ここで、「一置換若しくは多置換」は、いずれの場合も独立して、－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－Ｏ－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－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、－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）、－Ｎ（３～１４員シクロアルキル）（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｈ）－Ｃ１－６－アルキレン－ＯＨ、－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（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－Ｏ－Ｃ１－６－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｃ１－６－アルキレン－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－６－アルキル）－Ｓ（＝Ｏ）２－ＮＨ（Ｃ１－６－アルキル）、－Ｃ１－６－アルキレン－

Ｎ（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、－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ていることを意味する、化合物、その立体異性体形態、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】

Ｒ^{3}が、－Ｈを表す、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

Ｒ^{4}が、－Ｈ以外の残基を表す、請求項２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ^{1}が、－メチル又はエチルを表す、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$－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６】

Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$の各々を表す前記Ｒ^{Y}が、Ｈである、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項７】

Ｖが、（ｉ）ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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る５～１４員ヘテロアリールであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－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－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＨＦ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン

－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－シクロプロピル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－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）$_2$、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－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、－アゼチジン、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン、若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換若しくは多置換されており、特に、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－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－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－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）$_2$、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－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、－アゼチジン、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている５～１４員ヘテロアリールを表すか、又は（ｉｉ）非置換の、一置換若しくは多置換の－オキセタニルを表す、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項８】

Ｖの定義内の前記飽和又は不飽和３～１４員シクロアルキルが、非縮合若しくは非架橋、縮合、又は架橋シクロアルキルを含む、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、シクロノニル、又はシクロデシルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項９】

Ｖの定義内の前記５～１４員アリールが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、フェニル又はその他の５～１４員アリールである、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１０】

Ｖの定義内の前記３～１４員ヘテロシクロアルキルが、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、イソオキサリジン（ｉｓｏｘａｌｉｄｉｎｅ）、モルホリン、オキサゾリジン、オキサン、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、

＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

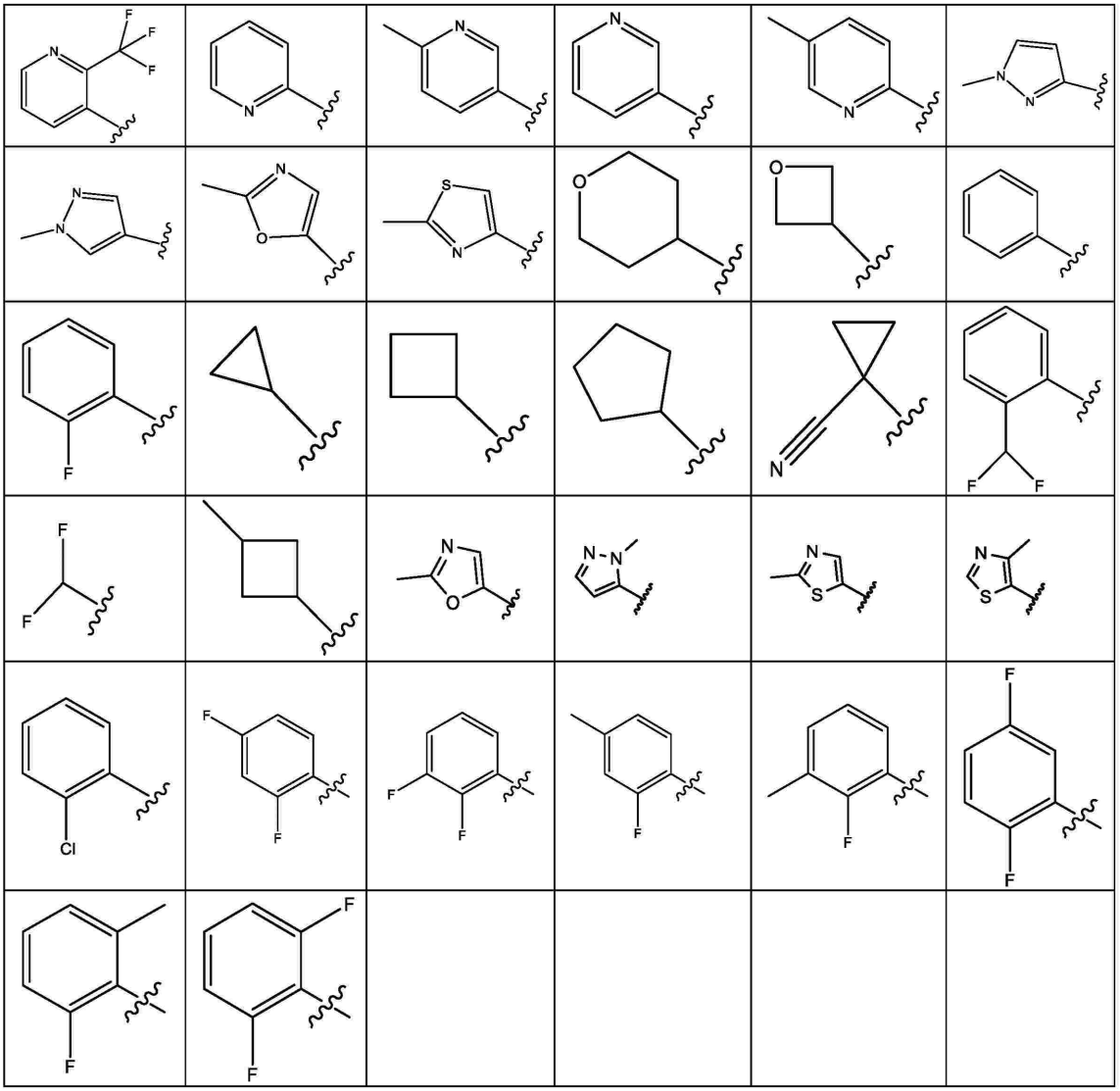
【請求項１１】

Ｖが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されているＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキル又はＣ$_1$－Ｃ$_6$ヘテロアルキルを表す、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１２】

Ｖが、以下からなる群から選択される残基である、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【化２】



【請求項１３】

Ｒ^{1}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－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に記載の化合物。

【請求項１４】

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

【請求項１５】

Ｒ^{4}が、

－Ｈ；

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

飽和、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）；

飽和、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）；

非置換の、一置換、若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）；

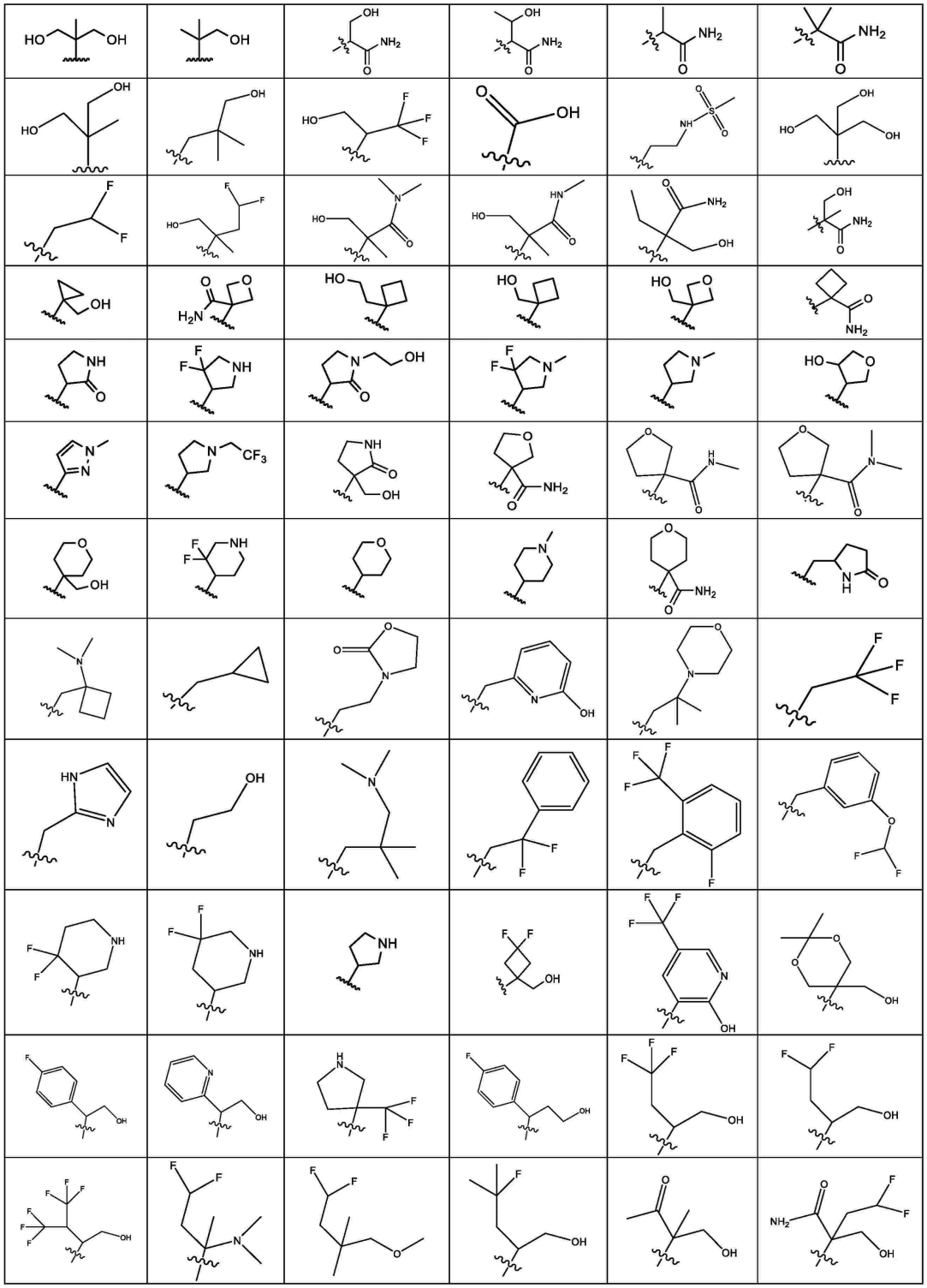
各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、－フェニル、若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル；又は

各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）を表す、請求項１～１４のいずれか一項に記載の化合物。

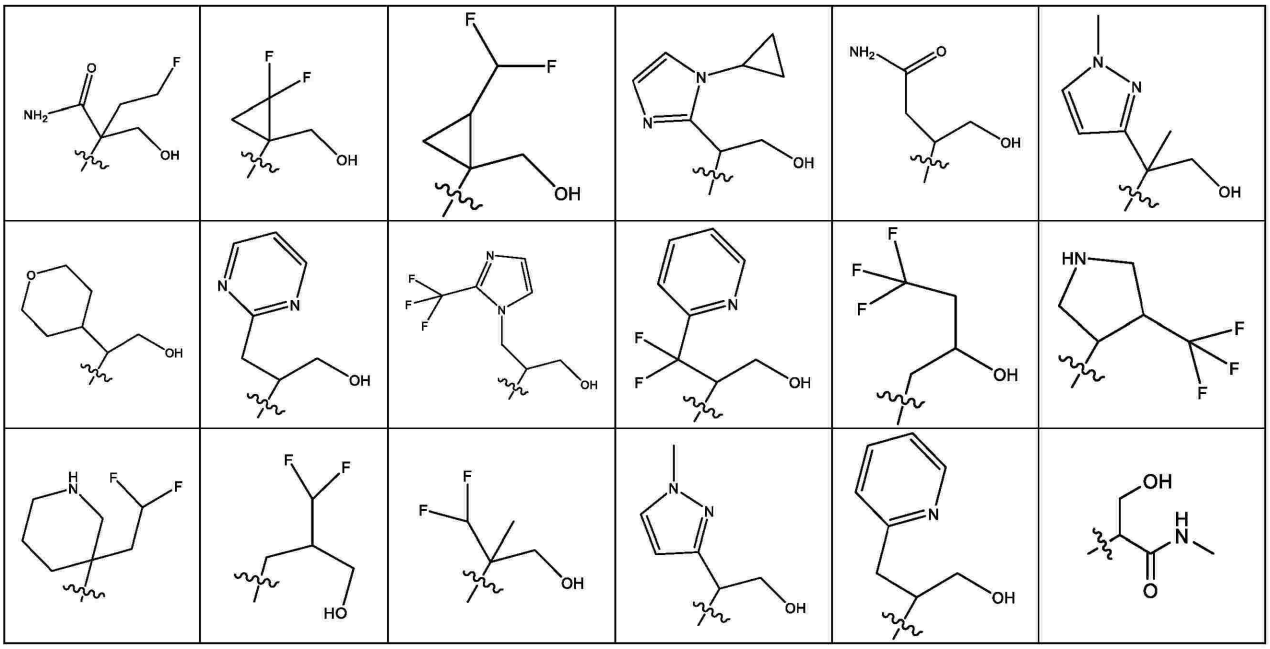
【請求項１６】

Ｒ^{4}が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル（好ましくは３、４、５又は６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、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは４、５又は６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、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル；又は非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール（好ましくは６員アリール）であって、前記６～１４員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、６～１４員アリール；又は非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール（好ましくは５若しくは６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、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表す、請求項１～１４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１７】
Ｒ^{3}が、Ｈであり、Ｒ^{4}が、以下からなる群から選択される残基である、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物。
【化３－１】



【化３－２】



【請求項１８】

Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－非置換ピリジル、及び、非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１９】

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、前記３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキルを表す、請求項１に記載の化合物。

【請求項２０】

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、若しくは互いに独立して、－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た－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル；

非置換、若しくは互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｓ

Ｈ、＝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た－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$；

非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；

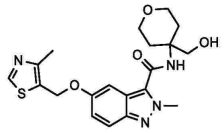
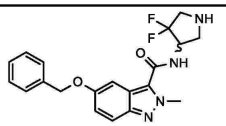
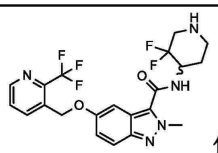
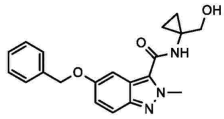
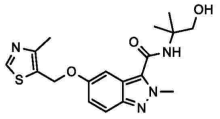
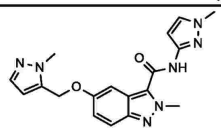
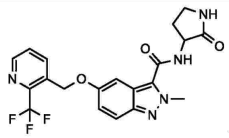
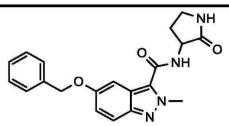
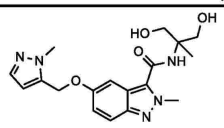
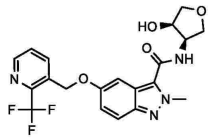
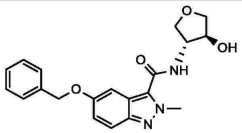
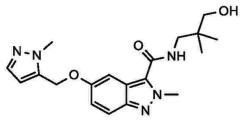
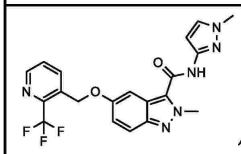
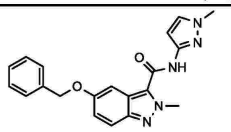
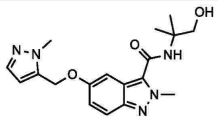
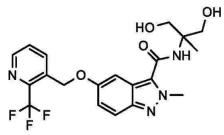
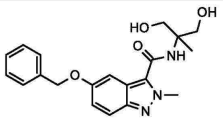
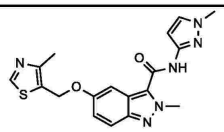
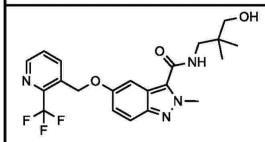
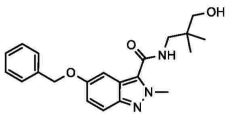
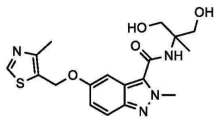
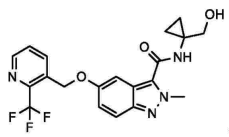
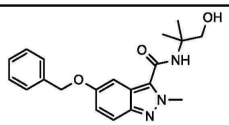
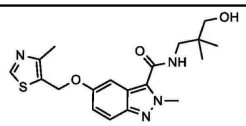
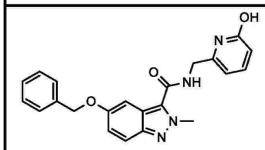
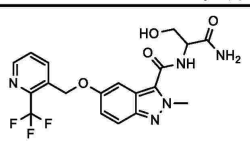
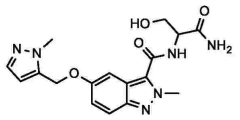
非置換、若しくは互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換された－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；又は

非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、請求項１～１９のいずれか一項に記載の化合物。

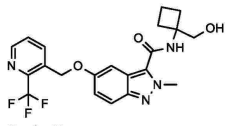
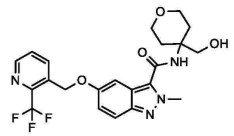
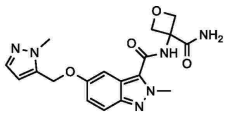
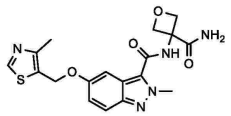
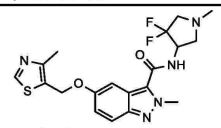
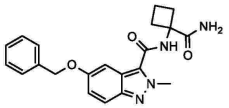
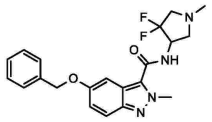
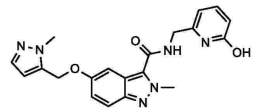
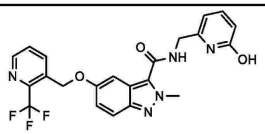
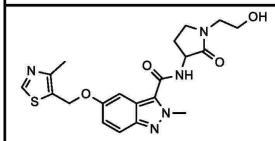
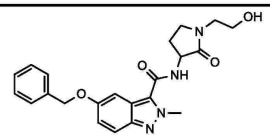
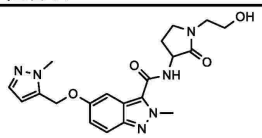
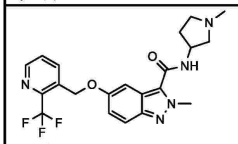
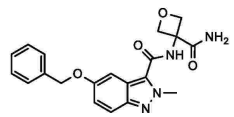
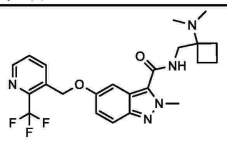
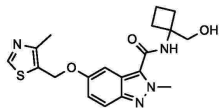
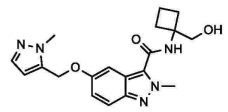
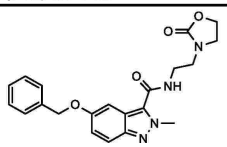
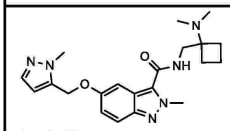
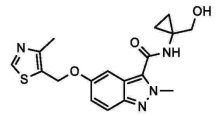
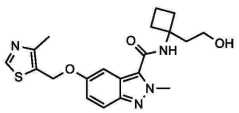
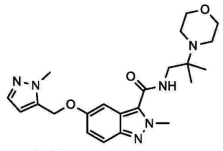
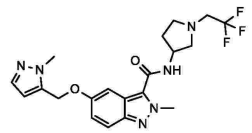
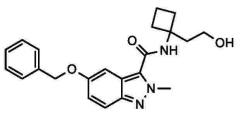
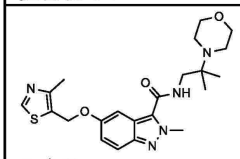
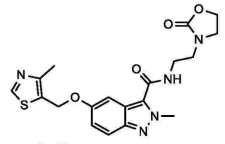
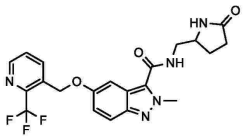
【請求項２１】

以下の表に示される、化合物００１～１９９からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

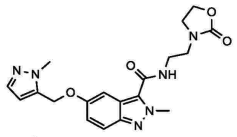
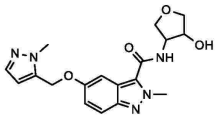
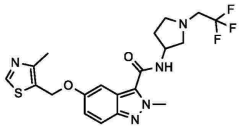
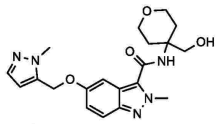
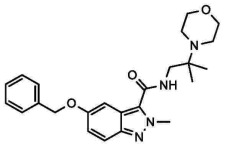
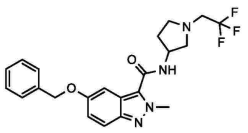
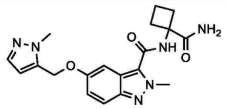
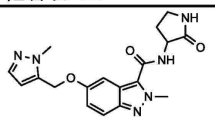
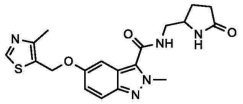
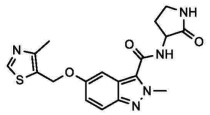
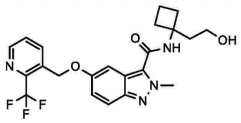
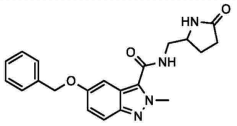
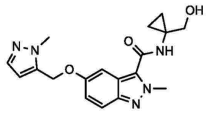
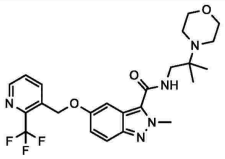
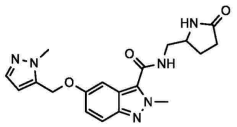
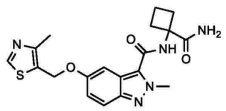
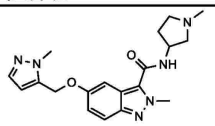
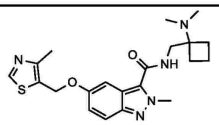
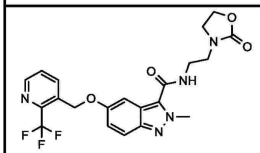
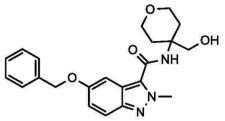
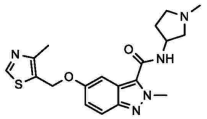
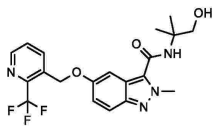
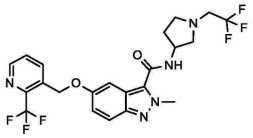
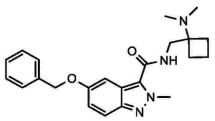
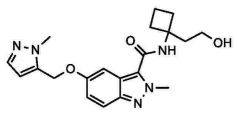
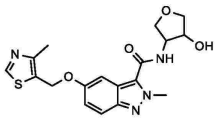
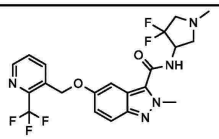
【化４－１】

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

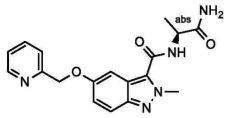
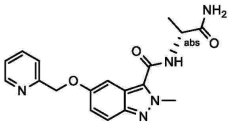
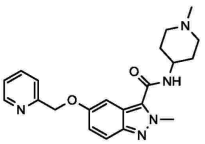
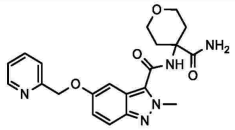
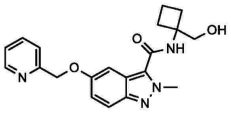
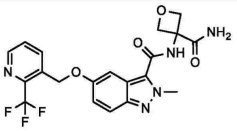
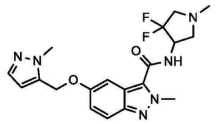
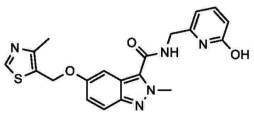
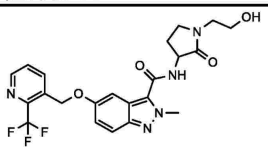
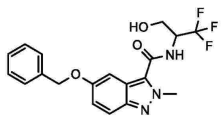
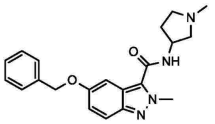
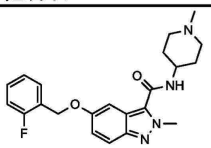
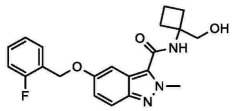
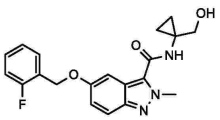
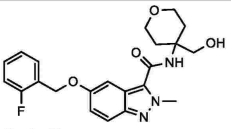
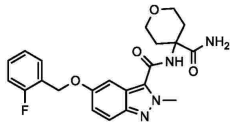
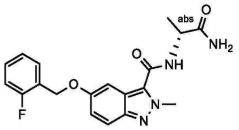
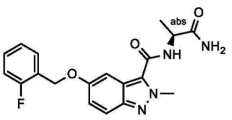
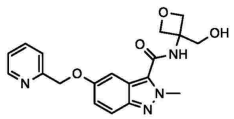
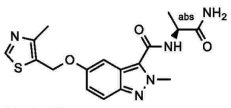
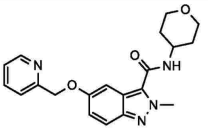
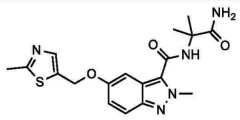
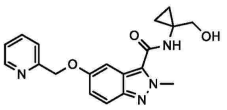
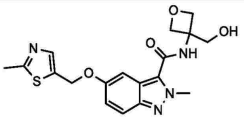
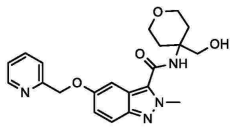
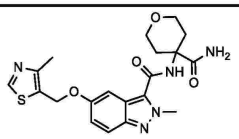
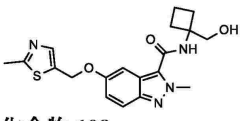
【化４－２】

 化合物 028	 化合物 029	 化合物 030
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036
 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042
 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045
 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048
 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051
 化合物 052	 化合物 053	 化合物 054

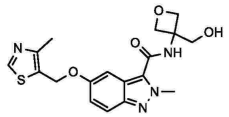
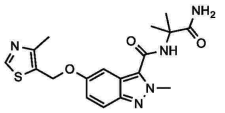
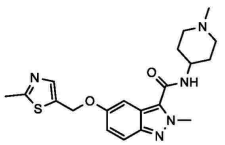
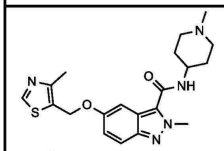
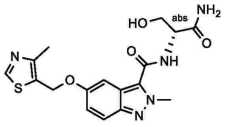
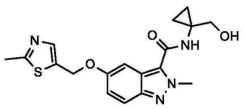
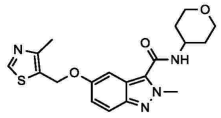
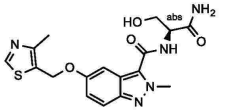
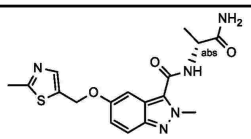
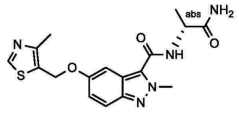
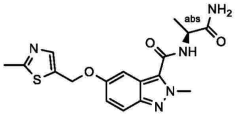
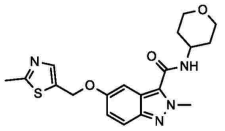
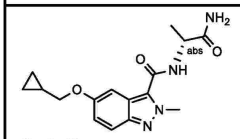
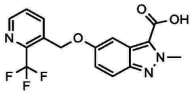
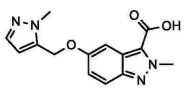
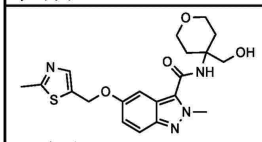
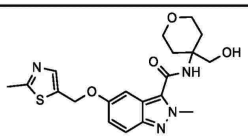
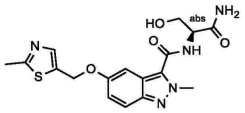
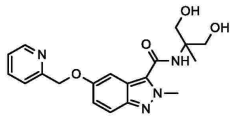
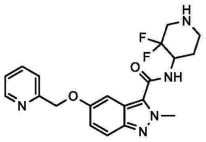
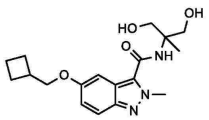
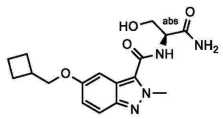
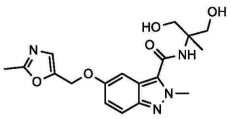
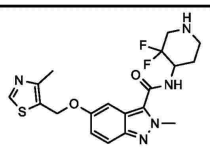
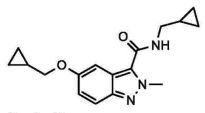
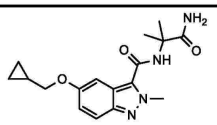
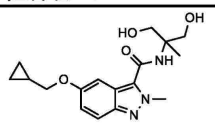
【化４－３】

 化合物 055	 化合物 056	 化合物 057
 化合物 058	 化合物 059	 化合物 060
 化合物 061	 化合物 062	 化合物 063
 化合物 064	 化合物 065	 化合物 066
 化合物 067	 化合物 068	 化合物 069
 化合物 070	 化合物 071	 化合物 072
 化合物 073	 化合物 074	 化合物 075
 化合物 076	 化合物 077	 化合物 078
 化合物 079	 化合物 080	 化合物 081

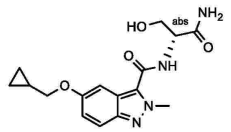
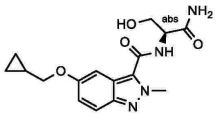
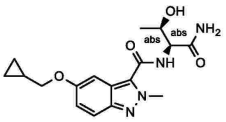
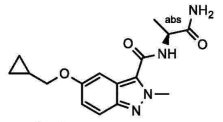
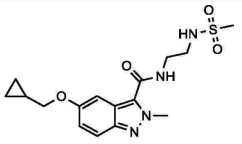
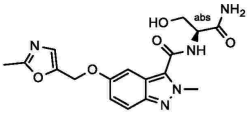
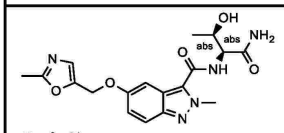
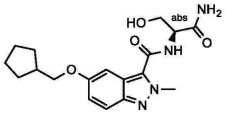
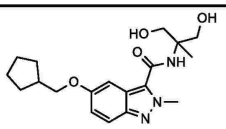
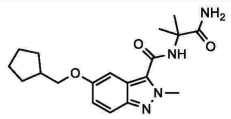
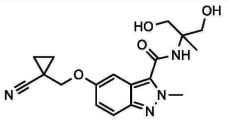
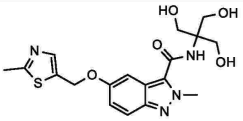
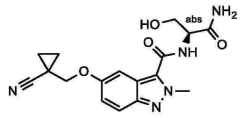
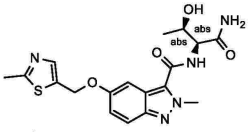
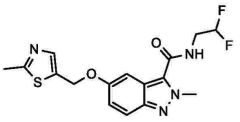
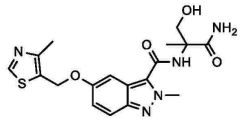
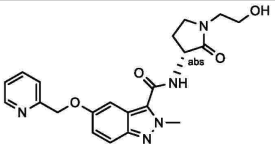
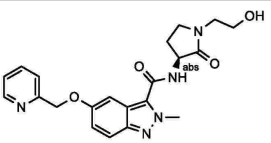
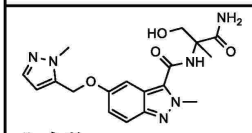
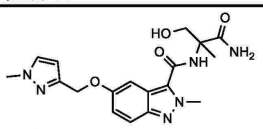
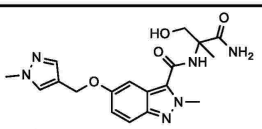
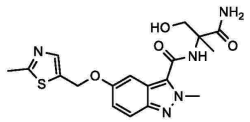
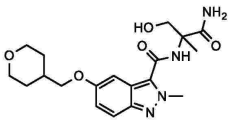
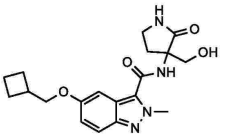
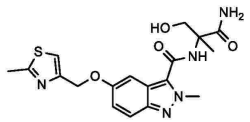
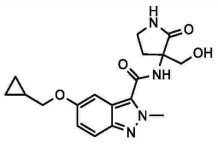
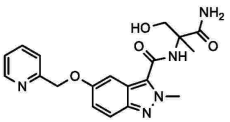
【化４－４】

 化合物 082	 化合物 083	 化合物 084
 化合物 085	 化合物 086	 化合物 087
 化合物 088	 化合物 089	 化合物 090
 化合物 091	 化合物 092	 化合物 093
 化合物 094	 化合物 095	 化合物 096
 化合物 097	 化合物 098	 化合物 099
 化合物 100	 化合物 101	 化合物 102
 化合物 103	 化合物 104	 化合物 105
 化合物 106	 化合物 107	 化合物 108

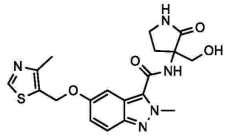
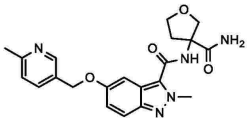
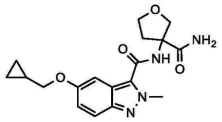
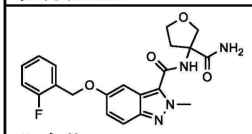
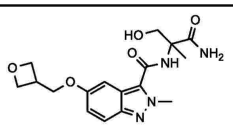
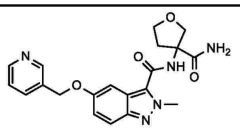
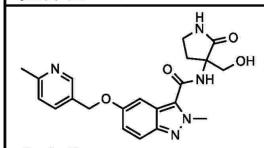
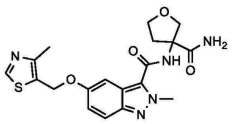
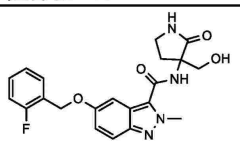
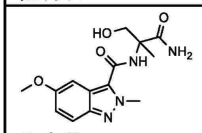
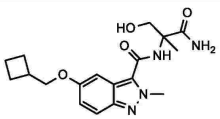
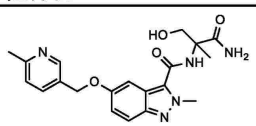
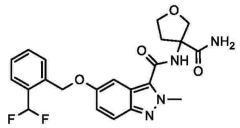
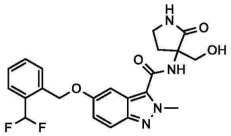
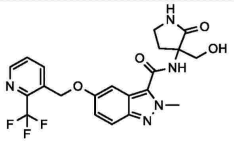
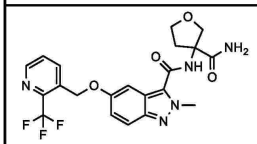
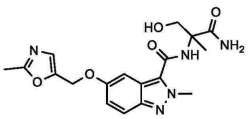
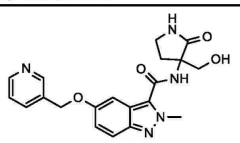
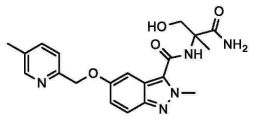
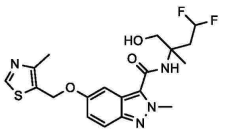
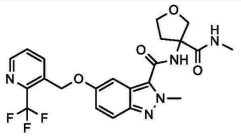
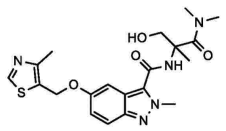
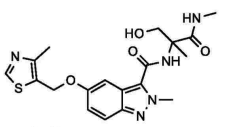
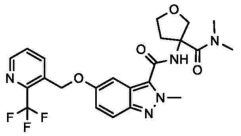
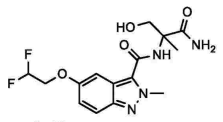
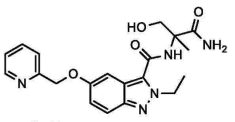
【化４－５】

 化合物 109	 化合物 110	 化合物 111
 化合物 112	 化合物 113	 化合物 114
 化合物 115	 化合物 116	 化合物 117
 化合物 118	 化合物 119	 化合物 120
 化合物 121	 化合物 122	 化合物 123
 化合物 124	 化合物 125	 化合物 126
 化合物 127	 化合物 128	 化合物 129
 化合物 130	 化合物 131	 化合物 132
 化合物 133	 化合物 134	 化合物 135

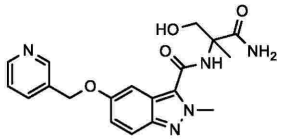
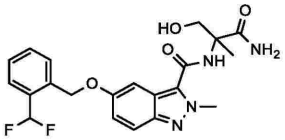
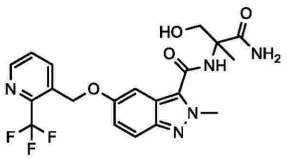
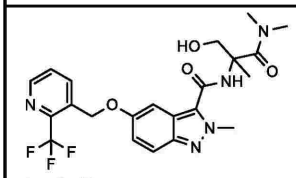
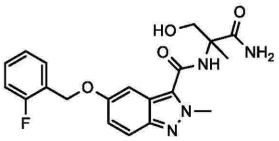
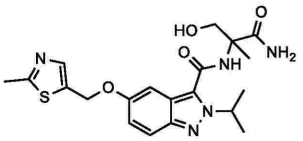
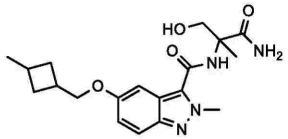
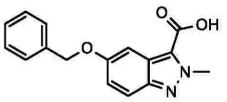
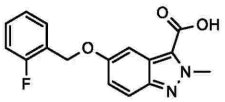
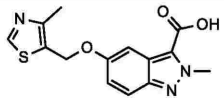
【化４－６】

 化合物 136	 化合物 137	 化合物 138
 化合物 139	 化合物 140	 化合物 141
 化合物 142	 化合物 143	 化合物 144
 化合物 145	 化合物 146	 化合物 147
 化合物 148	 化合物 149	 化合物 150
 化合物 151	 化合物 152	 化合物 153
 化合物 154	 化合物 155	 化合物 156
 化合物 157	 化合物 158	 化合物 159
 化合物 160	 化合物 161	 化合物 162

【化４－７】

 化合物 163	 化合物 164	 化合物 165
 化合物 166	 化合物 167	 化合物 168
 化合物 169	 化合物 170	 化合物 171
 化合物 172	 化合物 173	 化合物 174
 化合物 175	 化合物 176	 化合物 177
 化合物 178	 化合物 179	 化合物 180
 化合物 181	 化合物 182	 化合物 183
 化合物 184	 化合物 185	 化合物 186
 化合物 187	 化合物 188	 化合物 189

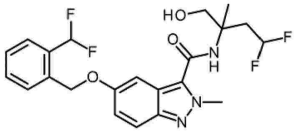
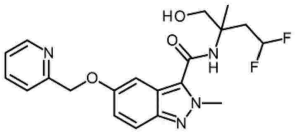
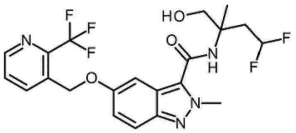
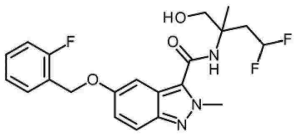
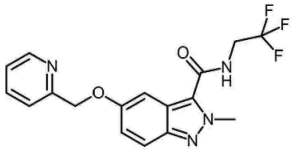
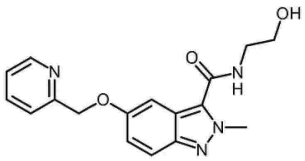
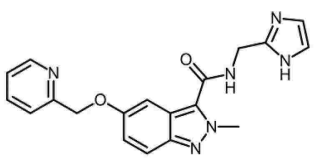
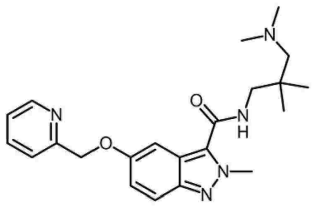
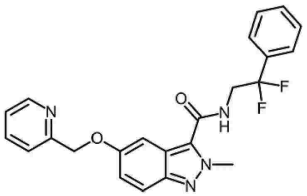
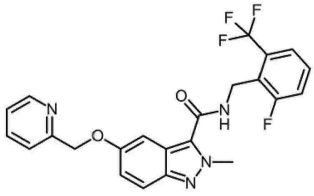
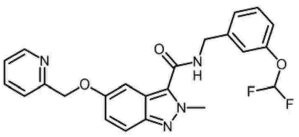
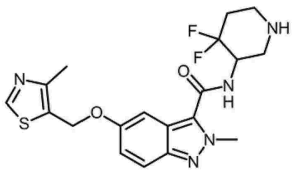
【化４－８】

 化合物 190	 化合物 191	 化合物 192
 化合物 193	 化合物 194	 化合物 195
 化合物 196	 化合物 197	 化合物 198
 化合物 199		

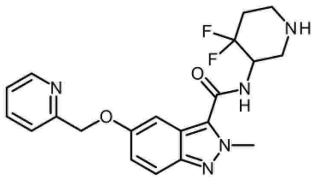
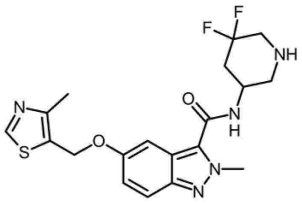
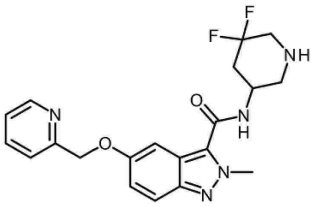
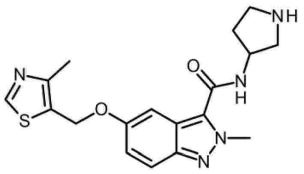
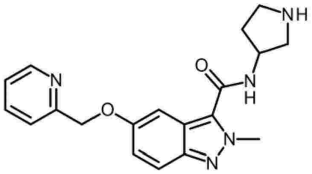
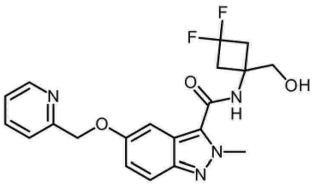
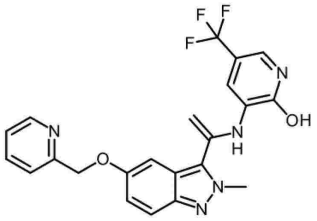
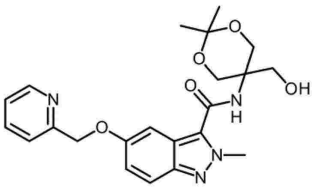
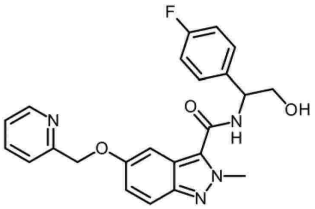
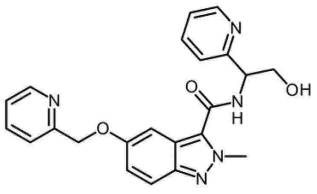
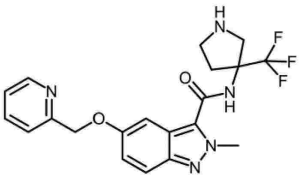
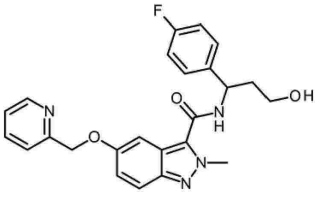
【請求項２２】

以下の表に示される化合物２００～２６２からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物。

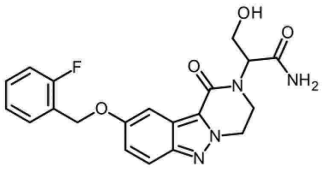
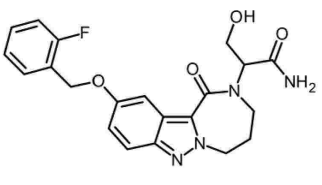
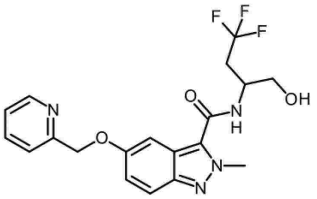
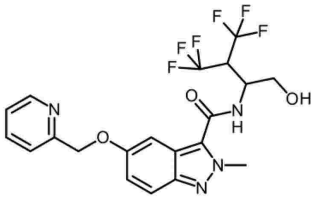
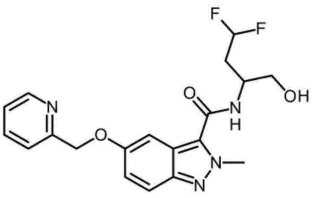
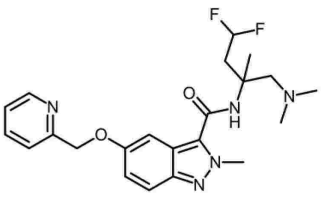
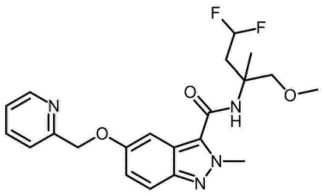
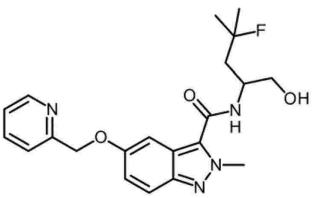
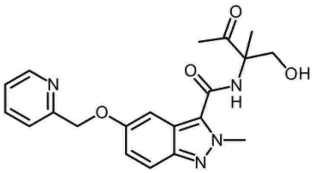
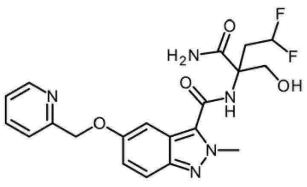
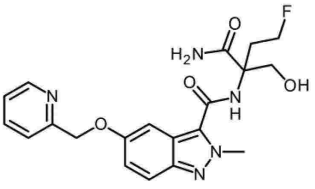
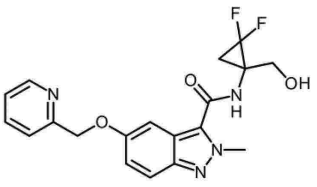
【化５－１】

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 200**	 **化合物 201**	 **化合物 202**
 **化合物 203**	 **化合物 204**	 **化合物 205**
 **化合物 206**	 **化合物 207**	 **化合物 208**
 **化合物 209**	 **化合物 210**	 **化合物 211**

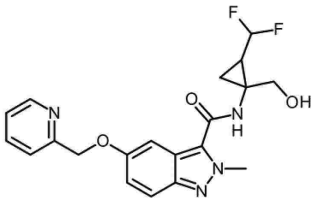
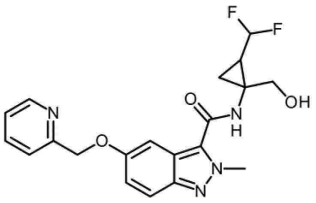
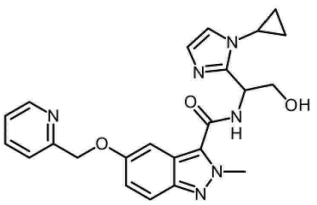
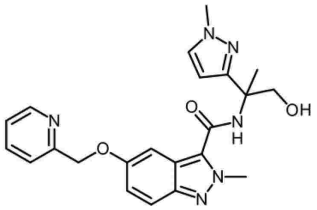
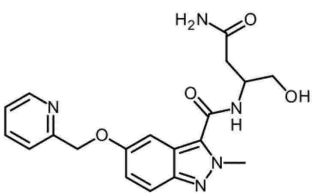
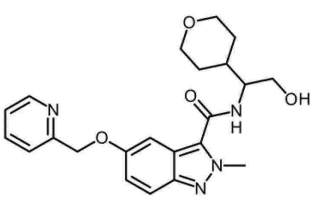
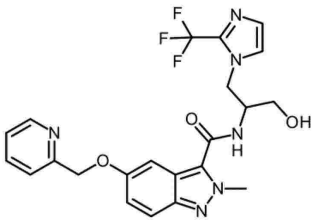
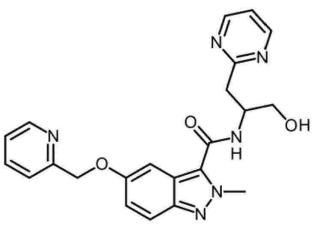
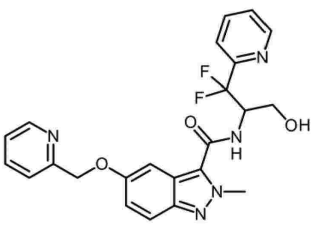
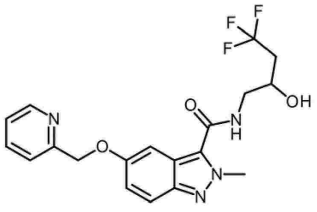
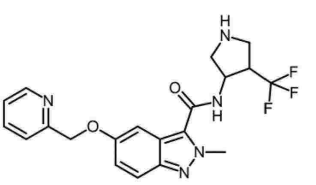
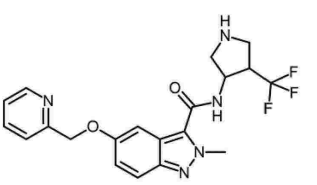
【化５－２】

 化合物 212	 化合物 213	 化合物 214
 化合物 215	 化合物 216	 化合物 217
 化合物 218	 化合物 219	 化合物 220
 化合物 221	 化合物 222	 化合物 223

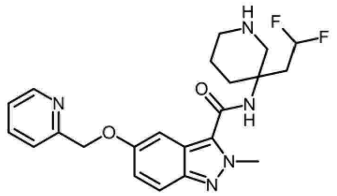
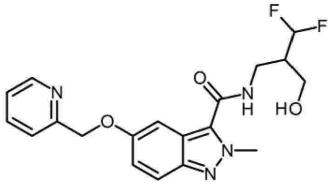
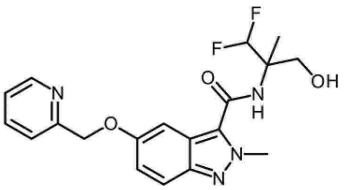
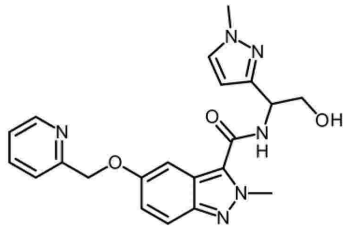
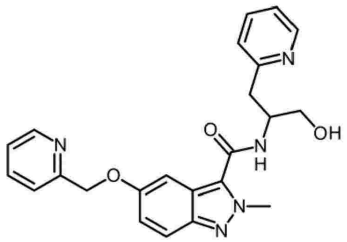
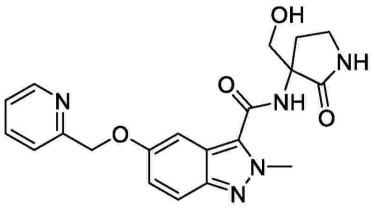
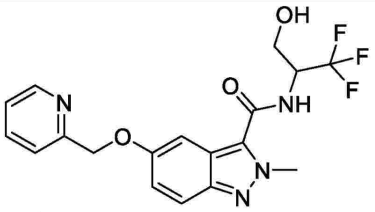
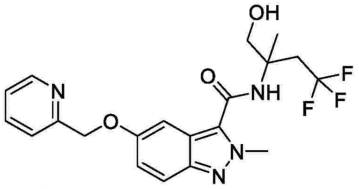
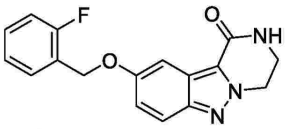
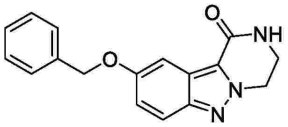
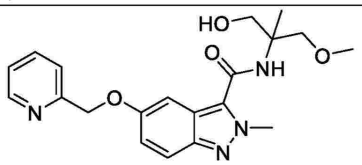
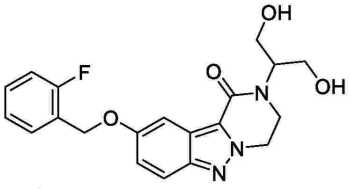
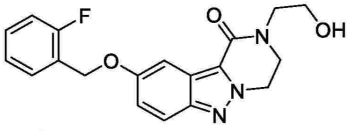
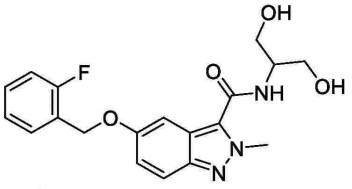
【化５－３】

 化合物 224	 化合物 225	 化合物 226
 化合物 227	 化合物 228	 化合物 229
 化合物 230	 化合物 231	 化合物 232
 化合物 233	 化合物 234	 化合物 235

【化５－４】

 化合物 236(トランス異性体)	 化合物 237(シス異性体)	 化合物 238
 化合物 239	 化合物 240	 化合物 241
 化合物 242	 化合物 243	 化合物 244
 化合物 245	 化合物 246(トランス異性体)	 化合物 247(シス異性体)

【化５－５】

 化合物 248	 化合物 249	 化合物 250
 化合物 251	 化合物 252	 化合物 253
 化合物 254	 化合物 255	 化合物 256
 化合物 257	 化合物 258	 化合物 259
 化合物 260	 化合物 261	 化合物 262

【請求項２３】

請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項２４】

疼痛の治療に使用するための、請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項２３に記載の医薬組成物。

【請求項２５】

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、好ましくは術後疼痛から選択される、請求項２４に記載の疼痛の治療に使用するための化合物又は医薬組成物。

【請求項２６】
疼痛を治療する方法であって、請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物、又は請求項２３～２５のいずれか一項に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法。
【請求項２７】
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、好ましくは術後疼痛から選択される、請求項２６に記載の方法。
【請求項２８】
てんかんの治療で使用するための、請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物又は請求項２３に記載の医薬組成物。
【請求項２９】
てんかんを治療する方法であって、請求項１～２２のいずれか一項に記載の化合物又は請求項２３に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法。
【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、炎症性過敏症、及びてんかんから選択される障害の予防又は治療に有用である化合物に関する。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られ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及び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。特に、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、短体幹症（ｂｒａｃｈｙｏｌｍｉａ）、二次性低カルシウム血症を伴う低マグネシウム血症、多発性嚢胞腎、ムコリピドーシスＩＶ型、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、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。ＴＲ

ＰＭ３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、最近では、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が示された。したがって、ＴＲＰＭ３アンタゴニストは、炎症性疼痛などの疼痛に対抗するための鎮痛剤として使用され得る（Ｖｒｉｅｎｓ　Ｊ．ｅｔ　ａｌ．Ｎｅｕｒｏｎ，Ｍａｙ　２０１１）。ＴＲＰＭ３とてんかんとの間の関係も確立されている（例えば、Ｅｕｒ　Ｊ　Ｈｕｍ　Ｇｅｎｅｔ．２０１９　Ｏｃｔ；２７（１０）：１６１１－１６１８；Ｅｌｉｆｅ　２０２０　Ｍａｙ　１９；９：ｅ５７１９０．ｄｏｉ：１０．７５５４／ｅＬｉｆｅ．５７１９０．ＤＯＩ：１０．７５５４／ｅＬｉｆｅ．５７１９０；Ｃｈａｎｎｅｌｓ（Ａｕｓｔｉｎ）．２０２１；１５（１）：３８６－３９７を参照されたい。したがって、ＴＲＰＭ３はまた、てんかんの治療のための潜在的な標的である。

【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、推定ＴＲＰＭ３遮断薬であるリクイリチゲニンは、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）。ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための、より具体的には炎症性疼痛などの疼痛及びてんかんのための新規の、代替の、かつ／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。ある特定のタイプの疼痛に対する良好な効力を有し、副作用が低レベル若しくは無く（オピエートのような依存の可能性がなく、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薬物力学特性を有する治療法が強く求められている。

【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】

本発明は、インダゾール誘導体、及びそのようなインダゾール誘導体を含む医薬組成物を提供する。本発明はまた、医薬として使用するための、より具体的には、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、疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんの予防及び／若しくは治療における使用のための、かつ／又は疼痛及び／若しくは炎症性過敏症に対抗するための及び／若しくはてんかんに対抗するための、インダゾール誘導体を提供する。

【０００９】

本発明はまた、ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／若しくは治療のための、特に疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんの予防及び／若しくは治療のための、かつ／又は疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんに対抗するための医薬組成物若しくは医薬の製造のためのインダゾール誘導体の使用を提供する。

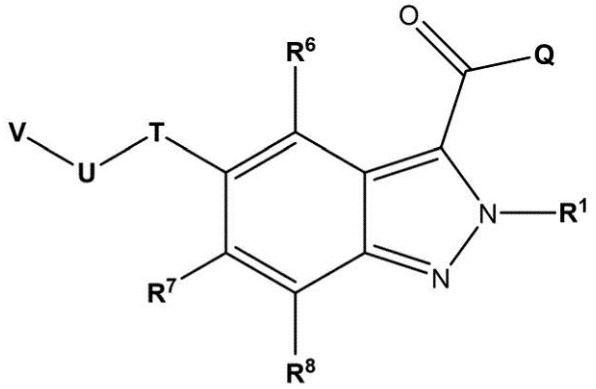
【００１０】

本発明はまた、本発明によるインダゾール誘導体を、それを必要とする対象に投与することによる、ＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療のための方法を提供する。より具体的には、本発明は、疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんの予防及び／若しくは治療のための、かつ／又は疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんに対抗するためのそのような方法に関する。

【００１１】

本発明は更に、本発明のインダゾール誘導体の調製方法を提供する。

【発明を実施するための形態】
【００１２】
本発明を更に説明し、場合によっては特定の実施形態に関して説明するが、本発明はそれらに限定されるものではない。
【００１３】
本発明の第１の態様は、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体の提供であり、
【化１】



（Ｉ）

任意選択的に、疼痛若しくはてんかんの治療に使用するための又は疼痛若しくはてんかんの治療方法で使用するためのものであり、
式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、
R^2が、$-R^Y$を表し、
R^3が、－ＯＨ又は$-R^Y$を表し、
R^4が、$-R^Y$又は$-S(=O)_2R^Y$を表すか、
あるいはR^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-CR^5R^{5'}-$を表すか、又はＴが、$-CR^5R^{5'}-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^Y$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、
Ｖが、飽和又は不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、C_1－C_6アルキル、$-C_1$－C_6ヘテロアルキル、又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-CF_3$、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換又は多置換されており、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、いずれの場合も独立して、

－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Y}及びＲ^{Z}が、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表すか、
あるいはＲ^{Y}及びＲ^{Z}が一緒になって、Ｎ、Ｏ及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７又は８員の複素環を形成し、
ここで、「一置換若しくは多置換」は、いずれの場合も独立して、－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－Ｏ－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－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）、－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）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｈ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－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、－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、例えば１つ、２つ、３つ、４つ、又はそれ以上の置換基で置換されていることを意味する。

【００１４】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、

（ａ－１）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{1}が、Ｒ^{W}を表し、Ｒ^{W}が、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、かつ／又は

（ａ－２）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$のうちの少なくとも１つが、－Ｈを表し、かつ／又は

（ａ－３）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{6}が、－Ｈを表し、かつ／又は

（ａ－４）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{8}が、－Ｈを表すか、

又は

（ｂ－１）

（ｂ－１）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{1}が、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＮ、－メチル、－エチル、－プロピル、若しくは－シクロプロピルを表し、かつ／又は

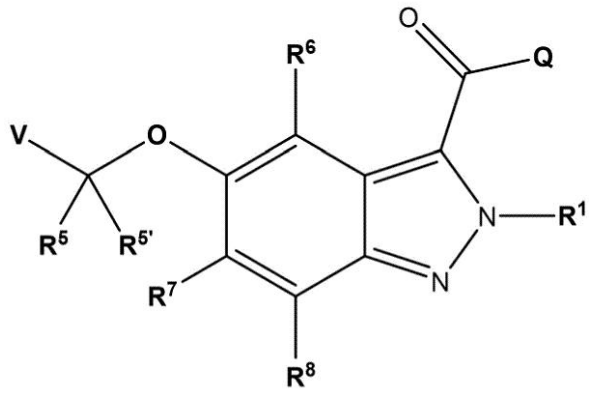
（ｂ－２）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$のうちの少なくとも１つが、－Ｈを表さず、かつ／又は

（ｂ－３）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{3}は、－Ｈを表す。

【００１５】

本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$－を表す。本実施形態によれば、本発明によるインダゾール誘導体は、式（ＩＩ）の化合物、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体である

【化２】



（ＩＩ）。

【００１６】
式Ｉによるインダゾール誘導体の別の実施形態では、Ｔが、－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表す。
【００１７】
式Ｉ又は式ＩＩによるインダゾール誘導体の一実施形態では、Ｒ^{1}が、メチル、エチル、又は他のＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルである。別の好ましい実施形態では、Ｒ^{1}が、メチルである。
【００１８】
本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す。
【００１９】
本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、Ｑは、－ＯＲ^{2}を表す。
【００２０】
本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｖは、飽和若しくは不飽和の３～１４員シクロアルキル；３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和５～１４員アリール、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_{5}$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている。
【００２１】
．
【００２２】
いくつかの実施形態では、Ｖの定義内の５～１４員ヘテロアリールが、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_{5}$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ

^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００２３】

好ましくは、Ｖの定義内の５～１４員ヘテロアリールが、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なる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、$-S(=O)_2R^{Y}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００２４】

好ましくは、Ｖの定義内の５～１４員ヘテロアリールが、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－３－イル、ピラゾール－４－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－４－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、及びイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イルからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、$-S(=O)_2R^{Y}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００２５】

いくつかの実施形態では、Ｖの定義内の５～１４員ヘテロアリールが、ピラゾール－３－イル、ピラゾール－４－イル、チアゾール－４－イル、チアゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、及びピリジン－４－イルからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、$-S(=O)_2R^{Y}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００２６】

一実施形態では、Ｖの定義内の飽和又は不飽和３～１４員シクロアルキルが、非縮合若しくは非架橋、縮合、又は架橋シクロアルキルを含む、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、シクロノニル、又はシクロデシルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、－Ｒ^{Y}、－ＯＲ^{Y}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Z}、－ＳＲ^{Y}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、$-S(=O)_2R^{Y}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{Y}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{Y}、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００２７】

一実施形態では、Ｖの定義内の５～１４員アリールが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、

－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－R^Y、－OR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－NR^YR^Z、－NR^YC（＝Ｏ）R^Z、－SR^Y、－Ｓ（＝Ｏ）R^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）R^Y、－Ｃ（＝Ｏ）OR^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）NR^YR^Zから選択される置換基で一置換又は多置換されている、フェニル又はその他の５～１４員アリールである。

【００２８】

本発明によるインダゾール誘導体の更なる実施形態では、Ｖは、飽和若しくは不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－R^Y、－OR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－NR^YR^Z、－NR^YC（＝Ｏ）R^Z、－SR^Y、－Ｓ（＝Ｏ）R^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）R^Y、－Ｃ（＝Ｏ）OR^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）NR^YR^Zから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、３～１４員ヘテロシクロアルキルを表す。

【００２９】

いくつかの実施形態では、Ｖの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルが、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、イソオキサリジン（ｉｓｏｘａｌｉｄｉｎｅ）、モルホリン、オキサゾリジン、オキサン、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－R^Y、－OR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－NR^YR^Z、－NR^YC（＝Ｏ）R^Z、－SR^Y、－Ｓ（＝Ｏ）R^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）R^Y、－Ｃ（＝Ｏ）OR^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）NR^YR^Zから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００３０】

いくつかの実施形態では、Ｖの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルが、オキサン、オキサン－４－イル、オキセタン、また又はオキセタン－３－イルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－R^Y、－OR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－NR^YR^Z、－NR^YC（＝Ｏ）R^Z、－SR^Y、－Ｓ（＝Ｏ）R^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）R^Y、－Ｃ（＝Ｏ）OR^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）NR^YR^Zから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００３１】

本発明によるインダゾール誘導体の別の好ましい実施形態では、Ｖは、飽和若しくは不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－NO_2、＝Ｏ、＝Ｓ、－SF_5、－R^Y、－OR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－NR^YR^Z、－NR^YC（＝Ｏ）R^Z、－SR^Y、－Ｓ（＝Ｏ）R^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）R^Y、－Ｃ（＝Ｏ）OR^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）NR^YR^Zから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、C_1－C_6アルキル又はC_1－C_6ヘテロアルキルを表す。

【００３２】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｖは、非置換、互いに独立して、

－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＳＦ$_5$；
飽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（＝Ｏ）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－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、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている。

【００３３】

いくつかの実施形態では、Ｖが、非置換、互いに独立して、
－ＯＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、又は－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$；
飽和又は不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和又は不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル；
非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｏ（Ｃ＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
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る３～１４員シクロアルキルであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている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、イソオキサリジン、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］ピラジンからなる群から選択される３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている３～１４員ヘテロシクロアルキル；から選択される置換基で一置換又は多置換されている。

【００３４】

いくつかの実施形態では、Ｖが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、メチル、エチル、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－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－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－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）$_2$、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－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、－アゼチジン、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換又は多置換されている。

【００３５】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｖが、
（ｉ）非置換であるか、
（ｉｉ）一置換されているか、
（ｉｉｉ）二置換されているか、
（ｉｖ）三置換されているか、又は
（ｖ）四置換されている。

【００３６】

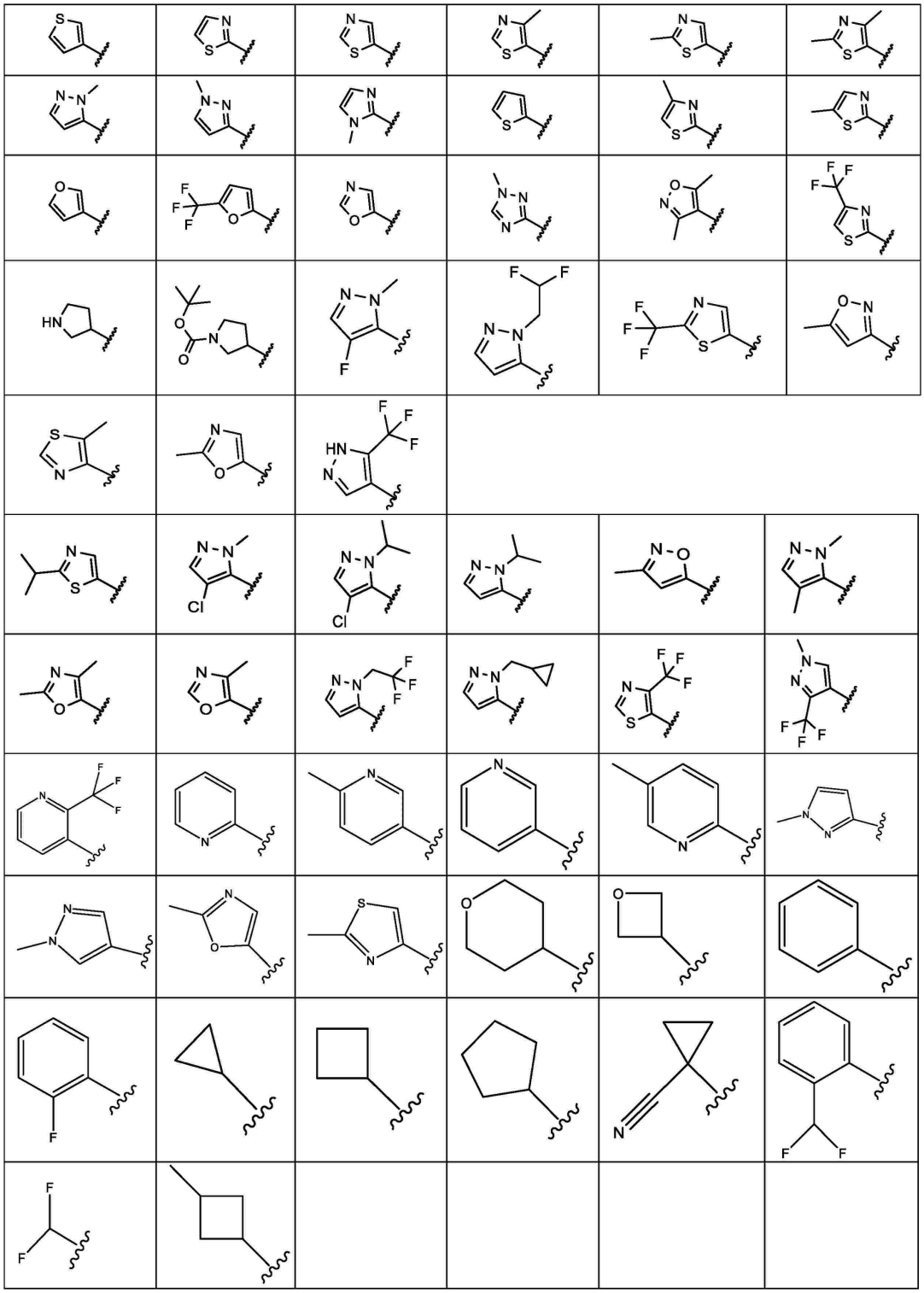
本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｖが、

（ｉ）非置換であるか、
（ｉｉ）一置換されているか、又は
（ｉｉｉ）二置換されている。

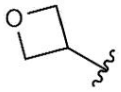
【００３７】

いくつかの実施形態では、Ｖは、飽和若しくは不飽和３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは３～５員ヘテロシクロアルキル）、５～１４員ヘテロアリール（好ましくは５～６員ヘテロアリール）、飽和若しくは不飽和３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、又はＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキルを表し、いずれの場合も、非置換、一置換又は多置換されており、好ましくは、以下からなる群から選択される残基である。

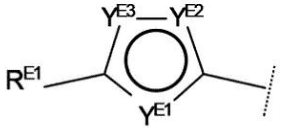
【化３】



【００３８】
一実施形態では、Ｖは、非置換、一置換又は多置換の、－オキセタニルを表し、好ましくは、
【化４】

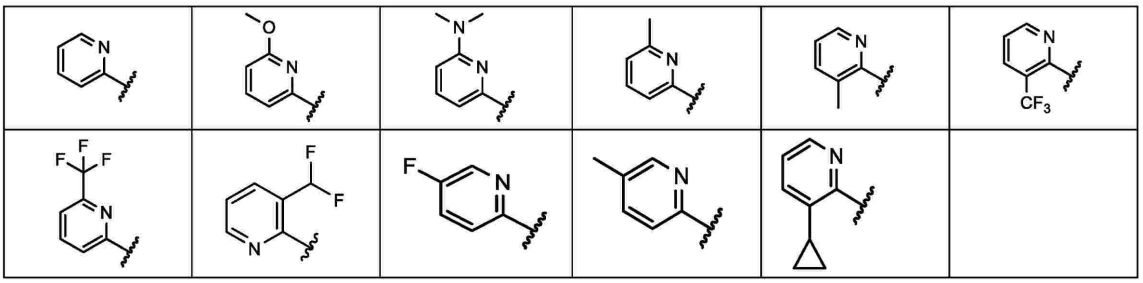


を表す。
【００３９】
いくつかの実施形態では、Ｖは、一般式（Ｅ）による残基を表し、
【化５】



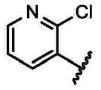
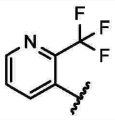
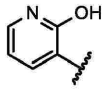
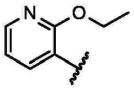
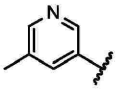
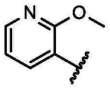
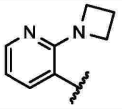
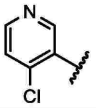
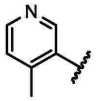
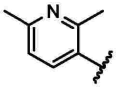
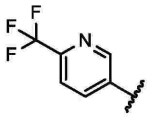
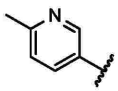
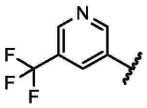
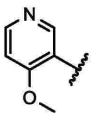
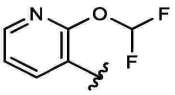
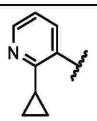
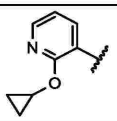
（Ｅ）

式中、
Y^{E1}が、－Ｎ＝、$-NR^{E2}-$、Ｓ、Ｏ、又は$-CR^{E3}=$を表し、Y^{E2}が、－Ｎ＝、$-NR^{E3}-$、Ｓ、Ｏ、又は$-CR^{E4}=$を表し、Y^{E3}が、－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では、Ｖが、一般式（Ｅ）による残基を表し、
式中、ＹＥ１が、－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。
【００４０】
いくつかの実施形態では、Ｖは、非置換、一置換、又は多置換の、２－ピリジンを表す。いくつかの実施形態では、Ｖは、以下からなる群から選択される残基を表す。
【化６】



【００４１】
いくつかの実施形態では、Ｖは、非置換、一置換、又は多置換の、３－ピリジンを表す。好ましい実施形態では、Ｖは、以下からなる群から選択される残基を表す。

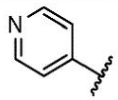
【化７】

【００４２】

いくつかの実施形態では、Ｖは、非置換、一置換、又は多置換の、４－ピリジンを表す。好ましい実施形態では、Ｖは、以下からなる群から選択される残基を表す。

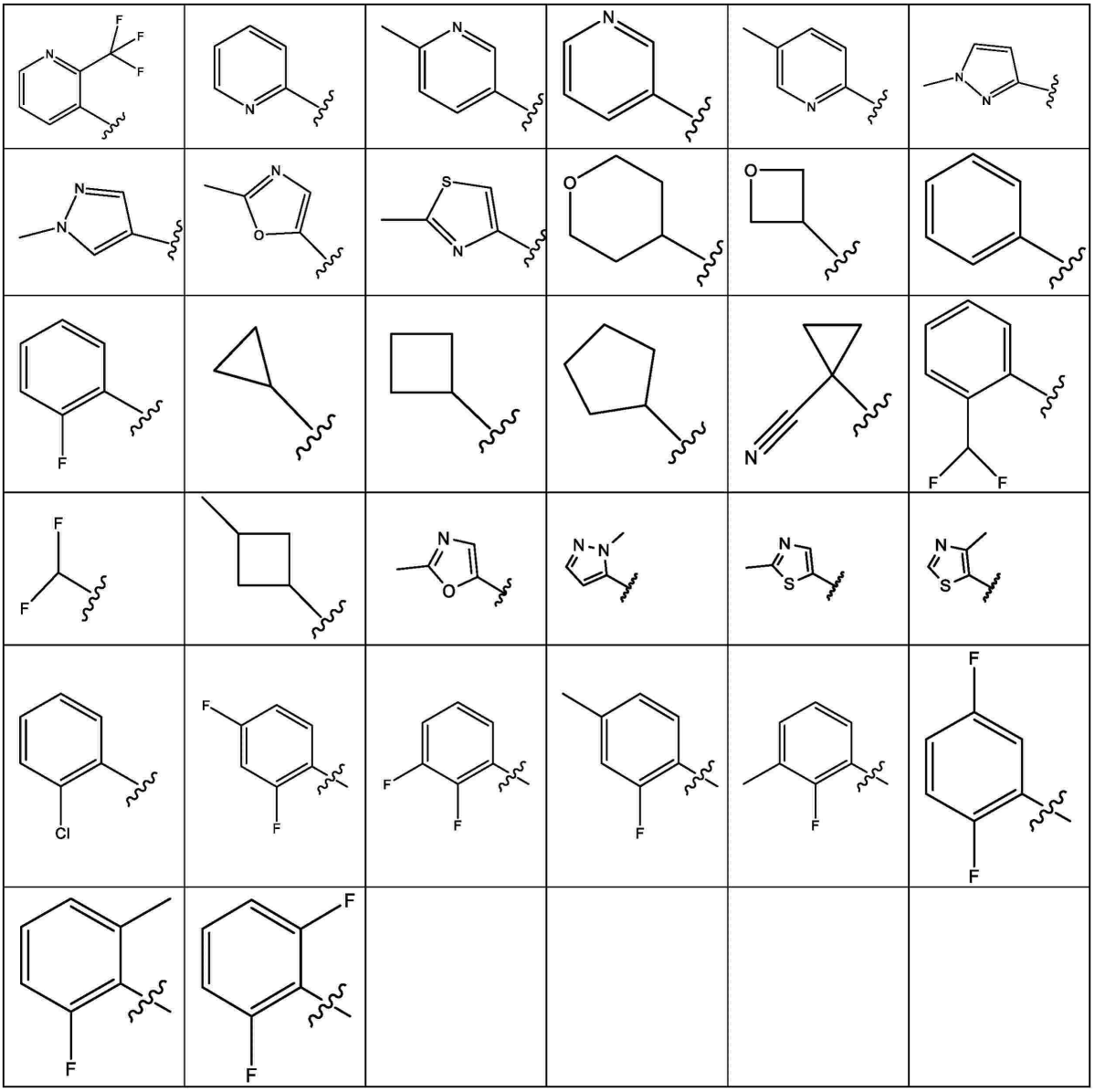
【化８】



【００４３】

いくつかの実施形態では、任意選択的に、Ｕ－ＣＨ$_2$の場合、Ｖは、以下からなる群から選択される残基を表す。

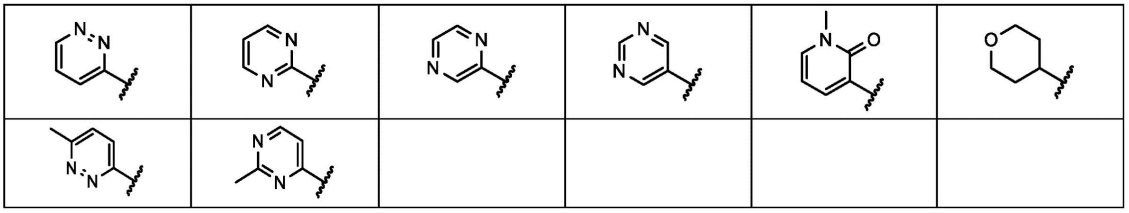
【化９】



【００４４】

代替的な実施形態では、Ｖは、以下からなる群から選択される残基を表す。

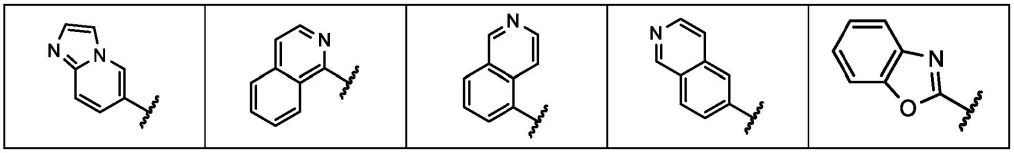
【化１０】



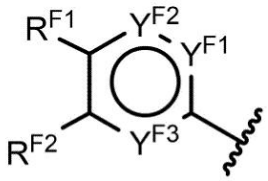
【００４５】

いくつかの実施形態では、Ｖは、非置換、一置換又は多置換の、二環式ヘテロアリールを表し、好ましくは、以下からなる群から選択される。

【化１１】

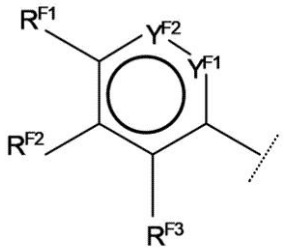


【００４６】
いくつかの実施形態では、Ｖは、一般式（Ｆ’）による残基を表し、
【化１２】



（Ｆ’）

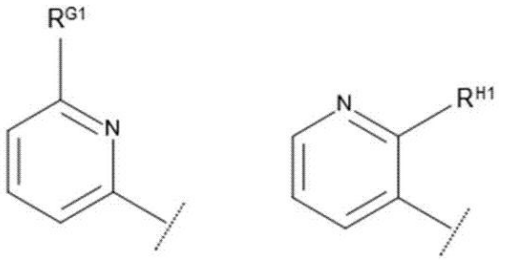
式中、
Y^{F1}は、－Ｎ＝又は－CR^{F4}＝を表し、Y^{F2}は、－Ｎ＝又は－CR^{F5}＝を表し、Y^{F3}は、－Ｎ＝又は－CR^{F3}＝を表すが、Y^{F1}及びY^{F2}のうちの少なくとも１つが、それぞれ、－CR^{F4}＝及び－CR^{F5}＝ではないことを条件とし、
R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}は、互いに独立して、－Ｈ、－CH_3、－CF_3、－ＯＨ、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－Ｃｌ、又は－アゼチジニルを表すが、好ましくは、R^{F1}、R^{F2}、R^{F3}、R^{F4}、及びR^{F5}のうちの１つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。
別の実施形態では、Ｖは一般式（Ｆ）による残基を表し、
【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、
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。
【００４７】
いくつかの実施形態では、Ｖは、一般式（Ｇ）又は（Ｈ）による残基を表し、

【化１４】

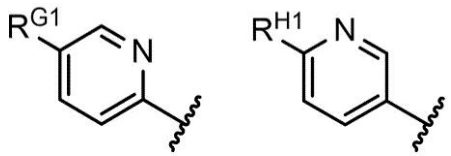


(G) (H)

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。

他の実施形態では、Ｖは、一般式（Ｇ’）又は（Ｈ’）による残基を表し、

【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、

【００４８】

本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、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－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

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

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

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

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

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

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

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

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルで

あって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている。

【００４９】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－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。

【００５０】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－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$_{3}$、－非置換シクロペンチル、又は－シクロプロピルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－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$_{3}$、－シクロペンチル、又は非置換を表す。いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－ＣＨ$_{3}$を表す。

【００５１】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{3}$、又は－シクロプロピルを表す。好ましくは、Ｒ^{1}は、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、又は－ＣＨ$_{3}$を表す。いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、又は－ＣＨＦ$_{2}$を表す。

【００５２】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、又は－シクロプロピルを表し、好ましくは、Ｒ^{1}は、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、又は－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$を表し、例えば、－ＣＨ$_{3}$である。

【００５３】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{2}は、

－Ｈ；

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は

飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員

ヘテロシクロアルキルを表す。
【００５４】
いくつかの実施形態では、R^2は、－Ｈ、－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、又は－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－CF_3を表す。
【００５５】
いくつかの実施形態では、R^2は、－Ｈ又は－C_{1-6}－アルキルを表す。
【００５６】
本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、R^3は、
－Ｈ；
－ＯＨ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキルを表す。
【００５７】
いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈ、－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}－アルキレン－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－C_{1-6}－アルキレン－NH_2、－C_{1-6}－アルキレン－ＮＨ（C_{1-6}－アルキル）、－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）$_2$、－CF_3、－CF_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、又は－C_{1-6}－アルキレン－Ｎ（C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキレン－CF_3を表す。
【００５８】
いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和、非置換、若しくは－ＯＨで一置換されている－C_{1-6}－アルキルを表す。好ましくは、R^3は、－Ｈを表す。
【００５９】
いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、－Ｈ以外の残基を表す。
【００６０】
本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、R^4は、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）C_{1-6}－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－C_1－$_6$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－ヘテロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－C_1－C_6－アルキレン－若しくは－C_1－C_6－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－C_1－C_6－

アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表す。
【００６１】
いくつかの実施形態では、Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、いずれの場合も、飽和若しくは不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）；
飽和若しくは不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$

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

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、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、いずれの場合も、飽和若しくは不飽和であり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）；

３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、いずれの場合も、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、イソオキサリジン、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］ピラジンからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$

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

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

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、いずれの場合も、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置

換基で一置換又は多置換されている、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す。

【００６２】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{4}が、

－Ｈ；

飽和、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換されている－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

飽和、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）；

飽和、非置換、互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＯＣ$_{1-6}$－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（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_{2}$、－非置換フェニルからなる群から選択される置換基で一置換又は二置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和、非置換、互いに独立して、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキルからなる群から選択される置換基で一置換又は二置換されている、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）；

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

－非置換フェニル；

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

されている、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）を表す。

【００６３】

本発明によるインダゾール誘導体の一実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ及びＳから選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５員又は６員の複素環を形成する。

【００６４】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－非置換ピリジル、及び、非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている。一実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、非置換、一置換又は多置換の、モルホリンを形成しない。

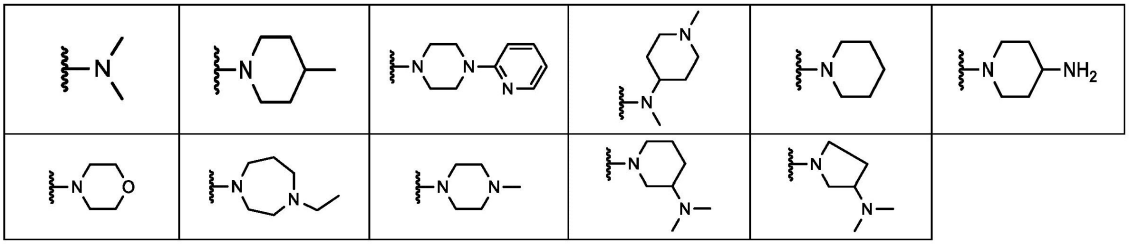
【００６５】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、
非置換、又は－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$で一置換された、ピロリジン環；
非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、及び非置換若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換されたピペリジン環；
非置換モルホリン環；あるいは
非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキル及び－非置換ピリジルからなる群から選択される置換基でＮ－置換されたピペラジン環を形成する。

【００６６】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が両方とも、－Ｈを表さない。いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}及びＲ^{4}が、それらが結合している窒素原子と一緒になって、以下からなる群から選択される残基を形成する。

【化１６】



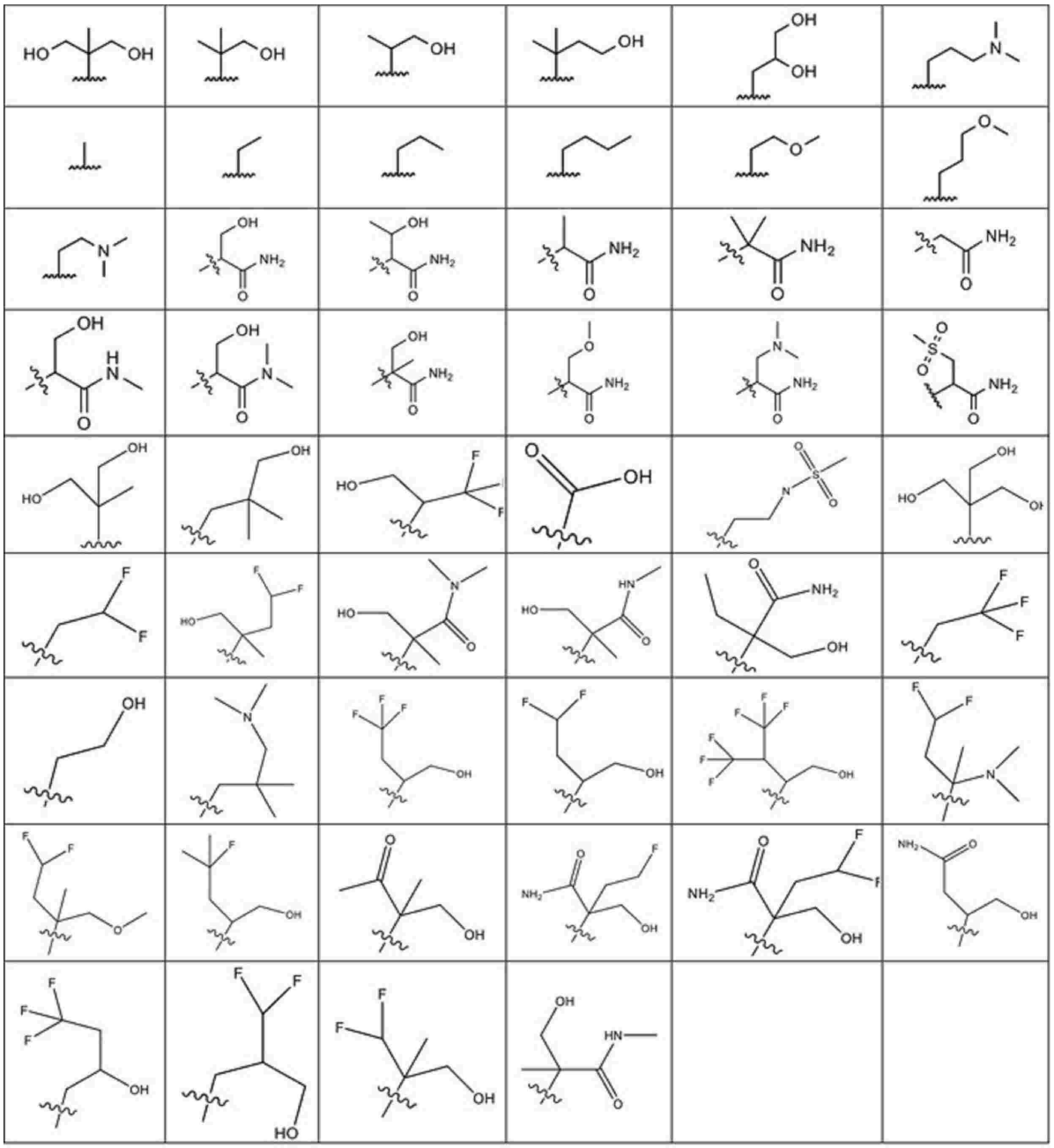
【００６７】

他の実施形態では、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、－Ｈを表さない。

【００６８】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、飽和又は不飽和の、非置換の、一置換又は多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す。いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、以下からなる群から選択される残基を表す。

【化１７】



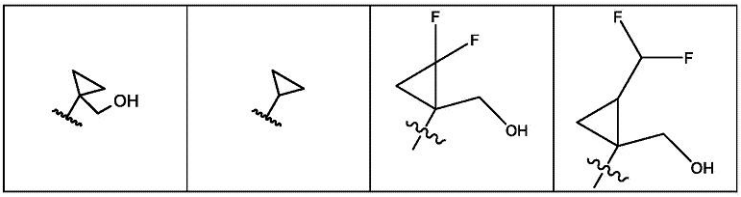
【００６９】

更なる実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、残基－ＣＲ’Ｒ’’－（C_nH_m－ＯＨを表し、式中、ｍは、１～６、好ましくは１～３の整数であり、式中、Ｒ’及びＲ’’が、互いに独立して、－Ｈ、－C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－Ｏ－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、又はＣ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-3}－アルキルを表し、好ましくは、－Ｈ、－CH_3、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）－NH_2、又はＣ（＝Ｏ）－ＮＨ－C_{1-3}－アルキルを表す。一実施形態では、少なくともＲ’又はＲ’’は、－Ｈを表さない。代替的な実施形態では、Ｒ’もＲ’’も－Ｈを表さない。

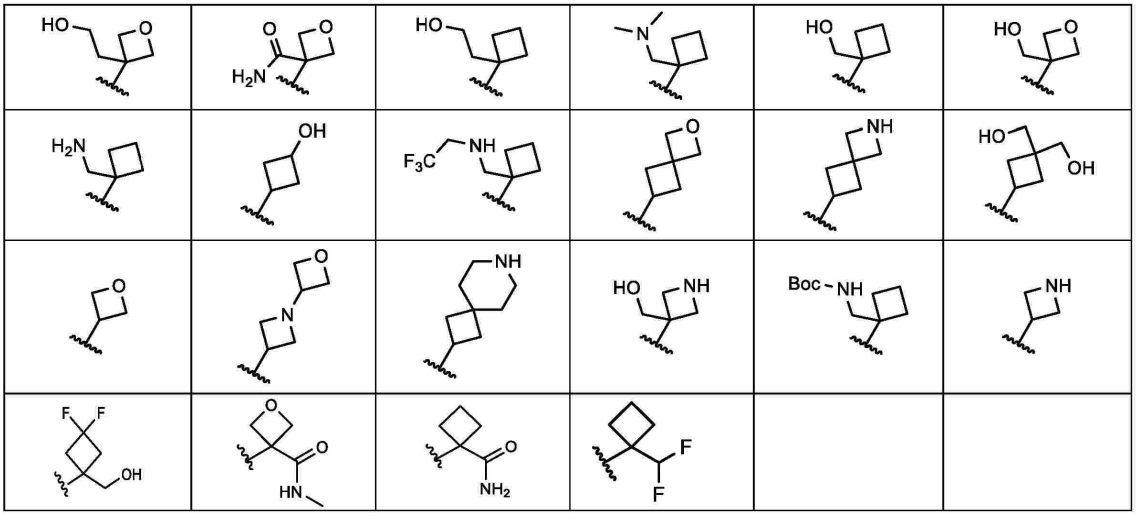
【００７０】

更なる実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4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、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を表す。

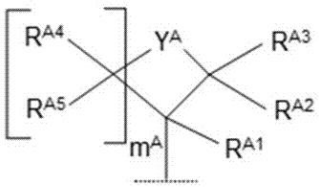
【００７１】
更なる実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３員シクロアルキル、又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３員ヘテロシクロアルキルを表す。いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、以下からなる群から選択される残基を表す。
【化１８】



【００７２】
いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4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４員シクロアルキル）、又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは、４員ヘテロシクロアルキル）を表す。いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、以下からなる群から選択される残基を表す。
【化１９】



【００７３】
いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、一般式（Ａ）による残基を表し、
【化２０】



(A)

式中、
m^Aが、０又は１であり、
Y^Aが、－Ｏ－、$-NR^{A6}-$、及び$-CR^{A7}R^{A8}-$から選択され、
R^{A1}、R^{A2}、R^{A3}、R^{A4}、R^{A5}、R^{A6}、R^{A7}、及びR^{A8}が、互いに独立して

、－Ｈ、Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-4}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－３－オキセタニル、又は－ＣＨＦ$_2$を表し、好ましくは、Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A6}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}が、互いに独立して、－Ｈ、Ｆ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＣＦ$_3$）、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-4}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）－ＮＨ－Ｃ$_{1-3}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は－３－オキセタニルを表すか、あるいはＲ^{A7}及びＲ^{A8}は、それらが結合している炭素原子と一緒になって環を形成し、－ＣＨ$_2$ＯＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、又は－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＮＨＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＮＨＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、又は－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＮＨＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－を表す。

【００７４】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、Ｒ^{4}が、上記に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、式中、

ｍ^{A}が、０又は１であり、

Ｙ^{A}が、－Ｏ－及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、

Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、又は－ＣＨＦ$_2$を表し、好ましくは、Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$を表し、好ましくは、Ｒ^{A1}、Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}のうちの１つのみが、－Ｈでない残基を表すことを条件とする。

【００７５】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、Ｒ^{4}が、上記に定義される一般式（Ａ）による残基を表し、式中、

ｍ^{A}が、０又は１であり、

Ｙ^{A}が、－Ｏ－及び－ＣＲ^{A7}Ｒ^{A8}－から選択され、

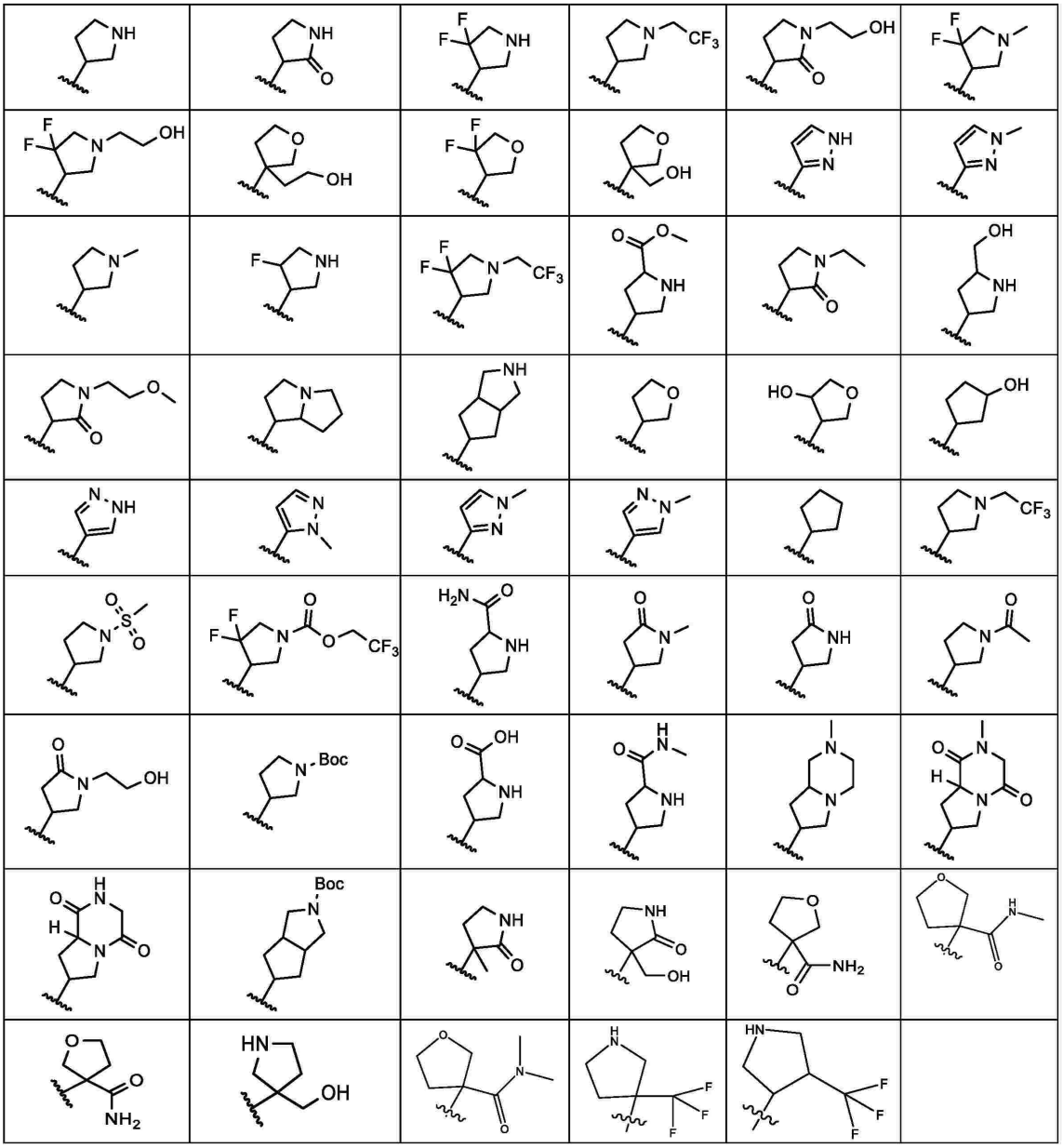
Ｒ^{A1}が、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、又は－ＣＨＦ$_2$を表し、好ましくは、Ｒ^{A1}が、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$－アルキル）$_2$、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$を表し、

Ｒ^{A2}、Ｒ^{A3}、Ｒ^{A4}、Ｒ^{A5}、Ｒ^{A7}、及びＲ^{A8}が、－Ｈを表す。

【００７６】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、Ｒ^{4}が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル（好ましくは５員シクロアルキル）、又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは５員ヘテロシクロアルキル）、又は非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール（好ましくは５員ヘテロアリール）を表す。好ましい実施形態では、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、以下からなる群から選択される残基を表す。

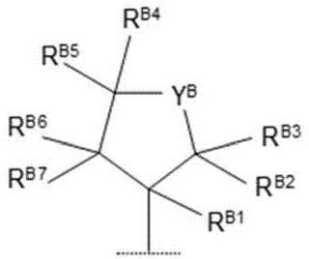
【化２１】



【００７７】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{3}が、－Ｈを表し、Ｒ^{4}が、一般式（Ｂ）による残基を表し、

【化２２】



（Ｂ）

式中、

Ｙ^{Ｂ}が、－Ｏ－、－ＮＲ^{Ｂ８}－、及び－ＣＲ^{Ｂ９}Ｒ^{Ｂ１０}－から選択され、

R^{B1}、R^{B2}、R^{B3}、R^{B4}、R^{B5}、R^{B6}、R^{B7}、R^{B8}、R^{B9}、及びR^{B10}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－Ｏ－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CO_2H、－C_{1-3}－アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-3}－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－C_{1-3}－アルキル、又は－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$を表すか、又はR^{B2}及びR^{B3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{B4}及びR^{B5}が一緒になって、＝Ｏを表す。

【００７８】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、上記に定義される一般式（Ｂ）による残基を表し、式中、

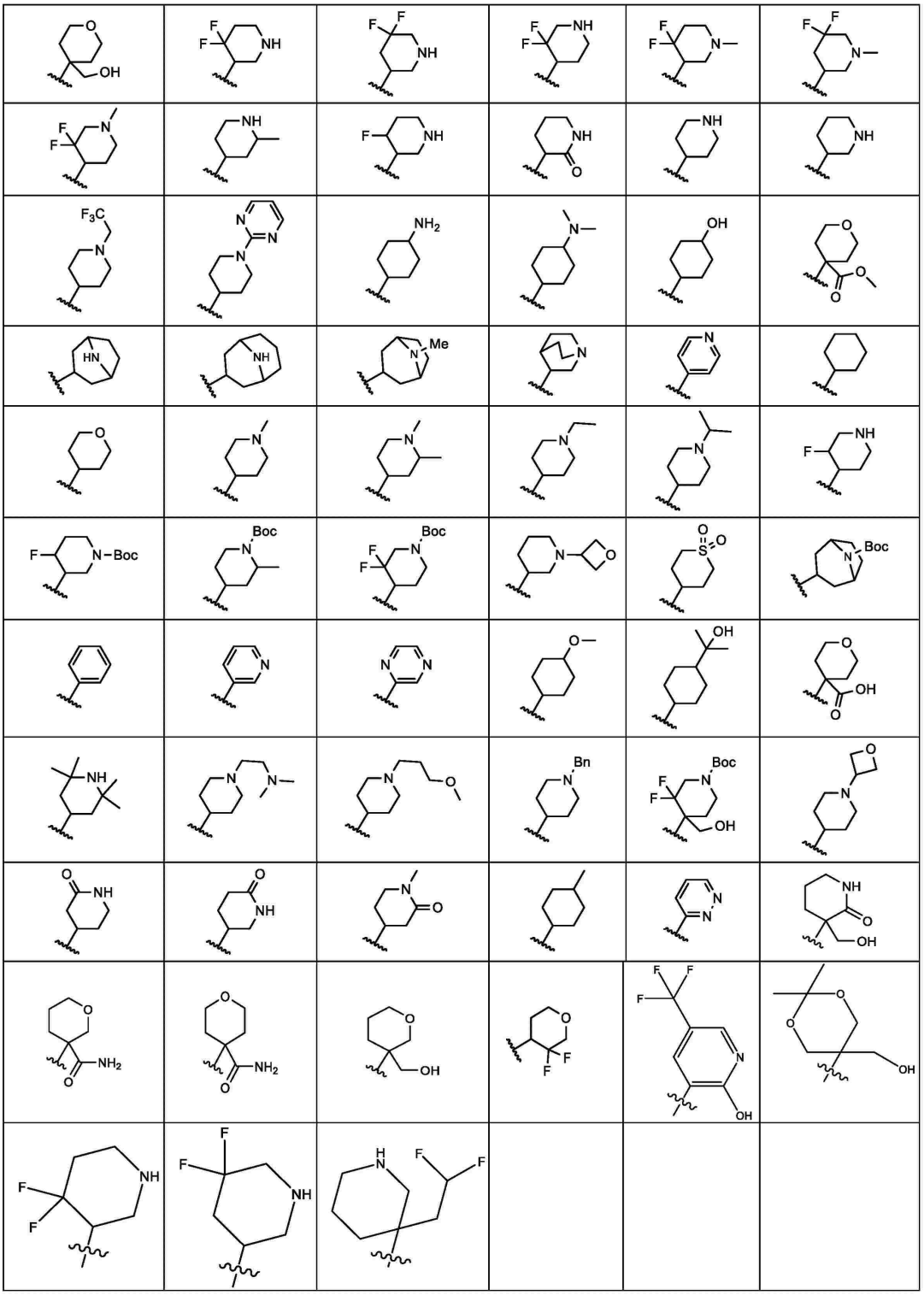
Y^Bが、－Ｏ－及び－ＮR^{B8}－から選択され、

R^{B1}、R^{B2}、R^{B3}、R^{B4}、R^{B5}、R^{B6}、R^{B7}、R^{B8}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）NH_2を表すか、又はR^{B2}及びR^{B3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{B4}及びR^{B5}が一緒になって＝Ｏを表し、好ましくは、R^{A1}、R^{A2}、R^{A3}、R^{A4}、R^{A5}、R^{A7}、及びR^{A8}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とし、好ましくは、R^{A1}、R^{A2}、R^{A3}、R^{A4}、R^{A5}、R^{A7}、及びR^{A8}のうちの少なくとも１つが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。

【００７９】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル（好ましくは、６員シクロアルキル）、又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは６員ヘテロシクロアルキル）、又は非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール（好ましくは６員アリール）、又は非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール（好ましくは６員ヘテロアリール）を表す。好ましい実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、以下からなる群から選択される残基を表す。

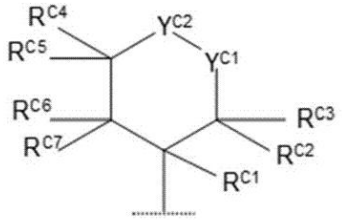
【化２３】



【００８０】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、一般式（Ｃ）による残基を表し、

【化２４】



（C）

式中、
Y^{C1}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、－ＮR^{C8}－、及び－Ｃ$R^{C9}R^{C10}$－から選択され、Y^{C2}が、－Ｃ$R^{C11}R^{C12}$－を表すか、又はY^{C1}が、－Ｃ$R^{C9}R^{C10}$－を表し、Y^{C2}が、－Ｏ－、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－、及び－ＮR^{C8}－から選択され、
R^{C1}、R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}、及びR^{C12}が、互いに独立して、
－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-3}－アルキル、－ＮH_2、－ＮＨ（C_{1-3}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－、－Ｃ（＝Ｏ）ＮH_2、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－C_{1-3}－アルキル、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$を表すか：又はR^{C2}及びR^{C3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{C4}及びR^{C5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{C9}及びR^{C10}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{C11}及びR^{C12}が一緒になって、＝Ｏを表す。

【００８１】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、上記に定義される一般式（Ｃ）よる残基を表し、式中、
Y^{C1}が、－Ｏ－若しくは－ＮR^{C8}－から選択され、Y^{C2}が、－Ｃ$R^{C11}R^{C12}$－を表すか、又はY^{C1}が、－Ｃ$R^{C9}R^{C10}$－を表し、Y^{C2}が、－Ｏ－、及び－ＮR^{C8}－から選択され、
R^{C1}、R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}、及びR^{C12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮH_2を表すが、好ましくは、R^{C1}、R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}、及びR^{C12}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とし、好ましくは、R^{C1}、R^{C2}、R^{C3}、R^{C4}、R^{C5}、R^{C6}、R^{C7}、R^{C8}、R^{C9}、R^{C10}、R^{C11}及びR^{C12}のうちの少なくとも１つが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。

【００８２】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の７員シクロアルキル、又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の７員ヘテロシクロアルキルを表す。いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、次の残基を表す。

【化２５】

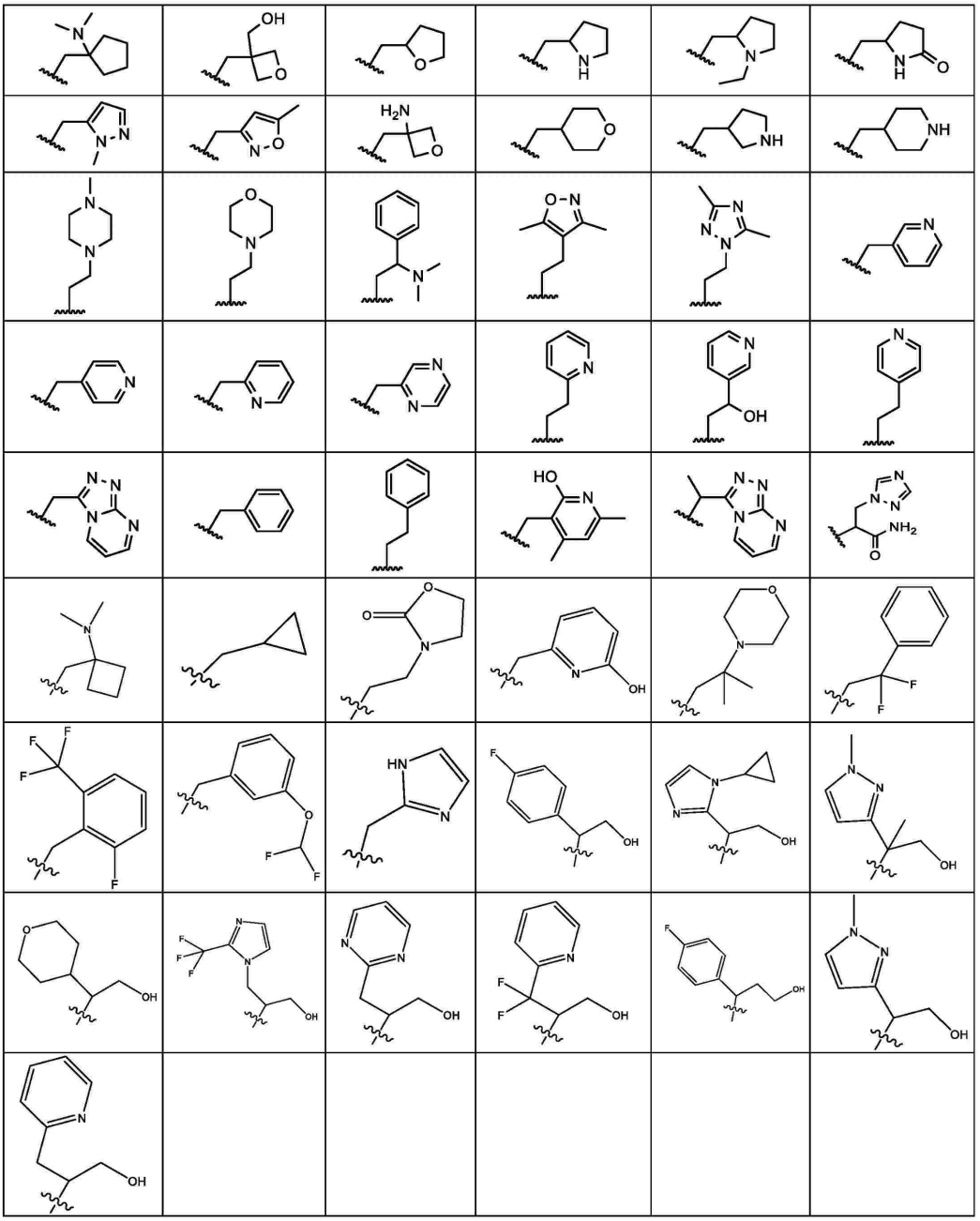


【００８３】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル（好ましくは３、４、５又は６員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の

、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは４、５又は６員ヘテロシクロアルキル）であって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル；又は非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール（好ましくは６員アリール）であって、当該６～１４員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、６～１４員アリール；又は非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール（好ましくは５若しくは６員ヘテロアリール）であって、当該５～１４員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表す。好ましい実施形態では、Ｒ^{3}は、－Ｈを表し、Ｒ^{4}は、以下からなる群から選択される残基を表す。

【化２６】



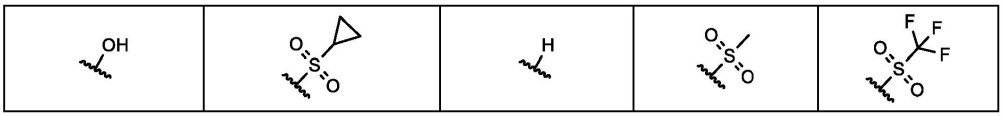
【００８４】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の５員ヘテロシクロアルキルであって、当該５員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続されている、５員ヘテロシクロアルキル；又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の５員ヘテロアリールであって、当該５員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－C_1－C_6－アルキレン－を介して接続されている、５員ヘテロアリールを表す。

【００８５】

いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、以下からなる群から選択される残基を表す。

【化２７】



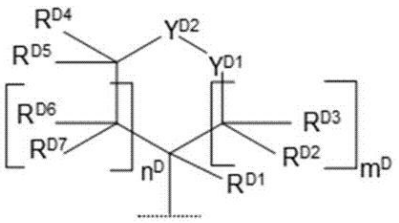
【００８６】

いくつかの実施形態では、R^3が、－Ｈを表し、R^4が、

（ｉ）残基－ＣＲ’Ｒ’’－（C_6）H_m－ＯＨであって、式中、ｍが、１～６の整数であり、好ましくは１～３の整数であり、Ｒ’及びＲ’’が、互いに独立して、－Ｈ、C_{1-3}－アルキル、－CF_3、－CF_2H、－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3、－C_{1-3}－アルキレン－CF_2H、－C_{1-3}－アルキレン－CFH_2、－C_{1-3}－アルキレン－Ｏ－C_{1-3}－アルキル、又は－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨを表し、好ましくは－Ｈ、－CH_3、又は－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨを表す。一実施形態では、少なくともＲ’又はＲ’’は、－Ｈを表さない。一実施形態では、Ｒ’もＲ’’も－Ｈを表さない、あるいは

（ｉｉ）一般式（Ｄ）による残基、

【化２８】



(D)

式中、

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

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

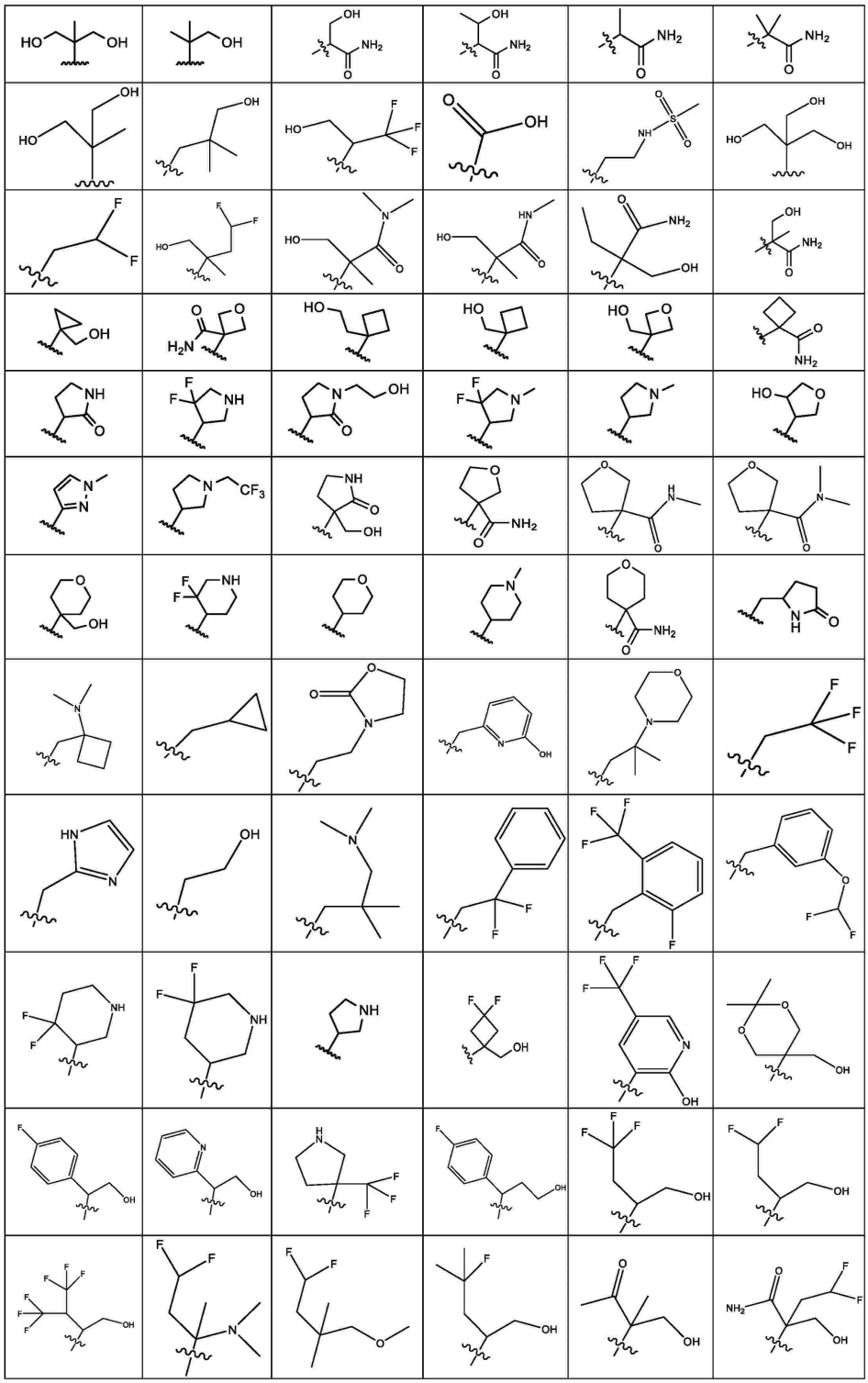
R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}、及びR^{D12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－Ｃ（Ｏ）NH_2、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－C_{1-3}－アルキル、－NH_2、－C_{1-3}－アルキレン－NH_2、－ＮＨ（C_{1-3}－アルキル）、－Ｎ（C_{1-3}－アルキル）$_2$、－ＮＨ（C_{1-3}－アルキレン－CF_3）、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＣＨ$_3$、－C_{1-3}－アルキル、－C_{1-3}－アルキレン－CF_3を表すか：又はR^{D2}及びR^{D3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D4}及びＲ

R^{D5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D9}及びR^{D10}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D11}及びR^{D12}が一緒になって、＝Ｏを表し、
好ましくは、
m^D及びn^Dが、互いに独立して、０、１、２又は３であり、好ましくは、$m^D+n^D \leqq 3$であることを条件とし；
Y^{D1}が、－Ｏ－、－NR^{D8}－、及び－$CR^{D9}R^{D10}$－から選択され、Y^{D2}が、－$CR^{D11}R^{D12}$－を表すか、又はY^{D1}が、－$CR^{D9}R^{D10}$－を表し、Y^{D2}が、－Ｏ－及び－NR^{D8}－から選択され、
R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}及びR^{D12}が、互いに独立して、－Ｈ、－Ｆ、－ＯＨ、－C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）NH_2、－CH_2NH_2、－$CH_2N(CH_3)_2$、－$NHCH_2CF_3$、－CH_3、若しくは－CH_2CF_3を表すか：又はR^{D2}及びR^{D3}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D4}及びR^{D5}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D9}及びR^{D10}が一緒になって、＝Ｏを表すか、又はR^{D11}及びR^{D12}が一緒になって、＝Ｏを表し、好ましくは、R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}及びR^{D12}のうちの１つ、２つ、又は３つのみが、－Ｈではない残基を表すことを条件とし、好ましくは、R^{D1}、R^{D2}、R^{D3}、R^{D4}、R^{D5}、R^{D6}、R^{D7}、R^{D8}、R^{D9}、R^{D10}、R^{D11}及びR^{D12}のうちの少なくとも１つが、－Ｈではない残基を表すことを条件とする。

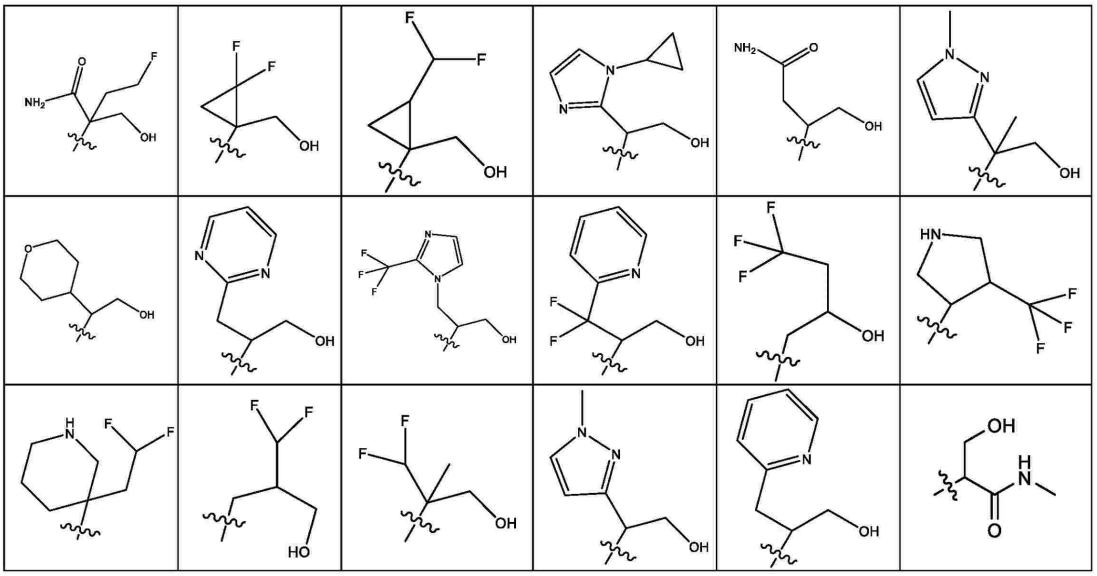
【００８７】

いくつかの実施形態では、R^3は、－Ｈを表し、R^4は、以下からなる群から選択される残基を表す。

【化２９－１】



【化２９－２】



【００８８】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキルを表す。

【００８９】

いくつかの実施形態では、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。

【００９０】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{5}及びＲ^{5}’のうちの少なくとも１つが、－Ｈではない。

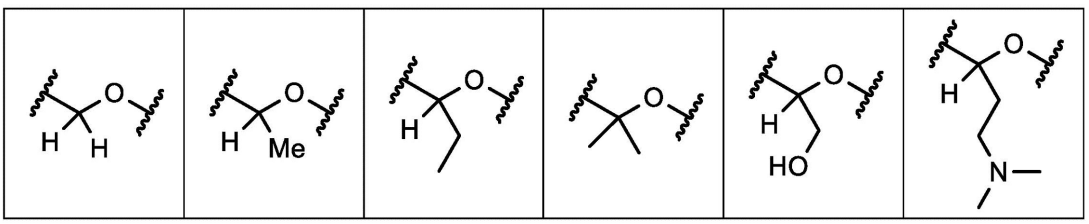
【００９１】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{5}及びＲ^{5}’が両方とも、－Ｈである。

【００９２】

いくつかの実施形態では、Ｔは、－Ｏ－を表し、Ｕは、－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－を表し、結果として得られた部分－Ｏ－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－が、以下からなる群から選択される残基を表す。

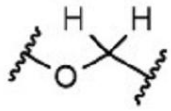
【化３０】



【００９３】

いくつかの実施形態では、Ｔが、－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、結果として得られた部分－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－Ｏ－が、次の残基を表す。

【化３１】



【００９４】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{5}が、－Ｈを表し、Ｒ^{5}’が、－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。

【００９５】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、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。

【００９６】

いくつかの実施形態では、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、若しくは互いに独立して、－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た－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル；

非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$；

非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；

非置換、若しくは互いに独立して、－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

ら選択される１つ以上の置換基で置換された－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；又は非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す。

【００９７】

いくつかの実施形態では、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、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。

【００９８】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{6}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【００９９】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{6}は、－Ｈを表さない。

【０１００】

いくつかの実施形態では、Ｒ^{6}が、－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。

【０１０１】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【０１０２】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{7}が、－Ｈを表さない。

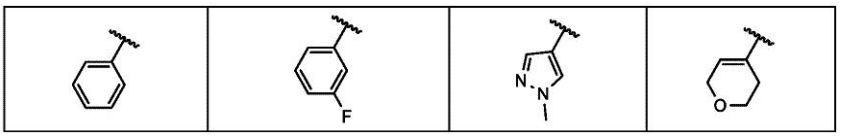
【０１０３】

いくつかの実施形態では、特にＱが－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す場合、Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又はＣＨ$_3$からなる群から選択される残基を表す。

【０１０４】

いくつかの実施形態では、特にＱが－ＯＲ^{2}を表す場合、Ｒ^{7}が、－Ｈ、又は以下からなる群から選択される残基を表す。

【化３２】



【０１０５】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{8}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表す。

【０１０６】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、Ｒ^{8}が、－Ｈを表さない。

【０１０７】

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

【０１０８】

本発明によるインダゾール誘導体のいくつかの実施形態では、

（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}のうちの残りが、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－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}のうちの残りが、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－ＣＨ$_{3}$を表す。

【０１０９】

いくつかの実施形態では、化合物は、一般式（Ｉ）に従うものであり、

－Ｒ^{1}が、－ＣＨ$_{3}$を表し、かつ／又は

－Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が各々、－Ｈを表し、かつ／又は

－Ｔが、－Ｏ－を表し、かつ／又は

－Ｕが、－ＣＨ$_{2}$－を表し、かつ／又は

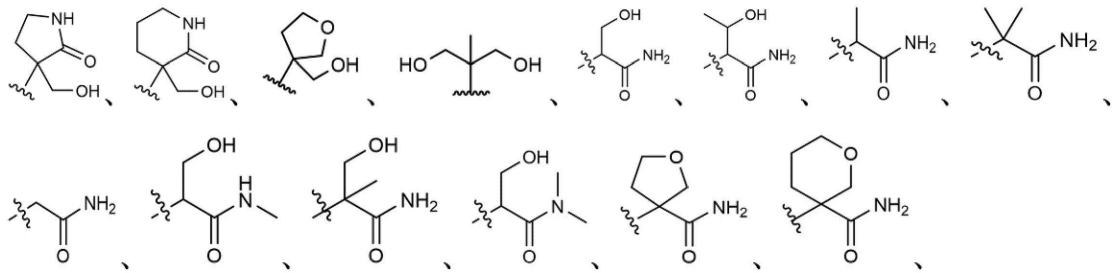
－Ｖが、チアゾリル、ピリジル、又はピラゾリルを表し、当該チアゾリル、ピリジル、及びピラゾリルが、各々、互いに独立して、非置換、－ＣＨ$_{3}$、－Ｆ、－ＣＨ$_{2}$ＣＨＦ$_{2}$、及び－ＣＦ$_{3}$からなる群から選択される置換基で一置換、若しくは二置換され得、かつ／又は

－Ｑが、ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、かつ／又は

－Ｒ^{3}が、Ｈを表し、かつ／又は

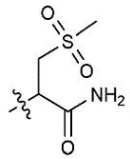
－Ｒ^{4}が、

【化３３】



若しくは

【化３４】



を表す。

【０１１０】

本発明の例示的な実施形態では、インダゾール誘導体は、以下からなる群から選択される：

化合物００１－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物００２－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロピロリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物００３－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物００４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物００５－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物００６－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－５－［

（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物００７－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物００８－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物００９－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１０－Ｎ－［４－ヒドロキシオキソラン－３－イル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１１－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［４－ヒドロキシオキソラン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１２－Ｎ－（３－ヒドロキシ－２，２－ジメチルプロピル）－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１３－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１４－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１５－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１６－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１７－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１８－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０１９－Ｎ－（３－ヒドロキシ－２，２－ジメチルプロピル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２０－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３－ヒドロキシ－２，２－ジメチルプロピル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２１－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２２－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２３－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２４－Ｎ－（３－ヒドロキシ－２，２－ジメチルプロピル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物０２５－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２６－３－ヒドロキシ－２－［（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｝－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物０２７－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０２８－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０２９－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３０－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３１－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３２－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３３－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（１－カルバモイルシクロブチル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３５－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３６－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３７－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３８－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０３９－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４０－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４１－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４２－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロブチル］メチル｝－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４３－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（

４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４４－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４５－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４６－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロブチル］メチル｝－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４７－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４８－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０４９－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５０－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［１－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピロリジン－３－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５１－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）シクロブチル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５２－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５３－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５４－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５５－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５６－Ｎ－［４－ヒドロキシオキソラン－３－イル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５７－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［１－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピロリジン－３－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５８－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０５９－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６０－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［１－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピロリジン－３－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６１－Ｎ－（１－カルバモイルシクロブチル）－２－メチル－５－［（１－メチ

ル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６２－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６３－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６４－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（２－オキソピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６５－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）シクロブチル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６６－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６７－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６８－２－メチル－Ｎ－［２－メチル－２－（モルホリン－４－イル）プロピル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０６９－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－［（５－オキソピロリジン－２－イル）メチル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７０－Ｎ－（１－カルバモイルシクロブチル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７１－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７２－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロブチル］メチル｝－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７３－２－メチル－Ｎ－［２－（２－オキソ－１，３－オキサゾリジン－３－イル）エチル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７４－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７５－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７６－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７７－２－メチル－Ｎ－［１－（２，２，２－トリフルオロエチル）ピロリジン－３－イル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０７８－５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－｛［１－（ジメチルアミノ）シクロブチル］メチル｝－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

化合物０７９－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８０－Ｎ－［（３Ｓ，４Ｓ）－４－ヒドロキシオキソラン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８１－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８２－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０８３－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０８４－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８５－Ｎ－（４－カルバモイルオキサン－４－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８６－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８７－Ｎ－（３－カルバモイルオキセタン－３－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８８－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メチルピロリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０８９－Ｎ－［（６－ヒドロキシピリジン－２－イル）メチル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９０－Ｎ－［１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９１－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９２－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９３－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９４－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９５－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９６－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９７－Ｎ－（４－カルバモイルオキサン－４－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物０９８－（２Ｒ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物０９９－（２Ｓ）－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１００－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－

５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０１－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１０２－２－メチル－Ｎ－（オキサン－４－イル）－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０３－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１０４－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０５－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０６－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０７－Ｎ－（４－カルバモイルオキサン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０８－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１０９－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）オキセタン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１１０－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１１１－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１１２－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（１－メチルピペリジン－４－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１１３－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１１４－Ｎ－［１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１１５－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（オキサン－４－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１１６－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１１７－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１１８－（２Ｒ）－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンア

ミド、
化合物１１９－（２Ｓ）－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１２０－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（オキサン－４－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１２１－（２Ｒ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物１２２－２－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸、
化合物１２３－２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸、
化合物１２４－Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１２５－（２Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１２６－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１２７－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１２８－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１２９－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１３０－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物１３１－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１３２－Ｎ－（３，３－ジフルオロピペリジン－４－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１３３－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（シクロプロピルメチル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１３４－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物１３５－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１３６－（２Ｒ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物１３７－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物１３８－（２Ｓ，３Ｒ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシブタンアミド、
化合物１３９－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝プロパンアミド、
化合物１４０－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－（２－メタンスルホンアミドエチ

ル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１４１－（２Ｓ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１４２－（２Ｓ，３Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物１４３－（２Ｓ）－２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物１４４－５－（シクロペンチルメトキシ）－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１４５－２－｛［５－（シクロペンチルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－２－メチルプロパンアミド、
化合物１４６－５－［（１－シアノシクロプロピル）メトキシ］－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１４７－Ｎ－［１，３－ジヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロパン－２－イル］－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１４８－（２Ｓ）－２－（｛５－［（１－シアノシクロプロピル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物１４９－（２Ｓ，３Ｒ）－３－ヒドロキシ－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物１５０－Ｎ－（２，２－ジフルオロエチル）－２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１５１－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５２－Ｎ－［（３Ｒ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１５３－Ｎ－［（３Ｓ）－１－（２－ヒドロキシエチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１５４－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５５－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５６－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５８－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキサン－

４－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１５９－５－（シクロブチルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６０－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－４－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１６１－５－（シクロプロピルメトキシ）－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６２－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１６３－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６４－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－２－メチル－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６５－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－（シクロプロピルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６６－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６７－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（オキセタン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１６８－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１６９－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７０－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７１－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７２－３－ヒドロキシ－２－［（５－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］－２－メチルプロパンアミド、
化合物１７３－２－｛［５－（シクロブチルメトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物１７４－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１７５－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－５－｛［２－（ジフルオロメチル）フェニル］メトキシ｝－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７６－５－｛［２－（ジフルオロメチル）フェニル］メトキシ｝－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾ

ール－３－カルボキサミド、
化合物１７７－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７８－Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１７９－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１８０－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１８１－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（５－メチルピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１８２－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１８３－２－メチル－Ｎ－［３－（メチルカルバモイル）オキソラン－３－イル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１８４－３－ヒドロキシ－Ｎ，Ｎ，２－トリメチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１８５－３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１８６－Ｎ－［３－（ジメチルカルバモイル）オキソラン－３－イル］－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｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物１８７－２－｛［５－（２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル］ホルムアミド｝－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物１８８－２－（｛２－エチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物１８９－２－（ヒドロキシメチル）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物１９０－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１９１－２－［（５－｛［２－（ジフルオロメチル）フェニル］メトキシ｝－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物１９２－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－［（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｝－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、
化合物１９３－３－ヒドロキシ－Ｎ，Ｎ，２－トリメチル－２－［（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｝－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド、

化合物１９４－２－（｛５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド、
化合物１９５－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２－（プロパン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド、
化合物１９６－３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（３－メチルシクロブチル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロペンアミド、
化合物１９７－５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸、
化合物１９８－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸、
化合物１９９－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸、
化合物２００－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－５－｛［２－（ジフルオロメチル）フェニル］メトキシ｝－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０１－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０２－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０３－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０４－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（２，２，２－トリフルオロエチル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０５－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０６－Ｎ－［（１Ｈ－イミダゾール－２－イル）メチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０７－Ｎ－［３－（ジメチルアミノ）－２，２－ジメチルプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０８－Ｎ－（２，２－ジフルオロ－２－フェニルエチル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２０９－Ｎ－｛［２－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）フェニル］メチル｝－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１０－Ｎ－｛［３－（ジフルオロメトキシ）フェニル］メチル｝－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１１－Ｎ－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１２－Ｎ－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１３－Ｎ－（５，５－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－

カルボキサミド、
化合物２１４－Ｎ－（５，５－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１５－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－Ｎ－（ピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１６－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（ピロリジン－３－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１７－Ｎ－［３，３－ジフルオロ－１－（ヒドロキシメチル）シクロブチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２１８－３－［（１－｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝エテニル）アミノ］－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－オール、
化合物２１９－Ｎ－［５－（ヒドロキシメチル）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキサン－５－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２０－Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）－２－ヒドロキシエチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２１－Ｎ－［２－ヒドロキシ－１－（ピリジン－２－イル）エチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２２－Ｎ－［３－（トリフルオロメチル）ピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２３－Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）－３－ヒドロキシプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２４－２－（９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，３Ｈ，４Ｈ，５Ｈ－［１，４］ジアゼピノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン－２－イル）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物２２５－２－（９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン－２－イル）－３－ヒドロキシプロパンアミド、
化合物２２６－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２７－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－［４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）ブタン－２－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２８－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２２９－Ｎ－［１－（ジメチルアミノ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３０－Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－メトキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３１－Ｎ－（４－フルオロ－１－ヒドロキシ－４－メチルペンタン－２－イル）

－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３２－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチル－３－オキソブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３３－４，４－ジフルオロ－２－（ヒドロキシメチル）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物２３４－４－フルオロ－２－（ヒドロキシメチル）－２－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物２３５－Ｎ－［２，２－ジフルオロ－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３６－Ｎ－［トランス－２－（ジフルオロメチル）－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３７－Ｎ－［シス－２－（ジフルオロメチル）－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３８－Ｎ－［１－（１－シクロプロピル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）－２－ヒドロキシエチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２３９－Ｎ－［１－ヒドロキシ－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）プロパン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４０－４－ヒドロキシ－３－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド、
化合物２４１－Ｎ－［２－ヒドロキシ－１－（オキサン－４－イル）エチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４２－Ｎ－｛１－ヒドロキシ－３－［２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール－１－イル］プロパン－２－イル｝－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４３－Ｎ－［１－ヒドロキシ－３－（ピリミジン－２－イル）プロパン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４４－Ｎ－［３，３－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（（ピリジン－２－イル））プロパン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４５－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－２－ヒドロキシブチル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４６－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－［トランス－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－３－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４７－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－［シス－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－３－イル］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４８－Ｎ－［３－（２，２－ジフルオロエチル）ピペリジン－３－イル］－２－

メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２４９－Ｎ－（２－ジフルオロメチル－１－ヒドロキシプロパン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５０－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（３，３－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５１－Ｎ－［２－ヒドロキシ－１－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）エチル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５２－Ｎ－［１－ヒドロキシ－３－（ピリジン－２－イル）プロパン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５３－Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５４－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５５－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５６－９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン、
化合物２５７－９－（ベンジルオキシ）－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン、
化合物２５８－Ｎ－（１－ヒドロキシ－３－メトキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２５９－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、
化合物２６０－２－（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）－９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン、
化合物２６１－９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－（２－ヒドロキシエチル）－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン、
化合物２６２－Ｎ－（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）－５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド、

【０１１１】

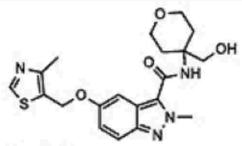
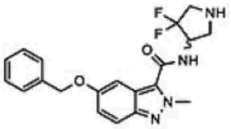
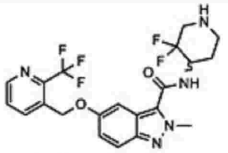
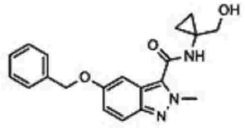
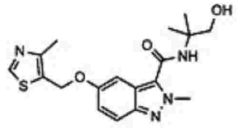
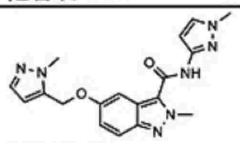
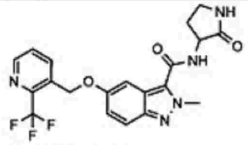
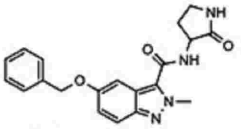
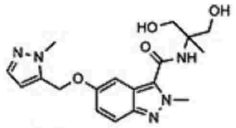
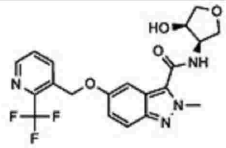
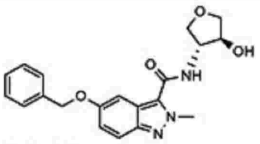
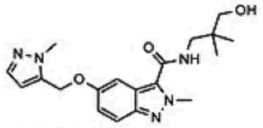
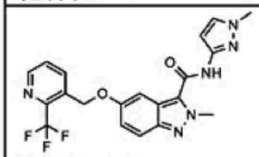
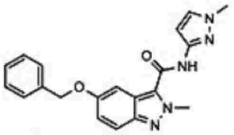
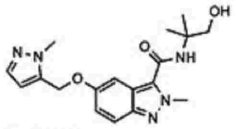
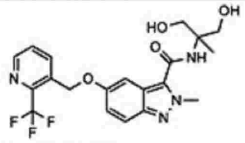
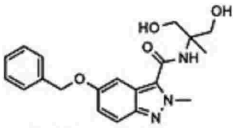
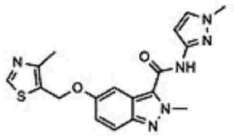
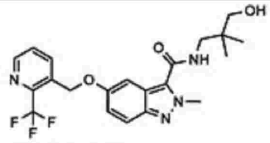
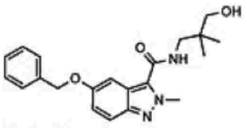
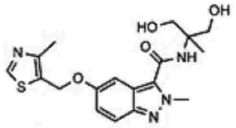
本発明によるインダゾール誘導体は、好ましくは、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される疼痛の治療に使用するためのものである。より好ましくは、疼痛は、術後疼痛である。本発明によるインダゾール誘導体はまた、てんかんの治療に使用するためのものである。

【０１１２】

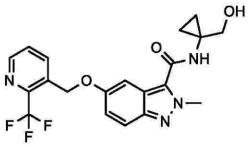
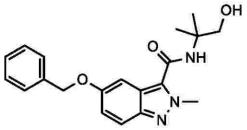
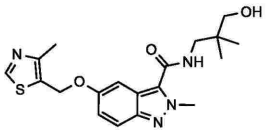
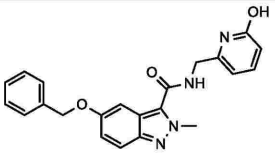
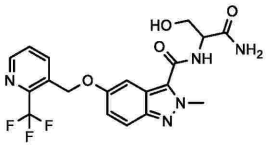
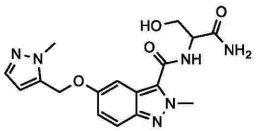
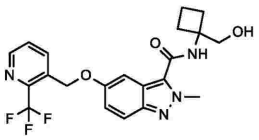
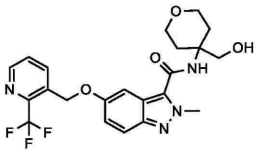
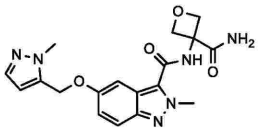
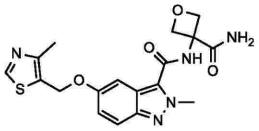
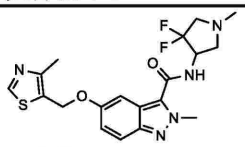
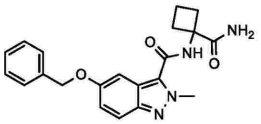
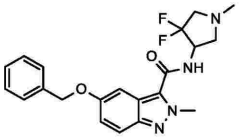
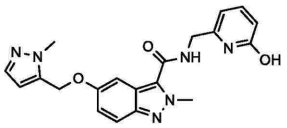
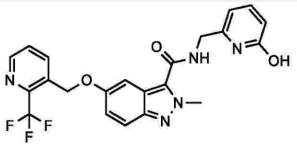
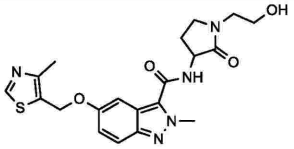
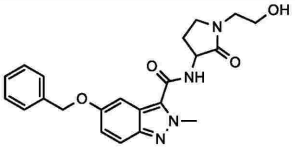
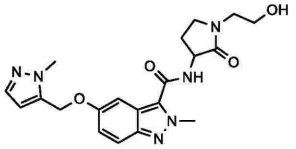
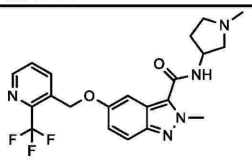
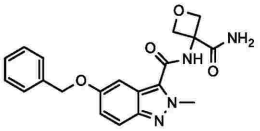
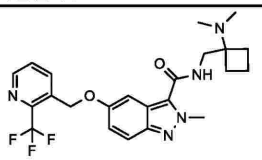
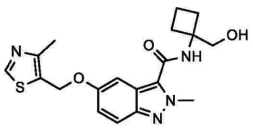
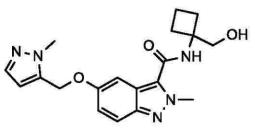
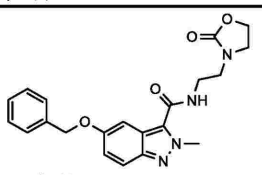
いくつかの実施形態では、インダゾール誘導体は、その立体異性体及び薬学的に許容される塩を含む、以下の表１に示される化合物１～２６２からなる群から選択される。

【表１－１】

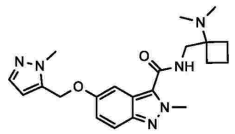
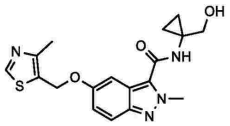
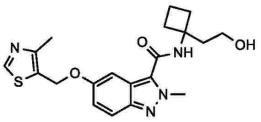
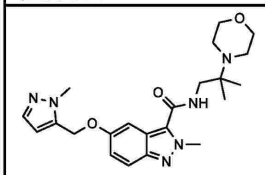
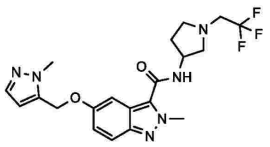
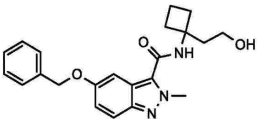
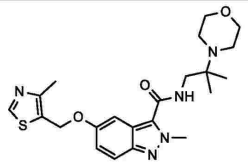
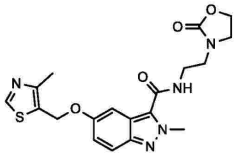
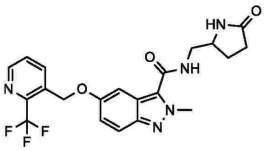
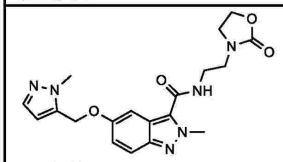
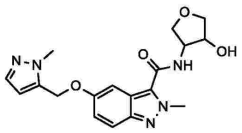
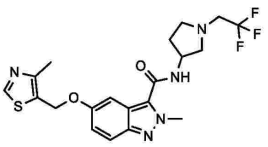
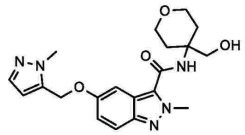
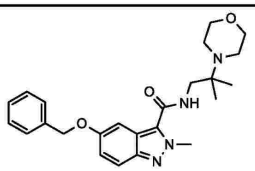
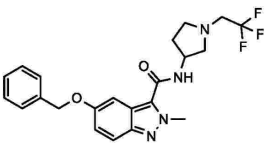
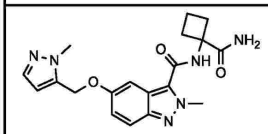
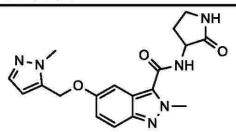
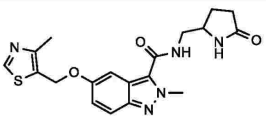
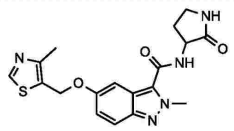
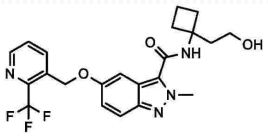
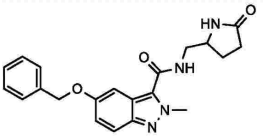
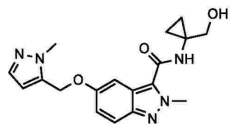
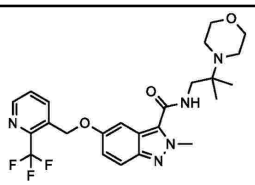
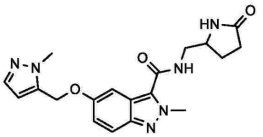
表１：例示的なインダゾール誘導体

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

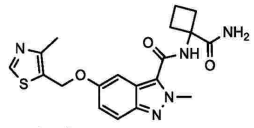
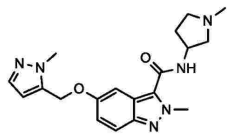
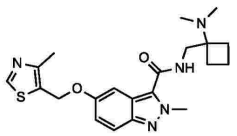
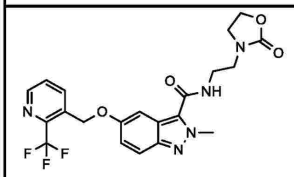
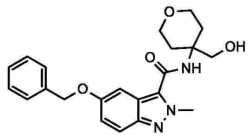
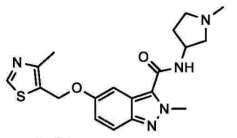
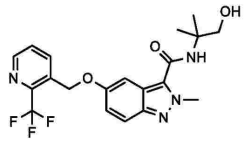
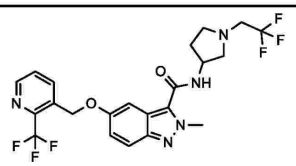
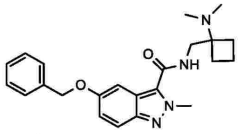
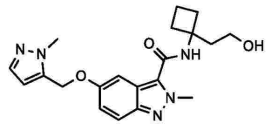
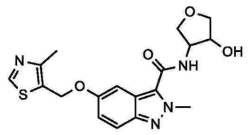
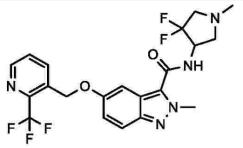
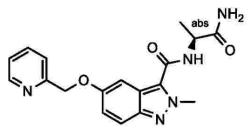
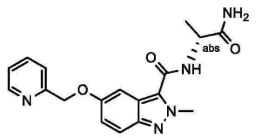
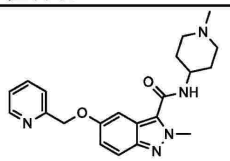
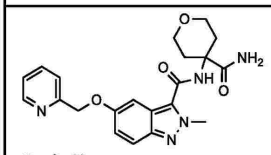
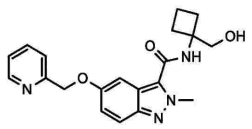
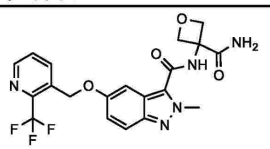
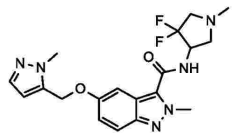
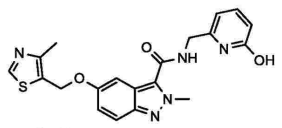
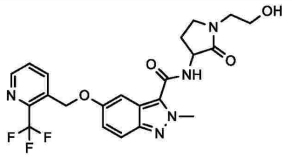
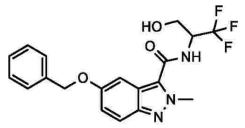
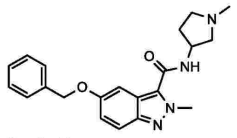
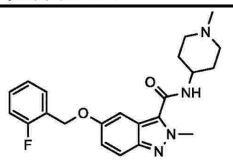
【表１－２】

 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
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036
 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042
 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045

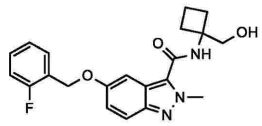
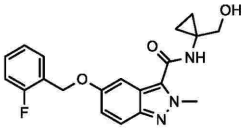
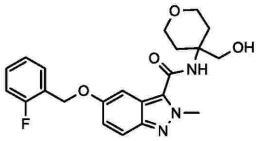
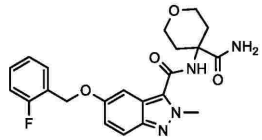
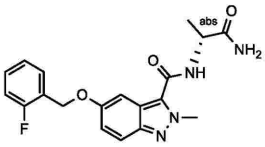
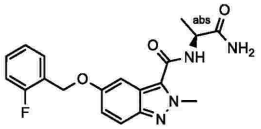
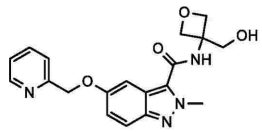
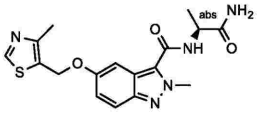
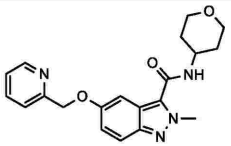
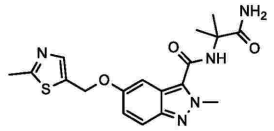
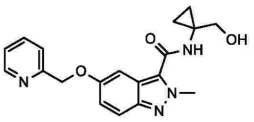
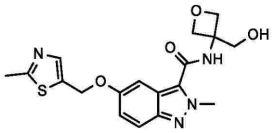
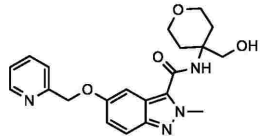
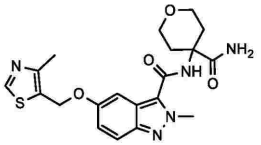
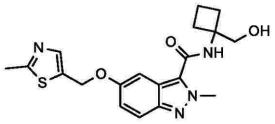
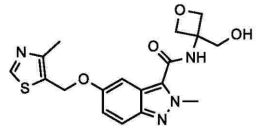
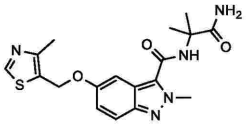
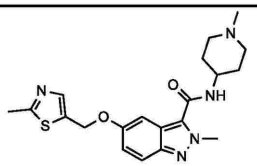
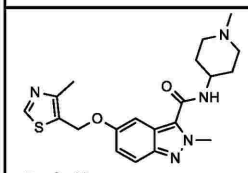
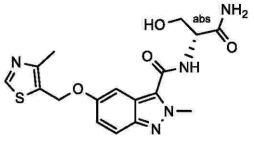
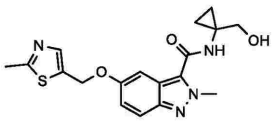
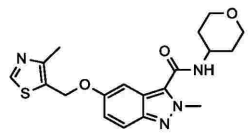
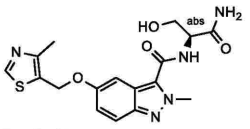
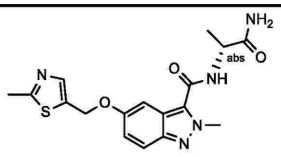
【表１－３】

 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048
 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051
 化合物 052	 化合物 053	 化合物 054
 化合物 055	 化合物 056	 化合物 057
 化合物 058	 化合物 059	 化合物 060
 化合物 061	 化合物 062	 化合物 063
 化合物 064	 化合物 065	 化合物 066
 化合物 067	 化合物 068	 化合物 069

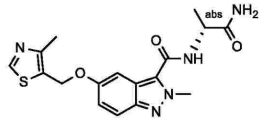
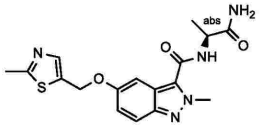
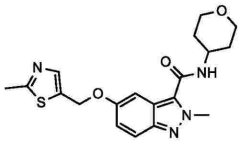
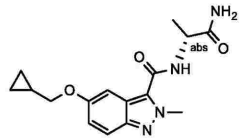
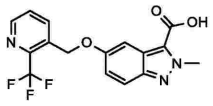
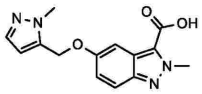
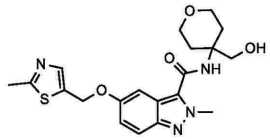
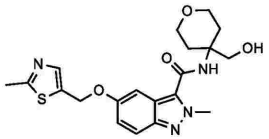
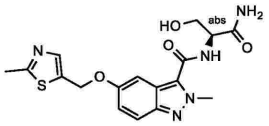
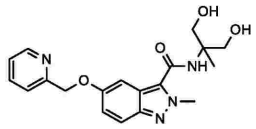
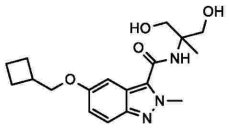
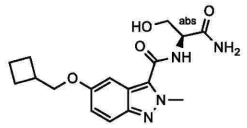
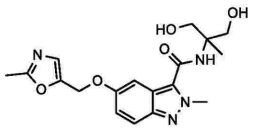
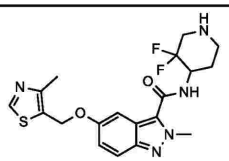
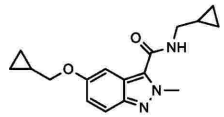
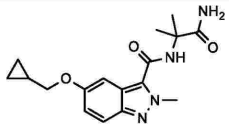
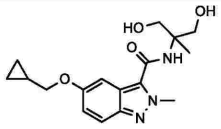
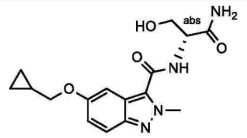
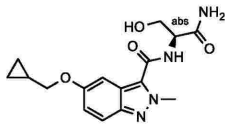
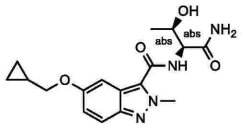
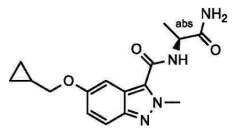
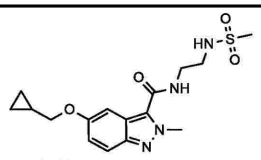
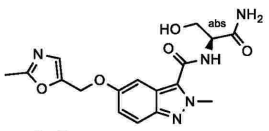
【表１－４】

 化合物 070	 化合物 071	 化合物 072
 化合物 073	 化合物 074	 化合物 075
 化合物 076	 化合物 077	 化合物 078
 化合物 079	 化合物 080	 化合物 081
 化合物 082	 化合物 083	 化合物 084
 化合物 085	 化合物 086	 化合物 087
 化合物 088	 化合物 089	 化合物 090
 化合物 091	 化合物 092	 化合物 093

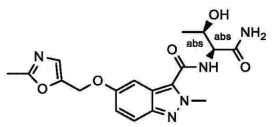
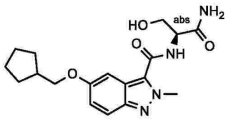
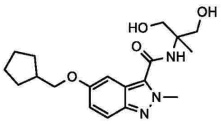
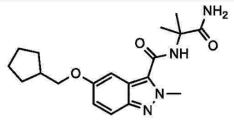
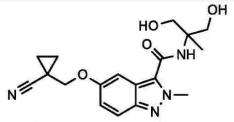
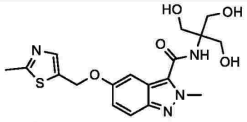
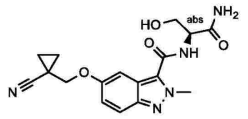
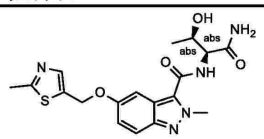
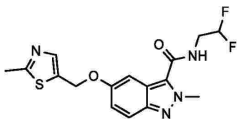
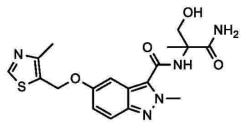
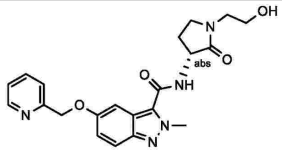
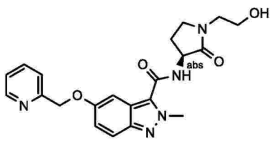
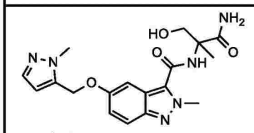
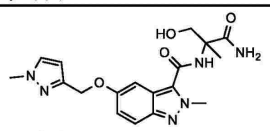
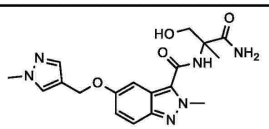
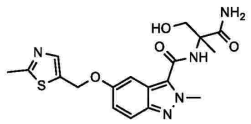
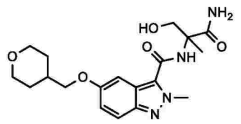
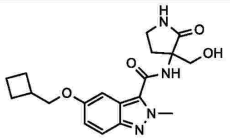
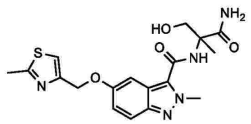
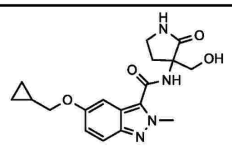
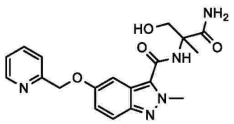
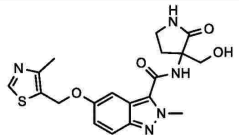
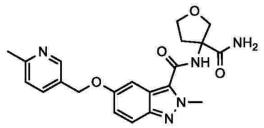
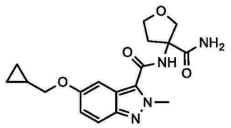
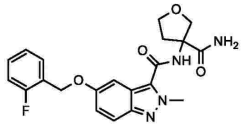
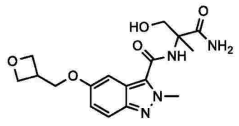
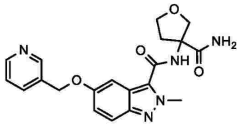
【表１－５】

 化合物 094	 化合物 095	 化合物 096
 化合物 097	 化合物 098	 化合物 099
 化合物 100	 化合物 101	 化合物 102
 化合物 103	 化合物 104	 化合物 105
 化合物 106	 化合物 107	 化合物 108
 化合物 109	 化合物 110	 化合物 111
 化合物 112	 化合物 113	 化合物 114
 化合物 115	 化合物 116	 化合物 117

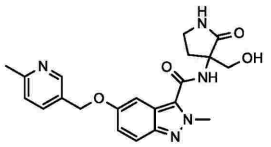
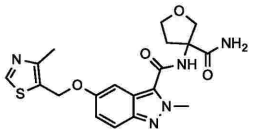
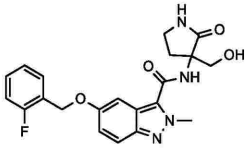
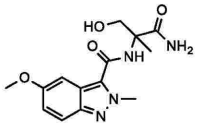
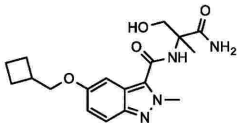
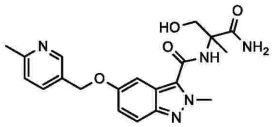
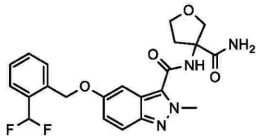
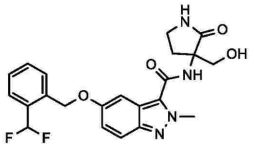
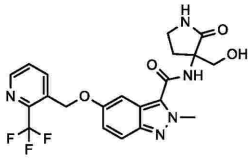
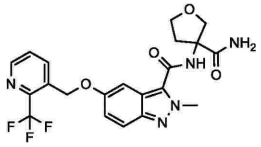
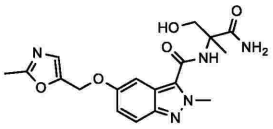
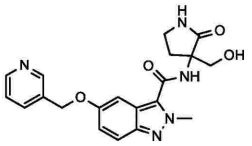
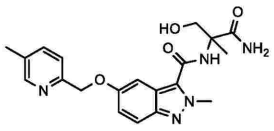
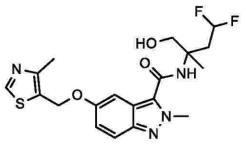
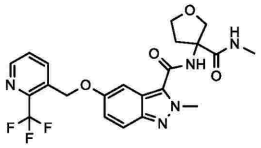
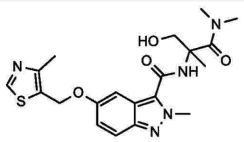
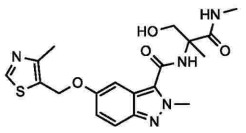
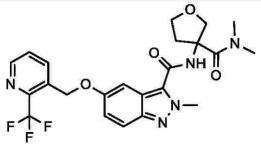
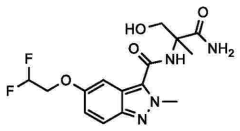
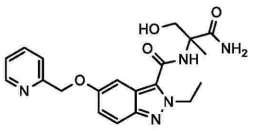
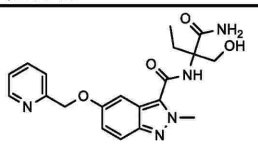
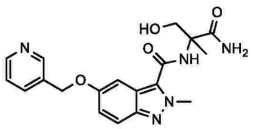
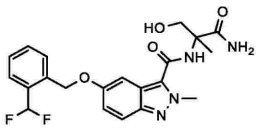
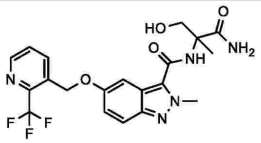
【表１－６】

 化合物 118	 化合物 119	 化合物 120
 化合物 121	 化合物 122	 化合物 123
 化合物 124	 化合物 125	 化合物 126
 化合物 127	 化合物 128	 化合物 129
 化合物 130	 化合物 131	 化合物 132
 化合物 133	 化合物 134	 化合物 135
 化合物 136	 化合物 137	 化合物 138
 化合物 139	 化合物 140	 化合物 141

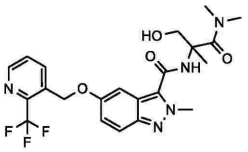
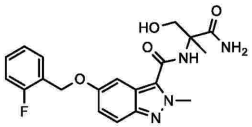
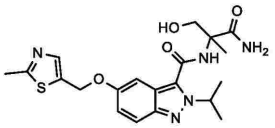
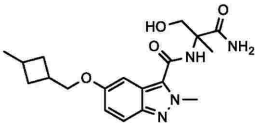
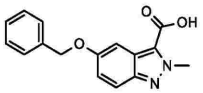
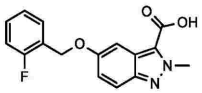
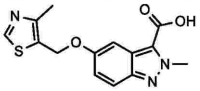
【表１－７】

 化合物 142	 化合物 143	 化合物 144
 化合物 145	 化合物 146	 化合物 147
 化合物 148	 化合物 149	 化合物 150
 化合物 151	 化合物 152	 化合物 153
 化合物 154	 化合物 155	 化合物 156
 化合物 157	 化合物 158	 化合物 159
 化合物 160	 化合物 161	 化合物 162
 化合物 163	 化合物 164	 化合物 165
 化合物 166	 化合物 167	 化合物 168

【表１－８】

 化合物 169	 化合物 170	 化合物 171
 化合物 172	 化合物 173	 化合物 174
 化合物 175	 化合物 176	 化合物 177
 化合物 178	 化合物 179	 化合物 180
 化合物 181	 化合物 182	 化合物 183
 化合物 184	 化合物 185	 化合物 186
 化合物 187	 化合物 188	 化合物 189
 化合物 190	 化合物 191	 化合物 192

【表１－９】

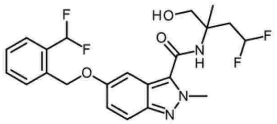
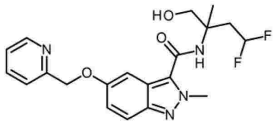
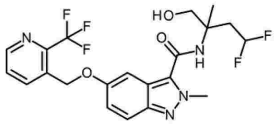
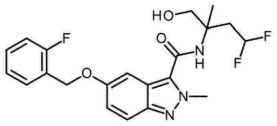
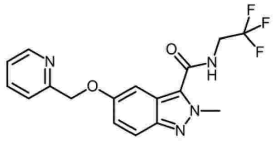
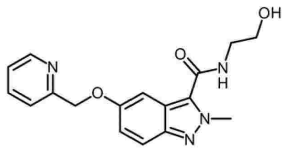
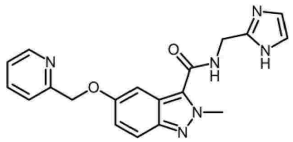
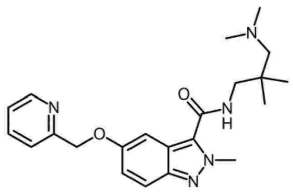
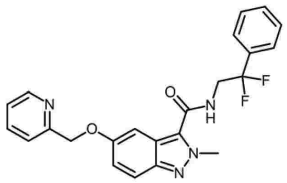
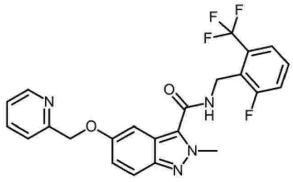
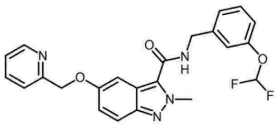
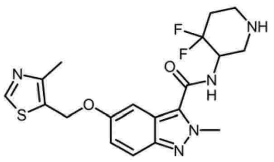
 化合物 193	 化合物 194	 化合物 195
 化合物 196	 化合物 197	 化合物 198
 化合物 199		

【０１１３】

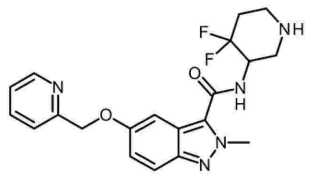
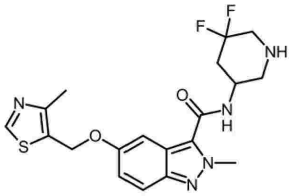
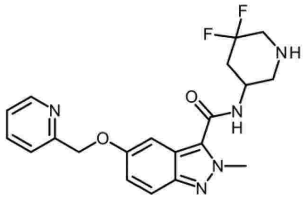
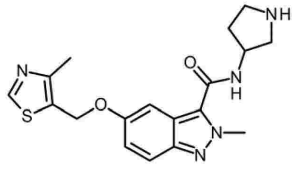
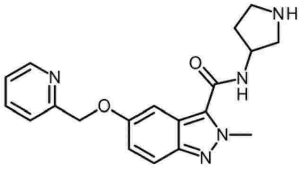
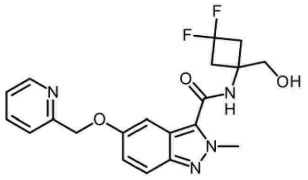
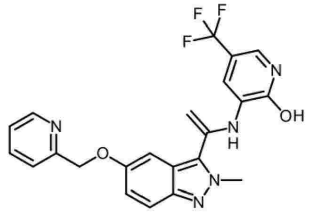
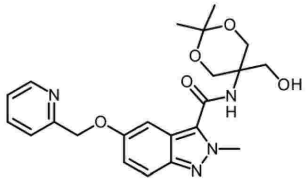
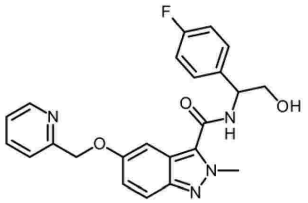
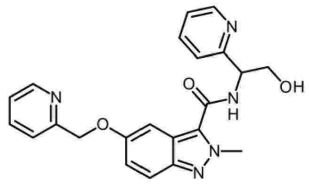
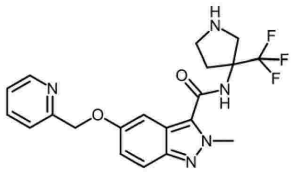
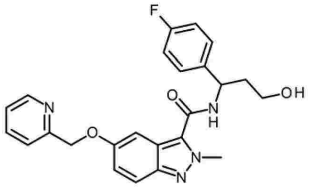
いくつかの実施形態では、インダゾール誘導体は、その立体異性体及び薬学的に許容される塩を含む、以下の表２に示される化合物２００～２６２からなる群から選択される。

【表２－１】

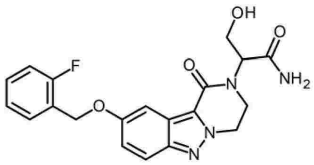
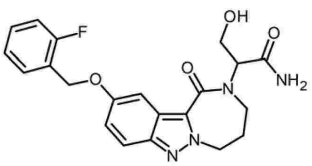
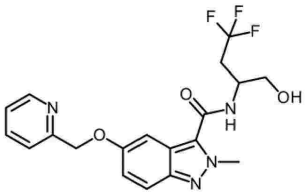
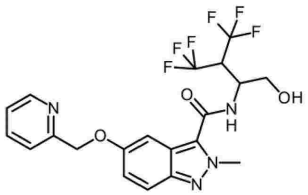
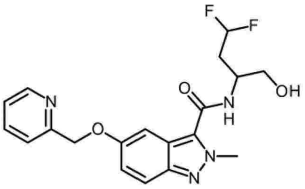
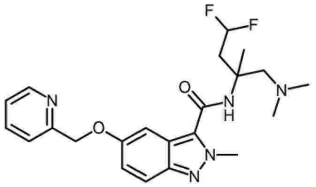
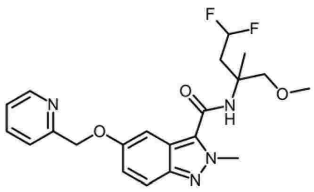
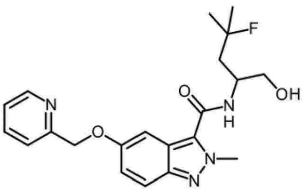
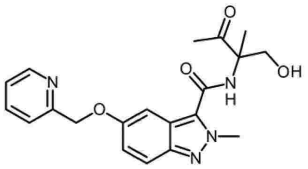
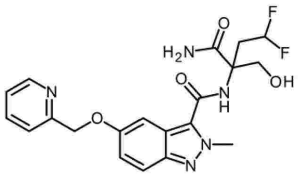
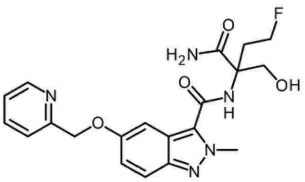
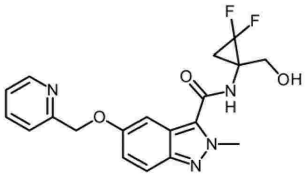
表２：例示的なインダゾール誘導体

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 200**	 **化合物 201**	 **化合物 202**
 **化合物 203**	 **化合物 204**	 **化合物 205**
 **化合物 206**	 **化合物 207**	 **化合物 208**
 **化合物 209**	 **化合物 210**	 **化合物 211**

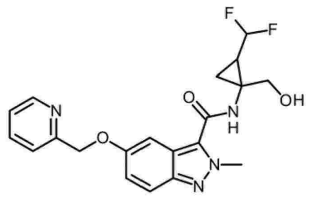
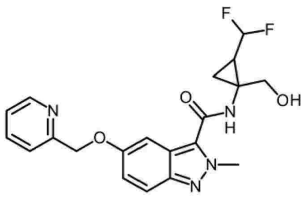
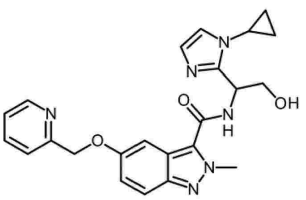
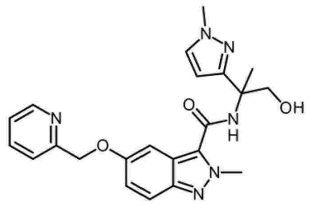
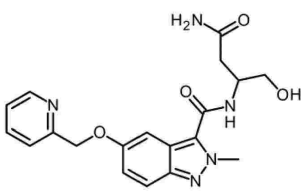
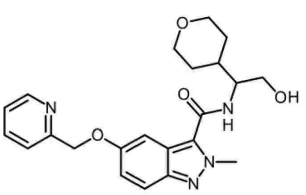
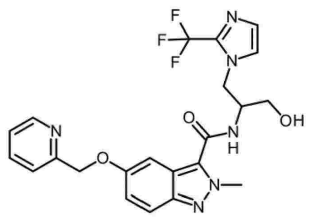
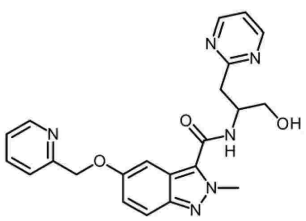
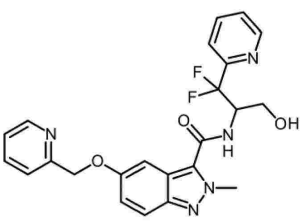
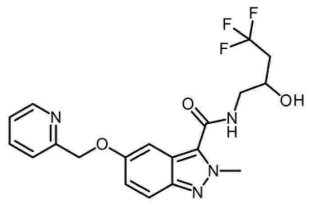
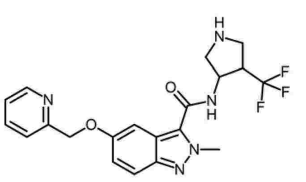
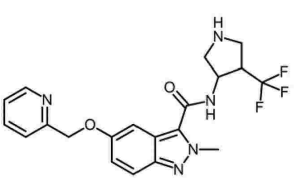
【表２－２】

 化合物 212	 化合物 213	 化合物 214
 化合物 215	 化合物 216	 化合物 217
 化合物 218	 化合物 219	 化合物 220
 化合物 221	 化合物 222	 化合物 223

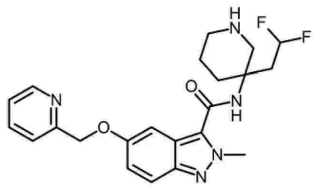
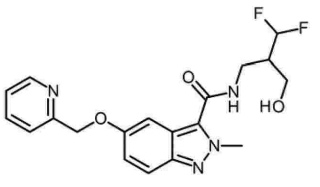
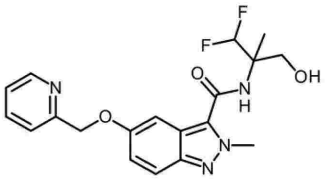
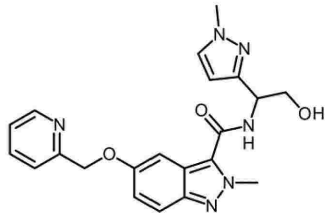
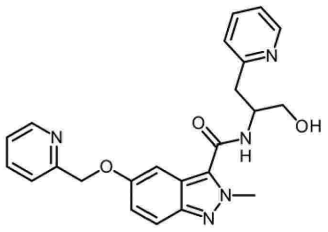
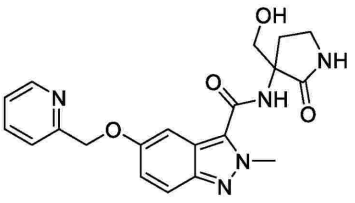
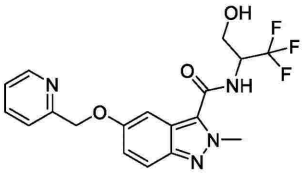
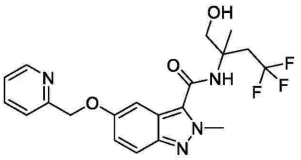
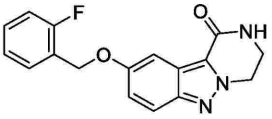
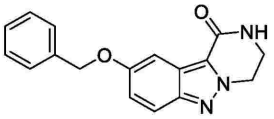
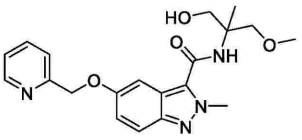
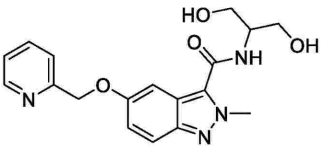
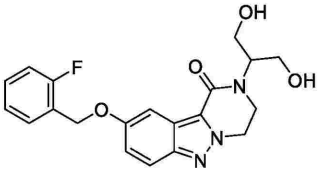
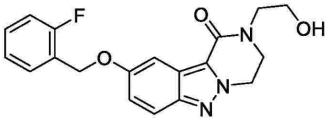
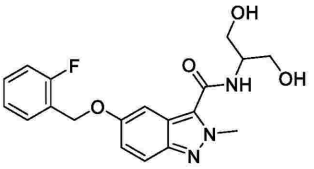
【表２－３】

 化合物 224	 化合物 225	 化合物 226
 化合物 227	 化合物 228	 化合物 229
 化合物 230	 化合物 231	 化合物 232
 化合物 233	 化合物 234	 化合物 235

【表２－４】

 化合物 236(トランス異性体)	 化合物 237(シス異性体)	 化合物 238
 化合物 239	 化合物 240	 化合物 241
 化合物 242	 化合物 243	 化合物 244
 化合物 245	 化合物 246(トランス異性体)	 化合物 247(シス異性体)

【表２－５】

 化合物 248	 化合物 249	 化合物 250
 化合物 251	 化合物 252	 化合物 253
 化合物 254	 化合物 255	 化合物 256
 化合物 257	 化合物 258	 化合物 259
 化合物 260	 化合物 261	 化合物 262

【０１１４】

開示された置換基を含むＱ、Ｔ、Ｕ、Ｖ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{5}’、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}の全ての定義、実施形態、及び意味はまた、（ａ－１）、（ａ－２）、（ａ－３）、（ｂ－１）、（ｂ－２）、及び（ｂ－３）を含むがこれらに限定されない、本発明によるインダゾール誘導体にも同様に適用するが、これらは必ずしも疼痛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、インダゾール誘導体自体、インダゾール誘導体を含む組成物、インダゾール誘導体を含む医薬、並びに疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんなどのＴＲＰＭ３媒介性障害の予防及び／若しくは治療に使用するための、及び／又は疼痛及び／若しくは炎症性過敏症及び／若しくはてんかんに対抗するためのインダゾール誘導体に関する。好ましくは、疼痛は、侵

害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛から選択される。より好ましくは、疼痛は、術後疼痛である。

【０１１５】

本発明のいくつかの実施形態では、インダゾール誘導体は、上述の化合物００１～化合物１９９、及びその生理学的に許容される塩からなる群から選択される。

【０１１６】

本発明のいくつかの実施形態では、インダゾール誘導体は、上述の化合物２００～化合物２６２、及びその生理学的に許容される塩からなる群から選択される。

【０１１７】

本発明の別の態様は、上記の本発明による化合物を含む医薬組成物又は医薬に関する。

【０１１８】

本明細書全体を通して、「一実施形態（ｏｎｅ　ｅｍｂｏｄｉｍｅｎｔ）」又は「一実施形態（ａｎ　ｅｍｂｏｄｉｍｅｎｔ）」への言及は、その実施形態に関連して説明される特定の特徴、構造、又は特性が、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、本明細書における様々な場所における「一実施形態では（ｉｎ　ｏｎｅ　ｅｍｂｏｄｉｍｅｎｔ）」又は「一実施形態では（ｉｎ　ａｎ　ｅｍｂｏｄｉｍｅｎｔ）」という語句の出現は、必ずしも全てが同じ実施形態に対して言及しているとは限らないが、その可能性がある。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であろうように、任意の好適な様式で組み合わせられ得る。また、本発明の態様について説明される実施形態は、本発明の別の態様に使用され得、組み合わせることができる。単数名詞を指す場合に、不定冠詞又は定冠詞が使用される場合（例えば、「ａ」又は「ａｎ」、「ｔｈｅ」）、別段の定めがない限り、これは、その名詞の複数形を含む。

【０１１９】

同様に、本発明の例示的な実施形態の説明では、本発明の様々な態様は、本開示を合理化し、様々な本発明の態様のうちの１つ以上の理解を助ける目的で、単一の実施形態、図、又はそれらの説明において一緒にグループ化されることがあることを理解されたい。

【０１２０】

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。

【０１２１】

本明細書で使用される「脱離基」又は「ＬＧ」という用語は、求核剤によって置換されやすい、又は塩基性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。特定の実施形態では、脱離基は、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。

【０１２２】

「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。保護基の化学的部分構造は多種多様である。保護基の１つの機能は、親薬物物質の合成における中間体として機能することにある。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。参照：“Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ　Ｇｒｏｕｐｓ　ｉｎ　Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，Ｔｈｅｏｄｏｒａ　Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ（Ｊｏｈｎ　Ｗｉｌｅｙ　＆　Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，Ｎｅｗ　Ｙｏｒｋ，１９９１。保護基は多くの場合、特定の官能基の反応性を隠し、例えば、順序的かつ計画された様式で化学結合を作製及び破壊するなど、所望の化学反応の効率を支援するために利用される。化合物の官能基の保護は、保護された官能基の反応性以外の他の物理的特性、例えば極性、親油性（疎水性）、及び一般的な分析ツールによって測定され得る他の特性などを変化させる。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。

【０１２３】

保護された化合物はまた、インビトロ及びインビボで変更された特性を示し得、場合によっては、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、親薬剤をプロドラッグに変換することであり、それによって、親薬剤は、インビボでのプロドラッグの変換される際に放出される。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効力を有し得る。保護基は、化学中間体の場合インビトロで、又はプロドラッグの場合インビボでのいずれかで除去される。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、一般的に、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。

【０１２４】

本明細書で使用される「ヘテロ原子」という用語は、四級化され得る若しくは酸化物として存在できる窒素、酸素、並びにスルホキシド及びスルホンを含む酸化硫黄、及び場合によってはスルホネートを含む硫黄から選択される原子を意味する。場合によっては、化合物及び／又は合成中間体は、ホウ素、リン、及びケイ素などのヘテロ原子を含み得る。

【０１２５】

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含む。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、ノルマル、二級又は三級、線状又は分岐状炭化水素を意味する。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－ブチルである。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、ノルマル、二級又は三級、線状又は分岐状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$_2$ＣＨ＝ＣＨ$_2$）、及び５－ヘキセニル（－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$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ってもよい。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、ノルマル、二級、三級、線状又は分岐状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$_2$Ｃ≡ＣＨ）が挙げられるが、これらに限定されない。

【０１２６】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和アルキレン」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含む。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、線状又は分岐鎖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$_2$－）、１，２－エチル（－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－）、１，３－プロピル（－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－）、１，４－ブチル（－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－）などが挙げられるが、これらに限定されない。本明細書で使用される「アルケニレン」という用語は、不飽和の少なくとも１つの部位（通常は１～３つ、好ましくは１つ）、すなわち炭素－炭素、ｓｐ２二重結合を有する、親アルケンの同じ又は２個の異なる炭素原子から２個の水素原子を除去することによって得られる２つの一価ラジカル中心を有する、線状又は分岐鎖炭化水素ラジカルを意味する。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、線状又は分岐鎖炭化水素ラジカルを意味する。

【０１２７】

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、ヘテロアルケニニル（ｈｅｔｅｒｏａｌｋｅｎｙｎｙｌ）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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、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ている、線状又は分岐鎖アルキルを意味するが、当該鎖が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、本発明のインダゾール誘導体中のヘテロアルキル基は、安定した化合物をもたらすであろう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、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ている、線状又は分岐鎖アルケニルを意味するが、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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、線状又は分岐鎖アルキニルを意味するが、当該鎖が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。

【０１２８】

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、ヘテロアルケニニレン（ｈｅｔｅｒｏａｌｋｅｎｙｎｙｌｅｎｅ）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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、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ている、線状又は分岐鎖アルキレンを意味するが、当該鎖が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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、線状又は分岐鎖アルケニレンを意味するが、当該鎖が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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、線状又は分岐鎖アルキニレンを意味するが、当該鎖が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。

【０１２９】

本明細書で使用される「飽和又は不飽和シクロアルキル」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包含する。本明細書で使用される「シクロアルキル」という用語は、特に明記されていない限り、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、アダマンチルなどの飽和環状炭化水素ラジカルを意味する。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。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ってもよい。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。一例としては、シクロヘプタ－１－インである。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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、ヘテロアリールとみなされる。

【０１３０】

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、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、飽和ヘテロシクロアルキル、並びに不飽和非芳香族ヘテロシクロアルキルを包含する。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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、「シクロアルキル」を意味するが、当該鎖が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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、「ヘテロシクロアルケニル」を意味するが、当該鎖が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、１個以上の炭素原子（通常は１個、２個、又は３個）が、酸素、窒素、又は硫黄原子によって置き換えられている、「ヘテロシクロアルキニル」を意味するが、当該鎖が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、イソオキサリジン、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）、特に第１章、第３章、第４章、第６章、第７章、及び第９章、“Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍ

ｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０～現在）、特に第１３巻、第１４巻、第１６巻、第１９巻、及び第２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ．“Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）、及び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、典型的には炭素を介して結合される。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、窒素又は炭素を介して結合され得る。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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、ヘテロアリールとみなされる。

【０１３１】

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、１環、又は一緒になって縮合された２環若しくは３環の、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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、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、コア構造に結合している環に関係なく、ヘテロアリールとみなされる。

【０１３２】

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つのヘテロ原子、すなわち、Ｎ、Ｏ、又はＳを芳香族環系の環員として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、ベンゾアゾール、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］ピリミジンが挙げられるが、これらに限定されない。

【０１３３】

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、ピラゾール、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。

【０１３４】

炭素結合複素環としては、２－ピリジル、３－ピリジル、４－ピリジル、５－ピリジル、６－ピリジル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、５－ピリダジニル、６－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、６－ピリミジニル、

２－ピラジニル、３－ピラジニル、５－ピラジニル、６－ピラジニル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、又は５－チアゾリルが挙げられる。例として、窒素結合複素環は、アジリジン、アゼチジン、ピロール、ピロリジン、２－ピロリン、３－ピロリン、イミダゾール、イミダゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、ピラゾール、ピラゾリン、２－ピラゾリン、３－ピラゾリン、ピペリジン、ピペラジン、インドール、インドリン、１Ｈ－インダゾール、の１位、イソインドール又はイソインドリンの２位、モルホリンの４位、及びカルバゾール又はβ－カルボリンの９位に結合される。窒素結合複素環としては、１－アジリジル、１－アゼテジル（ａｚｅｔｅｄｙｌ）、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）、特に第１章、第３章、第４章、第６章、第７章、及び第９章、“Ｔｈｅ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ，Ａ ｓｅｒｉｅｓ ｏｆ Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｓ”（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９５０～現在）、特に第１３巻、第１４巻、第１６巻、第１９巻、及び第２８巻、Ｋａｔｒｉｔｚｋｙ，Ａｌａｎ Ｒ．，Ｒｅｅｓ，Ｃ．Ｗ．ａｎｄ Ｓｃｒｉｖｅｎ，Ｅ.“Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”（Ｐｅｒｇａｍｏｎ Ｐｒｅｓｓ，１９９６）、及びＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．（１９６０）８２：５５６６に記載されている。

【０１３５】

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ていることを意味する。例えば、－Ｆで多置換され得る－Ｃ$_{1-6}$－アルキルは、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＨ$_2$ＣＦ$_3$、ＣＦ$_2$ＣＦ$_3$などを含む。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$_3$、－ＣＣｌＦＣＣｌ$_2$Ｆなどを含む。本発明の化合物中の複数の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。

【０１３６】

本明細書で使用される場合、特に明記されていない限り、「溶媒和物」という用語は、好適な無機溶媒（例えば、水和物）又はアルコール、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、有機溶媒との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。

【０１３７】

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。

【０１３８】

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意味する。

【０１３９】

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。

【０１４０】

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拮抗作用を産生することができる化合物を指す。一般的に、「アンタゴニスト」及び「阻害剤」は、ＴＲＰＭ３を調節するものと理解され得る。

【０１４１】

本発明の目的のために、「ＴＲＰＭ３調節された」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イオンチャネルの調節によって影響を受ける状態を指すために使用される。

【０１４２】

本明細書で使用される「ＴＲＰＭ３媒介性障害」という用語は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニスト又はモジュレーターの使用が、症状を予防、治療、（部分的に）緩和、又は改善する、疼痛及び炎症性過敏症状態、並びにてんかんからなる障害又は疾患を指す。国際疼痛研究協会（Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ Ａｓｓｏｃｉａｔｉｏｎ ｆｏｒ ｔｈｅ Ｓｔｕｄｙ ｏｆ Ｐａｉｎ）によると、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、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、かつ／又は熱的、機械的、及び／若しく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若しく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。

【０１４３】

本発明のインダゾール誘導体は、ＴＲＰＭ３のアンタゴニスト又はモジュレーターであることが示されているか、又はそうであると理解されており、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化合物、より具体的には、治療有効量の本発明のインダゾール誘導体を用いた対象におけるＴＲＰＭ３媒介性障害の予防又は治療における医薬として使用するための化合物を提供する。

【０１４４】

本発明の好ましい実施形態では、本発明のインダゾール誘導体は、治療のために投与される唯一の薬理学的に活性な化合物である。本発明の別の実施形態では、本発明のインダゾール誘導体は、ＴＲＰＭ３媒介性障害の治療又は予防のための他の治療剤と組み合わせて用いられ得る。したがって、本発明はまた、

－本明細書の式及び実施形態の１つ以上の化合物と、

－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と、を含む組成物の使用に関する。

【０１４５】

本発明による医薬組成物又は複合調製物は、意図される使用及び調製物の期待される効果に応じて、広範な含有量範囲にわたって本発明のインダゾール誘導体を含有し得る。一般に、組み合わせた調製物の本発明のインダゾール誘導体の含有量は、０．１～９９．９重量％、好ましくは１～９９重量％、より好ましくは５～９５重量％の範囲内である。

【０１４６】

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共同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、後者の状況では、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。

【０１４７】

当業者はまた、本発明のインダゾール誘導体が、とりわけ、それらの環境のｐＨに応じて、多くの異なるプロトン化状態で存在し得ることも認識するであろう。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。

【０１４８】

本明細書で使用される「薬学的に許容される塩」又は「生理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的に活性な非毒性塩形態を意味する。したがって、本発明の化合物は、任意選択的に、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。このような塩は、適切なカチオン、例えば、アルカリ金属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。本発明のインダゾール誘導体は、複数の正電荷又は負電荷を有し得る。本発明のインダゾール誘導体の正味電荷は、正又は負のいずれかであり得る。任意の関連する対イオンは、典型的には、化合物が得られる合成方法及び／又は単離方法によって決定される。典型的な対イオンとしては、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、トリフルオロ酢酸など、及びそれらの混合物が挙げられるが、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含む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）も含むことが意図される。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され得る。加えて、塩は、塩基性中心、典型的にはアミン、又は酸性基への、ある特定の有機酸及び無機酸の酸付加から形成され得る。かかる適切な酸の例としては、例えば、ヒドロハロゲン酸（ｈｙｄｒｏｈａｌｏｇｅｎ　ａｃｉｄ）、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、エタン二酸）、マロン酸、コハク酸（すなわち、ブタン二酸）、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、サリチル酸（すなわち、２－ヒドロキシ安息香酸）、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、本発明のインダゾール誘導体を、その非イオン化形態、並びに両性イオン形態、及び水和物として化学量論量の水との組み合わせで含むことを理解されたい。

【０１４９】

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との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、例えば、リジン、アルギニン、若しくはグルタミン酸などの塩基性若しくは酸性基、又はグリシン、セリン、トレオニン、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。

【０１５０】

本発明のインダゾール誘導体はまた、その生理学的に許容される塩を含む。本発明のインダゾール誘導体の生理学的に許容される塩の例としては、アルカリ金属（例えば、ナトリウム）、アルカリ土類（例えば、マグネシウム）、アンモニウム、及び$NX4^+$（式中

、Ｘは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルである）などの適切な塩基に由来する塩が挙げられる。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、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の塩が挙げられる。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に由来する形態であるか否かにかかわらず、本発明の範囲内である。

【０１５１】

本明細書で使用される「エナンチオマー」という用語は、特に明記されていない限り、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率（当該技術分野の標準的方法によって決定される）を有する、本発明のインダゾール誘導体の各個々の光学活性形態を意味する。

【０１５２】

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可能性のある、互変異性体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が、位置異性体は含まれない。典型的には、本明細書に示される構造は、化合物の１つの互変異性体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、基本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配置又はＳ配置のいずれかを有してもよく、多重結合は、シス配置又はトランス配置のいずれかを有してもよい。

【０１５３】

当該化合物の純粋な異性体形態は、同じ基本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％の立体異性体過剰率を有する化合物に関する。「エナンチオマー的に純粋な」及び「ジアステレオマー的に純粋な」という用語は、問題の混合物のエナンチオマー過剰率、それぞれジアステレオマー過剰率を考慮して、同様の方法で理解されるべきである。

【０１５４】

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。本発明のインダゾール誘導体の１つのエナンチオマーは、光学活性な分割剤を使用するジアステレオマーの形成などの方法により、その対向する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）Ｅ．Ｌ．Ｅｌｉｅｌ，ＭｃＧｒａｗ Ｈｉｌｌ，Ｌｏｃｈｍｕｌｌｅｒ，Ｃ．Ｈ．，（１９７５）Ｊ．Ｃｈｒｏｍａｔｏｇｒ．，１１３：（３）２８３－３０２）。混合物中の異性体の分離は、（１）キラル化合物によるイオン性ジアステレオマー塩の形成及び分別結晶化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こと、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、キニーネ、エフェドリン、ストリキニーネ、ａ－メチル－ｂ－フェニルエチルアミン（アンフェタミン）などのエナンチオマー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不斉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、分別結晶化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。あるいは、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てもよい（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、不斉化合物を、メチル誘導体などのエナンチオマー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を分離し及び加水分解することによって、遊離のエナンチオマー的に濃縮された化合物を得ることによって形成することができる。光学純度を決定する方法は、ラセミ混合物から、メンチルエステル又はモッシャーエステル、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）などのキラルエステルを作成し、によって精製して、２つのアトロプ異性ジアステレオマーの存在についてＮＭＲスペクトルを分析することが含まれる。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、順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）では、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する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、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た、ヘキサンなどである。（“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）。

【０１５５】

シス及びトランスという用語は、本明細書では、Ｃｈｅｍｉｃａｌ Ａｂｓｔｒａｃｔｓ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。

【０１５６】

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、分子が、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。

【０１５７】

本発明のインダゾール誘導体及びそれらの生理学的に許容される塩（以下、活性成分と

総称される）は、治療される状態に適した任意の経路、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。

【０１５８】

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の血漿レベルを確保する量に対応する。

【０１５９】

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。

【０１６０】

本発明は更に、本発明の１つ以上のインダゾール誘導体、より具体的には、本明細書に記載の全ての式（Ｉ）及び他の式及び実施形態、並びにそれらのより具体的な態様又は実施形態を含む（医薬）組成物を提供する。更に、本発明は、本発明の化合物又は（医薬）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、疼痛の治療に使用するために提供する。ＴＲＰＭ３媒介性障害は、疼痛並びに炎症性過敏症状態及びてんかんから選択される。

【０１６１】

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

【０１６２】

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、治療されるべき部位へのその適用又は散布を容易にするために、かつ／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、ダスト、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。

【０１６３】

当該医薬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、本発明内のそれらの選択に特に制限はない。それらはまた、湿潤剤、分散剤、ステッカー、接着剤、乳化剤、表面活性剤、溶媒、コーティング剤、抗菌剤及び抗真菌剤、等張剤などの添加剤も含み得るが、これらが薬学的実践に合致している、すなわち、哺乳動物に永久的な損傷を生じさせない担体及び添加剤であることを条件とする。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。

【０１６４】
インダゾール誘導体は単独で投与することが可能であるが、薬学的製剤としてそれらが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、そのための１つ以上の薬学的に許容される担体、及び任意選択的に他の治療成分とともに含む。担体は、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、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。このような方法は、活性成分を１つ以上の副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。

【０１６５】
経口投与に好適な本発明の製剤は、各々が所定量の活性成分を含有するカプセル、カシェ剤、又は錠剤などの個別の単位として、粉末若しくは顆粒として、水性液体若しくは非水性液体中の溶液若しくは懸濁液として、又は水中油型液体エマルション若しくは油中水型液体エマルションとして提示されてもよい。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。

【０１６６】
錠剤は、任意選択的に１つ以上の副成分とともに、圧縮又は成形することにより作成できる。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、又は分散剤と任意選択的に混合された、粉末又は顆粒などの自由流動形態での活性成分を、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、任意選択的に、コーティング又は刻み目付けされ得、錠剤中の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、活性成分を含有する局所軟膏又はクリームとして、任意選択的に適用される。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。あるいは、活性成分は、水中油型クリーム基剤を有するクリームに製剤化され得る。必要に応じて、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、望ましくは、皮膚又は他の影響を受ける領域を通る活性成分の吸収又は浸透を増強する化合物を含み得る。そのような皮膚浸透増強剤の例には、ジメチルスルホキシド及び関連する類似体が含まれる。

【０１６７】
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、エマルジェント（ｅｍｕｌｇｅｎｔ）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。任意選択的に、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。安定剤の有無にかかわらず、乳化剤は一緒に、いわゆる乳化ワックスを構成し、ワックスは、油及び脂肪と一緒になって、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。

【０１６８】
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、製剤に好適な油又は脂肪の選択は、所望の化粧品特性を達成することに基づく。したがって、クリームは、チューブ又は他の容器からの漏れを避けるために、好適な粘稠度を有するべたつかない、非汚染性及び洗浄可能な製品であるべきである。直鎖又は分岐鎖の、一又は二塩基性アルキルエステル、例えばジイソアジペート、ステアリン酸イソセチル、ヤシ脂肪酸の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、パルミチン酸２－エチルヘキシル、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。あるいは、白色軟質パラフィン及び／若しくは流動パラフィンなどの高融点脂質又は他の鉱油が、使用され得る。

【０１６９】

眼への局所投与に好適な製剤はまた、活性成分が適切な担体、特に活性成分のための水性溶媒中に溶解又は懸濁されている点眼薬を含む。活性成分は、任意選択的に、このような製剤中に、０．５～２０％、有利には０．５～１０％、特に約１．５ｗ／ｗ％の濃度で存在する。口内への局所投与に好適な製剤には、通常はスクロース及びアカシア又はトラガカントなどの着香基剤中に活性成分を含むロゼンジ；ゼラチン及びグリセリン、又はスクロース及びアカシアなどの不活性基剤中に活性成分を含むトローチ；並びに好適な液体担体中に活性成分を含む洗口液が含まれる。

【０１７０】

直腸投与用の製剤は、例えば、ココアバター又はサリシレートを含む好適な基剤を用いた坐薬として提示され得る。担体が固体である、経鼻投与のために好適な製剤は、嗅ぎたばこを吸う様式で、すなわち、鼻に近づけて維持した粉末の容器からの鼻腔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（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含む）を有する粗い粉末を含む。担体が液体であり、例えば、点鼻スプレーとして、又は点鼻薬としての投与のために好適な製剤は、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。

【０１７１】

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。

【０１７２】

非経口投与に好適な組成物には、抗酸化剤、緩衝剤、静菌剤、及び製剤を意図されるレシピエントの血液と等張にする溶質を含有し得る水性及び非水性滅菌注射液、並びに懸濁剤及び増粘剤を含み得る水性及び非水性滅菌懸濁液が含まれる。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、及び錠剤から調製することができる。

【０１７３】

好ましい単位用量製剤は、本明細書で上記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日単位副用量、又はその適切な部分を含有するものである。

【０１７４】

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。

【０１７５】

本発明のインダゾール誘導体を使用して、活性成分として、本発明の１つ以上のインダ

ゾール誘導体を含有する制御放出医薬製剤（「制御放出製剤」）を提供することができ、活性成分の放出は、より少ない頻度での投与を可能にするか、又は所与の本発明化合物の薬物動態若しくは毒性プロファイルを改善するように制御及び調節することができる。本発明の１つ以上のインダゾール誘導体を含む別個の単位で、経口投与に適合された制御放出製剤は、従来の方法に従って調製され得る。

【０１７６】

本発明の別の実施形態は、本発明のインダゾール誘導体の様々な前駆体又は「プロドラッグ」形態に関する。本発明のインダゾール誘導体を、それ自体は有意に生物学的活性ではないが、動物、哺乳動物、又はヒトに送達されたときに、体の正常な機能、特に、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、当該化学反応が、本明細書に定義される化合物を放出する効果を有する化学種の形態で製剤化することが望ましい場合がある。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。

【０１７７】

本発明のインダゾール誘導体のプロドラッグは、調合剤に適した任意の形態を有することができ、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、標的部位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、当該標的部位における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医薬成分の対応物は、当技術分野で知られているように、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し得る。

【０１７８】

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、「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、単一又は複数の生物学的変換によって、インビボで治療活性形態に変換され、過度の毒性、刺激、又はアレルギー反応なしに、意図された治療成果を達成するように改変された化合物」として本明細書で定義される。

【０１７９】

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、体内で自発的又は酵素変換反応を受けて、化合物の薬理学的に活性な形態を放出する、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。包括的な概説については、Ｒａｕｔｉｏ Ｊ．ｅｔ ａｌ．（“Ｐｒｏｄｒｕｇｓ：ｄｅｓｉｇｎ ａｎｄ ｃｌｉｎｉｃａｌ ａｐｐｌｉｃａｔｉｏｎｓ”Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ，２００８，ｄｏｉ：１０．１０３８／ｎｒｄ２４６８）を参照されたい。

【０１８０】

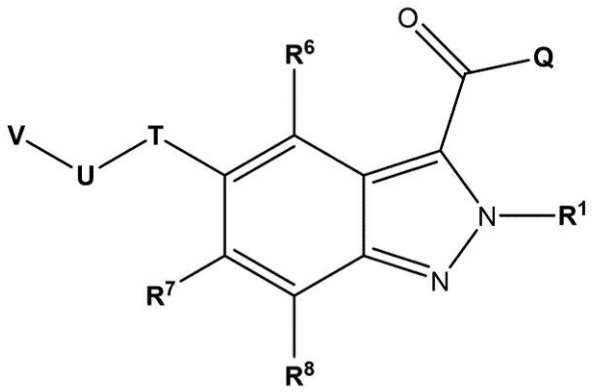
本発明の代表的なインダゾール誘導体は、以下に記載され、以下のスキームに例示される一般的な合成方法に従って合成することができる。スキームは例示であるため、本発明は、スキーム及び実施例に記載される特定の化学反応及び特定の条件によって限定されると解釈されるべきではない。スキームで使用される様々な出発物質は、市販されているか、又は当業者によく知られた方法によって調製され得る。変数は、本明細書に定義されるとおりであり、当業者の技量の範囲内である。

【０１８１】

本発明の例示的な実施形態を、以下の条項１～５１として要約する。

１．式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、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３５】



（Ｉ）

好ましくは、任意選択的に、疼痛若しくはてんかんの治療で又は疼痛若しくはてんかんの治療方法で使用するための、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、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、
式中、
R^1が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、$-R^W$、$-OR^W$、$-OC(=O)R^W$、$-NR^WR^X$、$-NR^WC(=O)R^X$、$-SR^W$、$-S(=O)R^W$、$-S(=O)_2R^W$、$-C(=O)R^W$、$-C(=O)OR^W$、又は$-C(=O)NR^WR^X$を表し、
Ｑが、$-OR^2$又は$-NR^3R^4$を表し、
R^2が、$-R^Y$を表し、
R^3が、－ＯＨ又は$-R^Y$を表し、
R^4が、$-R^Y$又は$-S(=O)_2R^Y$を表すか、
あるいはR^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、$-CR^5R^{5'}-$を表すか、又はＴが、$-CR^5R^{5'}-$を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
R^5及び$R^{5'}$が、互いに独立して、$-R^Y$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、
Ｖが、飽和又は不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、C_1－C_6アルキル、又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$-CF_3$、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換又は多置換されており、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
Ｒ^{Y}及びＲ^{Z}が、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表すか、
あるいはＲ^{Y}及びＲ^{Z}が一緒になって、Ｎ、Ｏ及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７又は８員の複素環を形成し、
ここで、「一置換若しくは多置換」は、いずれの場合も独立して、－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－Ｏ－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－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）、－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）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｈ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－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、－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ていることを意味する、化合物、その立体異性体形態、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$^{5'}$－を表す、条項１に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３．Ｔが、－ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表す、条項１に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

４．Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表す、条項１～３のいずれか１つに記載の化合物自体、又は使用のための化合物。

５．Ｑが、－ＯＲ^{2}を表す、条項１～３のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

６．Ｖが、飽和又は不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、条項１～５のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

７．５～１４員ヘテロアリールが、一置換又は多置換である、条項６に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

８．５～１４員ヘテロアリールが、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項６又は７に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

９．５～１４員ヘテロアリールが、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なる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、又は$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項６～８のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１０．５～１４員ヘテロアリールが、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－３－イル、ピラゾール－４－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－４－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、及びイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イルからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項６～９のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１１．Ｖが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換又は多置換されている、３～１４員ヘテロシクロアルキルを表す、条項１～５のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１２．３～１４員ヘテロシクロアルキルが、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、イソオキサリジン、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1-C_6アルキル、－ＣＮ

、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項１１に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１３．３～１４員ヘテロシクロアルキルが、オキサン、又はオキセタニルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項１１又は１２に記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１４．３～１４員ヘテロシクロアルキルが、オキサン－４－イル又はオキセタン－３－イルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、条項１１～１３のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１５．飽和又は不飽和３～１４員シクロアルキルが、非縮合若しくは非架橋、縮合、又は架橋シクロアルキルを含む、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、シクロノニル、又はシクロデシルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項１～５のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１６．５～１４員アリールが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換又は多置換されている、フェニル又はその他の５～１４員アリールである、条項１～５のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１７．Ｖを表すＣ$_1$－Ｃ$_6$アルキル又はＣ$_1$－Ｃ$_6$ヘテロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－Ｒ^Y、－ＯＲ^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－ＮＲ^{Y}Ｒ^Z、－ＮＲ^{Y}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Z、－ＳＲ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Y、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Y、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{Y}Ｒ^{Z}から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、条項１～６のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

１８．Ｖが、非置換、互いに独立して、

－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＮ、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、－ＮＯ$_2$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＳＦ$_5$；

飽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（＝Ｏ）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－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、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
１９．Ｖが、非置換、互いに独立して、
－ＯＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－シクロプロピル、若しくは－Ｏ－シクロプロピル（好ましくは、－ＯＨ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、若しくは－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$から選択され）；
飽和又は不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、及び－シクロプロピルからなる群から選択され、好ましくは、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和又は不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル；
非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｏ（Ｃ＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
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る３～１４員シクロアルキルであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている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、イソオキサリジン、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］ピラジンからなる群から選択される３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、Ｃ$_{2-6}$－アルケニル、－Ｃ$_{2-6}$－アルキニル、－ＯＨ、＝Ｏ、－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$_2$、Ｃ（＝Ｏ）ＣＨＦ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$からなる群から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている３～１４員ヘテロシクロアルキル；から選択される置換基で一置換又は多置換されている、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２０．Ｖが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－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－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－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）$_2$、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＣＦ$_3$、－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、－アゼチジン、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン、若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換若しくは多置換されているか、又は非置換、一置換若しくは多置換のオキセタニルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２１．Ｖが、
（ｉ）非置換であるか、
（ｉｉ）一置換されているか、
（ｉｉｉ）二置換されているか、
（ｉｖ）三置換されているか、又は
（ｖ）四置換されている、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２２．Ｒ^{1}が、

－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－$_{6}$－アルキル；飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1}$－$_{6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1}$－$_{6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、あるいは
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２３．Ｒ^{1}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－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）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、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２４．Ｒ^{1}が、－Ｈ、－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$_{3}$、－非置換シクロペンチル、又は－非置換シクロプロピルを表し、好ましくは、Ｒ^{1}が、－Ｈ、－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$_{3}$、又は－非置換シクロペンチルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２５．Ｒ^{1}が、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{3}$、又は－非置換シクロプロピルを表し、好ましくは、Ｒ^{1}が、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{3}$、又は－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２６．Ｒ^{2}が、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－

若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２７．Ｒ^{2}が、－Ｈ、－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$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２８．Ｒ^{2}が、－Ｈ又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
２９．Ｒ^{3}が、
－Ｈ；
－ＯＨ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
３０．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－ＣＦＨ$_{2}$、－ＣＦ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
３１．Ｒ^{3}が、－Ｈ、－ＯＨ、又は飽和、非置換、若しくは－ＯＨで一置換されている－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
３２．Ｒ^{4}が、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非

置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
３３．Ｒ^{4}が、
飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、及びシクロヘプチルからなる群から選択され、いずれの場合も、飽和若しくは不飽和の、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（３～１４員シクロアルキル）；

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

３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員シクロアルキルが、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、いずれの場合も、飽和若しくは不飽和であり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、３～１４員シクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）；

３～１４員ヘテロシクロアルキル又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、いずれの場合も、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、イソオキサリジン、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］ピラジンからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル

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

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

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、いずれの場合も、ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－ＯＨ、＝Ｏ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アル

キレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－フェニル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル、飽和若しくは不飽和の、非置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル、及び非置換の５～１４員ヘテロアリール、からなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３４．Ｒ^{4}が、

－Ｈ；

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

飽和、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）；

飽和、非置換、互いに独立して、－ＯＨ、－ＯＣ$_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－非置換フェニルからなる群から選択される置換基で一置換又は二置換されている、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

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

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

－非置換フェニル；

５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）であって、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－が、非置換であるか、又は－ＯＨで一置換されており、当該５～１４員ヘテロアリールが、いずれの場合も、ピリジン、ピリダジン、ピラジン、ピラゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、及び［１，２，４］トリアゾロ［４

，３－ａ］ピリミジンからなる群から選択され、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＯＨからなる群から選択される置換基で一置換又は二置換されている、５～１４員ヘテロアリール又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）、を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３５．Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の５若しくは６員の複素環を形成する、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３６．Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣＨ$_{3}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－非置換ピリジル、及び、非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３７．Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、

非置換、又は－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$で一置換されたピロリジン環；

非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、及び非置換若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換されたピペリジン環；

非置換モルホリン環；あるいは

非置換、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキル及び－非置換ピリジルからなる群から選択される置換基でＮ－置換されたピペラジン環を形成する、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３８．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、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

３９．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、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

４０．Ｒ^{5}及びＲ^{5}’のうちの少なくとも１つが、－Ｈを表さない、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。

４１．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；

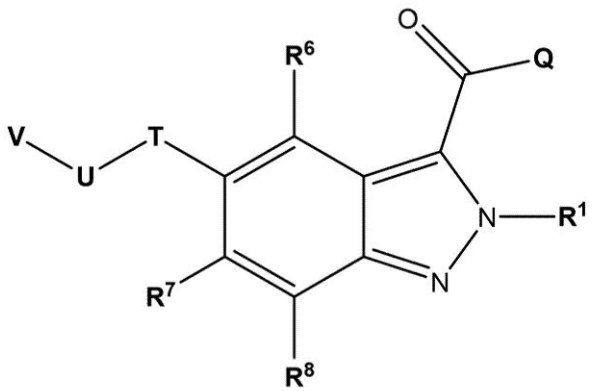
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；

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、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４２．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、若しくは互いに独立して、－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た－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル；
非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_{2}$；
非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$－アルキル；
非置換、若しくは互いに独立して、－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た－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$－アルキル；又は
非置換、若しくは互いに独立して、－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た－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキル、を表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４３．Ｒ^{6}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４４．Ｒ^{6}が、－Ｈを表さない、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４５．Ｒ^{7}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４６．Ｒ^{7}が、－Ｈを表さない、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４７．Ｒ^{8}が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルを表す、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４８．Ｒ^{8}が、－Ｈを表さない、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
４９．
（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}のうちの残りが、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－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

うちの残りが、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、又は－ＣＨ$_3$を表す、化合物自体、又は先行条項のいずれか１つに記載の使用のための化合物。
５０．上述した化合物００１～１９９、又は化合物２００～２６２からなる群から選択される、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物、及びその生理学的に許容される塩。
５１．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、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
５２．疼痛が、術後疼痛である、先行条項のいずれか１つに記載の化合物それ自体、又は使用のための化合物。
５３．
（ａ－１）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{1}が、Ｒ^{W}を表し、Ｒ^{W}が、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルを表し、かつ／又は
（ａ－２）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{5}及びＲ^5’のうちの少なくとも１つが、－Ｈを表し、かつ／又は
（ａ－３）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{6}が、－Ｈを表し、かつ／又は
（ａ－４）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{8}が、－Ｈを表すか、
又は
（ｂ－１）
（ｂ－１）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{1}が、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＮ、－メチル、－エチル、－プロピル、若しくは－シクロプロピルを表し、かつ／又は
（ｂ－２）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{5}及びＲ^5’のうちの少なくとも１つが、－Ｈを表さず、かつ／又は
（ｂ－３）Ｑが、－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、Ｒ^{3}は、－Ｈを表す、先行条項のいずれか１つで定義された式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。
５４．先行条項のいずれか１つに記載の化合物を含む、薬学的組成物又は医薬。
本発明の更なる例示的な実施形態を、以下の項目１～７０として要約する。
１．式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、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３６】



（Ｉ）

式中、
Ｒ^{1}が、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－Ｒ^W、－ＯＲ^W、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^W、－ＮＲ^{W}Ｒ^X、－ＮＲ^{W}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^X、－ＳＲ^W、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^W、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^W、又は－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{W}Ｒ^{X}を表し、
Ｑが、－ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、
Ｒ^{2}が、－Ｒ^{Y}を表し、

R^3が、－ＯＨ又は－R^Yを表し、
R^4が、－R^Y又は－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^Y$を表すか、
あるいはR^3及びR^4が一緒になって、Ｎ、Ｏ、及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７、又は８員の複素環を形成し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－Ｃ$R^5$$R^5$’－を表すか、又はＴが、－Ｃ$R^5$$R^5$’－を表し、Ｕが、－Ｏ－を表し、
R^5及びR^5’が、互いに独立して、－R^Yを表し、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＦ$_5$、－R^W、－ＯR^W、－ＯＣ（＝Ｏ）R^W、－Ｎ$R^W$$R^X$、－Ｎ$R^W$Ｃ（＝Ｏ）$R^X$、－Ｓ$R^W$、－Ｓ（＝Ｏ）$R^W$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^W$、－Ｃ（＝Ｏ）$R^W$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^W$、又は－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^W$$R^X$を表し、
Ｖが、飽和又は不飽和の３～１４員ヘテロシクロアルキル、飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル、５～１４員アリール、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル又は５～１４員ヘテロアリールを表し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、－ＳＦ$_5$、－R^Y、－ＯR^Y、－ＯＣ（＝Ｏ）R^Y、－Ｎ$R^Y$$R^Z$、－Ｎ$R^Y$Ｃ（＝Ｏ）$R^Z$、－Ｓ$R^Y$、－Ｓ（＝Ｏ）$R^Y$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）$R^Y$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^Y$、若しくは－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^Y$$R^Z$から選択される置換基で一置換又は多置換されており、
R^W及びR^Xが、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_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$－ヘテロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル、を表し、
R^Y及びR^Zが、互いに独立して、いずれの場合も独立して、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_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$－ヘテロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキルであって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル；

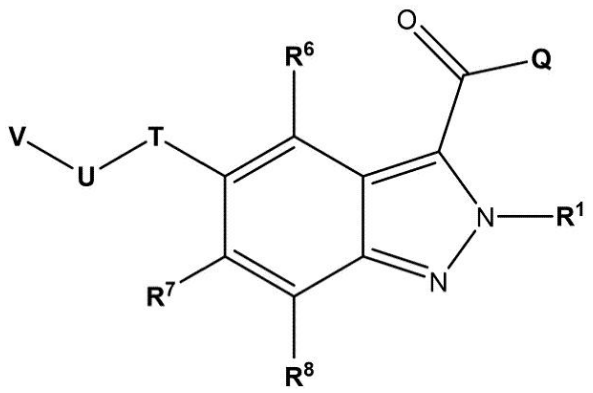
非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリールであって、当該６～１４員アリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、６～１４員アリール、又は
非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリールであって、当該５～１４員ヘテロアリールが、任意選択的に、－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表すか、
あるいはＲ^{Y}及びＲ^{Z}が一緒になって、Ｎ、Ｏ及びＳから選択される１～３個のヘテロ原子を含有する、飽和若しくは不飽和の、非置換の、又は一置換若しくは多置換の４、５、６、７又は８員の複素環を形成し、
ここで、「一置換若しくは多置換」は、いずれの場合も独立して、－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－Ｏ－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－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）、－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）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｎ（Ｈ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－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、－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ていることを意味する、化合物、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

２．項目１に記載の好ましい、式（Ｉ）の化合物、その立体異性体形態、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３７】



式中、

Ｑが、－ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、

Ｔが、－Ｏ－を表し、

Ｕが、－ＣＲ^{5}Ｒ^{5}’－を表し、

Ｖが、Ｈ又はＲ^{4}を表し、

Ｒ^{1}が、－Ｈ、Ｒ^{9}、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－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$_{3}$、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－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し、

Ｒ^{2}が、水素又はＲ^{9}を表し、

Ｒ^{3}が、－Ｈ、Ｒ^{9}、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{2}$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_{3}$を表し、

Ｒ^{4}が、Ｒ^{4}’又は－ＳＯ$_{2}$－Ｒ^{4}’を表し、

Ｒ^{4}’が、－Ｒ^{9}、－Ｒ^{cycl}、又は－Ｒ^{10}－Ｒ^{cycl}を表し、

Ｒ^{cycl}が、

飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル

ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～１４員ヘテロシクロアルキル

６～１４員アリール、又は

ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する、５～１４員ヘテロアリール

を表すか、あるいは

Ｒ^{1}及びＲ^{3}が一緒になって、基－Ｒ^{10}－を形成してもよく、又は

Ｒ^{3}及びＲ^{4}が一緒になって、基－Ｒ^{10}－を形成してもよく、

Ｒ^{5}、Ｒ^{5}’、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、水素又はＲ^{9}を表し、

Ｒ^{cycl}が、Ｒ^{9}によって置換されていてもよく、Ｒ^{cycl}のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環が、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、

Ｒ^{9}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキルを表し、

Ｒ^{10}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキレン－を表し、

Ｒ^{9}及びＲ^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、

Ｒ^{9}、Ｒ^{10}、及びＲ^{cycl}が、Ｒ^{11}によって置換されていてもよく、

Ｒ^{11}が、－ＯＲ、－ＮＲ$_2$、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＯＯＲ、－ＣＯ－ＮＲ$_2$、－ＣＯＮＲ（ＯＲ）、－Ｏ－ＣＯ－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｒ）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－ＳＲ、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｒ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＲ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＲ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＲ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＲ$_2$からなるリストから選択され、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルであってよく、

全ての基Ｒ^9～Ｒ^{11}及びＲ^{cycl}は、互いに独立して選択されてもよく、いずれの場合も独立して選択されてもよい、化合物、その立体異性体形態、生理学的に許容される塩、溶媒和物、及び／又は多形体。

３．Ｒ^{1}が、ハロゲン、－ＯＲ、－ＣＯＮＲ$_2$又は－ＮＲ$_2$によって置換され得る、１～６個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルキルを表し、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ又はＣ$_{1-6}$アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

４．Ｒ^{3}が、水素又はＲ^{9}を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

５．

Ｑが、ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、

Ｔが、－Ｏ－を表し、

Ｕが、－ＣＲ^{5}Ｒ$^{5'}$－を表し、

Ｖが、Ｈ又はＲ^{4}を表し、

Ｒ^{1}が、ハロゲン、－ＯＲ、－ＣＯＮＲ$_2$若しくは－ＮＲ$_2$によって置換され得る、１～６個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルキルを表し、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ若しくはＣ$_{1-6}$アルキルを表し、

Ｒ^{2}及びＲ^{3}が、水素若しくはＲ^{9}を表し、

Ｒ^{4}が、Ｒ$^{4'}$又は－ＳＯ$_2$－Ｒ$^{4'}$を表し、

Ｒ$^{4'}$が、－Ｒ^9、－Ｒ^{cycl}、又は－Ｒ^{10}－Ｒ^{cycl}を表し、

Ｒ^{cycl}が、

飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル

ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～１４員ヘテロシクロアルキル；

６～１４員アリール、又は

ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する、５～１４員ヘテロアリールを表すか、あるいは

Ｒ^{1}及びＲ^{3}が一緒になって、基－Ｒ^{10}－を形成してもよく、

Ｒ^5、Ｒ$^{5'}$、Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、互いに独立して、水素又はＲ^{9}を表し、

Ｒ^{cycl}が、Ｒ^{9}によって置換されていてもよく、Ｒ^{cycl}のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環が、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、

Ｒ^{9}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキルを表し、

Ｒ^{10}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキレン－を表し、

Ｒ^{9}及びＲ^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、

Ｒ^9、Ｒ^{10}、及びＲ^{cycl}が、Ｒ^{11}によって置換されていてもよく、

Ｒ^{11}が、－ＯＲ、－ＮＲ$_2$、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＯＯＲ、－ＣＯ－ＮＲ$_2$、－ＣＯＮＲ（ＯＲ）、－Ｏ－ＣＯ－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｒ）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－ＳＲ、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｒ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＲ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＮＲ$_2$、－ＮＯ、－ＮＯ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＲ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＲ$_2$からなるリストから選択され、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルであってよく、

全ての基R^{9}～R^{11}及びR^{cycl}は、互いに独立して選択されてもよく、いずれの場合も独立して選択されてもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
６．Ｖが、Ｈ、－R^{9}、又は
－R^{cycl}を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
７．R^{5}、$R^{5'}$、R^{6}、R^{7}、及びR^{8}が、互いに独立して、水素又はC_{1-3}－アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
８．R^{5}、$R^{5'}$、R^{6}、R^{7}、及びR^{8}が、互いに独立して、水素又はメチルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
９．
Ｑが、OR^{2}又は－$NR^{3}R^{4}$を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、－$CR^{5}R^{5'}$－を表し、
Ｖが、Ｈ、－R^{9}、又は－R^{cycl}を表し、
R^{1}が、ハロゲン、－ＯＨ、ＯＲ、－ＣＯＮR_{2}又は－NR_{2}
で置換されていてもよい－C_{1-6}－アルキルを表し、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ又は－C_{1-6}－アルキルを表し、
R^{2}及びR^{3}が、水素又はメチルを表し、
R^{4}が、$R^{4'}$又は－$SO_{2}-R^{4'}$を表し、
$R^{4'}$が、－R^{9}、－R^{cycl}、又は－$R^{10}-R^{cycl}$を表し、
R^{cycl}が、
飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～１４員ヘテロシクロアルキル
６～１４員アリール、又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する、５～１４員ヘテロアリールを表すか、あるいは
R^{1}及びR^{3}が一緒になって、基－R^{10}－を形成してもよく、
R^{5}、$R^{5'}$、R^{6}、R^{7}、及びR^{8}が、互いに独立して、水素又はメチルを表し、
R^{cycl}が、R^{9}によって置換されていてもよく、R^{cycl}のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環が、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、
R^{9}が、－C_{1-6}－アルキル又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有す－C_{1-6}－ヘテロアルキルを表し、
R^{10}が、－C_{1-6}－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-6}－ヘテロアルキレン－を表し、
R^{9}及びR^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、
R^{9}、R^{10}、及びR^{cycl}が、R^{11}によって置換されていてもよく、
R^{11}が、－ＯＲ、－NR_{2}、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＯＯＲ、－ＣＯ－NR_{2}、－ＣＯＮＲ（ＯＲ）、－Ｏ－ＣＯ－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｒ）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－NR_{2}、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$$NR_{2}$、－ＳＲ、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｒ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＲ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－$NR_{2}$、－ＮＯ、－$NO_{2}$、－$C_{1-6}$－アルキレン－ＯＲ、－$C_{1-6}$－アルキレン－$NR_{2}$からなるリストから選択され、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ、又は－C_{1-6}－アルキルであってよく、
全ての基R^{9}～R^{11}及びR^{cycl}は、互いに独立して選択されてもよく、いずれの場合も独立して選択されてもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１０．R^{5}及び$R^{5'}$が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１１．R^{1}及びR^{3}が一緒になって、－R^{10}－基を形成する、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１２．R^{4}が、$R^{4'}$又は－$SO_{2}-C_{1-6}$－アルキルを表す、先行項目のいずれか１つ

に記載の化合物。
１３．Ｖが、Ｈ、Ｃ$_{1-6}$－アルキル、又は－Ｒ^{cycl}を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１４．
Ｑが、ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、－ＣＨ$_{2}$－を表し、
Ｖが、Ｈ、Ｃ$_{1-6}$－アルキル、又は－Ｒ^{cycl}を表し、基ＶのＲ^{cycl}が、－ＣＯＯ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＣＯ－ＮＲ$_{2}$、－ＣＮ、ハロゲン、又はＣ$_{1-6}$－アルキルからなるリストから選択される少なくとも１つの基によって置換され得、Ｒが、互いに独立して、Ｈ又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表し、基Ｖ中のアルキル基は、１つ以上のハロゲン原子によって置換されていてもよく、
Ｒ^{1}は、ハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＮＲ$_{2}$、又は－ＮＲ$_{2}$によって置換され得る－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表し、残基Ｒは、互いに独立して、Ｈ又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルを表し、
Ｒ^{2}及びＲ^{3}が、水素又はメチルを表し、
Ｒ^{4}が、－ＳＯ$_{2}$－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｒ^{9}、－Ｒ^{cycl}、又は－Ｒ^{10}－Ｒ^{cycl}を表し、
Ｒ^{cycl}が、
飽和又は不飽和の３～１４員シクロアルキル
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～１４員ヘテロシクロアルキル
６～１４員アリール、又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する５～１４員ヘテロアリールを表し、また、Ｒ^{1}及びＲ^{3}が一緒になって、Ｒ^{11}によって置換され得る基－Ｒ^{10}－を形成してもよく、
Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、水素又はメチルを表し、
Ｒ^{cycl}が、Ｒ^{9}によって置換されていてもよく、Ｒ^{cycl}のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環が、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、
Ｒ^{9}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキルを表し、
Ｒ^{10}が、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－Ｃ$_{1-6}$－ヘテロアルキレン－を表し、
Ｒ^{9}及びＲ^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、
Ｒ^{4}のＲ^{9}、Ｒ^{10}、及びＲ^{cycl}が、Ｒ^{11}で置換されていてもよく、
Ｒ^{11}が、－ＯＲ、－ＮＲ$_{2}$、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＯＯＲ、－ＣＯ－ＮＲ$_{2}$、－ＣＯＮＲ（ＯＲ）、－Ｏ－ＣＯ－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｒ）$_{2}$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ$_{2}$、－ＳＲ、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｒ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＯＲ、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$－ＮＲ$_{2}$、－ＮＯ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＲ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＲ$_{2}$からなるリストから選択され、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ、又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルであってよく、
全ての基Ｒ^{9}～Ｒ^{11}及びＲ^{cycl}は、互いに独立して選択されてもよく、いずれの場合も独立して選択されてもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１５．Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１６．Ｒ^{2}が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１７．Ｒ^{3}が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１８．Ｒ^{2}及びＲ^{3}が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
１９．Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{5}、Ｒ$^{5'}$、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、及びＲ^{8}が、互いに独立して、水素を表す

、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２０．R^1が、－C_{1-6}－アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２１．R^1及びR^3が一緒になって、直線状又は分岐状の、－C_{1-4}－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-4}－ヘテロアルキレン－を表す基を形成し、これらは不飽和であってもよく、R^{11}によって置換されていてもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２２．R^1及びR^3が一緒になって、直線状又は分岐状の、－C_{1-3}－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-3}－ヘテロアルキレン－を表す基を形成し、これらは不飽和であってもよく、R^{11}によって置換されていてもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２３．
Ｑが、OR^2又は－NR^3R^4を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、－CH_2－を表し、
Ｖが、Ｈ、C_{1-6}－アルキル、又は－R^{cycl}を表し、基ＶのR^{cycl}が、－ＣＯＯ－C_{1-6}－アルキル、－ＣＯ－NR_2、－ＣＮ、ハロゲン、又はC_{1-6}－アルキルからなるリストから選択される少なくとも１つの基によって置換され得、Ｒが、互いに独立して、Ｈ又は－C_{1-6}－アルキルを表し、基Ｖ中のアルキル基は、１つ以上のハロゲン原子によって置換されていてもよく、
R^1が、－C_{1-6}－アルキルを表し、
R^2が、水素を表し、
R^3が、水素を表し、
R^4が、－SO_2－C_{1-6}－アルキル、－R^9、－R^{cycl}、又は－R^{10}－R^{cycl}を表し、
R^{cycl}が、
飽和又は不飽和の３～６員シクロアルキル
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～７員ヘテロシクロアルキル
６員アリール、又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する６員ヘテロアリールを表し、
R^1及びR^3が一緒になって、－C_{1-3}－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-3}－ヘテロアルキレン－を表す基を形成してもよく、これらは不飽和であってもよく、R^{11}によって置換されていてもよく、
R^6、R^7、及びR^8が、互いに独立して、水素又はメチルを表し、
R^{cycl}が、R^9によって置換されていてもよく、R^{cycl}のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環が、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、
R^9が、－C_{1-6}－アルキル又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-6}－ヘテロアルキルを表し、
R^{10}が、－C_{1-6}－アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する－C_{1-6}－ヘテロアルキレン－を表し、
R^9及びR^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、
R^4のR^9、R^{10}、及びR^{cycl}が、R^{11}で置換されていてもよく、
基R^{11}が、互いに独立して、－ＯＲ、－NR_2、ハロゲン、－ＣＮ、－ＣＯＯＲ、－ＣＯ－NR_2、－ＣＯＮＲ（ＯＲ）、－Ｏ－ＣＯ－Ｏ－C_{1-6}－アルキル、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｒ、－ＮＲ－Ｃ（＝Ｏ）－Ｎ（Ｒ）$_2$、－Ｏ－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－NR_2、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$NR_2$、－ＳＲ、－Ｓ（＝Ｏ）－Ｒ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－ＯＲ、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$－$NR_2$、－ＮＯ、－$NO_2$、－$C_{1-6}$－アルキレン－ＯＲ、－$C_{1-6}$－アルキレン－$NR_2$からなるリストから選択され、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ、又は－C_{1-6}－アルキルであっ

てよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２４．R^9が、直線状又は分岐状－C_{1-6}－アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２５．R^9が、直線状又は分岐状－C_{1-6}－アルキルを表し、R^{10}が、直線状又は分岐状－C_{1-6}－アルキレン－を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２６．R^9が、１～６個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２７．R^{10}が、１～６個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２８．R^{10}が、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
２９．
Ｑが、OR^2又は$-NR^3R^4$を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、$-CH_2-$を表し、
Ｖが、Ｈ、C_{1-6}－アルキル、又は$-R^{cycl}$を表し、基ＶのＲ^{cycl}が、－ＣＮ、ハロゲン、又はC_{1-3}－アルキルからなるリストから選択される少なくとも１つの基によって置換され得、基Ｖ中の全てのアルキル基が、１つ以上のハロゲン原子によって置換されていてもよく、
R^1が、$-C_{1-3}-$アルキルを表し、
R^2が、水素を表し、
R^3が、水素を表し、
R^4が、$-SO_2-C_{1-6}-$アルキル、$-R^9$、$-R^{cycl}$、又は$-R^{10}-R^{cycl}$を表し、
Ｒ^{cycl}が、
飽和又は不飽和の３～６員シクロアルキル
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する、飽和又は不飽和の４～７員ヘテロシクロアルキル
６員アリール、又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳを有する６員ヘテロアリールを表し、
R^1及びR^3が一緒になって、$-C_{1-3}-$アルキレン－又は鎖中に１つ以上のＮ、Ｏ若しくはＳを有する$-C_{1-3}-$ヘテロアルキレン－を表す基を形成してもよく、これらは不飽和であってもよく、R^{11}によって置換されていてもよく、
R^6、R^7、及びR^8が、水素を表し、
Ｒ^{cycl}が、R^9によって置換されていてもよく、Ｒｃｙｃｌ　のシクロアルキル環及びヘテロシクロアルキル環は、互いに独立して、＝Ｏ又は＝Ｓによって置換されていてもよく、
R^9が、C_{1-6}アルキルを表し、
R^{10}が、$-C_{1-3}-$アルキレンを表し、
R^9及びR^{10}が、直線状又は分岐状、飽和又は不飽和であってもよく、
R^4のR^9、R^{10}、及びＲ^{cycl}が、R^{11}で置換されていてもよく、
基R^{11}が、互いに独立して、ＯＨ、ハロゲン、C_{1-3}－アルキル基、又は－ＣＯＮR_2基からなるリストから選択され、Ｒが、互いに独立して、Ｈ又はC_{1-3}－アルキル基であってもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３０．Ｒ^{cycl}が、１個、２個、又は３個のヘテロ原子を含む、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３１．Ｒ^{cycl}が、１個又は２個のヘテロ原子を含む、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３２．R^1及びR^3が一緒になって、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイル又はアルケンジイルを表す基を形成し、これらは置換されていなくてもよく、

又はハロゲン、C_{1-6}－アルキル、若しくは$CONR_2$によって置換されていてもよく、残基Rが、互いに独立して、H又はC_{1-3}－アルキルであってもよい、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３３．R^1及びR^3が一緒になって、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイル又はアルケンジイルを表す基を形成する、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３４．R^9が、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３５．
Qが、OR^2又は－NR^3R^4を表し、
Tが、－O－を表し、
Uが、－CH_2－を表し、
Vが、
H；
少なくとも１つのハロゲンで置換され得るC_{1-3}－アルキル；
－CN基で置換され得る３～６員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つの酸素原子を含む、４～６員ヘテロシクロアルキル；
少なくとも１つのハロゲン若しくは
C_{1-3}－アルキル基で置換され得る６員アリールであって、C_{1-3}－アルキル基が少なくとも１つのハロゲン原子で置換され得る、６員アリール；
ヘテロアリール環中に１つ以上のN、O、又はS原子を有する５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、少なくとも１つのハロゲン原子によって置換され得るC_{1-3}アルキル基で置換され得る、５～６員ヘテロアリール、を表し、
R^1が、－C_{1-3}－アルキルを表し、
R^2が、水素を表し、
R^3が、水素を表し、
R^4が、
－SO_2－C_{1-3}－アルキル；
OH、F、若しくは－$CONR_2$によって置換され得るC_{1-6}アルキルであって、残基Rが、互いに独立して、水素若しくはC_{1-3}アルキルである、C_{1-6}アルキル；
C_{1-3}－アルキレン－OH、又は－$CONH_2$で置換され得る３～６員シクロアルキル；
C_{1-3}－アルキル又は－N（C_{1-6}アルキル）$_2$基によって置換され得るC_{1-3}－アルキレン－３－６員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のN又はO原子を有する４～７員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル環が、＝O、ハロゲン、又は－$CONR_2$によって置換され得、残基Rが、互いに独立して、H又はC_{1-3}－アルキルを表すか、又はシクロアルキル環が、OH又はハロゲンのうちの少なくとも１つによって置換され得るC_{1-3}アルキル基によって置換されてもよい、４～７員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のN、Oを有するC_{1-4}－アルキレン－４～７員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル基が、C_{1-3}アルキル又は＝Oで置換され得る、C_{1-4}－アルキレン－４～７員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロアリール環中に１つ以上のN、O、若しくはSを有する５～７員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、$C_{1\sim6}$アルキル若しくはOHで置換され得る、５～７員ヘテロアリール；又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のN、O、若しくはSを有するC_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、OHによって置換され得る、C_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロアリール、を表すか、又は
R^1及びR^3が一緒になって、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイル又はアルケンジイルを表す基を形成し、

R^6、R^7、及びR^8が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３６．
Ｑが、OR^2又は－NR^3R^4を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、－CH_2－を表し、
Ｖが、
Ｈ；
少なくとも１つのフッ素原子で置換されていてもよいC_{1-3}－アルキル；
－ＣＮ基で置換され得る３～６員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つの酸素原子を含む、４～６員ヘテロシクロアルキル；
少なくとも１つのフッ素原子で、又はC_{1-3}－アルキル基で置換されていてもよい６員アリールであって、C_{1-3}－アルキル基が少なくとも１つのフッ素原子で置換されていてもよい、６員アリール；
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、又はＳ原子を有する５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、少なくとも１つのフッ素原子によって置換され得るC_{1-3}－アルキル基で置換され得る、５～６員ヘテロアリール、を表し、
R^1が、－C_{1-3}－アルキルを表し、
R^2が、水素を表し、
R^3が、水素を表し、
R^4が、
－SO_2－C_{1-3}－アルキル；
ＯＨ、Ｆ若しくは－ＣＯＮR_2によって置換され得るC_{1-6}アルキルであって、残基Ｒが、互いに独立して、水素若しくはメチルである、C_{1-6}アルキル；
C_{1-3}－アルキレン－ＯＨ、又は－ＣＯＮH_2で置換され得る３～６員シクロアルキル；
C_{1-3}－アルキル又は－ＮＭe_2基によって置換され得るC_{1-3}－アルキレン－３～６員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ若しくはＯ原子を有する４～７員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル環が、＝Ｏ、Ｆ、若しくは－ＣＯＮR_2によって置換され得、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ若しくはC_{1-3}－アルキルを表すか、又はシクロアルキル環が、C_{1-3}アルキル基によって置換されていてもよく、C_{1-3}アルキル基が、ＯＨ若しくはフッ素のうちの少なくとも１つによって置換されてもよい、４～７員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ、Ｏを有するC_{1-4}－アルキレン－４～７員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル基が、C_{1-3}アルキル又は＝Ｏで置換され得る、C_{1-4}－アルキレン－４～７員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、若しくはＳを有する５～７員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、メチル若しくはＯＨで置換され得る、５～７員ヘテロアリール；又は
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮ、Ｏ、若しくはＳを有するC_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、ＯＨによって置換され得る、C_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロアリール、を表すか、又は
R^1及びR^3が一緒になって、１～３個の炭素原子を有する直線状又は分岐状アルカンジイルを表す基を形成し、
R^6、R^7、及びR^8が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３７．R^1及びR^3が一緒になって、－CH_2－CH_2－及び－CH_2－CH_2－CH_2－から選択される基を表す基を形成する、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３８．
Ｑが、OR^2又は－NR^3R^4を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、

Ｕが、－ＣＨ$_2$－を表し、
Ｖが、
Ｈ；
少なくとも１つのフッ素原子で置換されていてもよいメチル；
－ＣＮ基で置換され得る３～５員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つの酸素原子を含む、４～６員ヘテロシクロアルキル；
少なくとも１つのフッ素原子で、若しくはメチル基で置換されていてもよいフェニルであって、メチル基が少なくとも１つのフッ素原子で置換されていてもよい、フェニル；
メチル基で置換されていてもよい１，３－チアゾール若しくは１Ｈ－ピラゾール；又は
メチル基で置換されていてもよいピリジンであって、メチル基の水素原子が少なくとも１つのフッ素原子で置換されていてもよい、ピリジンを表し、
Ｒ^{1}が、－Ｃ$_{1-3}$－アルキルを表し、
Ｒ^{2}が、水素を表し、
Ｒ^{3}が、水素を表し、
Ｒ^{4}が、
－ＳＯ$_2$Ｍｅ；
ＯＨ、Ｆ、－ＣＯＮＲ$_2$、又は－ＮＨＳ（＝Ｏ）$_2$－Ｍｅによって置換され得るＣ$_{1-5}$アルキルであって、残基Ｒが、互いに独立して、水素又はメチルである、Ｃ$_{1-5}$アルキル；
－ＣＨ$_2$ＯＨ、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＯＨ又は－ＣＯＮＨ$_2$によって置換され得る３～４員シクロアルキル；
メチル基又は－ＮＭｅ$_2$基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$－アルキレン－３－４員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ若しくはＯ原子を有する（ラクタム環であってもよい）４～６員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル環が、Ｆ若しくは－ＣＯＮＲ$_2$によって置換されてもよく、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ若しくはメチルを表すか、又はヘテロシクロアルキル環が、Ｃ$_{1-2}$アルキル基によって置換されていてもよく、Ｃ$_{1-2}$アルキル基が、ＯＨ若しくはＦのうちの少なくとも１つによって置換されてもよい、４～６員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ又はＯを有する（ラクタム環であってもよい）Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－５～６員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル基がメチルで置換されていてもよい、Ｃ$_{1-3}$－アルキレン－５～６員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮを有する５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、メチル若しくはＯＨで置換され得る、５～６員ヘテロアリール；又は
ピリジン環で置換されるＣ$_{1-3}$－アルキレン基であって、ピリジン環がＯＨで置換されていてもよい、Ｃ$_{1-3}$－アルキレン基を表すか、又は
Ｒ^{1}及びＲ^{3}が一緒になって、－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－及び－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－から選択される基を表す基を形成し、
Ｒ^6、Ｒ^7、及びＲ^{8}が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
３９．Ｒ^{1}及びＲ^{3}が一緒になって、－ＣＨ$_2$－ＣＨ$_2$－基を形成する、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４０．
Ｑが、ＯＲ^{2}又は－ＮＲ^{3}Ｒ^{4}を表し、
Ｔが、－Ｏ－を表し、
Ｕが、－ＣＨ$_2$－を表し、
Ｖが、
Ｈ；
２つのフッ素原子で置換されたメチル；
－ＣＮ基で置換され得る３～４員シクロアルキル；

ヘテロシクロアルキル環中に１つの酸素原子を含む、４～６員ヘテロシクロアルキル；
少なくとも１つのフッ素原子で、若しくはメチル基で置換されていてもよいフェニルであって、メチル基の水素原子のうちの２つが２つのフッ素原子で置換されている、フェニル；
メチル基で置換された１，３－チアゾール若しくは１Ｈ－ピラゾール、又は
メチル基で置換されていてもよいピリジンであって、メチル基の水素原子が３つのフッ素原子で置換されていてもよい、ピリジンを表し、
R^1が、－C_{1-3}－アルキルを表し、
R^2が、水素を表し、
R^3が、水素を表し、
R^4が、
－SO_2Me；
最大３つのＯＨ、最大３つのＦ、－ＣＯＮR_2、又は－ＮＨＳ（＝Ｏ）$_2$－Ｍｅによって置換され得るC_{1-5}アルキルであって、残基Ｒが、互いに独立して、水素又はメチルである、C_{1-5}アルキル；
－CH_2OH、－CH_2CH_2OH又は－$CONH_2$によって置換された３～４員シクロアルキル；
メチル又は－NMe_2基で置換されたC_{1-3}－アルキレン－３－４員シクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ若しくはＯ原子を有する（ラクタム環であってもよい）４～５員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル環が、Ｆ、－ＣＯＮR_2によって置換されていてもよく、残基Ｒが、互いに独立して、Ｈ若しくはメチルを表すか、又はヘテロシクロアルキル環が、C_{1-2}アルキル基によって置換されていてもよく、C_{1-2}アルキル基が、ＯＨ若しくはＦによって置換されてもよい、４～５員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロシクロアルキル環中に１つ以上のＮ又はＯを有する（ラクタム環であってもよい）C_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロシクロアルキルであって、ヘテロシクロアルキル環がメチルで置換されていてもよい、C_{1-3}－アルキレン－５～６員ヘテロシクロアルキル；
ヘテロアリール環中に１つ以上のＮを有する５～６員ヘテロアリールであって、ヘテロアリール環が、メチル若しくはＯＨで置換され得る、５～６員ヘテロアリール；又は
ピリジン環で置換されたC_{1-3}－アルキレン基であって、ピリジン環がＯＨで置換されているC_{1-3}－アルキレン基、を表すか、あるいは
R^1及びR^3が一緒になって、－CH_2－CH_2－基を形成し、
R^6、R^7、及びR^8が、水素を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４１．R^1及びR^4が、複素環を形成するために接続されない、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４２．R^{cycl}が、１個のヘテロ原子を含む、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４３．R^3が、－Ｈを表す、項目１に記載の化合物。
４４．。R^4が、－Ｈ以外の残基を表す、項目４３に記載の化合物。
４５．R^1が、－メチル又はエチルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４６．Ｔが、－Ｏ－を表し、Ｕが、－$CR^5R^{5'}$－を表す、項目１及び項目４３～４５のいずれか１つに記載の化合物。
４７．R^5及び$R^{5'}$の各々を表すR^Yが、Ｈである、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
４８．Ｖが、（ｉ）ベンズイミダゾール、ベンズイソオキサゾール、ベンゾアゾール、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る５～１４員ヘテロアリールであって、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$ＣＨＦ_2$、－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＨＦ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－シクロプロピル、－シクロプロピル、－Ｏ－シクロプロピル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－$ＯＣＦ_3$、－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、－アゼチジン、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン、若しくは－$Ｃ_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換若しくは多置換されており、特に、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－ＣＮ、－ＯＨ、＝Ｏ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$ＣＨＦ_2$、－$ＣＦ_3$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－$ＮＨ_2$、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－ＮＨＣ（＝Ｏ）－Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－$Ｃ_{1-6}$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_{1-6}$－アルキル）$_2$、－$ＯＣ_{1-6}$－アルキル、－$ＯＣＦ_3$、－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、－アゼチジン、－$Ｃ_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－テトラヒドロピラン若しくは－$Ｃ_{1-6}$－アルキルで置換された－ピペラジンから選択される置換基で一置換若しくは多置換されている５～１４員ヘテロアリールを表すか、又は（ｉｉ）非置換の、一置換若しくは多置換の－オキセタニルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

４９．Ｖの定義内の飽和又は不飽和３～１４員シクロアルキルが、非縮合若しくは非架橋、縮合、又は架橋シクロアルキルを含む、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、シクロノニル、又はシクロデシルであり、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、、$ＣＦ_3$、$－ＣＦ_2Ｈ$、$Ｃ_1－Ｃ_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$－ＮＯ_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$－ＳＦ_5$、$－Ｒ^Ｙ$、$－ＯＲ^Ｙ$、$－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－ＮＲ^ＹＲ^Ｚ$、$－ＮＲ^ＹＣ（＝Ｏ）Ｒ^Ｚ$、$－ＳＲ^Ｙ$、$－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－Ｓ（＝Ｏ）_2Ｒ^Ｙ$、$－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Ｙ$、又は$－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^ＹＲ^Ｚ$から選択される置換基で一置換又は多置換されている、項目１～４７のいずれか１つに記載の化合物。

５０．Ｖの定義内の５～１４員アリールが、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、$ＣＦ_3$、$－ＣＦ_2Ｈ$、$Ｃ_1－Ｃ_6$アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$－ＮＯ_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$－ＳＦ_5$、$－Ｒ^Ｙ$、$－ＯＲ^Ｙ$、$－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－ＮＲ^ＹＲ^Ｚ$、$－ＮＲ^ＹＣ（＝Ｏ）Ｒ^Ｚ$、$－ＳＲ^Ｙ$、$－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－Ｓ（＝Ｏ）_2Ｒ^Ｙ$、$－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^Ｙ$、$－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^Ｙ$、又は$－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^ＹＲ^Ｚ$から選択される置換基で一置換又は多置換されている、フェニル又はその他の５～１４員アリールである、項目１～４７のいずれか１つに記載の化合物。

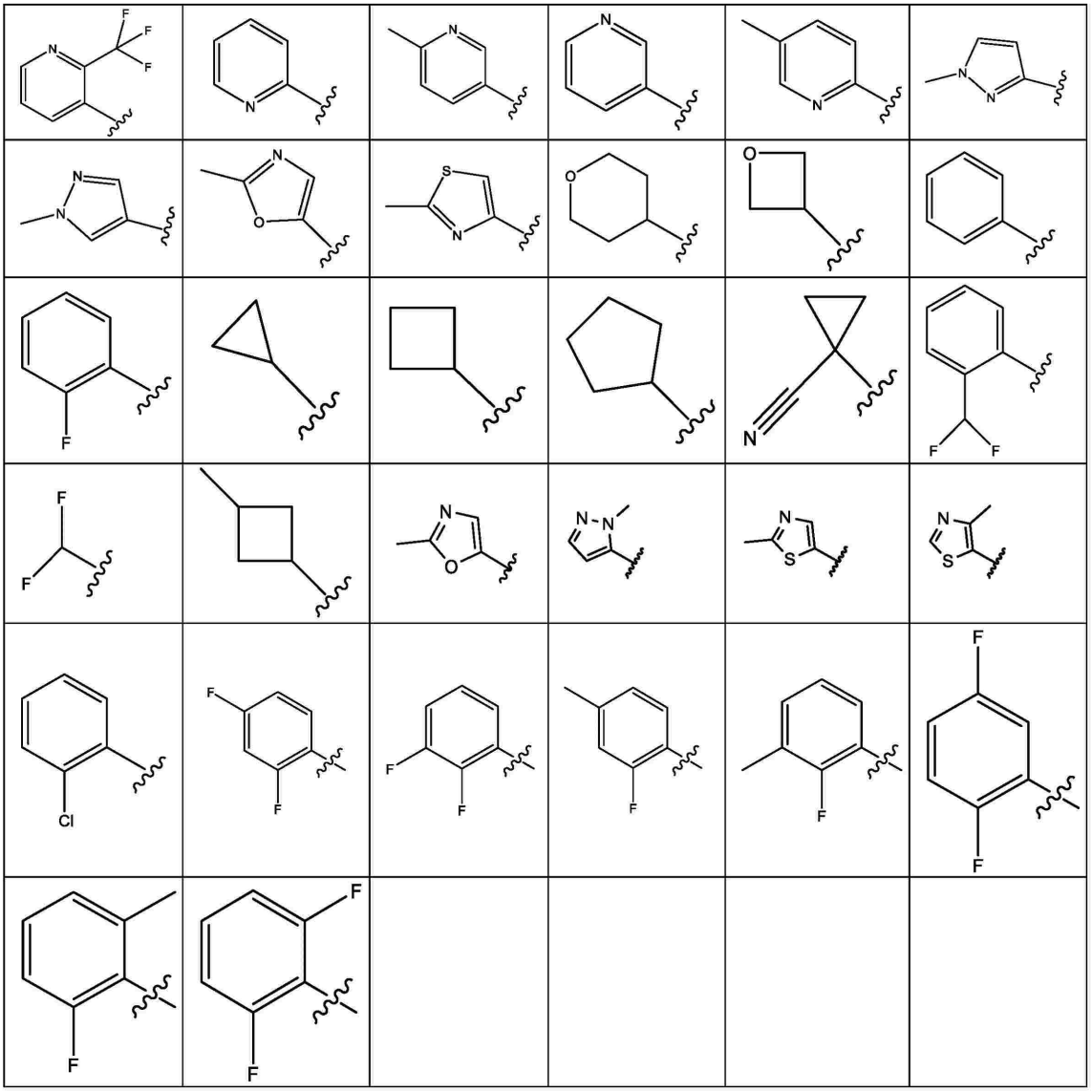
５１．Ｖの定義内の３～１４員ヘテロシクロアルキルが、アゼパン、１，４－オキサゼパン、アゼタン、アゼチジン、アジリジン、アゾカン、ジアゼパン、ジオキサン、ジオキソラン、ジチアン、ジチオラン、イミダゾリジン、イソチアゾリジン、イソオキサリジン、モルホリン、オキサゾリジン、オキサン、オキセパン、オキセタン、オキシラン、ピペラジン、ピペリジン、ピラゾリジン、ピロリジン、キヌクリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、チアゾリジン、チエタン、チイラン、チオラン、チオモルホリン、インドリン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾ－チオフェン、１，１－ジオキソチア－シクロヘキサン、２－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、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換若しくは多置換されている、項目１～４７のいずれか１つに記載の化合物。

５２．Ｖが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、CF_3、$-CF_2H$、C_1－C_6アルキル、－ＣＮ、－ＮＯ、$-NO_2$、＝Ｏ、＝Ｓ、$-SF_5$、$-R^Y$、$-OR^Y$、$-OC(=O)R^Y$、$-NR^YR^Z$、$-NR^YC(=O)R^Z$、$-SR^Y$、$-S(=O)R^Y$、$-S(=O)_2R^Y$、$-C(=O)R^Y$、$-C(=O)OR^Y$、若しくは$-C(=O)NR^YR^Z$から選択される置換基で一置換若しくは多置換されているC_1－C_6アルキル又はC_1－C_6ヘテロアルキルを表す、項目１～４７のいずれか１つに記載の化合物。

５３．Ｖが、以下からなる群から選択される残基である、項目１～４７のいずれか１つに記載の化合物。

【化３８】

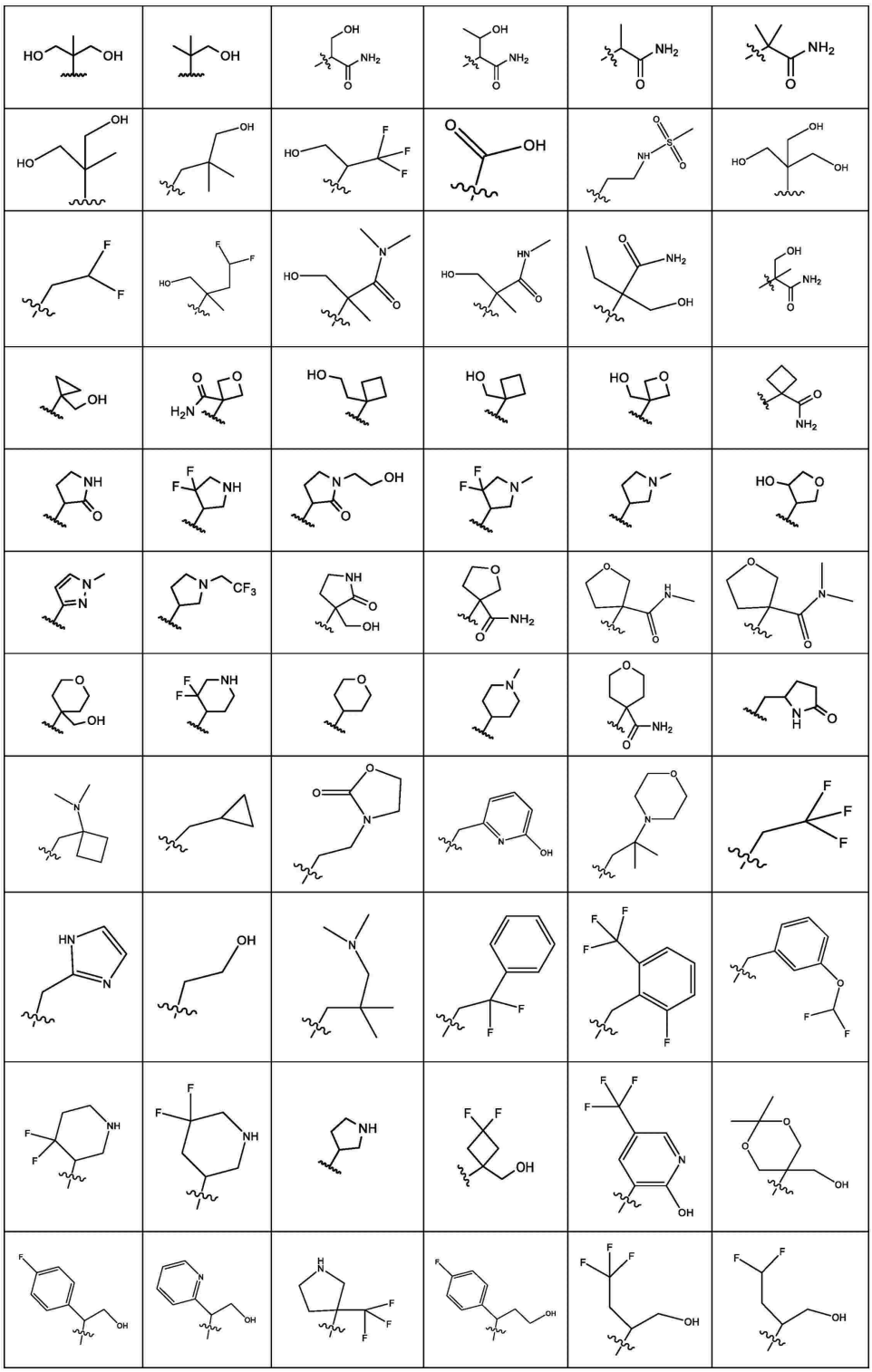


５４．Ｒ[1]が、－Ｈ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－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、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

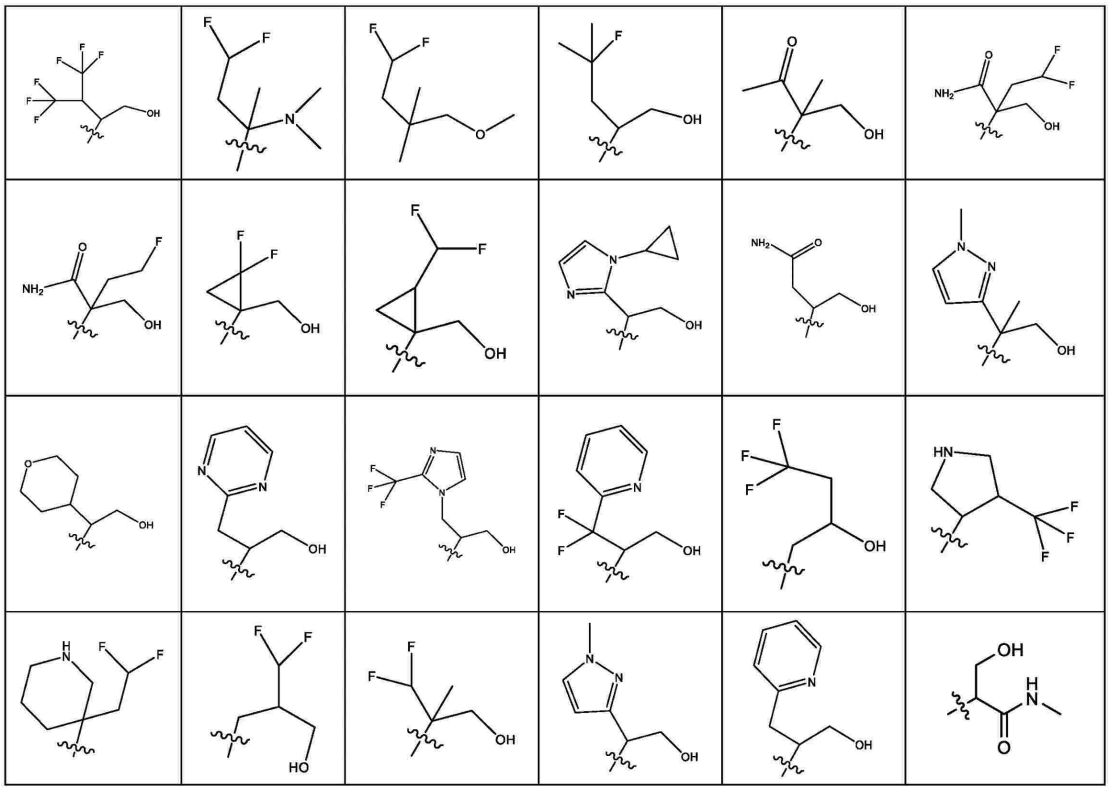
５５．Ｒ[3]が、－Ｈ、－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＯＨ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－ＣＦ$_3$、－ＣＦ$_2$Ｈ、－ＣＦＨ$_2$、－ＣＦ$_2$Ｃｌ、－ＣＦＣｌ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_2$Ｈ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦＨ$_2$、－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$、又は

－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－ＣＦ$_3$を表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。
５６．Ｒ^{4}が、
－Ｈ；
飽和、非置換の、－Ｆで一置換若しくは多置換されている－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
飽和、非置換の－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（３～１４員シクロアルキル）；
飽和、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_{1-6}$－アルキル；
各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、３～１４員シクロアルキル若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員シクロアルキル）；
非置換の、一置換、若しくは多置換の、３～１４員ヘテロシクロアルキル若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（３～１４員ヘテロシクロアルキル）；
各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、－フェニル、若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－フェニル；又は
各々非置換の、一置換、若しくは多置換の、５～１４員ヘテロアリール若しくは－Ｃ$_{1-6}$－アルキレン－（５～１４員ヘテロアリール）を表す、先行項目のいずれか１つのいずれか１つに記載の化合物。
５７．Ｒ^{4}が、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキル（好ましくは３、４、５又は６員シクロアルキル）であって、当該３～１４員シクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員シクロアルキル；又は飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員ヘテロシクロアルキル（好ましくは４、５又は６員ヘテロシクロアルキル）であって、当該３～１４員ヘテロシクロアルキルが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、３～１４員ヘテロシクロアルキル；又は非置換の、一置換若しくは多置換の６～１４員アリール（好ましくは６員アリール）であって、当該６～１４員アリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、６～１４員アリール；又は非置換の、一置換若しくは多置換の５～１４員ヘテロアリール（好ましくは５若しくは６員ヘテロアリール）であって、当該５～１４員ヘテロアリールが、飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－を介して接続されている、５～１４員ヘテロアリールを表す、先行項目のいずれか１つのいずれか１つに記載の化合物。
５８．Ｒ^{3}が、Ｈであり、Ｒ^{4}が、以下からなる群から選択される残基である、先行項目のいずれか１つのいずれか１つに記載の化合物。

【化３９－１】



【化３９－２】



５９．Ｒ[3]及びＲ[4]が一緒になって、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、及びピペラジンからなる群から選択される複素環を形成し、いずれの場合も、非置換、互いに独立して、－Ｆ、－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｏ－Ｃ$_{1-6}$－アルキル、－非置換ピリジル、及び、非置換又は－Ｃ$_{1-6}$－アルキルで一置換された１，２，４－オキサジアゾールからなる群から選択される置換基で一置換又は多置換されている、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

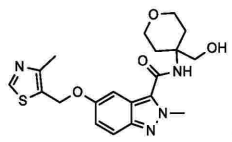
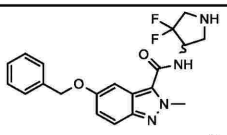
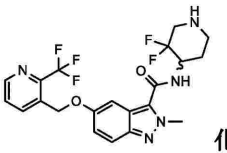
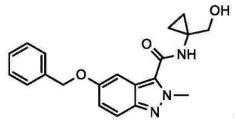
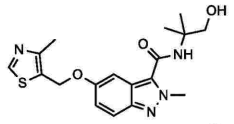
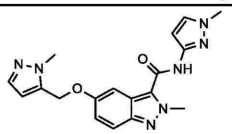
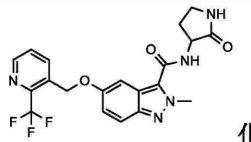
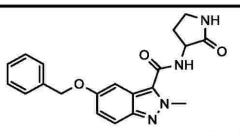
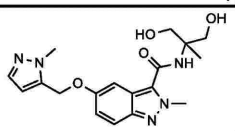
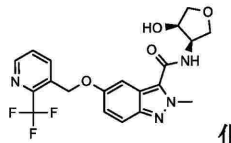
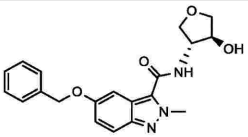
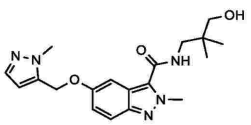
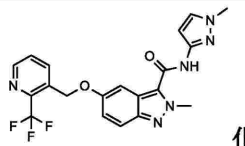
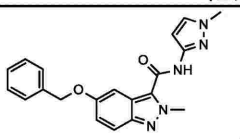
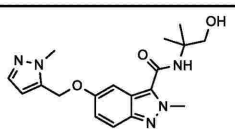
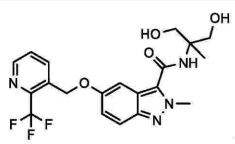
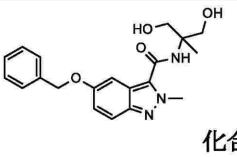
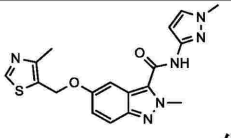
６０．Ｒ[5]及びＲ[5]’が、互いに独立して、
－Ｈ；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキル；
飽和若しくは不飽和の、非置換の、一置換若しくは多置換の３～１４員シクロアルキルであって、当該３～１４員シクロアルキルが、任意選択的に、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキレン－若しくは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－ヘテロアルキレン－（いずれの場合も、飽和若しくは不飽和、非置換、一置換若しくは多置換である）を介して接続されている、３～１４員シクロアルキルを表す、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

６１．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、若しくは互いに独立して、－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た－ＮＨＣ$_{1-6}$－アルキル；
非置換、若しくは互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ

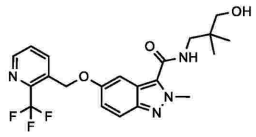
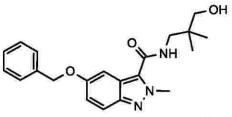
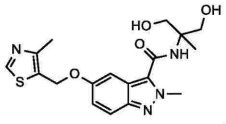
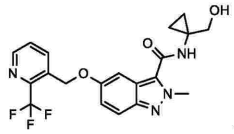
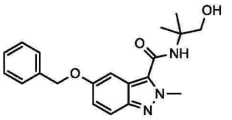
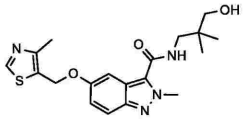
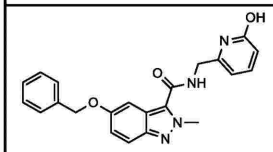
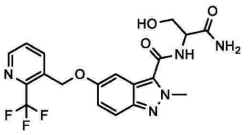
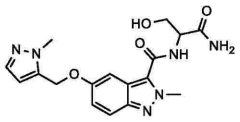
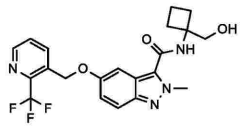
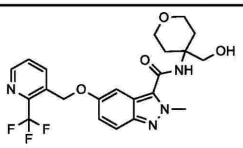
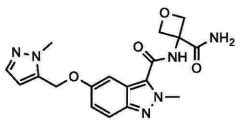
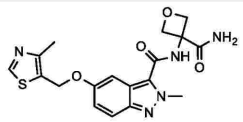
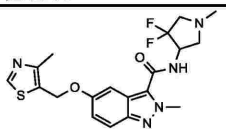
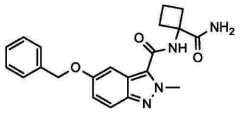
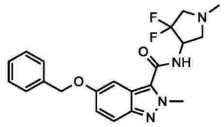
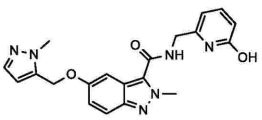
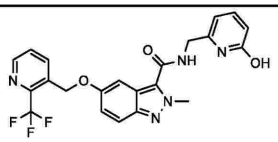
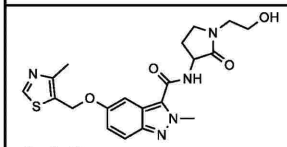
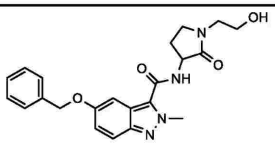
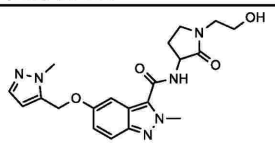
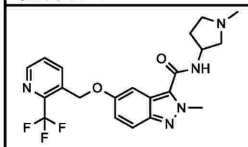
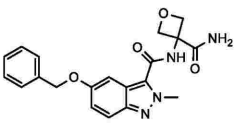
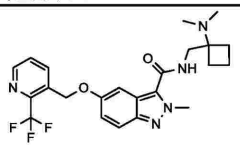
、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$から選択される１つ以上の置換基で置換された－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$－アルキル）$_2$；
非置換、若しくは互いに独立して、－ＯＨ、＝Ｏ、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、－Ｉ、－ＳＨ、＝Ｓ、－ＣＮ、－ＣＦ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、－ＣＨ$_2$Ｆ、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＣＨＦ$_2$、－ＯＣＨ$_2$Ｆ、ＳＦ$_5$、－ＮＯ$_2$、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＨ、－ＮＨ$_2$、及び－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ$_2$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

６２．以下の表に示される、化合物００１～１９９からなる群から選択される、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

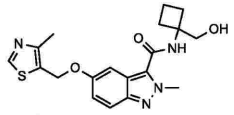
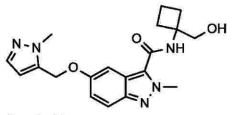
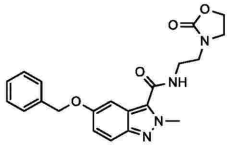
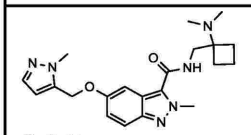
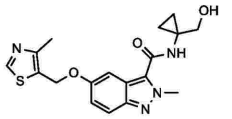
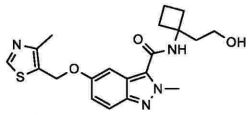
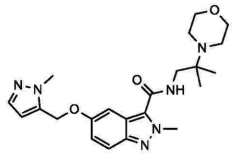
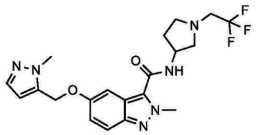
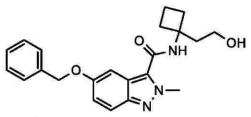
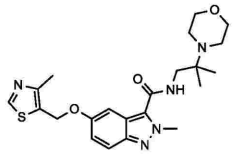
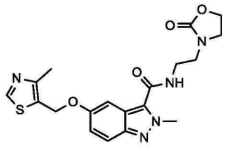
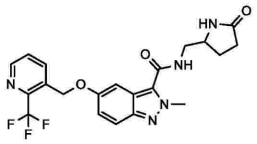
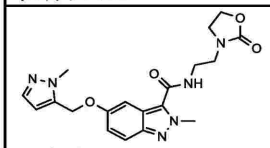
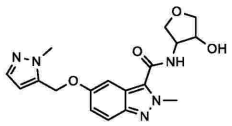
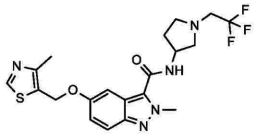
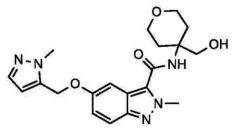
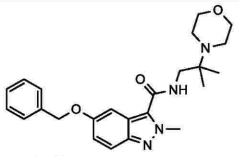
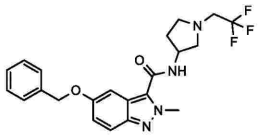
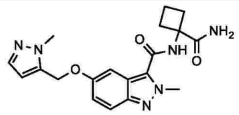
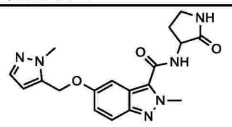
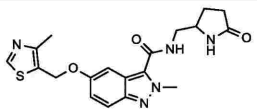
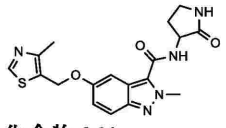
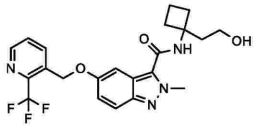
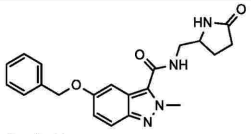
【化４０－１】

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

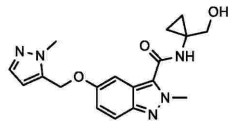
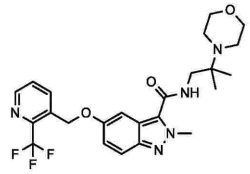
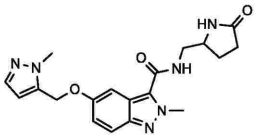
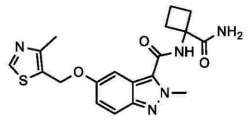
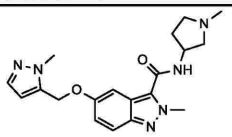
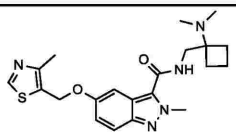
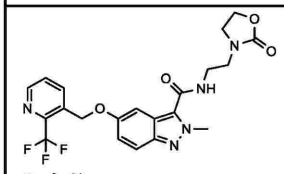
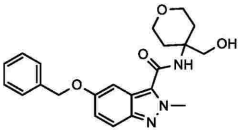
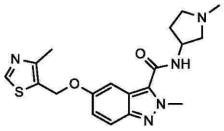
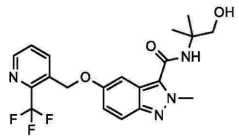
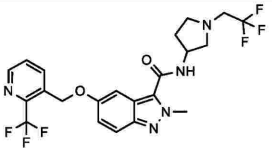
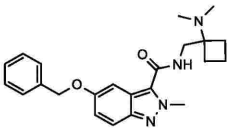
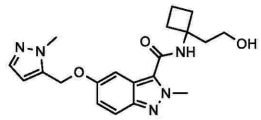
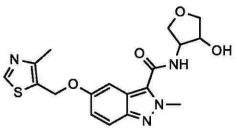
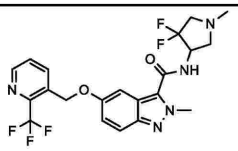
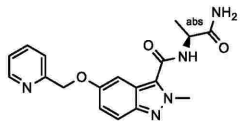
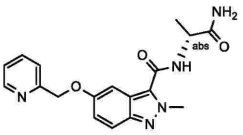
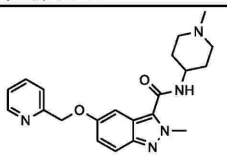
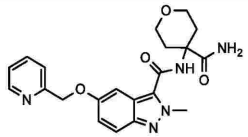
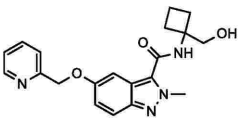
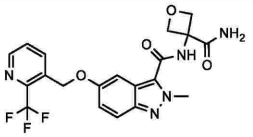
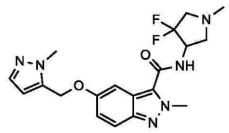
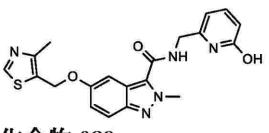
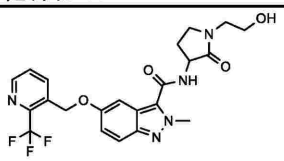
【化４０－２】

 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
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036
 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042

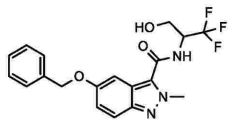
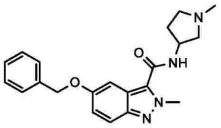
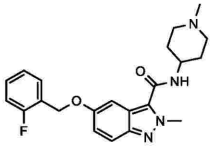
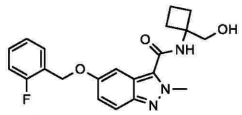
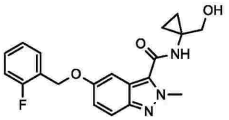
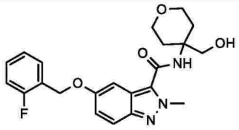
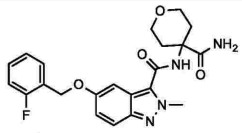
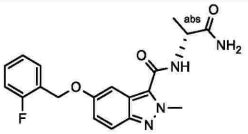
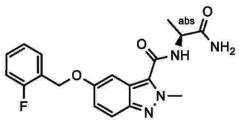
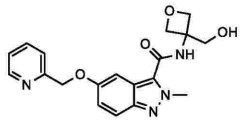
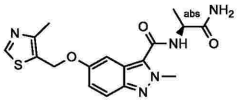
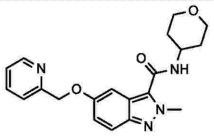
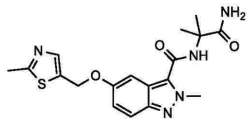
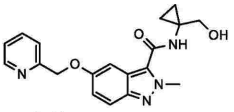
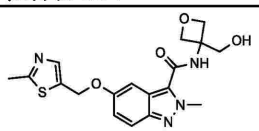
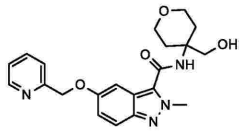
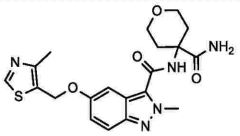
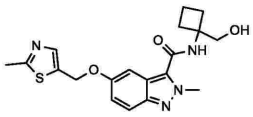
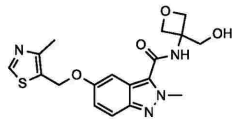
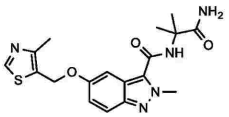
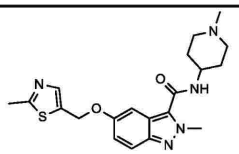
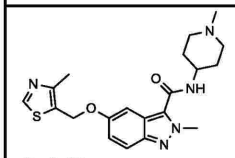
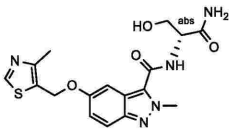
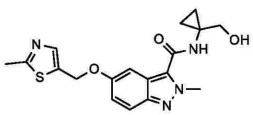
【化４０－３】

 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045
 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048
 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051
 化合物 052	 化合物 053	 化合物 054
 化合物 055	 化合物 056	 化合物 057
 化合物 058	 化合物 059	 化合物 060
 化合物 061	 化合物 062	 化合物 063
 化合物 064	 化合物 065	 化合物 066

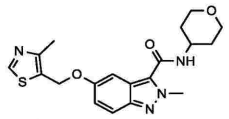
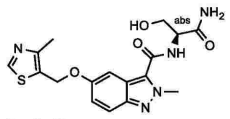
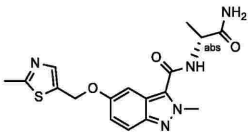
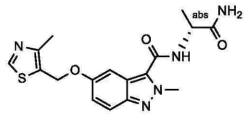
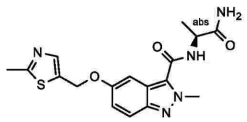
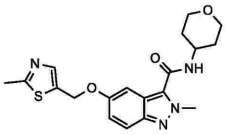
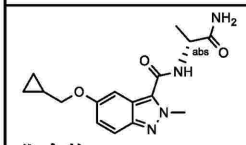
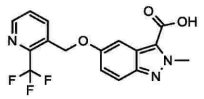
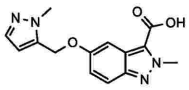
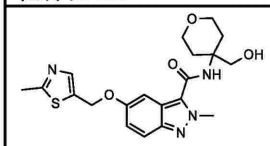
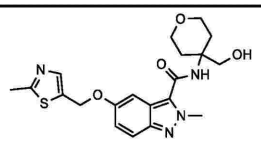
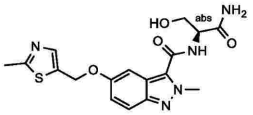
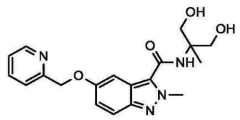
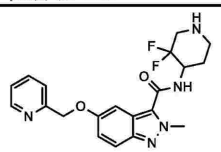
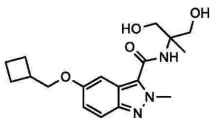
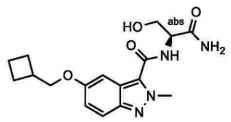
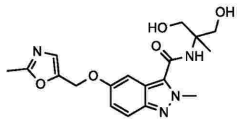
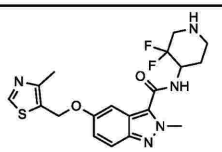
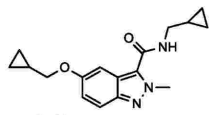
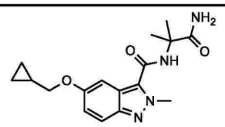
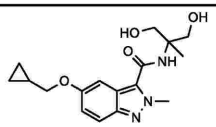
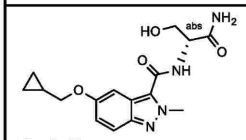
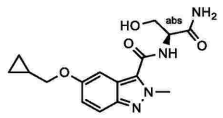
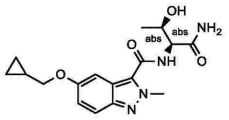
【化４０－４】

 化合物 067	 化合物 068	 化合物 069
 化合物 070	 化合物 071	 化合物 072
 化合物 073	 化合物 074	 化合物 075
 化合物 076	 化合物 077	 化合物 078
 化合物 079	 化合物 080	 化合物 081
 化合物 082	 化合物 083	 化合物 084
 化合物 085	 化合物 086	 化合物 087
 化合物 088	 化合物 089	 化合物 090

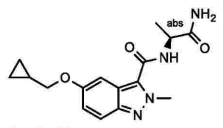
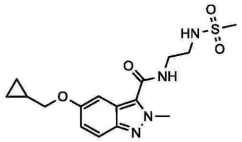
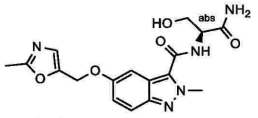
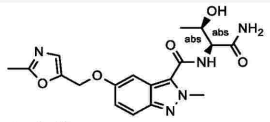
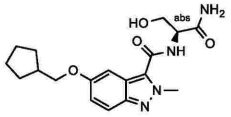
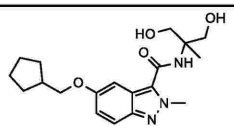
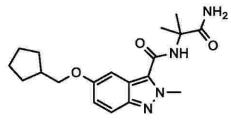
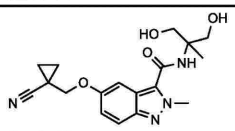
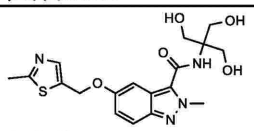
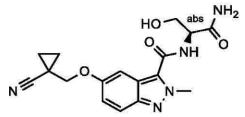
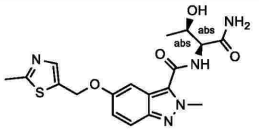
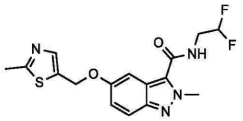
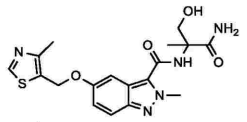
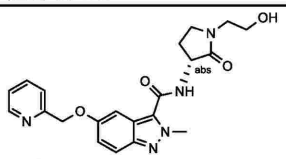
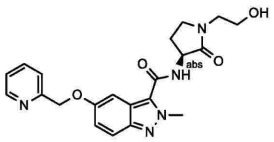
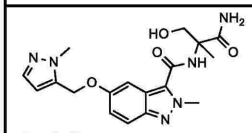
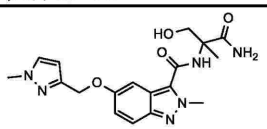
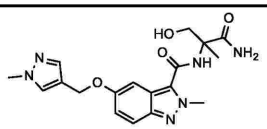
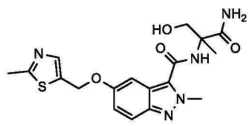
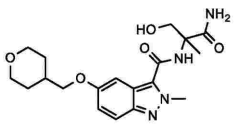
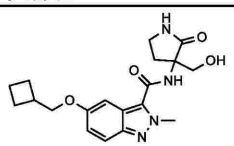
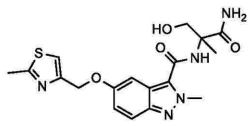
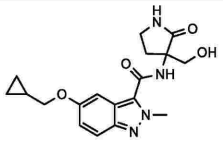
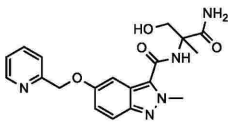
【化４０－５】

 化合物 091	 化合物 092	 化合物 093
 化合物 094	 化合物 095	 化合物 096
 化合物 097	 化合物 098	 化合物 099
 化合物 100	 化合物 101	 化合物 102
 化合物 103	 化合物 104	 化合物 105
 化合物 106	 化合物 107	 化合物 108
 化合物 109	 化合物 110	 化合物 111
 化合物 112	 化合物 113	 化合物 114

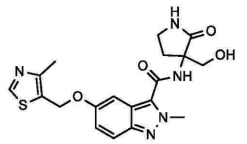
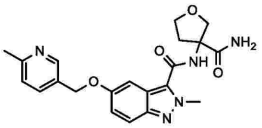
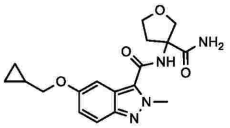
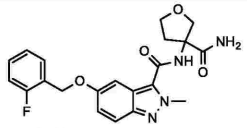
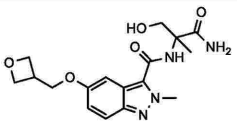
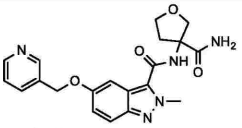
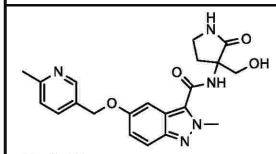
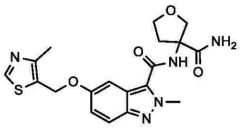
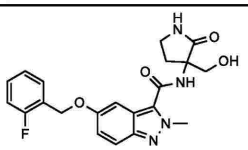
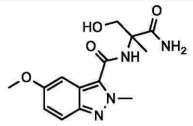
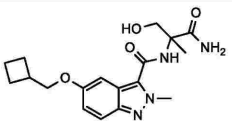
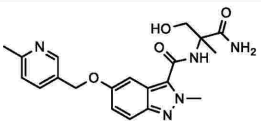
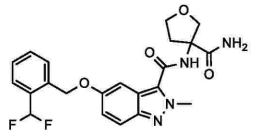
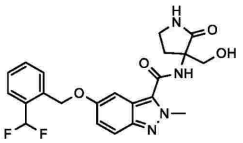
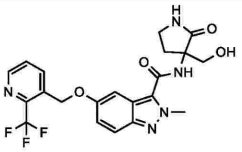
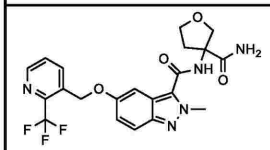
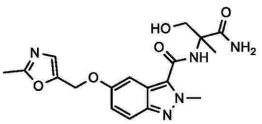
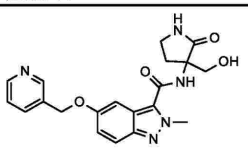
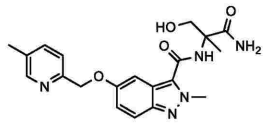
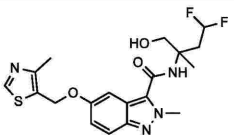
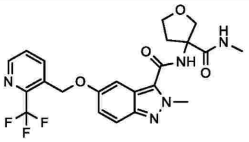
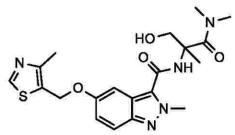
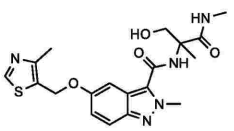
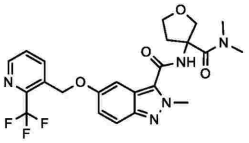
【化４０－６】

 化合物 115	 化合物 116	 化合物 117
 化合物 118	 化合物 119	 化合物 120
 化合物 121	 化合物 122	 化合物 123
 化合物 124	 化合物 125	 化合物 126
 化合物 127	 化合物 128	 化合物 129
 化合物 130	 化合物 131	 化合物 132
 化合物 133	 化合物 134	 化合物 135
 化合物 136	 化合物 137	 化合物 138

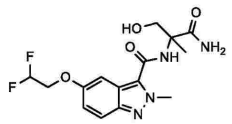
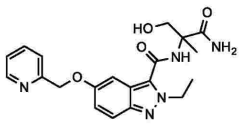
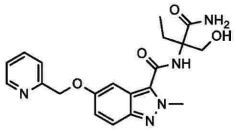
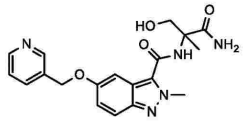
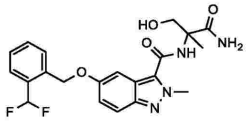
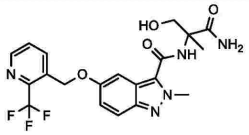
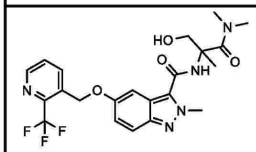
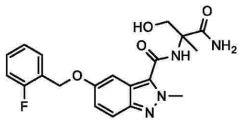
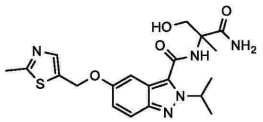
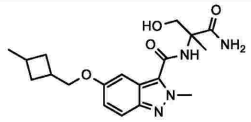
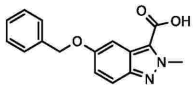
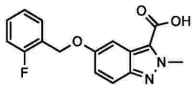
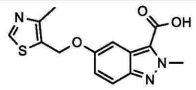
【化４０－７】

 化合物 139	 化合物 140	 化合物 141
 化合物 142	 化合物 143	 化合物 144
 化合物 145	 化合物 146	 化合物 147
 化合物 148	 化合物 149	 化合物 150
 化合物 151	 化合物 152	 化合物 153
 化合物 154	 化合物 155	 化合物 156
 化合物 157	 化合物 158	 化合物 159
 化合物 160	 化合物 161	 化合物 162

【化４０－８】

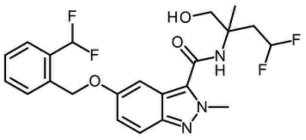
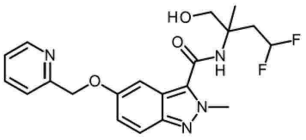
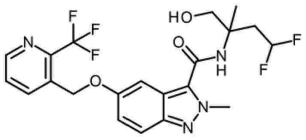
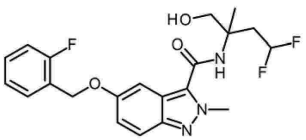
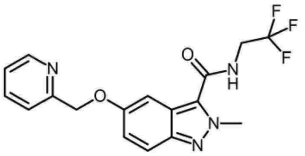
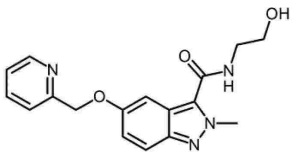
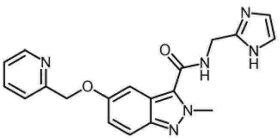
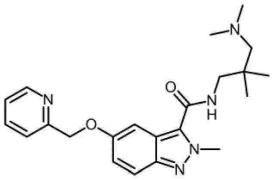
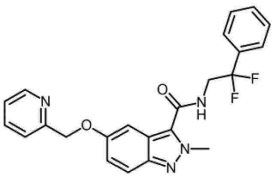
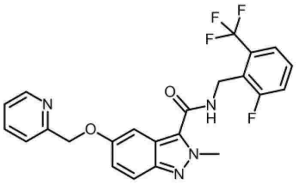
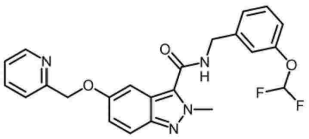
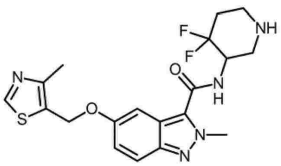
 化合物 163	 化合物 164	 化合物 165
 化合物 166	 化合物 167	 化合物 168
 化合物 169	 化合物 170	 化合物 171
 化合物 172	 化合物 173	 化合物 174
 化合物 175	 化合物 176	 化合物 177
 化合物 178	 化合物 179	 化合物 180
 化合物 181	 化合物 182	 化合物 183
 化合物 184	 化合物 185	 化合物 186

【化４０－９】

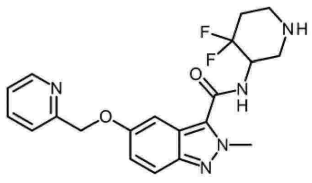
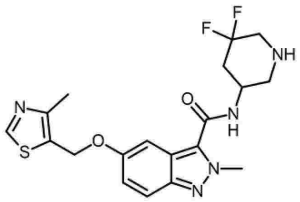
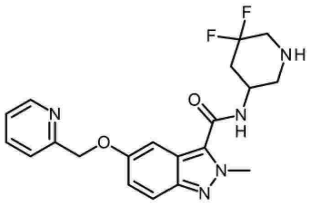
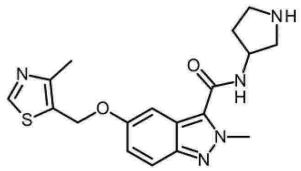
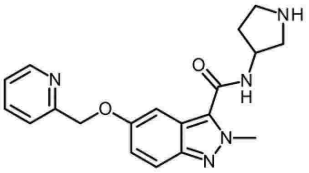
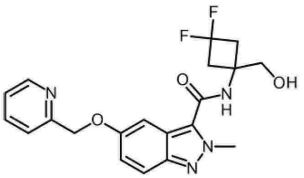
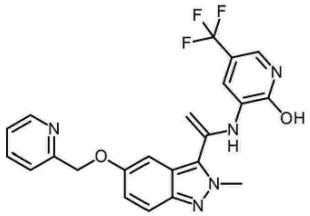
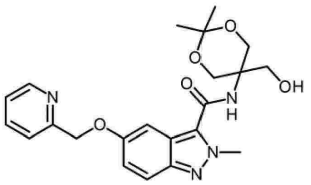
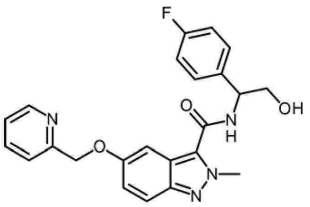
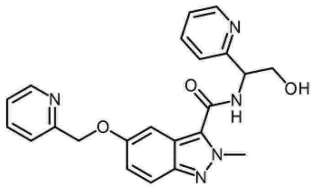
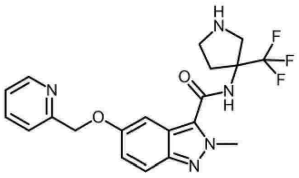
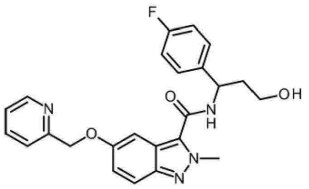
 化合物 187	 化合物 188	 化合物 189
 化合物 190	 化合物 191	 化合物 192
 化合物 193	 化合物 194	 化合物 195
 化合物 196	 化合物 197	 化合物 198
 化合物 199		

６３．以下の表に示される、化合物２００～２６２からなる群から選択される、先行項目のいずれか１つに記載の化合物。

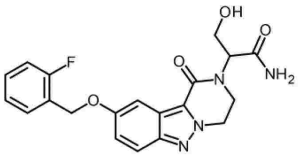
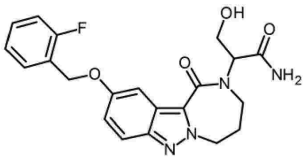
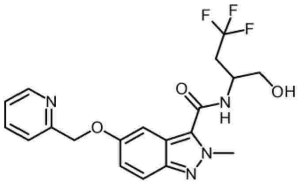
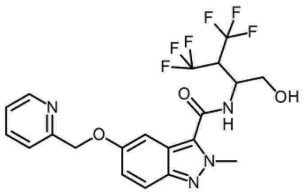
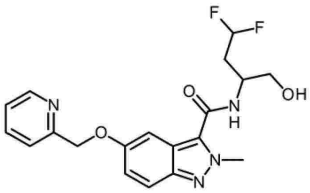
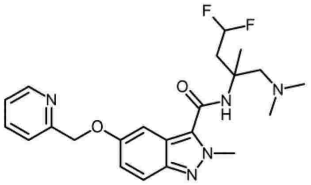
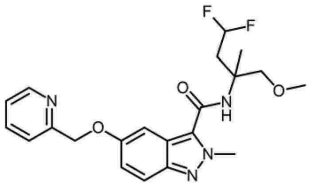
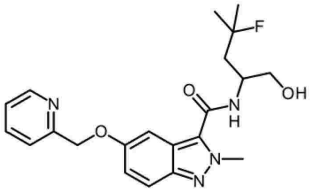
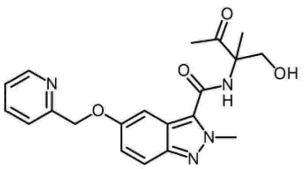
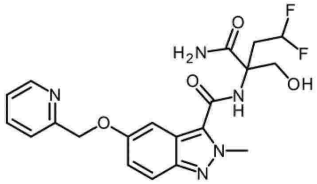
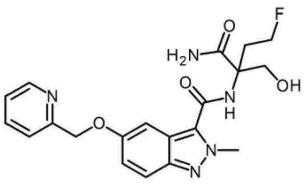
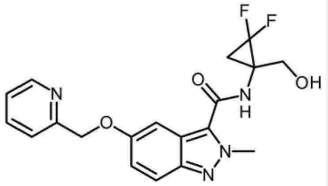
【化４１－１】

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 200**	 **化合物 201**	 **化合物 202**
 **化合物 203**	 **化合物 204**	 **化合物 205**
 **化合物 206**	 **化合物 207**	 **化合物 208**
 **化合物 209**	 **化合物 210**	 **化合物 211**

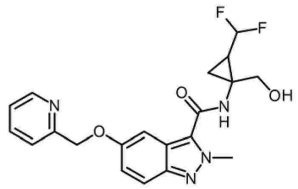
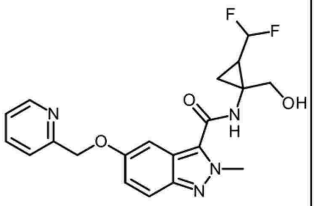
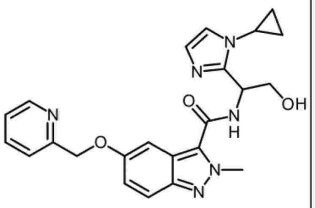
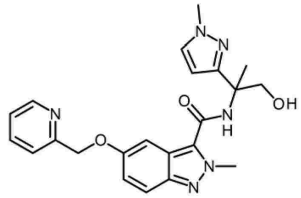
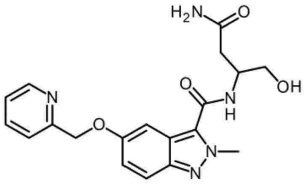
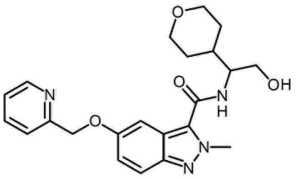
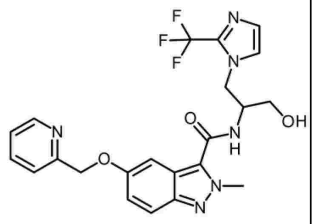
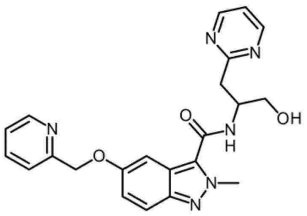
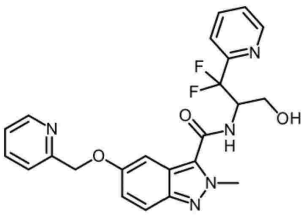
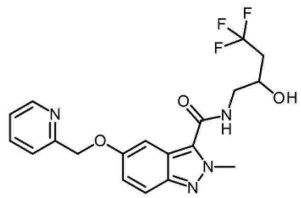
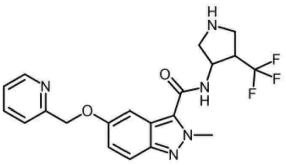
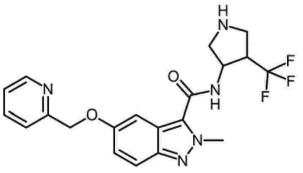
【化４１－２】

 化合物 212	 化合物 213	 化合物 214
 化合物 215	 化合物 216	 化合物 217
 化合物 218	 化合物 219	 化合物 220
 化合物 221	 化合物 222	 化合物 223

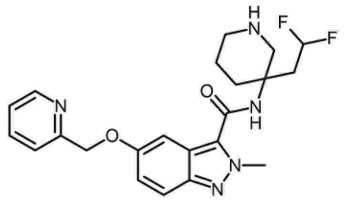
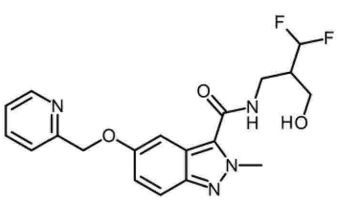
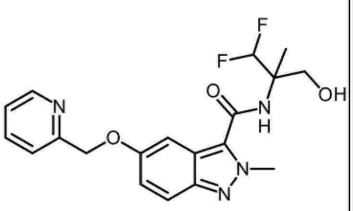
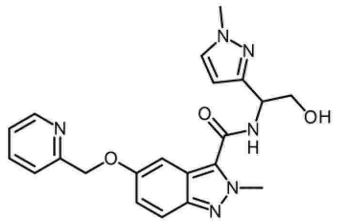
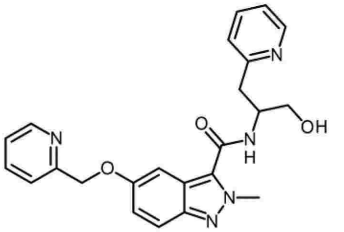
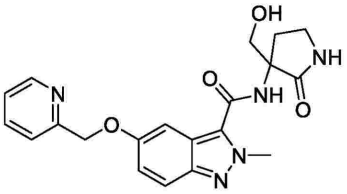
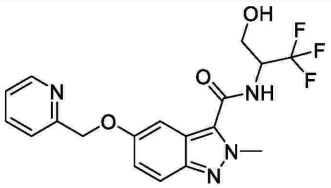
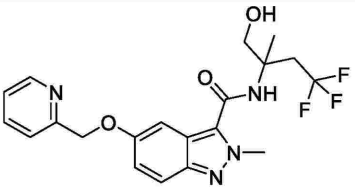
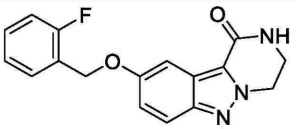
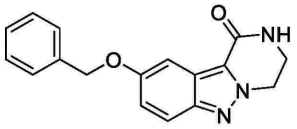
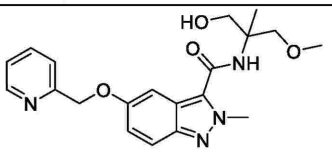
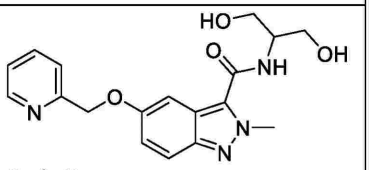
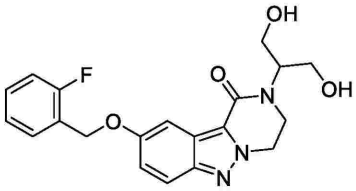
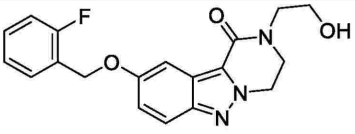
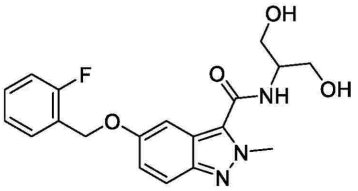
【化４１－３】

 化合物 224	 化合物 225	 化合物 226
 化合物 227	 化合物 228	 化合物 229
 化合物 230	 化合物 231	 化合物 232
 化合物 233	 化合物 234	 化合物 235

【化４１－４】

 化合物 236 (トランス異性体)	 化合物 237(シス異性体)	 化合物 238
 化合物 239	 化合物 240	 化合物 241
 化合物 242	 化合物 243	 化合物 244
 化合物 245	 化合物 246 (トランス異性体)	 化合物 247(シス異性体)

【化４１－５】

 化合物 248	 化合物 249	 化合物 250
 化合物 251	 化合物 252	 化合物 253
 化合物 254	 化合物 255	 化合物 256
 化合物 257	 化合物 258	 化合物 259
 化合物 260	 化合物 261	 化合物 262

６４．先行項目のいずれか１つに記載の化合物を含む、医薬組成物。

６５．疼痛の治療で使用するための、項目１～６３のいずれか１つ記載の化合物、又は項目６４に記載の医薬組成物。

６６．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛、好ましくは、術後疼痛から選択される、項目６５に記載の疼痛の治療で使用するための、化合物又は医薬組成物。

６７．疼痛を治療する方法であって、項目１～６３のいずれか１つに記載の化合物、又は項目６４に記載の医薬組成物を、治療を必要とする対象に投与することを含む、方法。

６８．疼痛が、侵害受容性疼痛、炎症性疼痛、及び神経障害性疼痛、好ましくは、術後疼痛から選択される、項目６７に記載の方法。

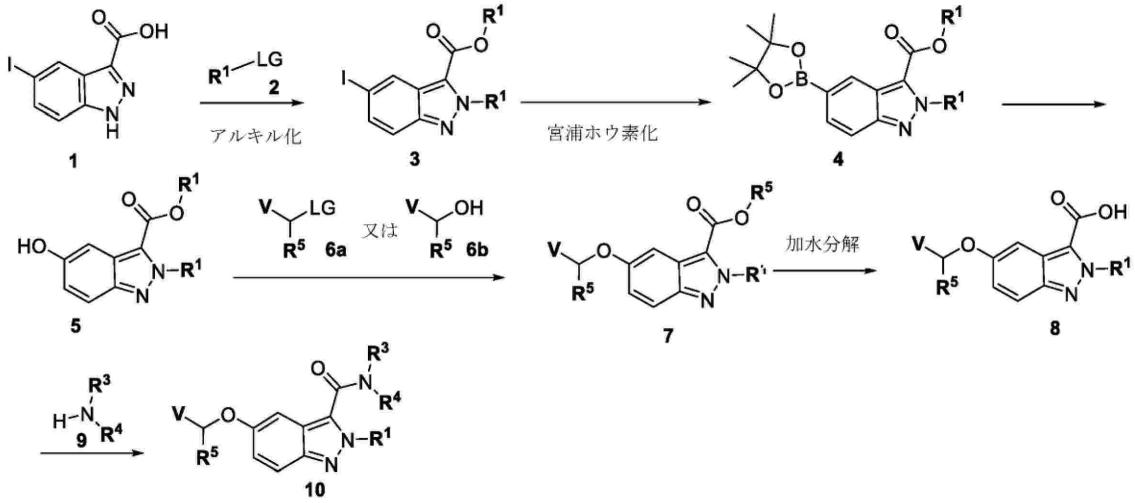
６９．てんかんの治療で使用するための、項目１～６３のいずれか１つに記載の化合物、又は請求項６４に記載の医薬組成物。
７０．てんかんを治療する方法であって、項目１～６３のいずれか１つに記載の化合物、又は項目６４又は６９のいずれかに記載の医薬組成物を、治療を必要とする対象に投与することを含む、方法。
【実施例】
【０１８２】
以下の実施例は、本発明を更に例示するために提供され、決して本発明の範囲を限定することを意図するものではない。
【０１８３】
本発明の代表的な化合物は、以下に記載する一般的な合成方法に従って合成することができ、以下のスキームに例示される。スキームは例示であるため、本発明は、スキーム及び実施例に記載される特定の化学反応及び特定の条件によって限定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、又は当業者に周知の方法によって調製され得る。変数は、本明細書に定義されるとおりであり、当業者の技量の範囲内である。
【０１８４】
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、以下のとおりである。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－ジエチルアミノ硫黄トリフルオリド、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－アゾジカルボン酸ジエチル、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、ＤＰＰＡ－ジフェニルホスホリルアジド、ＤＴＢＡＤ－アゾジカルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル、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－高速液体クロマトグラフィー、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＬＡＨ－水素化アルミニウムリチウム、ＬＧ－脱離基、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、ｎＢｕＬｉ－ｎ－ブチルリチウム、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－トリフェニルホスピン（Ｔｒｉｐｈｅｎｙｌｐｈｏｓｐｉｎｅ）、ＰＳ－ＤＩＥＡ－ポリスチレンに担持されたジイソプロピルエチルアミン、ＰＳ－ＰＰｈ３－ポリスチレンに担持されたトリフェニルホスピン、ＰｙＢｏｐ－ベンゾトリアゾール－１－イルオキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ＰＴＳＡ－ｐ－トルエンスルホン酸、ＲＦ：境界比（ｒａｔｉｏ　ｏｆ　ｆｒｏｎｔｉｅｒｓ）、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－テトラブチルアンモニウムフルオリド水和物、ＴＢＡＩ－テトラブチルアンモ

ニウムヨージド、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－薄層クロマトグラフィー、ＴＰＰ－トリフェニルホスフィン、ＩＰＡ－イソプロピルアルコール、ＴＭＳ－トリメチルシリル、Ｔ３Ｐ－プロピルホスホン酸無水物。

【０１８５】

本明細書に記載の一般式（Ａ）及び全ての他の一般式、並びにその実施形態に従う構造を有する対象の化合物は、一般化学スキーム１に概説されるように調製することができる。

【化４２】



【０１８６】

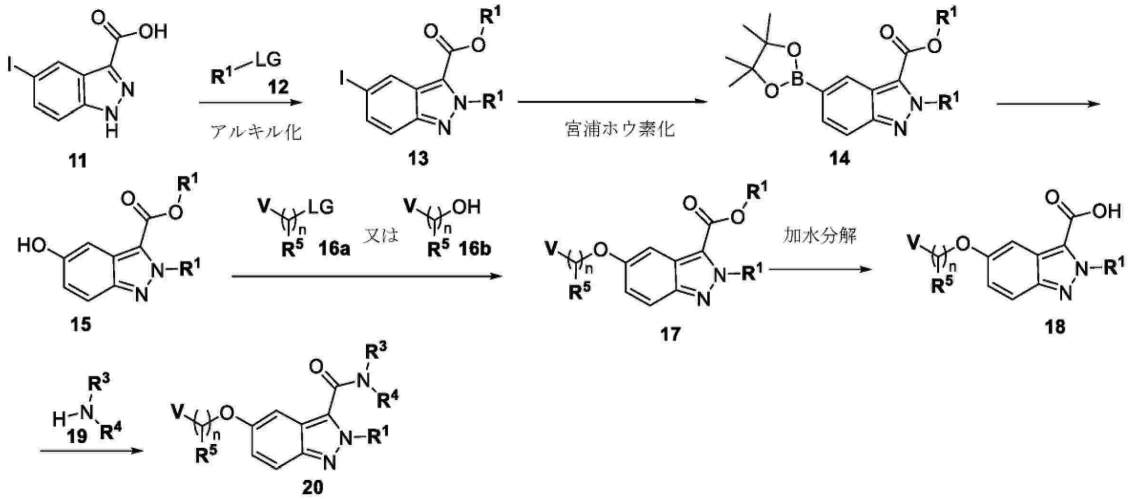
スキーム１：全てのＶ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、及びＲ^{5}は、本発明の化合物について記載されるとおりである。Ｒ^{5}の各出現において、最大２つの独立した置換基が企図される（すなわち、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$）。

【０１８７】

式１の５－ヨード－１Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸は、式２の中間体（市販品又は合成品）（ここで、ＬＧは脱離基（例えば、ハロゲン化物、スルホン酸エステルなど）である）を使用して、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中、塩基（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下、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）伴い又は伴わずに、０～１００℃の範囲の温度で求核置換反応を介して式３の中間体に変換することができる。式３の化合物は、溶媒（例えば、ＤＭＦ、ジオキサンなど）中、金属触媒（例えば、［１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロパラジウム（ＩＩ）など）及び塩基（例えば、K_2CO_3、酢酸カリウムなど）の存在下で、室温から還流の温度で、ホウ素試薬（例えば、ビス（ピナコラート）ジボロンなど）とクロスカップリング反応条件下で反応させて、式４の中間体を得ることができる。次いで、アルコール誘導体５は、溶媒（例えば、アセトンなど）中、酸化剤（例えば、オキソンなど）及び水の存在下で、中間体４からボロンエステルの酸化的開裂を介して得ることができる。次いで、式５の中間体は、式６ａの中間体（市販品又は合成品）（式中、ＬＧは脱離基（例えば、ハロゲン化物、スルホン酸エステルなど）である）を使用して、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰ、及びこれに類するもの）中、塩基（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下、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）を伴い又は伴わずに、０から還流までの範囲の温度での求核置換反応を介して、式７の所望の化合物に変換することができる。あるいは、式５の中間体は、代わりに、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中、アゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブ

チルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下で、０～１００℃の範囲の温度で、式６ｂの中間体（市販品又は合成品）と反応させて、式７の所望の化合物を得ることができる。次いで、エステル誘導体７は、標準的な鹸化反応を介して式８の所望の化合物に変換され得る。式１０の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中で標準的なペプチドカップリング条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で式９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）との反応によって、式８の酸誘導体から得ることができる。あるいは、式８のカルボン酸誘導体を、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載される手順によって、酸塩化物誘導体に変換し、次いで、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載される手順によって、式９のアミンと反応させて、式１０の所望の化合物を得ることができる。

【化４３】



【０１８８】

スキーム２：全てのＶ、ｎ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、及びＲ^{5}は、本発明の化合物について記載されるとおりである。Ｒ^{5}の各発生において、最大２つの独立した置換基が企図される（すなわち、Ｒ^{5}及びＲ$^{5'}$）。整数ｎは、いくつかの実施形態では、１～１０の範囲であり得る。

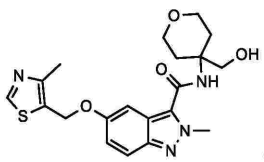
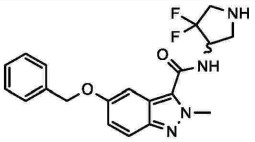
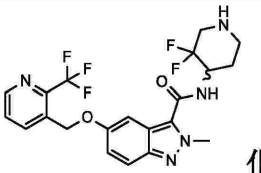
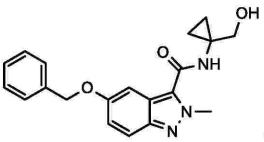
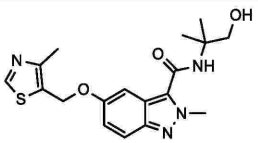
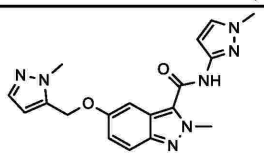
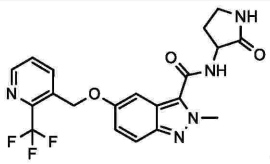
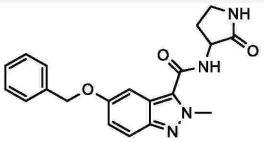
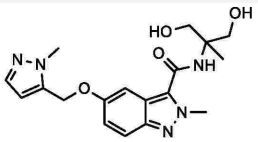
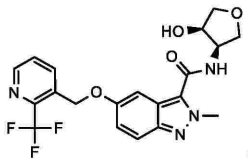
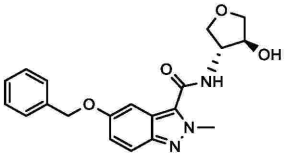
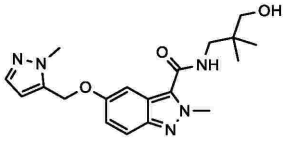
【０１８９】

代替的な実施形態では、式１１の５－ヨード－１Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸は、式１２の中間体（市販品又は合成品）（ここで、ＬＧは脱離基（例えば、ハロゲン化物、スルホン酸エステルなど）である）を使用して、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰなど）中、塩基（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下、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）伴い又は伴わずに、０～１００℃の範囲の温度で求核置換反応を介して式１３の中間体に変換することができる。式１３の化合物は、溶媒（例えば、ＤＭＦ、ジオキサンなど）中、金属触媒（例えば、［１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］ジクロロパラジウム（ＩＩ）など）及び塩基（例えば、K_2CO_3、酢酸カリウムなど）の存在下で、室温から還流の温度で、ホウ素試薬（例えば、ビス（ピナコラート）ジボロンなど）とクロスカップリング反応条件下で反応させて、式１４の中間体を得ることができる。次いで、アルコール誘導体１５は、溶媒（例えば、アセトンなど）中、酸化剤（例えば、オキソンなど）及び水の存在下で、中間体１４からボロンエステルの酸化的開裂を介して得ることができる。次いで、式１５の中間体は、式１６ａの中間体（市販品又は合成品）（式中、ＬＧは脱離基（例えば、ハロゲン化物、スルホン酸エステルなど）である）を使用して、極性溶媒（例えば、アセトニトリル、ＤＭＦ、ＮＭＰ、及びこれに類するもの）中、塩基（例えば、ＤＩＰＥＡ、ＤＢＵ

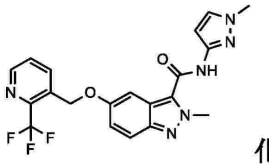
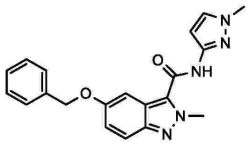
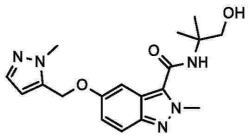
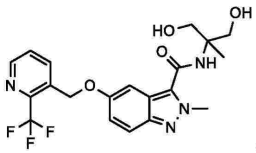
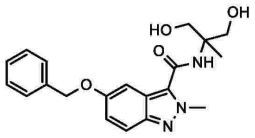
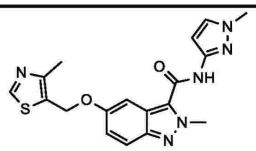
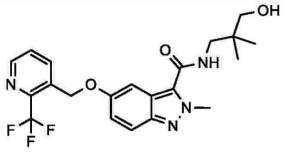
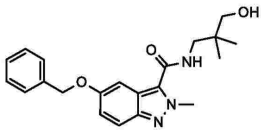
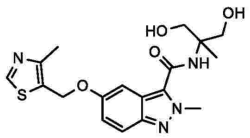
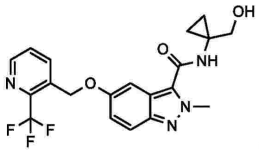
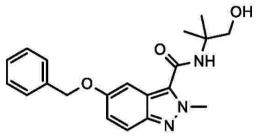
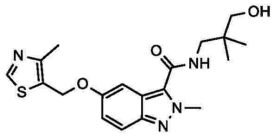
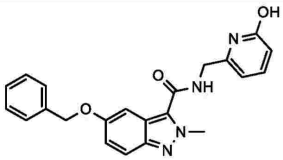
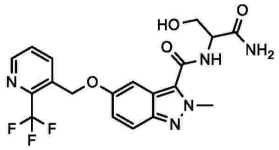
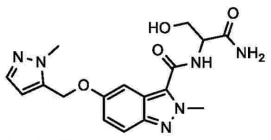
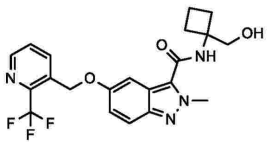
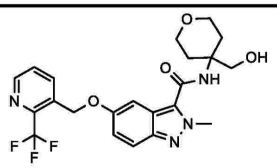
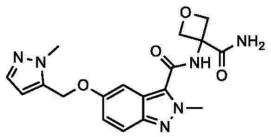
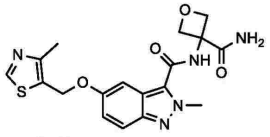
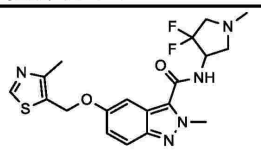
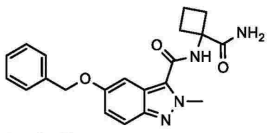
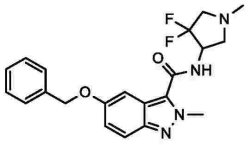
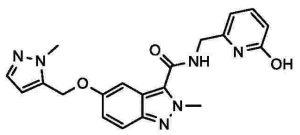
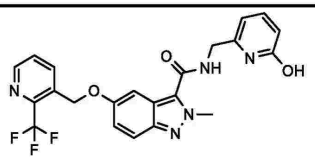
、トリエチルアミン、Cs_2CO_3など）の存在下、キレート剤（例えば、１８－クラウン－６、シス－アンチ－シス－ジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６など）を伴い又は伴わずに、０から還流までの範囲の温度での求核置換反応を介して、式１７の所望の化合物に変換することができる。あるいは、式１５の中間体は、代わりに、溶媒（例えば、ＴＨＦ、トルエンなど）中、アゾジカルボキシレート試薬（例えば、ＤＥＡＤ、ＤＩＡＤ、ＡＤＤＰなど）及びホスフィン（例えば、トリブチルホスフィン、トリフェニルホスフィンなど）の存在下で、０～１００℃の範囲の温度で、式１６ｂの中間体（市販品又は合成品）と反応させて、式１７の所望の化合物を得ることができる。次いで、エステル誘導体１７は、標準的な鹸化反応を介して式１８の所望の化合物に変換され得る。式２０の所望の化合物は、極性非プロトン性溶媒（例えば、ＤＣＭ、ＤＭＦなど）中で標準的なペプチドカップリング条件（例えば、ＤＣＣ、ＥＤＣＩ、ＨＡＴＵ、ＰｙＢｏｐなど）下で式１９のアミン誘導体（市販されているか、又は当該技術分野において既知の手順によって若しくは以下の実施例に記載されるように合成されている）との反応によって、式１８の酸誘導体から得ることができる。あるいは、式１８のカルボン酸誘導体を、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載される手順によって、酸塩化物誘導体に変換し、次いで、当業者に既知の手順によって、又は以下の実施例に記載される手順によって、式１９のアミンと反応させて、式２０の所望の化合物を得ることができる。

【表３－１】

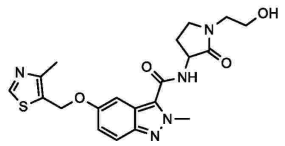
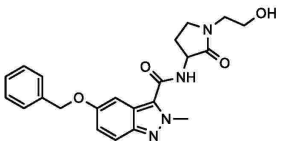
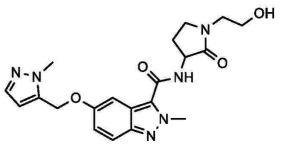
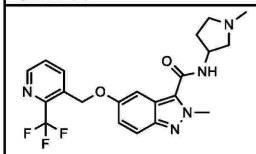
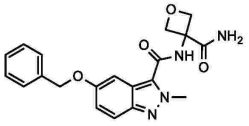
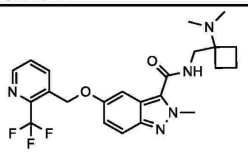
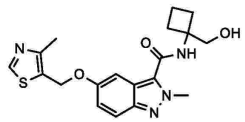
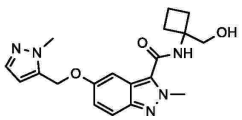
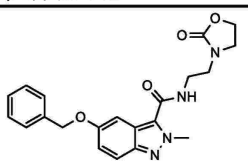
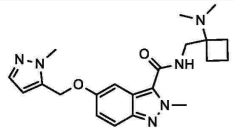
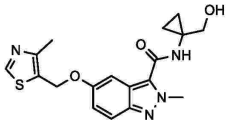
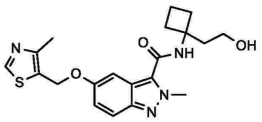
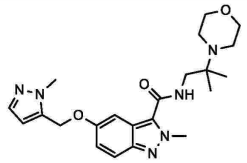
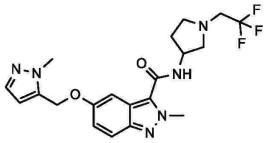
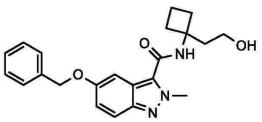
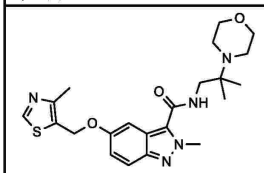
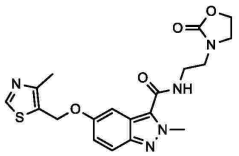
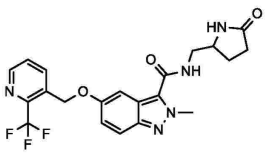
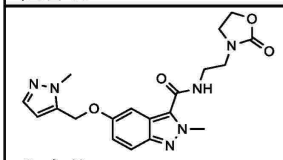
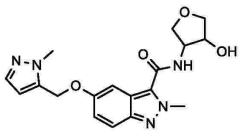
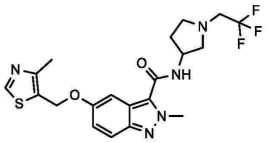
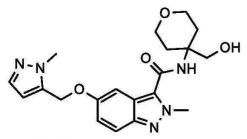
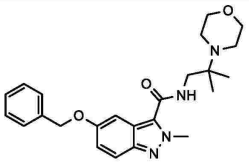
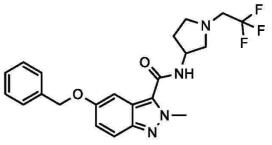
表３：例示的な化合物

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

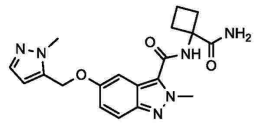
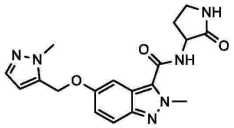
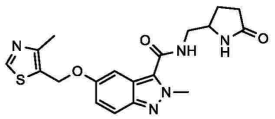
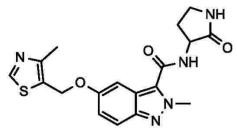
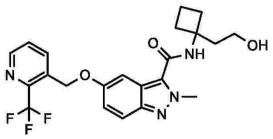
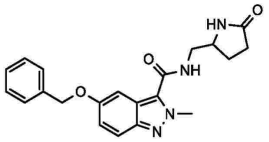
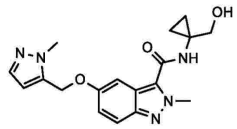
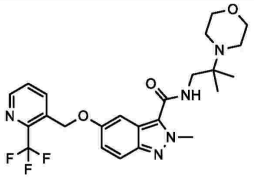
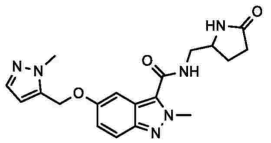
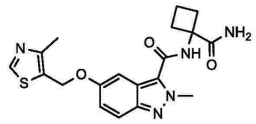
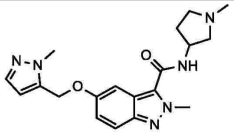
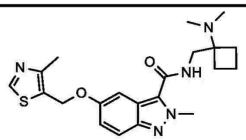
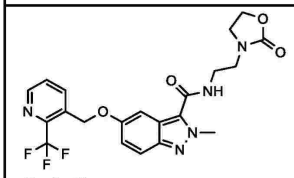
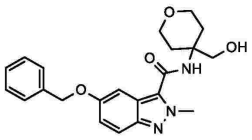
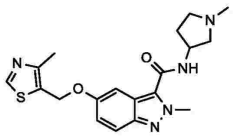
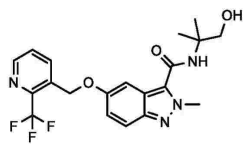
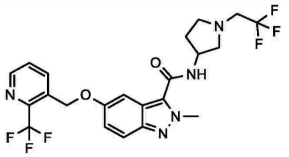
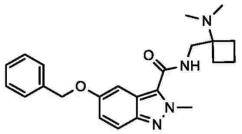
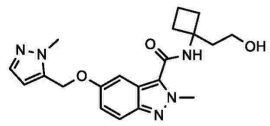
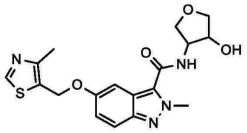
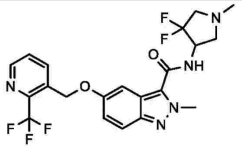
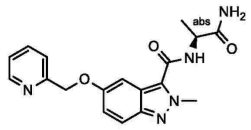
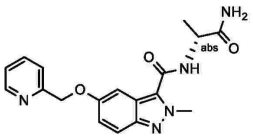
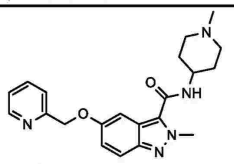
【表３－２】

 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
 化合物 031	 化合物 032	 化合物 033
 化合物 034	 化合物 035	 化合物 036

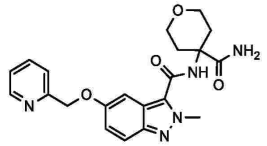
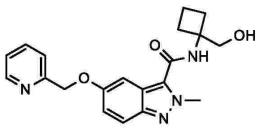
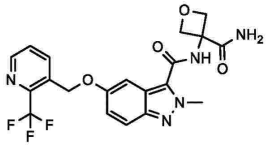
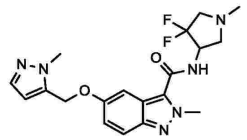
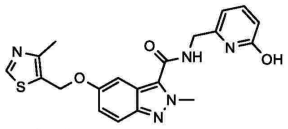
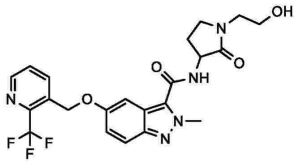
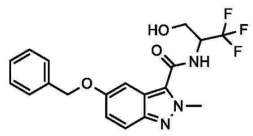
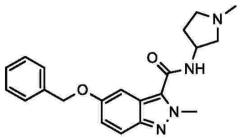
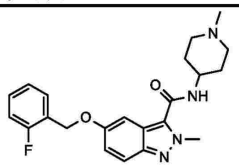
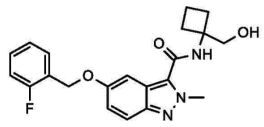
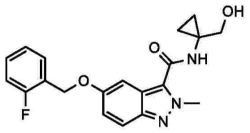
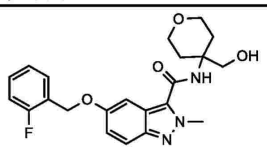
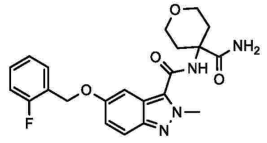
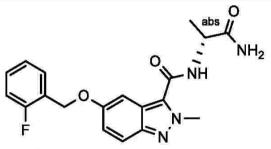
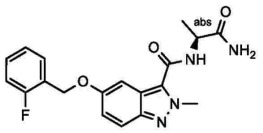
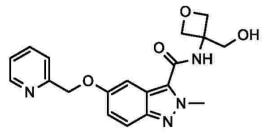
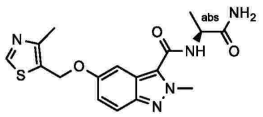
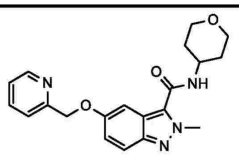
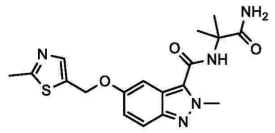
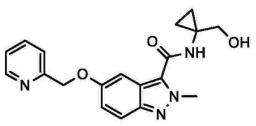
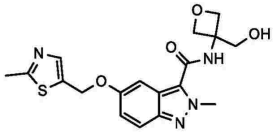
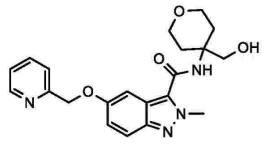
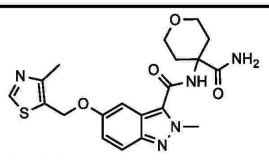
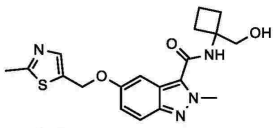
【表３－３】

 化合物 037	 化合物 038	 化合物 039
 化合物 040	 化合物 041	 化合物 042
 化合物 043	 化合物 044	 化合物 045
 化合物 046	 化合物 047	 化合物 048
 化合物 049	 化合物 050	 化合物 051
 化合物 052	 化合物 053	 化合物 054
 化合物 055	 化合物 056	 化合物 057
 化合物 058	 化合物 059	 化合物 060

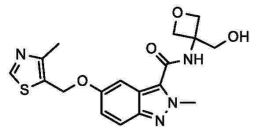
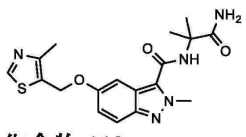
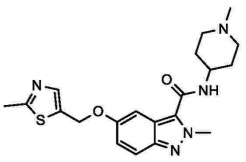
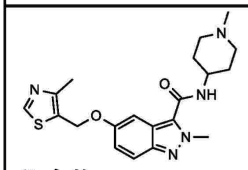
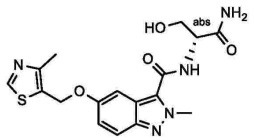
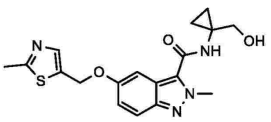
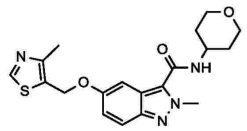
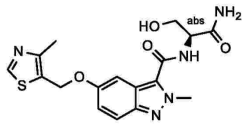
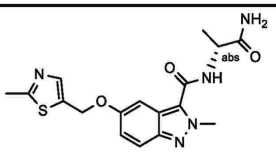
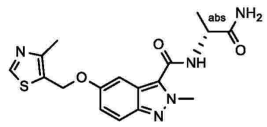
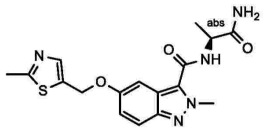
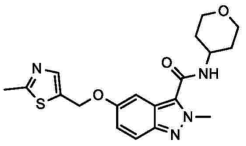
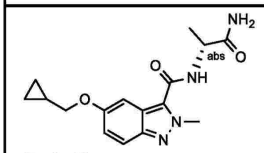
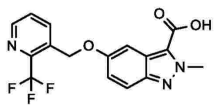
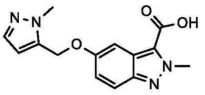
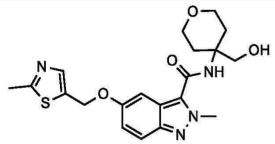
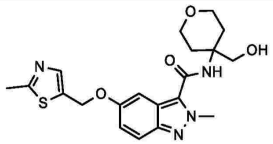
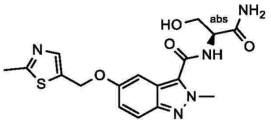
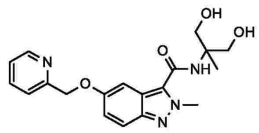
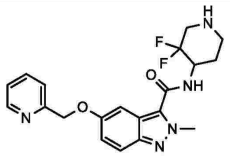
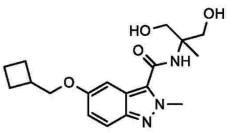
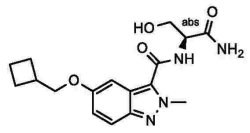
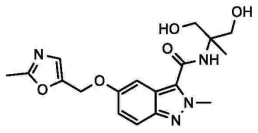
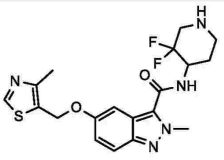
【表３－４】

 化合物 061	 化合物 062	 化合物 063
 化合物 064	 化合物 065	 化合物 066
 化合物 067	 化合物 068	 化合物 069
 化合物 070	 化合物 071	 化合物 072
 化合物 073	 化合物 074	 化合物 075
 化合物 076	 化合物 077	 化合物 078
 化合物 079	 化合物 080	 化合物 081
 化合物 082	 化合物 083	 化合物 084

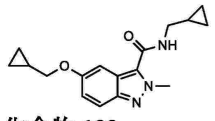
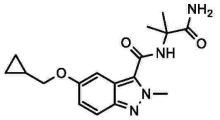
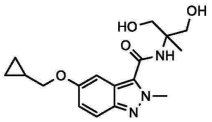
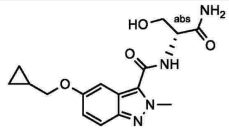
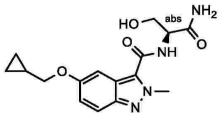
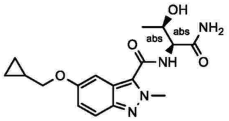
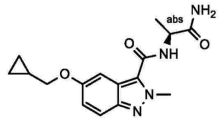
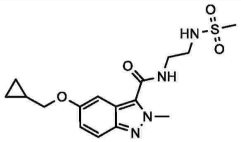
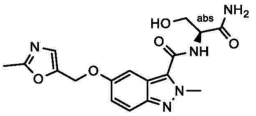
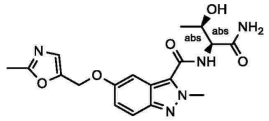
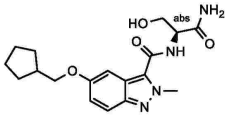
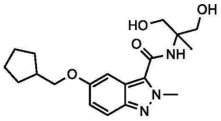
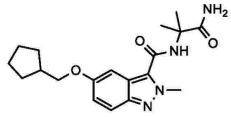
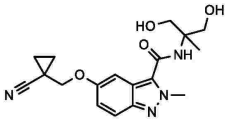
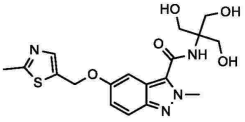
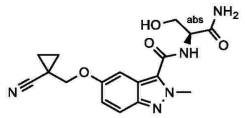
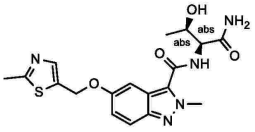
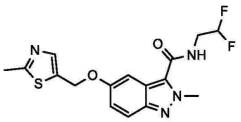
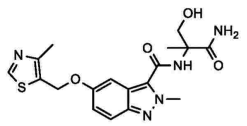
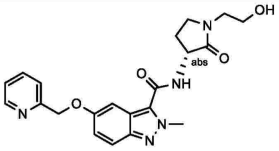
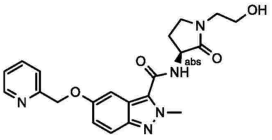
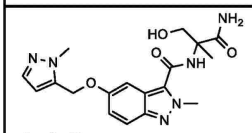
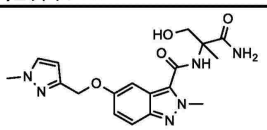
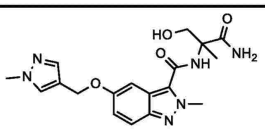
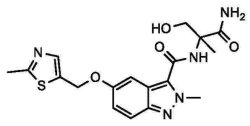
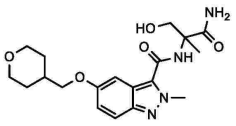
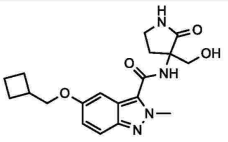
【表３－５】

 化合物 085	 化合物 086	 化合物 087
 化合物 088	 化合物 089	 化合物 090
 化合物 091	 化合物 092	 化合物 093
 化合物 094	 化合物 095	 化合物 096
 化合物 097	 化合物 098	 化合物 099
 化合物 100	 化合物 101	 化合物 102
 化合物 103	 化合物 104	 化合物 105
 化合物 106	 化合物 107	 化合物 108

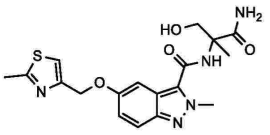
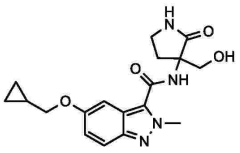
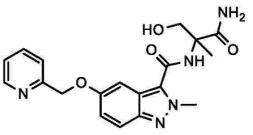
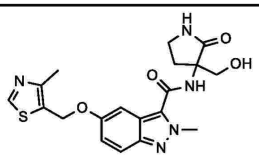
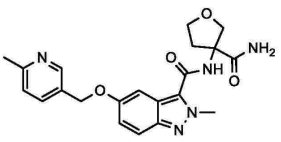
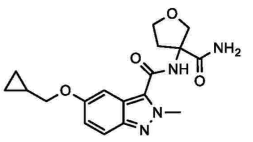
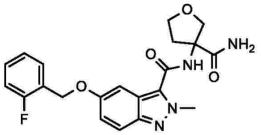
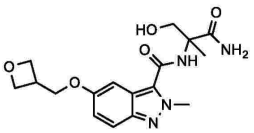
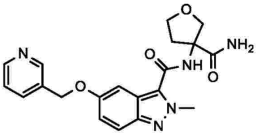
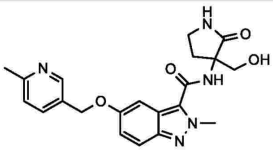
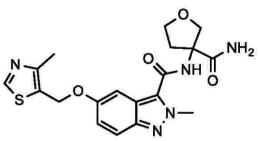
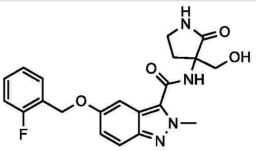
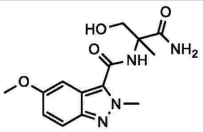
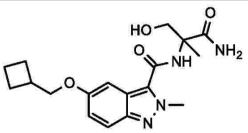
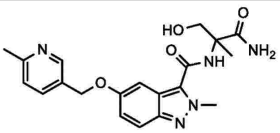
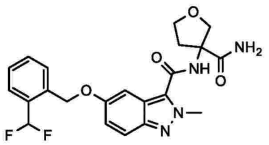
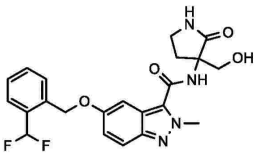
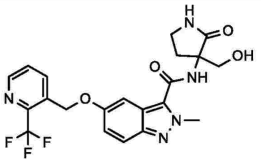
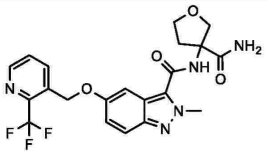
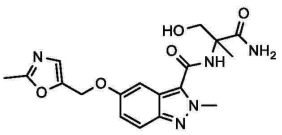
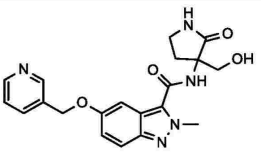
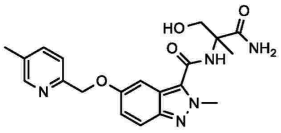
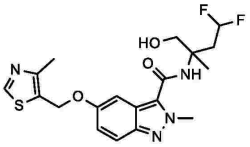
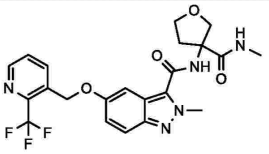
【表３－６】

 化合物 109	 化合物 110	 化合物 111
 化合物 112	 化合物 113	 化合物 114
 化合物 115	 化合物 116	 化合物 117
 化合物 118	 化合物 119	 化合物 120
 化合物 121	 化合物 122	 化合物 123
 化合物 124	 化合物 125	 化合物 126
 化合物 127	 化合物 128	 化合物 129
 化合物 130	 化合物 131	 化合物 132

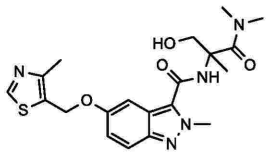
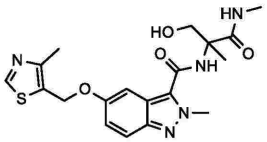
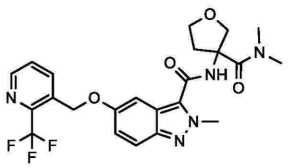
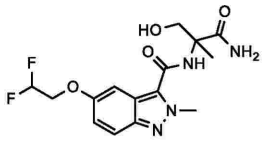
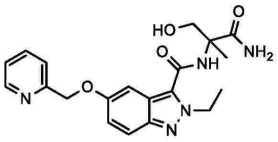
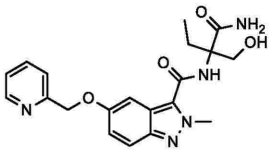
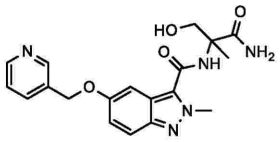
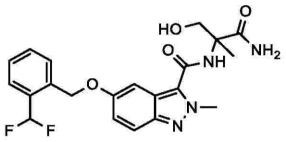
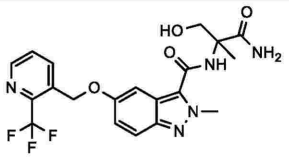
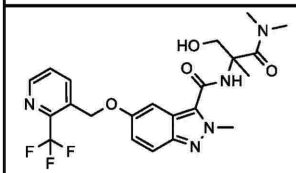
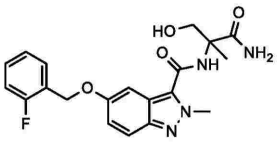
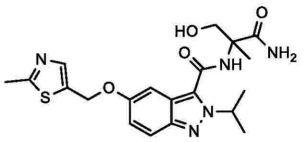
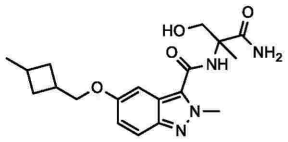
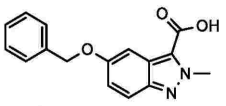
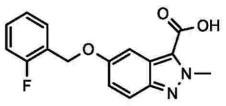
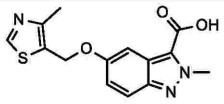
【表３－７】

 化合物 133	 化合物 134	 化合物 135
 化合物 136	 化合物 137	 化合物 138
 化合物 139	 化合物 140	 化合物 141
 化合物 142	 化合物 143	 化合物 144
 化合物 145	 化合物 146	 化合物 147
 化合物 148	 化合物 149	 化合物 150
 化合物 151	 化合物 152	 化合物 153
 化合物 154	 化合物 155	 化合物 156
 化合物 157	 化合物 158	 化合物 159

【表３－８】

 化合物 160	 化合物 161	 化合物 162
 化合物 163	 化合物 164	 化合物 165
 化合物 166	 化合物 167	 化合物 168
 化合物 169	 化合物 170	 化合物 171
 化合物 172	 化合物 173	 化合物 174
 化合物 175	 化合物 176	 化合物 177
 化合物 178	 化合物 179	 化合物 180
 化合物 181	 化合物 182	 化合物 183

【表３－９】

 化合物 184	 化合物 185	 化合物 186
 化合物 187	 化合物 188	 化合物 189
 化合物 190	 化合物 191	 化合物 192
 化合物 193	 化合物 194	 化合物 195
 化合物 196	 化合物 197	 化合物 198
 化合物 199		

10

20

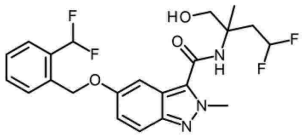
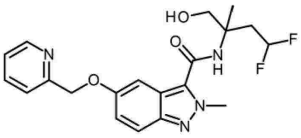
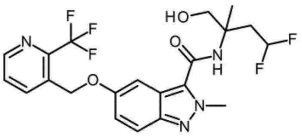
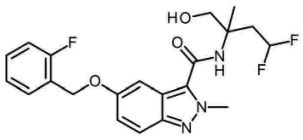
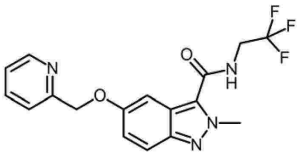
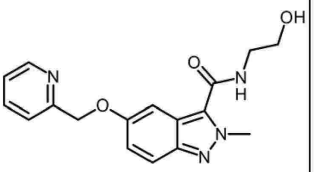
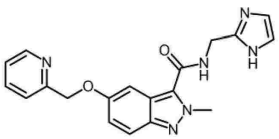
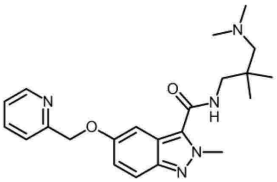
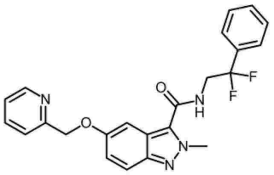
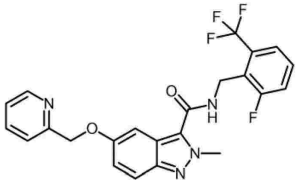
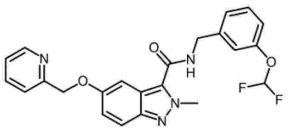
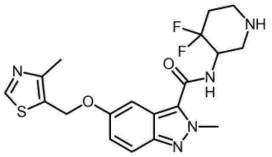
30

40

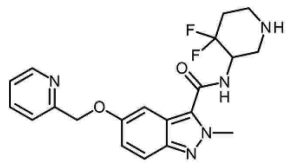
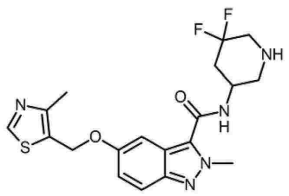
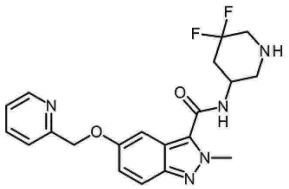
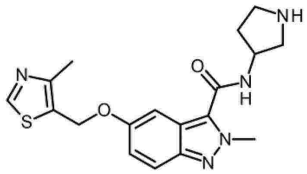
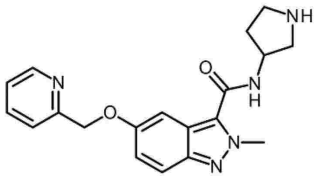
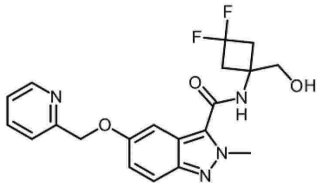
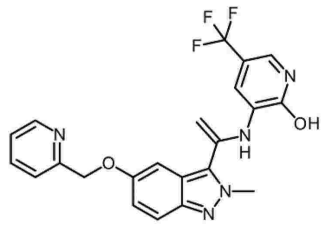
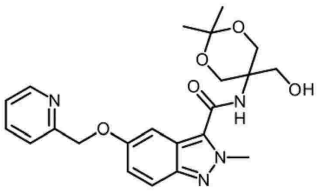
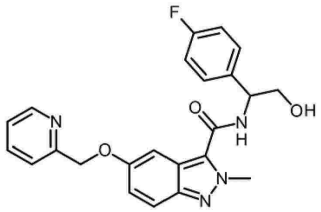
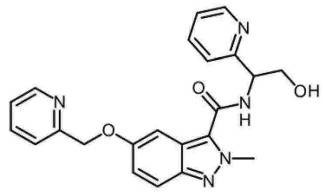
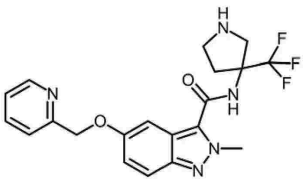
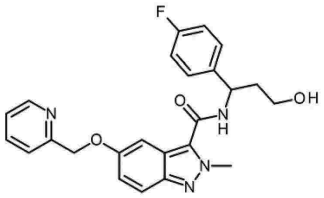
50

【表４－１】

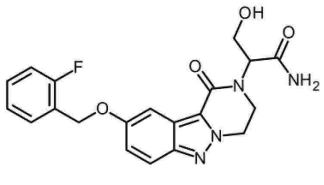
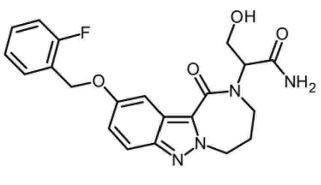
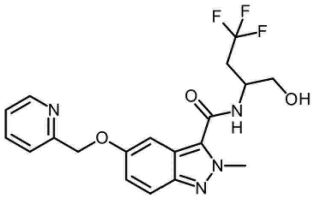
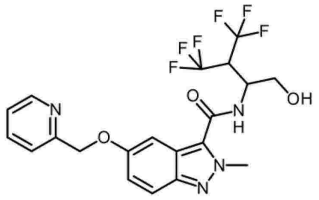
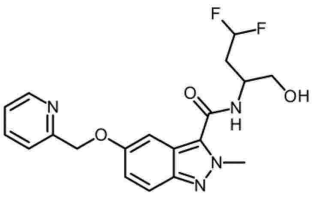
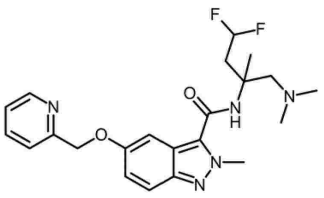
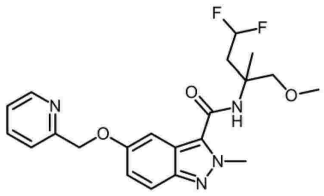
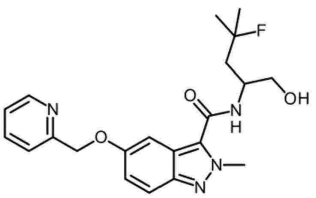
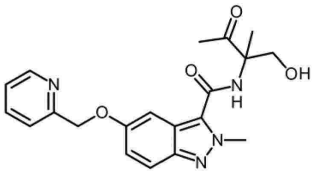
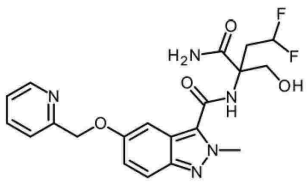
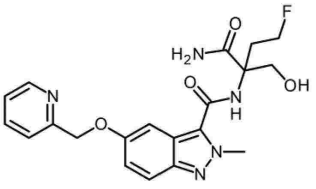
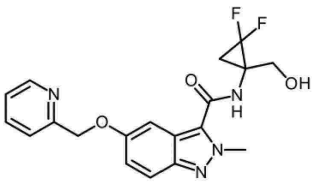
表４：例示的な化合物

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 200**	 **化合物 201**	 **化合物 202**
 **化合物 203**	 **化合物 204**	 **化合物 205**
 **化合物 206**	 **化合物 207**	 **化合物 208**
 **化合物 209**	 **化合物 210**	 **化合物 211**

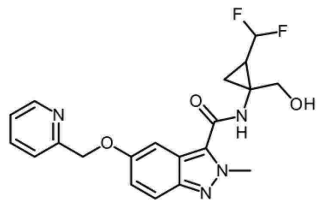
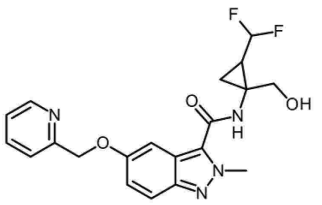
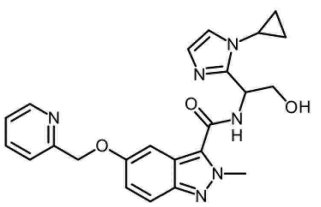
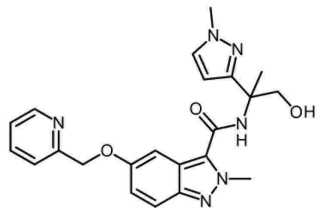
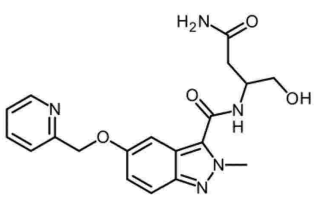
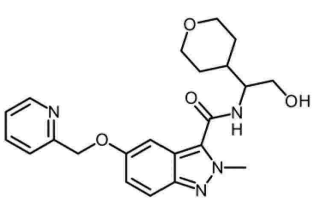
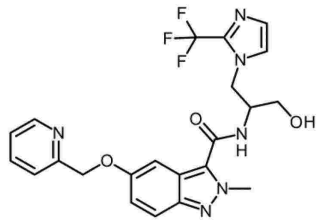
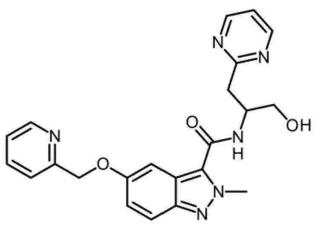
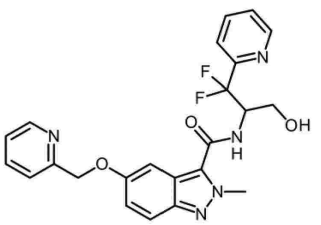
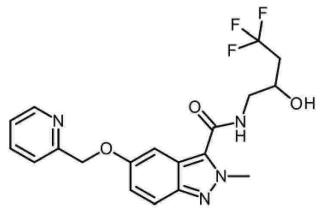
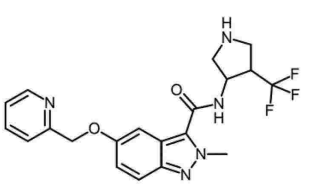
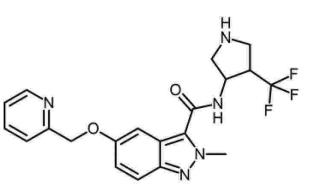
【表４－２】

 化合物 212	 化合物 213	 化合物 214
 化合物 215	 化合物 216	 化合物 217
 化合物 218	 化合物 219	 化合物 220
 化合物 221	 化合物 222	 化合物 223

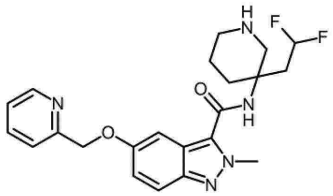
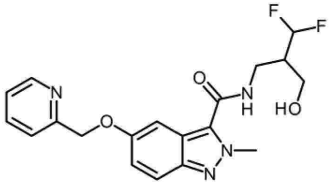
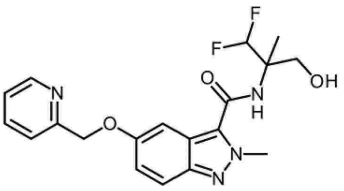
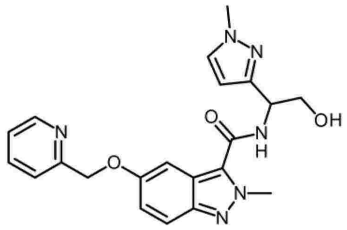
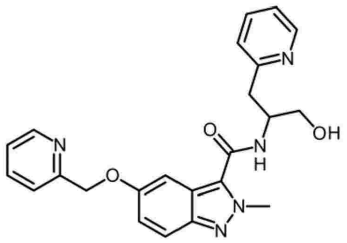
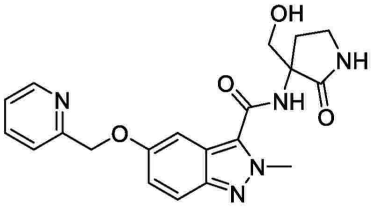
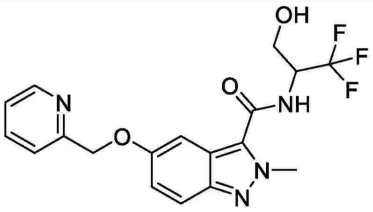
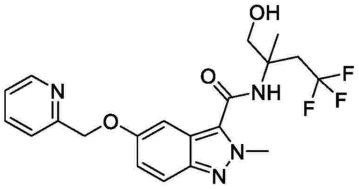
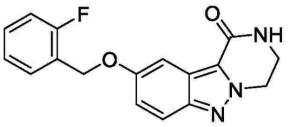
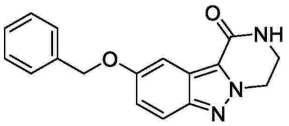
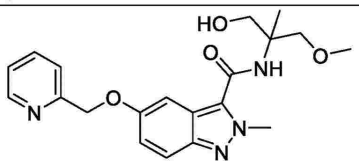
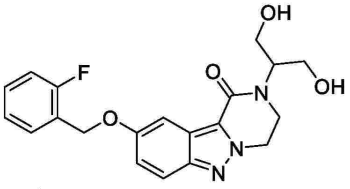
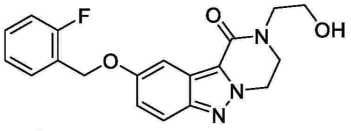
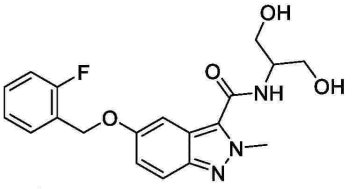
【表４－３】

 化合物 224	 化合物 225	 化合物 226
 化合物 227	 化合物 228	 化合物 229
 化合物 230	 化合物 231	 化合物 232
 化合物 233	 化合物 234	 化合物 235

【表４－４】

 化合物 236(トランス異性体)	 化合物 237(シス異性体)	 化合物 238
 化合物 239	 化合物 240	 化合物 241
 化合物 242	 化合物 243	 化合物 244
 化合物 245	 化合物 246(トランス異性体)	 化合物 247(シス異性体)

【表４－５】

 化合物 248	 化合物 249	 化合物 250
 化合物 251	 化合物 252	 化合物 253
 化合物 254	 化合物 255	 化合物 256
 化合物 257	 化合物 258	 化合物 259
 化合物 260	 化合物 261	 化合物 262

【０１９０】

以下の実施例は、本発明を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。

【０１９１】

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。

【０１９２】

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（例えば、ＡＢＣＲ、Ａｐｏｌｌｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ Ｃｏｍｂｉ－Ｂｌｏｃｋｓ、Ｅｎａｍｉｎｅ、ＦｌｕｏｒｏＣｈ

ｅｍ、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すことができる）、又はそれらの合成は、専門文献に既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すことができる）、又は当業者に既知の従来の方法を使用して調製することができる。

【０１９３】

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）下で実施された。試薬の当量の数及び用いられる溶媒の量、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間でわずかに変化し得る。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れ、類似の方法ではわずかに変化し得る。調製された化合物の収率は、最適化されていない。

【０１９４】

「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での濃度の表示であり、「ｓｏｌ．」は、溶液を意味し、「ｃｏｎｃ．」は、濃縮されたことを意味する。溶媒の混合比は、通常、体積／体積比で表される。

【０１９５】

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／又は質量分析法（ＭＳ、［Ｍ＋Ｈ］$^+$及び／又は［Ｍ－Ｈ］$^-$に対するｍ／ｚ）によって実施された。ある特定の事例では、例えば、位置異性体及び／又はジアステレオマーが反応中に形成され得る／形成されていた場合、例えば、^{13}ＣＮＭＲ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、場合によっては実施された。

【０１９６】

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（ソフトウェア　Ｔｏｐｓｐｉｎ）を使用し、代替的に、ＢＲＵＫＥＲ　ＡＶＡＮＣＥ　３００ＭＨｚ及び４００Ｍｈｚを使用した。ＬＣ／ＭＳ分析には、例えば、Ａｇｉｌｅｎｔ　１２９０　ｉｎｆｉｎｉｔｙ、Ｍａｓｓ：６１５０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）、又はＡｇｉｌｅｎｔ　１２００　ＳＥＲＩＥＳ、Ｍａｓｓ：６１３０　ＳＱＤ（ＥＳＩ／ＡＰＣＩ）（ソフトウェア　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）を使用した。分析ＨＰＬＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ（ソフトウェア　Ｅｍｐｏｗｅｒ）、Ａｇｉｌｅｎｔ－１２００－ＥＬＳＤ（ソフトウェア　Ｃｈｅｍｉｓｔａｔｉｏｎ）、又はＡｇｉｌｅｎｔ－１２６０（ソフトウェア　ＯｐｅｎＬＡＢ）で測定した。分析ＳＦＣを、例えば、ＰＩＣ　ｓｏｌｕｔｉｏｎ（ソフトウェア：ＳＦＣ　ＰＩＣＬＡＢ　ＯＮＬＩＮＥ）、ＷＡＴＥＲＳ－Ｘ５（ソフトウェア　ＭＡＳＳＬＹＮＸ）、又はＷＡＴＥＲＳ－ＵＰＣ２（Ｅｍｐｏｗｅｒ）で行った。

【０１９７】

分取ＨＰＬＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ　２９９８（ソフトウェア　Ｅｍｐｏｗｅｒ）又はＹＭＣ（ソフトウェア　Ｋ－Ｐｒｅｐ）で行った。分取ＳＦＣを、例えば、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－２００（ソフトウェア　Ｃｈｒｏｍｓｃｏｐｅ又はＳｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、Ｗａｔｅｒｓ、ＳＦＣ－８０（Ｓｕｐｅｒ　ｃｈｒｏｍｅ）、又はＰＩＣ、ＰＩＣ－１７５（ソフトウェア　Ｓ１０－１００）で行った。

【０１９８】

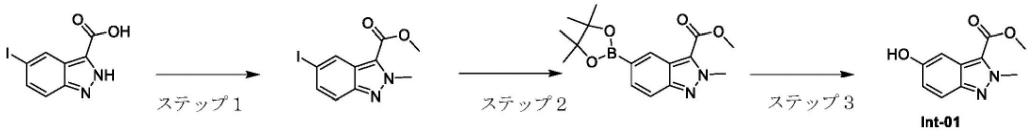
立体中心を含有する例示的な化合物の構造は、既知の場合、絶対立体化学で描かれ、命名される。未知の絶対立体化学の場合、化合物は、ラセミ、ジアステレオマーの混合物、未知の立体化学の純粋なジアステレオマー、又は未知の立体化学の純粋なエナンチオマーのいずれかであり得る。Ｄｉａ１及びＤｉａ２は、ジアステレオ異性体が分離されたが、立体化学は不明であることを意味する。Ｅｎ１及びＥｎ２は、両方のエナンチオマーが分離されたが、絶対配置は不明であることを意味する。化合物コードの後に接尾辞が付かな

い場合、化合物の化学名が正確な立体化学を明記しない限り、立体中心を含む化合物はそれぞれ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。

【０１９９】

５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）の合成。

【化４４】



【０２００】

ステップ１：ＤＭＦ（５００ｍｌ）中の（５－ヨード－１Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（３６ｇ、０．１２ｍｏｌ）の撹拌溶液に、K_2CO_3（８６．３８ｇ、０．６２５ｍｏｌ）、続いてヨウ化メチル（２３．５ｍｌ、０．３７５ｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０　０℃で４時間撹拌した。ＲＭをセライト床で濾過し、ＥｔＯＡｃ（３×１００）で洗浄した。濾液を氷水中に注いで、得られた水溶液をＥｔＯＡｃ（３×７００ｍｌ）で抽出した。合わせた有機層を水（２×３５０ｍｌ）、続いてブライン（３５０ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗製物を得た。粗製物をＦＣＣ（シリカゲル１００～２００メッシュ、溶離液としてヘキサン中１５％のＥｔＯＡｃを使用）により精製して、５－ヨード－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチルエステルを得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ３）δ［ｐｐｍ］：８．４１（ｓ，１Ｈ），７．５８－７．５６（ｄｄ，１Ｈ），７．５２－７．５０（ｄ，１Ｈ），４．４８（ｓ，３Ｈ），４．０３（ｓ，３Ｈ）。

【０２０１】

ステップ２：１，４－ジオキサン（１５０ｍｌ）中の５－ヨード－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチルエステル（７．５ｇ、０．０２３ｍｏｌ）の撹拌溶液に、ビス－ピン（Ｂｉｓ－ｐｉｎ）（８．７６ｇ、０．０３４５ｍｏｌ）、続いて酢酸カリウム（６．７７ｇ、０．０６９ｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを窒素で１０分間脱気し、次いでＰｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ２．ＤＣＭ付加物（０．５６ｇ、０．０００６９ｍｏｌ）を添加し、１１０℃で１６時間加熱した。ＲＭをセライト床を通して濾過し、ＥｔＯＡｃで洗浄した。合わせた濾液を濃縮して、２－メチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（７．５ｇ）を褐色の固体として得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ［ｐｐｍ］：８．５０（ｓ，１Ｈ），７．７２（ｓ，２Ｈ），４．５１（ｓ，３Ｈ），４．０５（ｓ，３Ｈ），１．２５（ｓ，１２Ｈ）。

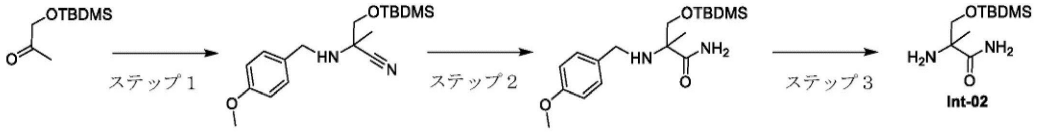
【０２０２】

ステップ３：アセトン（１５０ｍｌ）中の２－メチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（７．５ｇ、０．０２３ｍｏｌ）の撹拌溶液に、水（１５０ｍｌ）中のオキソン（１４．１３ｇ、０．０２３ｍｏｌ）の溶液を０℃で滴加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。ＲＭをＥｔＯＡｃ（２００ｍｌ）で希釈した。２つの層を分離し、水層をＥｔＯＡｃ（２００ｍｌ）で抽出した。合わせた有機層を水（１５０ｍｌ）、続いてブライン（１５０ｍｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、粗製物を得た。粗製物を、ＦＣＣ（シリカゲル１００～２００メッシュ、溶離液としてヘキサン中３０％のＥＡを使用）により精製して、オフホワイト色の固体として５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（２．６ｇ、５３％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ［ｐｐｍ］：９．６６（ｓ，１Ｈ），７．６２－７．６０（ｄ，１Ｈ），７．１６－７．１５（ｄ，１Ｈ），６．９６－６．９３（ｄｄ，１Ｈ），４．３５（ｓ，３Ｈ），３．９３（ｓ，３Ｈ）。

【０２０３】

２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ－０２）の合成。

【化４５】



【０２０４】

ステップ１：ＥｔＯＨ（２５０ｍｌ）中の１－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－プロパン－２－オン（２５ｇ、１３２．７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、４－メトキシベンジルアミン（１９．０８ｍｌ、１４６ｍｍｏｌ）を室温で添加した。トリメチルシリルシアニド（１９．９３ｍｌ、１５９．２８６ｍｍｏｌ）、続いて塩化アンモニウム（２．１３ｇ、３９．８ｍｍｏｌ）を室温でＲＭに添加した。ＲＭを８０℃で１６時間撹拌した。ＲＭを濃縮した。粗製物をＥｔＯＡｃと飽和重炭酸ナトリウム溶液との間で分配した。有機層をブライン溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。粗製物をＦＣＣ（１００～２００シリカゲルを使用、１０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）で精製し、黄色の液体として３－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－２－（４－メトキシ－ベンジルアミノ）－２－メチル－プロピオニトリル（２５ｇ、５７％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ）δ［ｐｐｍ］：７．２５－７．２３（ｄ，２Ｈ），６．６８－６．８６（ｄ，２Ｈ），３．７２－３．６８（ｍ，６Ｈ），３．５１－３．４８（ｍ，１Ｈ），１．３６（ｓ，３Ｈ），０．８７（ｓ，９Ｈ），０．０６（ｓ，６Ｈ）。

【０２０５】

ステップ２：ＤＭＳＯ（１００ｍｌ）中の３－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－２－（４－メトキシ－ベンジルアミノ）－２－メチル－プロピオニトリル（１０ｇ、２９．９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、炭酸カリウム（２８．９２ｇ、２０９．２４３ｍｍｏｌ）を室温で添加した。過酸化水素（１４．０３ｍｌ、２９８．９２ｍｍｏｌ）を０℃で反応物に滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを氷冷水でクエンチし、ＭＴＢＥで抽出した。有機部分をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。結果として得られた粗物質をＦＣＣ（１００～２００シリカゲルを使用、５０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）で精製して、油性液体として３－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－２－（４－メトキシ－ベンジルアミノ）－２－メチル－プロピオンアミド（３．４ｇ、３３％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ）δ［ｐｐｍ］：７．２６－７．２４（ｄ，３Ｈ），７．０６（ｓ，１Ｈ），６．８７－６．８５（ｄ，２Ｈ），３．７２（ｓ，３Ｈ），３．７０－３．６８（ｍ，１Ｈ），３．５８－３．５６（ｍ，１Ｈ），３．５１－３．５０（ｄ，２Ｈ），２．０４（ｍ，１Ｈ），１．１５（ｓ，３Ｈ），０．８５（ｓ，９Ｈ），０．０３（ｓ，６Ｈ）。

【０２０６】

ステップ３：ＭｅＯＨ（６０ｍｌ）中の－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－２－（４－メトキシ－ベンジルアミノ）－２－メチル－プロピオンアミド（３ｇ、８．５０９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水酸化パラジウム（１．５ｇ）を室温で添加した。ＲＭを、室温でH_2ガスバルーン圧力下で４時間撹拌した。ＲＭをセライト床を通して濾過し、１０％ＭｅＯＨ－ＤＣＭで洗浄した。濾液を合わせて濃縮し、オフホワイト色の固体として２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ－０２）（１．５ｇ、７６％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ）δ［ｐｐｍ］：７．２５（ｓ，１Ｈ），６．９５（ｓ，１Ｈ），３．７７－３．７４（ｄ，１Ｈ），３．７０－３．６８（ｍ，１Ｈ），３．２７－３．２４（ｄ，１Ｈ），１．８２（ｓ，２Ｈ），１．０４（ｓ，３Ｈ），０．８５（ｓ，９Ｈ），０．０２（ｓ，６Ｈ）。

【０２０７】

５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（Ｉｎｔ－０３）の合成。

【化４６】



【０２０８】

ステップ１：トルエン（１００ｍｌ）中の５－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（２．５ｇ、１１．３６ｍｍｏｌ、１．０当量）の撹拌溶液に、ＡｌＣｌ３（４．５３ｇ、３４．０９ｍｍｏｌ、４当量）を室温で添加し、次いで反応混合物を１１０℃まで２時間加熱した。反応の進行をＬＣＭＳによって監視した。反応混合物を真空下で蒸留して粗製物を得て、これを氷水（１０ｍｌ）で希釈し、次いで１０分間撹拌し、濾過し、沈殿した固体をジエチルエーテルで洗浄して、５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（Ｉｎｔ－０３）（１．０ｇ、４７％、オフホワイト色の固体）を得た。ＴＬＣ系：６０％ＥｔＯＡｃ／Ｐｅｔエーテル、ＲＦ：０．１。

【０２０９】

５－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（Ｉｎｔ－０４）の合成。

【化４７】



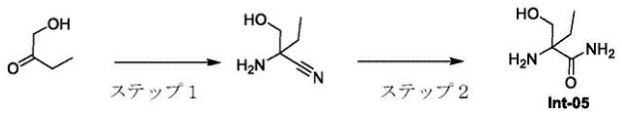
【０２１０】

ステップ１：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１；２０ｍＬ）中の５－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（５００ｍｇ、２．２７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水（５ｍＬ）中のＮａＯＨ（９００ｍｇ、２２．７２ｍｍｏｌ）を室温で添加した。反応混合物を室温で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水（２０ｍＬ）で希釈し、１Ｎの　ＨＣｌ水溶液でｐＨ約１に酸性化し、３０分間撹拌した。固体沈殿物を濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、５５－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（Ｉｎｔ－０４）（３５０ｍｇ、粗製物）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％酢酸エチル、Ｒｆ：０．２１。

【０２１１】

２－アミノ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンアミド（Ｉｎｔ－０５）の合成。

【化４８】



【０２１２】

ステップ１：メタノール（６５ｍｌ）中のシアン化ナトリウム（４．４５ｇ、９０．９０ｍｍｏｌ）、塩化アンモニウム（４．９ｇ、９０．９０ｍｍｏｌ）、及びアンモニア溶液（メタノール中７Ｍ、１２０ｍＬ）の混合物を室温で撹拌し、１０分間撹拌し、次いで１－ヒドロキシブタン－２－オン（４．０ｇ、４５．４５ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を室温で２４時間撹拌し、セライト床を通して濾過し、セライト床をメタノール（５０ｍＬ）で洗浄した。合わせた濾液を真空下で濃縮した。残渣に酢酸エチル（８０ｍＬ）を添加し、混合物を濾過した。濾液を真空下で濃縮した。残渣をジクロロメタン（２×５

０ｍＬ）と共蒸留して、淡黄色残渣として２－アミノ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンニトリル（４．２ｇ）を得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル、ＲＦ：０．３。

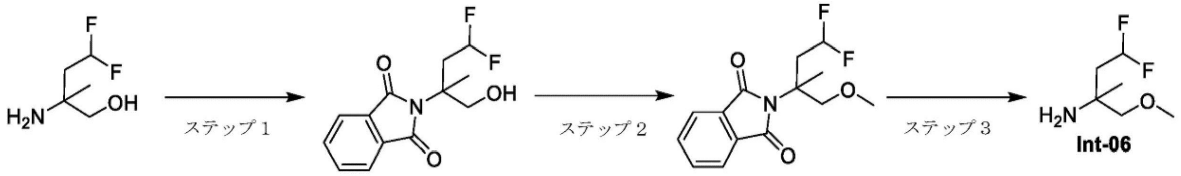
【０２１３】

ステップ２：０℃に冷却されたエタノール（２０ｍＬ）中の２－アミノ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンニトリル（２．０ｇ、１７．５４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＫＯＨ（１．４７ｇ、２６．３１ｍｍｏｌ）、続いて、３０％H_2O_2（２ｍＬ）を０℃で滴加した。反応混合物を室温で１時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視し、反応混合物を真空下で濃縮した。粗製物を、ジクロロメタン中の１０％メタノール（２×５０ｍｌ）で希釈し、２０分間撹拌し、濾過した。濾液を減圧下で濃縮して、２－アミノ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンアミド（Ｉｎｔ－０５）（１．８ｇ）を濃厚な残渣として得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の１０％メタノール、ＲＦ：０．１。

【０２１４】

４，４－ジフルオロ－１－メトキシ－２－メチルブタン－２－アミン塩酸塩（Ｉｎｔ－０６）の合成。

【化４９】



ステップ１：トルエン（２５ｍＬ）中の２－アミノ－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－１－オール（２．５ｇ、１７．９６ｍｍｏｌ）の溶液に、無水フタル酸（２．６６ｇ、１７．９６ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを密封管中で１２０℃で２４時間撹拌した。消費後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）イソインドリン－１，３－ジオン（２．０ｇ、収率４１．３４％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，$CDCl_3$）δｐｐｍ：７．７９－７．８４（ｍ，２Ｈ），７．７１－７．７５（ｍ，２Ｈ），６．０６－６．３７（ｄｔ，１Ｈ），４．０３－４．１２（ｍ，２Ｈ），３．６２（ｔ，１Ｈ），２．８７－３．００（ｍ，１Ｈ），２．２９－２．４３（ｍ，１Ｈ），１．６６（ｓ，３Ｈ）。

ステップ２：ＤＭＦ（２６ｍＬ）中の２－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）イソインドリン－１，３－ジオン（２．６ｇ、９．６５７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＨ（鉱油中６０％）（４６３．５１ｍｇ、１９．３１３ｍｍｏｌ）、ヨードメタン（１．１９４ｍＬ、１９．３１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。消費後、ＲＭを氷冷水（２０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×４０ｍＬ）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、ｐｅｔエーテル中の２５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（４，４－ジフルオロ－１－メトキシ－２－メチルブタン－２－イル）イソインドリン－１，３－ジオン（１．１ｇ、収率：４０．２１％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，$CDCl_3$）δｐｐｍ：７．７６－７．８１（ｍ，２Ｈ），７．６７－７．７２（ｍ，２Ｈ），５．８７－６．１７（ｄｔ，１Ｈ），３．９９（ｄ，１Ｈ），３．７９（ｄ，２Ｈ），３．３６（ｄ，３Ｈ），２．７７－２．９０（ｍ，１Ｈ），２．４０－２．５３（ｍ，１Ｈ），１．８２（ｓ，３Ｈ）。

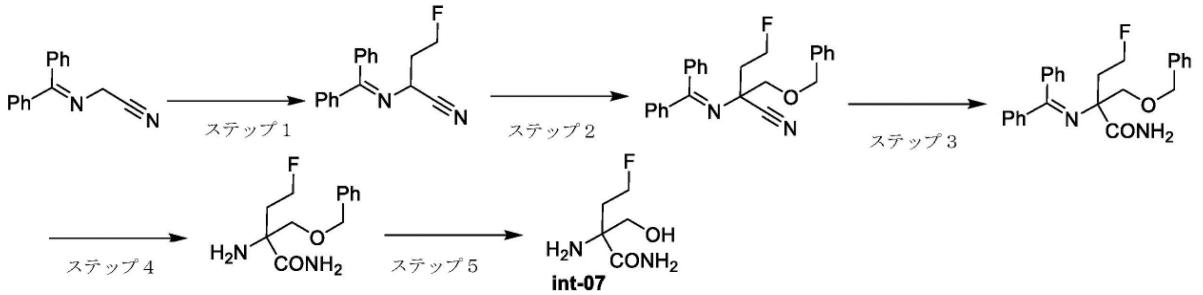
ステップ３：ＩＰＡ（２２ｍＬ）及び水（２．２ｍＬ）中の２－（４，４－ジフルオロ－１－メトキシ－２－メチルブタン－２－イル）イソインドリン－１，３－ジオン（１．１ｇ、３．８８３ｍｍｏｌ）の溶液に、$NaBH_4$（７３３．９ｍｇ、１９．４１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを濃縮し、得られた残渣を冷水（３０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。有機層

をブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を６Ｎ　ＨＣｌ（２２ｍＬ）で処理し、８０℃で２時間加熱した。ＲＭを減圧下で濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテル（２×３０ｍＬ）で粉砕した。固体を濾過し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として４，４－ジフルオロ－１－メトキシ－２－メチルブタン－２－アミン塩酸塩（ｉｎｔ－０６）（６５０ｍｇ、収率：８８．２７％）を得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δｐｐｍ：８．４０（ｓ，３Ｈ），６．２０－６．５０（ｄｔ，１Ｈ），３．４３（ｓ，２Ｈ），３．３３（ｓ，３Ｈ），２．１９－２．３０（ｍ，２Ｈ），１．２９（ｓ，３Ｈ）。

【０２１５】

２－アミノ－４－フルオロ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンアミド（Ｉｎｔ－０７）の合成。

【化５０】



ステップ１：ＴＨＦ（６０ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）アセトニトリル（５ｇ、２２．６９９ｍｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ、ヘキサン中の２．５Ｍ溶液（１３．６１ｍＬ、３４．０４９ｍｍｏｌ）を－７８℃で添加した。ＲＭを－７８℃で１５分間撹拌した。１５分後、１－フルオロ－２－ヨードエタン（３．９４９ｇ、２２．６９９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１５分間撹拌した。完了後、ＲＭを水（５０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔ．エーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用したシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として４－（ヒドロキシメチル）－２，２－ジメチルオキサゾリジン－３－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４．５ｇ、７４．４４％）を得た。

ステップ２：ＴＨＦ（２５．０ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４－フルオロブタンニトリル（３．２ｇ、１２．０１６ｍｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ、ヘキサン中の２．５Ｍ溶液、（９．６１ｍＬ、２４．０３１ｍｍｏｌ）を－７８℃で添加した。ＲＭを１５分間撹拌した。１５分後、（クロロメトキシ）メチル）ベンゼン（２．０ｍＬ、１４．４１９ｍｍｏｌ）を－７８℃でＲＭに添加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。完了後、ＲＭを水（２５ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（（ベンジルオキシ）メチル）－２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４－フルオロブタンニトリル（１．５ｇ、収率３２．３０％）を得た。

ステップ３：ＭｅＯＨ（５０ｍＬ）及び水（２０ｍＬ）中の２－（（ベンジルオキシ）メチル）－２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４－フルオロブタンニトリル（３．３ｇ、８．５３９ｍｍｏｌ）の溶液に、ＬｉＯＨ一水和物（１．２５４ｇ、２９．８８６ｍｍｏｌ）及びH_2O_2（水中５０重量％溶液、安定化）（４．３ｍＬ、１７．０７８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを水（５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、Ｐ

ｅｔ．エーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（（ベンジルオキシ）メチル）－２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４－フルオロブタンアミド（１．６ｇ、４６．３３％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：９．７８（ｓ，１Ｈ），７．５８（ｄ，２　Ｈ），７．３７－７．２４（ｍ，１２　Ｈ），７．１５－７．１３（ｍ，２　Ｈ），４．６０（ｍ，１　Ｈ），４．５３－４．４６（ｍ，１　Ｈ），４．４３－４．３８（ｍ，２　Ｈ），３．５５（ｄ，１　Ｈ），３．４３（ｄ，１　Ｈ），１．７７－１．７１（ｍ，１　Ｈ），１．６１－１．５０（ｍ，１　Ｈ）．

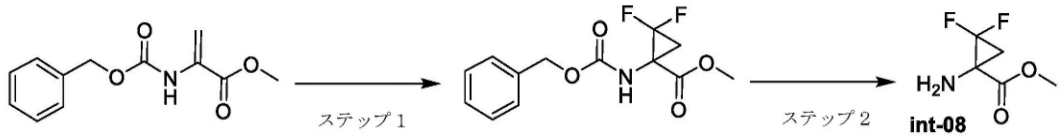
ステップ４：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の２－（（ベンジルオキシ）メチル）－２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４－フルオロブタンアミド（２．８ｇ、６．９２２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＦＡ（１０．５ｍＬ、１３８．４４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で蒸発乾固させた。残渣を、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、褐色のガム状液体として２－アミノ－２－（（ベンジルオキシ）メチル）－４－フルオロブタンアミド（６００ｍｇ、３６％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）δ　ｐｐｍ：７．３６－７．２４（ｍ，５　Ｈ），７．１２（ｓ，１　Ｈ），４．５９－４．４１（ｍ，３　Ｈ），３．６３（ｄ，１Ｈ），３．２７（ｄ，１Ｈ），１．９９－１．７６（ｍ，３　Ｈ）．

ステップ５：ＥｔＯＨ（２５．０ｍＬ）中の２－アミノ－２－（（ベンジルオキシ）メチル）－４－フルオロブタンアミド（３００ｍｇ、１．２４２ｍｍｏｌ）の溶液に、１０％パラジウム活性炭（２６４ｍｇ、２．４８４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを、水素バルーン圧力下で、室温で１６時間撹拌した。反応混合物をセライトパッドを通して濾過し、ＭｅＯＨ（３×１０ｍＬ）で洗浄し、濾液を真空下で蒸発させて、白色の固体として２－アミノ－４－フルオロ－２－（ヒドロキシメチル）ブタンアミド（Ｉｎｔ－０７）（１７０ｍｇ、９１％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：７．３８－７．２６（ｍ，２　Ｈ），７．１３（ｓ，１　Ｈ），５．０（ｓ，１Ｈ），４．６１－４．４１（ｍ，２　Ｈ），３．５８－３．５４（ｍ，１　Ｈ），２．０１－１．９４（ｍ，１　Ｈ），１．９０（ｓ，２　Ｈ），１．８７－１．７６（ｍ，１Ｈ）．．

【０２１６】

１－アミノ－２，２－ジフルオロシクロプロパン－１－カルボン酸メチル臭化水素酸塩（Ｉｎｔ－０８）の合成。

【化５１】



ステップ１：トルエン（５０ｍＬ）中の２－（（（ベンジルオキシ）カルボニル）アミノ）アクリル酸メチル（２．５ｇ、１０．６２７ｍｍｏｌ）のｚ溶液に、ＮａＦ（４４．６１ｍｇ、１．０６３ｍｍｏｌ）を室温で添加し、１１０℃に加熱した。１０分後、トルエン（５０ｍＬ）中のトリメチルシリル２，２－ジフルオロ－２－（フルオロスルホニル）アセテート（５．２３６ｍＬ、２６．５６ｍｍｏｌ）の溶液を４時間かけてＲＭに滴加した。ＲＭを１１０℃で１８時間撹拌した。完了後、ＲＭを０℃まで冷却し、飽和Ｎａ$_{2}$ＣＯ$_{3}$溶液（７０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×７０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン溶液（５０ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色の液体として１－（（（ベンジルオキシ）カルボニル）アミノ）－２，２－ジフルオロシクロプロパン－１－カルボン酸メチル（１．４ｇ、収率４６．１８％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ３）δ　ｐｐ

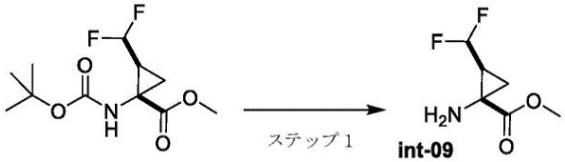
ｍ：７．３２－７．３８（ｍ，５　Ｈ），５．５７（ｓ，１　Ｈ），５．１４（ｓ，２Ｈ），３．７７（ｓ，３　Ｈ），２．６６－２．７１（ｍ，１　Ｈ），１．７５－１．９５（ｍ，１　Ｈ）．

ステップ２：酢酸（３３％）（７．５ｍＬ）中の１－（（（ベンジルオキシ）カルボニル）アミノ）－２，２－ジフルオロシクロプロパン－１－カルボン酸メチル（１．４ｇ、４．９０８ｍｍｏｌ）及びＨＢｒを室温で２時間撹拌した。消費後、ＲＭを減圧下で濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテル（２×３０ｍＬ）で粉砕した。得られた固体を濾過し、真空下で乾燥させて、淡褐色の固体として１－アミノ－２，２－ジフルオロシクロプロパン－１－カルボン酸メチル臭化水素酸塩（Ｉｎｔ－０８）を得た（１．０ｇ、収率：８７．８１％）。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：９．１５（ｓ，２　Ｈ），３．８２（ｓ，３　Ｈ），２．６９－２．７８（ｍ，１　Ｈ），２．４３－２．５１（ｍ，１　Ｈ）．

【０２１７】

（シス－１－アミノ－２－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メタノール塩酸塩（Ｉｎｔ－０９）の合成。

【化５２】

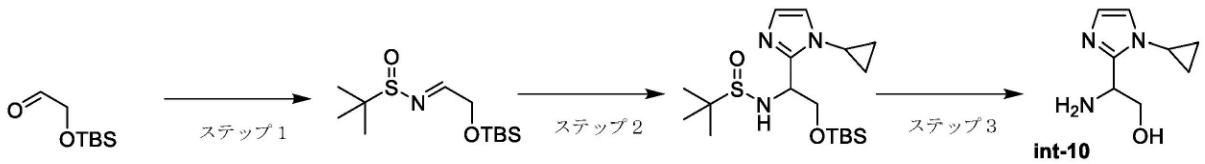


ステップ１：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の（シス－２－（ジフルオロメチル）－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（８８０ｍｇ、３．３１８ｍｍｏｌ）の溶液に、ジオキサン（５．０ｍＬ）中の４ＭのＨＣｌを室温で添加した。ＲＭを室温で１時間撹拌した。消費後、ＲＭを減圧下で濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテル（２×２０ｍＬ）で粉砕した。残渣を真空下で乾燥させて、シス－１－アミノ－２－（ジフルオロメチル）シクロプロピル）メタノール塩酸塩（Ｉｎｔ－０９）を淡黄色ガム状物（７００ｍｇ）として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δｐｐｍ：９．１９（ｓ，２Ｈ），６．００－５．７０（ｄｔ，１Ｈ），３．７０（ｓ，３Ｈ），２．８０－２．７０（ｍ，１Ｈ），２．２３－２．１８（ｍ，１Ｈ），１．９０－１．８６（ｍ，１Ｈ）。

【０２１８】

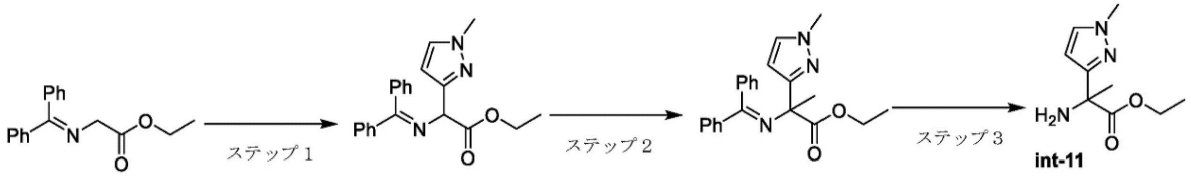
２－アミノ－２－（１－シクロプロピル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）エタン－１－オール塩酸塩（Ｉｎｔ－１０）の合成。

【化５３】



ステップ１：ＤＣＭ（３０ｍＬ）中の２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）アセトアルデヒド（２ｇ、１１．４７ｍｍｏｌ）の溶液に、２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．５３ｇ、１２．６２ｍｍｏｌ）及び硫酸銅（ＩＩ）（３．６６ｇ、２２．９４ｍｍｏｌ）をＮ$_{2}$雰囲気下で室温で添加した。ＲＭを室温で１２時間撹拌した。完了後、ＲＭを濾過し、ＤＣＭ（５０ｍＬ）ですすいだ。濾液を減圧下で濃縮した。残渣を、Ｐｅｔ．エーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製し、淡黄色のガムとして（Ｅ／Ｚ）－Ｎ－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチリデン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．５ｇ、収率４７．１１％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δｐｐｍ：７．９６（ｓ，１　Ｈ），４．４４（ｓ，２Ｈ），１．１０（ｓ，９Ｈ）．０．

８２（ｓ，９Ｈ）．
ステップ２：ＴＨＦ（２２ｍＬ）中の１－シクロプロピル－１Ｈ－イミダゾール（５００ｍｇ、４．６２ｍｍｏｌ）の溶液に、ｎＢｕＬｉ（５ｍＬ、２．５Ｍ）を－７８℃で滴下して処理した。ＲＭを－７８℃で２時間撹拌した。２時間後、ＴＨＦ（２ｍＬ）中の（Ｅ）－Ｎ－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチリデン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．５４ｇ、５．５４ｍｍｏｌ）の溶液をＲＭに滴加した。ＲＭを１．５時間撹拌した。完了後、ＲＭを飽和　NH_4Cl（２５ｍＬ）で０℃でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、濃縮して、化合物（１．５ｇ、８４％）を得た。
ステップ３：１，４－ジオキサン（１０ｍＬ）中のＮ－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－１－（１－シクロプロピル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）エチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．３ｇ、３．３７ｍｍｏｌ）のｑ溶液に、１，４－ジオキサン（５ｍＬ）中の４Ｍ　ＨＣｌを０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。消費後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣をＤＣＭ（２×５ｍＬ）で粉砕し、真空下で乾燥させて、褐色のガム状物として２－アミノ－２－（１－シクロプロピル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル）エタン－１－オール塩酸塩（Ｉｎｔ－１０）（８００ｍｇ、８８．７１）を得た。
【０２１９】
２－アミノ－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）プロパン酸エチル（Ｉｎｔ－１１）の合成。
【化５４】



ステップ１：２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）酢酸エチル（５．０ｇ、１８．７０４ｍｍｏｌ）、３－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール（２．８５０ｍＬ、２８．０５６ｍｍｏｌ）のトルエン（５０ｍＬ、１００ｍＬの密封管に取り込んだ）溶液に、K_3PO_4（１１．９０７ｇ、５６．１１３ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭをアルゴンで２０分間脱気した。Ｐｄ（ｔ－Ｂｕ３Ｐ）２（９５５．８７ｍｇ、１．８７０ｍｍｏｌ）を室温で添加した。得られたＲＭを１００℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１２％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（２．５ｇ、収率３８．４７％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：７．６８－７．７１（ｑ，２　Ｈ），７．４２－７．４４（ｍ，３　Ｈ），７．３６－７．３８（ｍ，１　Ｈ），７．３０－７．３３（ｍ，３　Ｈ），７．１７－７．２０（ｍ，２　Ｈ），６．４５（ｄ，１　Ｈ），５．３４（ｓ，１　Ｈ），４．１５－４．１９（ｍ，２　Ｈ），３．８４（ｓ，３　Ｈ），１．２２（ｔ，３　Ｈ）．
ステップ２：２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（１．８ｇ、５．１８１ｍｍｏｌ）のＤＭＦ（２０ｍＬ、密封管に採取）溶液に、ＮａＨ（６０％）（６２１ｍｇ、１５．５４３ｍｍｏｌ）を０℃で少量ずつに分けて添加した。ＲＭを０℃で３０分間撹拌した。３０分後、ヨードメタン（１．６１３ｍＬ、２５．９０ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（５０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し

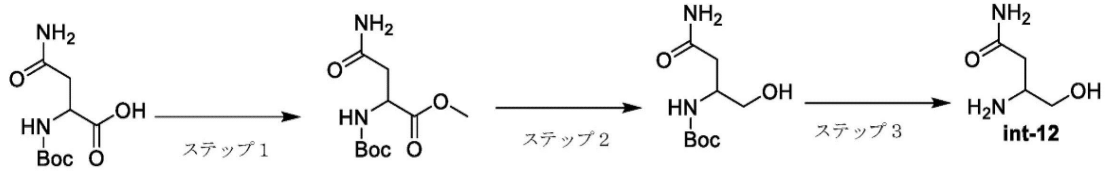
、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡褐色のガム状物として２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）プロパン酸エチル（１．０ｇ、収率５３．４０％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：７．４８－７．５２（ｍ，３　Ｈ），７．３４－７．４２（ｍ，６　Ｈ），６．３４（ｄ，２　Ｈ），５．７５（ｓ，１　Ｈ），３．６３－３．７５（ｍ，５　Ｈ），１．６２（ｓ，３　Ｈ），１．００（ｔ，３　Ｈ）．

ステップ３：ヘキサン（１５ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）プロパン酸エチル（１．６ｇ、４．４２７ｍｍｏｌ）の溶液に、１Ｎ　ＨＣｌ（水溶液）（３０ｍＬ）を室温で添加した。ＲＭを１６時間撹拌した。完了後、ＲＭをＥｔＯＡｃ（３×２０ｍＬ）で抽出した。水層を飽和　ＮａＨＣＯ$_{3}$溶液（ｐＨ約０．８）で塩基性化し、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨで抽出した（３×３０ｍＬ）。合わせた有機層をＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、褐色の液体として２－アミノ－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）プロパン酸エチル（６３０ｍｇ、７２．２４％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：７．５４（ｓ，１　Ｈ），６．１８（ｓ，１　Ｈ），４．００－４．０７（ｍ，２　Ｈ），３．９９（ｓ，３　Ｈ），２．２１（ｓ，２　Ｈ），１．５０（ｓ，３　Ｈ），１．１２（ｔ，３　Ｈ）．

【０２２０】

３－アミノ－４－ヒドロキシブタンアミドトリフルオロ酢酸（Ｉｎｔ－１２）の合成。

【化５５】



ステップ１：ＴＨＦ（４０ｍＬ）及びＭｅＯＨ（４０ｍＬ）中の（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アスパラギン（４．０ｇ、１７．２２ｍｍｏｌ）の溶液に、（トリメチルシリル）ジアゾメタン（ヘキサン中２Ｍ溶液）（１７ｍＬ、３４．４４ｍｍｏｌ）を－２０℃で滴加した。ＲＭを０℃で２時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣をジエチルエーテル（８０ｍＬ）で希釈し、次いで高真空下で蒸留した。残渣を、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、オフホワイト色の固体として（４－アミノ－１－ヒドロキシ－４－オキソブタン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．４ｇ、３７％）を得た。

ステップ２：ＭｅＯＨ（２８ｍＬ）中の（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アスパラギン酸メチル（１．４ｇ、５．６８ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＢＨ$_{4}$（１ｇ、２８．４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。完了後、、ＲＭを冷水（２０ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ中の２０％ＭｅＯＨ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣をＤＣＭ中の２０％ＭｅＯＨを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、オフホワイト色の固体として（４－アミノ－１－ヒドロキシ－４－オキソブタン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（９００ｍｇ、７２％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$）δ　ｐｐｍ：７．１９（ｂｒｓ，１　Ｈ），６．７８（ｂｒｓ，１　Ｈ），６．４５（ｄ，１　Ｈ），４．６４（ｔ，１　Ｈ），３．６８－３．７３（ｍ，１　Ｈ），３．１６－３．２６（ｍ，１　Ｈ），３．３１－３．３６（ｍ，１　Ｈ），２．２３－２．２８（ｍ，１　Ｈ），２．１２－２．１８（ｍ，１　Ｈ），１．３７（ｓ，９　Ｈ）．

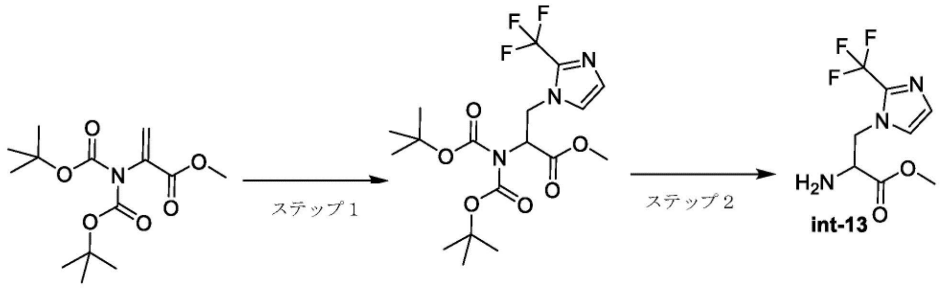
ステップ３：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の（４－アミノ－１－ヒドロキシ－４－オキソブタン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（９００ｍｇ、４．１２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＦＡ（４．５ｍＬ）を０℃で添加した。ＲＭ混合物を室温で２時間撹拌した。ＲＭを

高真空下で濃縮して、３－アミノ－４－ヒドロキシブタンアミドトリフルオロ酢酸（Ｉｎｔ－１２）を得た。（１．０ｇ）。

【０２２１】

２－アミノ－３－（２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロパン酸メチル塩酸塩（Ｉｎｔ－１３）の合成。

【化５６】



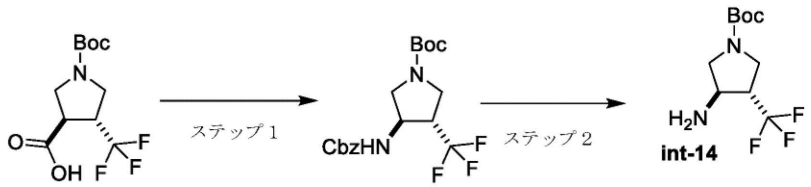
ステップ１：ＡＣＮ（１０ｍＬ）中の２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール（９０３ｍｇ、６．６３７ｍｍｏｌ）の溶液に、Cs_2CO_3（６．４９１ｇ、１９．９１１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。５分後、２－（ビス（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）アクリル酸メチル（２ｇ、６．６３７ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを７０℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（ビス（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－（２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロパン酸メチル（４００ｍｇ、収率１３．７８％）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ｐｐｍ：７．５１（ｄ，１ Ｈ），７．１０（ｄ，１ Ｈ），５．４１－５．４４（ｍ，１ Ｈ），４．７１－４．７６（ｍ，１ Ｈ），７．４３（ｓ，１ Ｈ），４．５４－４．６１（ｍ，１ Ｈ），３．７１（ｓ，３ Ｈ），１．３９（ｓ，９ Ｈ）．

ステップ２：１，４－ジオキサン（４．０ｍＬ）中の４Ｍ ＨＣｌの溶液を、２－（ビス（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－（２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロパン酸メチル（４００ｍｇ、２．２８６ｍｍｏｌ）に０℃で添加した。ＲＭを室温で３時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、$NaHCO_3$水溶液（２０ｍＬ）で塩基性化し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔ．エーテル中の３０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－アミノ－３－（２－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロパン酸メチル（１００ｍｇ、収率３６．８８％）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ ｐｐｍ：７．４８（ｄ，１ Ｈ），７．０９（ｄ，１ Ｈ），４．３１－４．３６（ｍ，１ Ｈ），４．１４－４．２０（ｍ，１Ｈ），３．６７－３．７２（ｍ，１Ｈ），３．６１（ｓ，３Ｈ）．

【０２２２】

トランス－３－アミノ－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（Ｉｎｔ－１４）の合成。

【化５７】



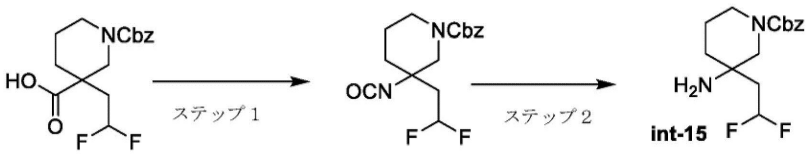
ステップ１：キシレン（２５ｍＬ）中のトランス－１－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－３－カルボン酸（３ｇ、１０．５９１ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＥＡ（１．７７１ｍＬ、１２．７１０ｍｍｏｌ）及びＤＰＰＡ（２．５０５ｍＬ、１１．６５１ｍｍｏｌ）を室温で滴加した。ＲＭを１３０℃に加熱し、１時間撹拌した。１時間後、フェニルメタノール（１．２１１ｍＬ、１１．６５１ｍｍｏｌ）をＲＭに添加し、１３０℃で３時間撹拌した。室温まで冷却した後、ＲＭを１Ｎ　ＮａＯＨ溶液（８０．０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で洗浄した。水層をクエン酸水溶液（ｐＨ約５）で酸性化し、ＤＣＭ（２×８０ｍＬ）で抽出した。有機層をブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、黄色の固体としてトランス－３－（（（ベンジルオキシ）カルボニル）アミノ）－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２．２ｇ、５３．４８％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．３２－７．３８（ｍ，７　Ｈ），５．１０（ｓ，３　Ｈ），４．６９（ｄ，１　Ｈ），４．３５－４．４０（ｍ，１　Ｈ），３．７７－３．８２（ｍ，１　Ｈ），３．４９（ｓ，２　Ｈ），２．９４（ｓ，２　Ｈ），１．４５（ｓ，９　Ｈ）．

ステップ２：ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）中のトランス－３－（（（ベンジルオキシ）カルボニル）アミノ）－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２．４ｇ、６．１７９ｍｍｏｌ）の溶液に、１０％Ｐｄ／Ｃ（１．３１５ｇ、１２．３５９ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを、水素バルーン圧力下で、室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭをセライトパッドに通して濾過し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）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４５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、無色の液体としてトランス－３－アミノ－４－（トリフルオロメチル）ピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．３ｇ、８２．７４％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：３．４９－３．６２（ｍ，３　Ｈ），３．２６－３．３１（ｍ，２　Ｈ），２．９６（ｓ，１　Ｈ），２．８５（ｓ，１　Ｈ），１．８２－１．９８（ｍ，２　Ｈ），１．３９（ｓ，９　Ｈ）．

【０２２３】

３－アミノ－３－（２，２－ジフルオロエチル）ピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（Ｉｎｔ－１５）の合成。

【化５８】



ステップ１：トルエン（２０ｍＬ）中の１－（（ベンジルオキシ）カルボニル）－３－（２，２－ジフルオロエチル）ピペリジン－３－カルボン酸（２．０ｇ、６．１１４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＥＡ（１．７０４ｍＬ、１２．２２８ｍｍｏｌ）及びＤＰＰＡ（１．４４６ｍＬ、６．７２５ｍｍｏｌ）を室温で滴加した。ＲＭを１００℃で２時間加熱した。室温まで冷却した後、ＲＭを水で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、淡黄色の液体として３－（２，２－ジフルオロエチル）－３－イソシアナトピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（１．８ｇ、９０．７８％）を得た。

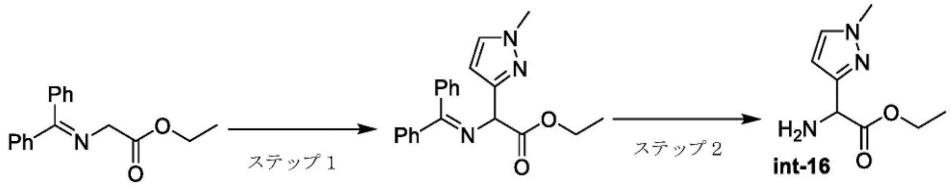
ステップ２：１，４－ジオキサン（１８ｍＬ）中の３－（２，２－ジフルオロエチル）－３－イソシアナトピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（１．８ｇ、５．５５０ｍｍｏｌ）の溶液に６Ｍ　ＨＣｌ水溶液（１８ｍＬ）を添加した。ＲＭを４５℃に１６時間加熱した。完了後、ＲＭを濃縮した。残渣を水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）で洗浄した。水層を１Ｎ　ＮａＯＨ溶液（５０ｍＬ）で塩基性化し、ＤＣＭ（２×１０

０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、淡黄色の液体として３－アミノ－３－（２，２－ジフルオロエチル）ピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（Ｉｎｔ－１５）を得た（９００ｍｇ、５４．３６％）。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ　d_6）δ　ｐｐｍ：７．３７－７．３０（ｍ，５　Ｈ），６．３７－６．０７（ｍ，１　Ｈ），５．０６（ｓ，２　Ｈ），３．５６（ｓ，４　Ｈ），３．３８－３．１６（ｍ，３　Ｈ），１．９０－１．７９（ｍ，２　Ｈ），１．６５－１．５５（ｍ，４　Ｈ），１．４３－１．３８（ｍ，２　Ｈ）．

【０２２４】

２－アミノ－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（Ｉｎｔ－１６）の合成。

【化５９】



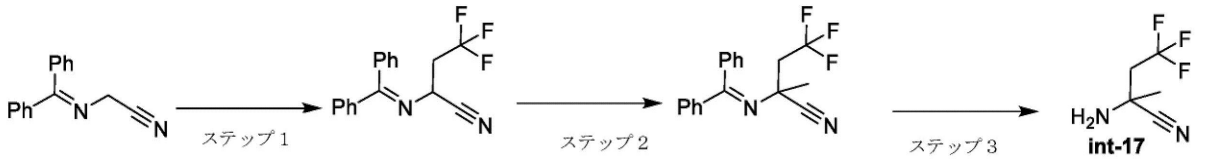
ステップ１：２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）酢酸エチル（５．０ｇ、１８．７０４ｍｍｏｌ）、３－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール（２．８５０ｍＬ、２８．０５６ｍｍｏｌ）のトルエン（５０ｍＬ、１００ｍＬの密封管に取り込んだ）溶液に、K_3PO_4（１１．９０７ｇ、５６．１１３ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭをアルゴンで２０分間脱気した。Ｐｄ（ｔ－Bu_3P）$_2$（９５５．８７ｍｇ、１．８７０ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを１００℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１２％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物として２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（２．５ｇ、３８．４７％）を得た。^{1}ＨＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：７．６８－７．７１（ｑ，２　Ｈ），７．４２－７．４４（ｍ，３　Ｈ），７．３６－７．３８（ｍ，１　Ｈ），７．３０－７．３３（ｍ，３　Ｈ），７．１７－７．２０（ｍ，２　Ｈ），６．４５（ｄ，１　Ｈ），５．３４（ｓ，１　Ｈ），４．１５－４．１９（ｍ，２　Ｈ），３．８４（ｓ，３　Ｈ），１．２２（ｔ，３　Ｈ）．

ステップ２：ヘキサン（１０ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（２．４ｇ、６．９０８ｍｍｏｌ、１．０当量）の溶液に、１Ｎ　ＨＣｌ（水溶液）（２５ｍＬ）を室温で添加した。ＲＭを１６時間撹拌した。完了後、ＲＭをＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。水層を飽和　$NaHCO_3$溶液（ｐＨ約０．８）で塩基性化し、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨで抽出した（３×５０ｍＬ）。合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、褐色の液体として２－アミノ－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）酢酸エチル（９００ｍｇ、７１．１１％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：７．５７（ｄ，１　Ｈ），６．１５（ｄ，１　Ｈ），４．４３（ｓ，１　Ｈ），４．１１－４．０１（ｍ，２　Ｈ），３．７０（ｓ，３　Ｈ），２．０７（ｓ，２　Ｈ），１．１４（ｔ，３　Ｈ）．

【０２２５】

２－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタンニトリル塩化水素（Ｉｎｔ－１７）の合成。

【化６０】



ステップ１：ＤＭＦ（１００ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）アセトニトリル（１０ｇ、４５．３９９ｍｍｏｌ）の溶液に、カリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（５．６０４ｇ、４９．９３９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１０分間撹拌した。１０分後、１，１，１－トリフルオロ－２－ヨードエタン（４．９２２ｍＬ、４９．９３９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１時間撹拌した。完了後、ＲＭを氷水（１００ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（１００ｍＬ）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、ｐｅｔ．エーテル中の１％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色ガム状物として２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４，４，４－トリフルオロブタンニトリル（５ｇ、３６．４３％）を得た。

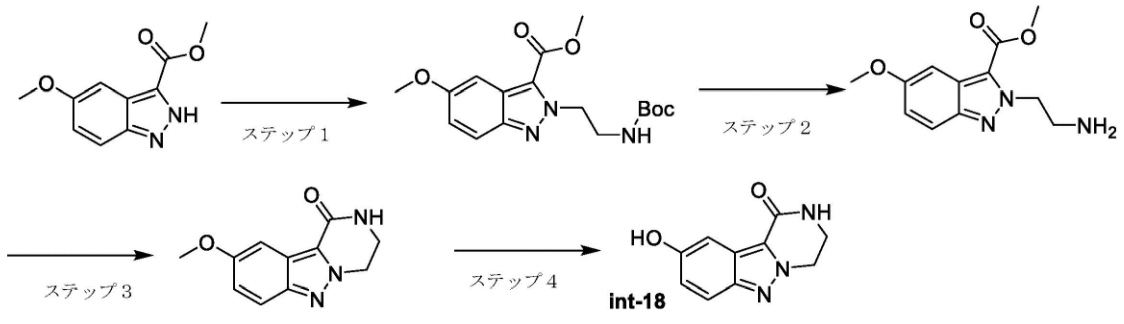
ステップ２：ＴＨＦ（１５０ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４，４，４－トリフルオロブタンニトリル（５．０ｇ、１６．５４ｍｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中１．６Ｍ）（１２ｍＬ、１９．８４８ｍｍｏｌ）を－７８℃で添加した。ＲＭを－７８℃で１５分間撹拌した。１５分後、ヨウ化メチル（１０．２２ｍＬ、１９．８４ｍｍｏｌ）を－７８℃で添加した。ＲＭを０℃で４時間撹拌した。完了後、ＲＭを飽和塩化アンモニウム溶液（５０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣによって精製して、淡黄色のガム状物として２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタンニトリル（２．０ｇ、３８．２３％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：７．５９（ｄ，２　Ｈ），７．５１－７．５４（ｍ，３　Ｈ），７．４０－７．４７（ｍ，２　Ｈ），７．３１－７．３７（ｍ，３　Ｈ），２．９４（ｂｓ，１　Ｈ），２．９２（ｂｓ，１　Ｈ），１．７７（ｓ，３　Ｈ）．

ステップ３：ＴＨＦ（１００ｍＬ）及び水（３．０ｍＬ）中の２－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－４，４－ジフルオロブタンニトリル（２．０ｇ、６．３２３ｍｍｏｌ）の溶液に、ジオキサン（２．０ｍＬ）中の４Ｎ　ＨＣｌを室温で添加した。ＲＭを６時間撹拌した。完了後、ＲＭを濃縮し、ｎ－ペンタンで処理し、減圧下で乾燥させて、褐色の固体として２－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタンニトリル塩酸塩（Ｉｎｔ－１７）（９００ｍｇ、９３．５８％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δｐｐｍ：９．６４（ｂｓ，２Ｈ），３．２５－３．３３（ｍ，２Ｈ），１．８２（ｓ，３Ｈ）。

【０２２６】

９－ヒドロキシ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１（２Ｈ）－オン（Ｉｎｔ－１８）の合成。

【化６１】



ステップ１：ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の５－メトキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．３ｇ、６．３０５ｍｍｏｌ）の溶液に、（２－ブロモエチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２．１１９ｍｇ、９．４５７ｍｍｏｌ）及び炭酸セシウム（６．１６２ｍｇ、１８．９１４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２０～４０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製し、オフホワイト色の固体として２－（２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）エチル）－５－メトキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（所望の生成物）（７００ｍｇ、３１．７８％）を得た。

ステップ２：ＤＣＭ（１０．０ｍＬ）中の２－（２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）エチル）－５－メトキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（６００ｍｇ、１．７１７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＦＡ（１．３ｍＬ、１７．１７３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を、ｎ－ペンタン（３０ｍＬ）を粉砕して、淡黄色の固体として２－（２－アミノエチル）－５－メトキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（ＴＦＡ塩）（４００ｍｇ、９３％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：７．６０（ｄ，１　Ｈ），７．１９（ｄ，１　Ｈ），７．０９－７．１２（ｄｄ，１　Ｈ），５．２２（ｓ，２　Ｈ），４．０６（ｓ，３　Ｈ），３．９７（ｔ，４　Ｈ），３．７３（ｓ，３　Ｈ）．

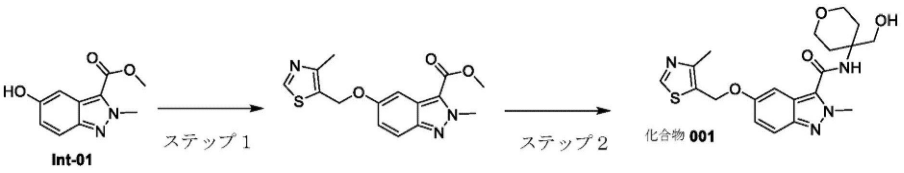
ステップ３：ＭｅＯＨ（１０．０ｍＬ）中の２－（２－アミノエチル）－５－メトキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４００ｍｇ、１．６０５ｍｍｏｌ）の溶液に、炭酸セシウム（２．０９１ｍｇ、６．４１９ｍｍｏｌ、４当量）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、揮発物を減圧下で除去した。残渣を水（１５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×１５ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣をｎ－ペンタン（１５ｍＬ）で粉砕し、乾燥させて、オフホワイト色の固体化合物、９－メトキシ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］－インダゾール－１（２Ｈ）－オン（３２０ｍｇ、９１％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$DMSO-D_6$）δ　ｐｐｍ：８．１９（ｓ，１　Ｈ），７．６６（ｄ，１　Ｈ），７．２３（ｄ，１　Ｈ），７．００（ｄｄ，１　Ｈ），４．５７（ｔ，２　Ｈ），３．８４（ｓ，３　Ｈ），３．６６－３．７１（ｍ，２　Ｈ）．

ステップ４：ＤＣＭ（１０．０ｍＬ）中の９－メトキシ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］－インダゾール－１（２Ｈ）－オン（３５０ｍｇ、４．８０３ｍｍｏｌ）の溶液に、BBr_3（ＤＣＭ中１Ｍ）（６．４４ｍＬ、６．４４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２４時間撹拌した。完了後、溶媒を減圧下で蒸発させた。０℃で、残渣を飽和重炭酸ナトリウム（ｐＨ約９）でクエンチした。沈殿物を濾過によって収集し、乾燥させた。残渣をｎ－ペンタンで粉砕し、乾燥させて、オフホワイト色の固体として９－ヒドロキシ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１（２Ｈ）－オン（Ｉｎｔ－１８）（２６０ｍｇ、７９．５％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$DMSO-D_6$）δ　ｐｐｍ：９．５４（ｓ，１　Ｈ），８．０７（ｓ，１　Ｈ），７．５９（ｄ，１　Ｈ），７．１８（ｄ，１　Ｈ），６．９１－６．９４（ｄｄ，１　Ｈ），４．５４（ｔ，２　Ｈ），３．６６－３．６９（ｍ，２　Ｈ）．

【０２２７】

Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物００１）の合成（光延）。

【化６２】



【０２２８】

ステップ１：ＴＨＦ（５０ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（０．３０ｇ、１．４５ｍｍｏｌ、１．０当量）及び（４－メチルチアゾール－５－イル）メタノール（１．２５ｇ、２．１８ｍｍｏｌ、１．５当量）の撹拌溶液に、ＡＤＤＰ（０．７３ｇ、２．９０ｍｍｏｌ、２．０当量）及びＰＢｕ３（０．７３ｍｌ、２．９０ｍｍｏｌ、２．０当量）を０℃で滴加した。次いで、反応混合物を室温で１８時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を氷水で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍｌ）で抽出した。合わせた有機層を、氷水（５０ｍｌ）、ブライン溶液（５０ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、濾過し、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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（０．３３ｇ、粗製物）を得た。ＴＬＣ系：６０％ＥｔＯＡｃ／Ｐｅｔエーテル、ＲＦ：０．４。

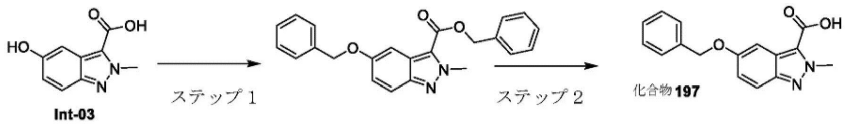
【０２２９】

ステップ２：室温でＴＨＦ（１００ｍｌ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（０．３０ｇ、０．９４ｍｍｏｌ、１．０当量）及び（４－アミノテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）メタノール（０．１８４ｇ、１．１３ｍｍｏｌ、１．２当量）の撹拌溶液に、Ｅｔ３Ｎ（０．２７ｍｌ、１．８８ｍｍｏｌ、２．０当量）及び１，３，４，６，７，８－ヘキサヒドロ－２Ｈ－ピリミド［１，２－ａ］ピリミジン（０．２６１ｇ、１．８８ｍｍｏｌ、２．０当量）を室温で添加した。次いで、反応混合物を８０℃まで加熱し、１８時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を氷水で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍｌ）で抽出した。合わせた有機層を、氷水（５０ｍｌ）、ブライン溶液（２５ｍｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗製物を得、これを、分取ＨＰＬＣ精製によって精製して、Ｎ－［４－（ヒドロキシメチル）オキサン－４－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物００１）（３０ｍｇ、３ステップで、１．４％）を得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．２。

【０２３０】

５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１９７）の合成。

【化６３】



【０２３１】

ステップ１：ＤＭＦ（２０ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（Ｉｎｔ－０３）（８００ｍｇ、４．１６６ｍｍｏｌ、１当量）の撹拌溶液に、Ｃｓ２ＣＯ３（４ｇ、１２．４９８ｍｍｏｌ、３当量）及び（ブロモメチル）ベンゼン（０．９８ｍＬ、８．３３３ｍｍｏｌ、２当量）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１８時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応の完了後、ＲＭを氷水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン溶液（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、残渣を得た。残渣を、溶離液３０％ＥｔＯＡｃ－Ｐｅｔエーテルを使用するＦＣＣにより精製

して、５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸ベンジル（６５０ｍｇ、４３％、淡黄色の固体）を得た。ＴＬＣ系：３０％ＥｔＯＡｃ－Ｐｅｔエーテル、Ｒｆ：０．３４。

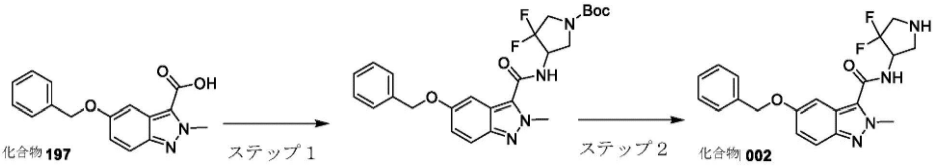
【０２３２】

ステップ２：ＭｅＯＨ－ＴＨＦ－Ｈ２Ｏ（１：１：１）（１５ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸ベンジル（６５０ｍｇ、１．７４７ｍｍｏｌ、１当量）の撹拌溶液に、ＮａＯＨ（２７９ｍｇ、６．９８９ｍｍｏｌ、４当量）を室温で添加した。ＲＭを５０℃に加熱し、５０℃で１時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応の完了後、ＲＭを室温まで冷却し、溶媒を蒸発させた。残渣を水（２０ｍＬ）で希釈し、１Ｎの　ＨＣｌ（５ｍＬ）水溶液でＰＨ約１に酸性化し、５分間撹拌した。沈殿した固体を濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、乾燥させて、５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１９７）（４５０ｍｇ、９１％　淡黄色の固体）を得た。ＴＬＣ系：５％ＭｅＯＨ－ＣＨ２Ｃｌ２、Ｒｆ：０．２４。

【０２３３】

５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロピロリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物００２）の合成。

【化６４】



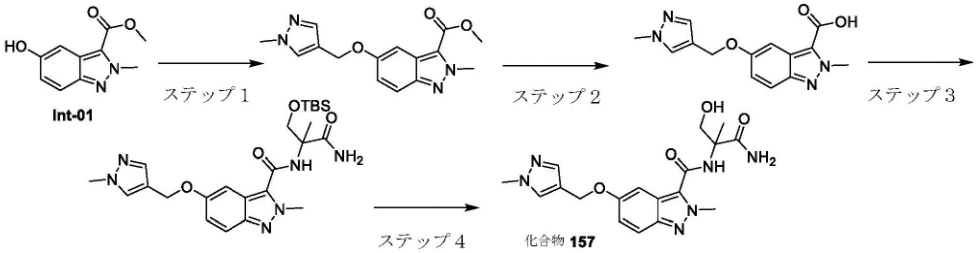
【０２３４】

ステップ１：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１９７）（４５０ｍｇ、１．５９５ｍｍｏｌ、１当量）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（９０９ｍｇ、２．３９３ｍｍｏｌ、１．５当量）、ＤＩＰＥＡ（０．７ｍＬ、３．９８９ｍｍｏｌ、２．５当量）、及び４－アミノ－３，３－ジフルオロピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５３１ｍｇ、２．３９３ｍｍｏｌ、１．５当量）を室温で添加した。ＲＭを室温で３時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応の完了後、ＲＭをＥｔＯＡｃ（３５０ｍＬ）で希釈した。有機層を、水（４×１００ｍＬ）、ブライン溶液（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、残渣を得て、これをｎ－ヘキサン中で粉砕し、濾過して、４－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）－３，３－ジフルオロピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５５０ｍｇ、粗製物、オフホワイト色の固体を得た。ＴＬＣ系：８０％ＥｔＯＡｃ－Ｐｅｔエーテル、Ｒｆ：０．４６。

【０２３５】

ステップ２：ＤＣＭ（１０ｍｌ）中の４－（５－（ベンジルオキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）－３，３－ジフルオロピロリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５５０ｍｇ、１．１３１ｍｍｏｌ、１当量）の撹拌溶液に、ＴＦＡ（３ｍＬ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応の完了後、反応混合物を濃縮し、ＥｔＯＡｃ（３５０ｍＬ）で希釈した。有機層を飽和　ＮａＨＣＯ３（２×５０ｍＬ）、水（５０ｍＬ）、ブライン溶液（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、残渣を得て、これをジエチルエーテル（１０ｍＬ）で粉砕して、５－（ベンジルオキシ）－Ｎ－（４，４－ジフルオロピロリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物００２）（２７０ｍｇ、２ステップで４４％、オフホワイト色の固体）を得た。ＴＬＣ系：５％ＭｅＯＨ－ＤＣＭ、Ｒｆ：０．１２。

【０２３６】
分取キラルＳＦＣを、化合物００２のラセミ混合物に対して実行して、化合物００２－Ｅｎ１及び化合物００２－Ｅｎ２を得た。
【０２３７】
以下の化合物は、化合物００２－Ｅｎ１及び化合物００２－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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００３－Ｅｎ１、化合物００３－Ｅｎ２、化合物１２８－Ｅｎ１、化合物１２８－Ｅｎ２、化合物１３２－Ｅｎ１、化合物１３２－Ｅｎ２、化合物２４６－Ｅｎ１、化合物２４６－Ｅｎ２。
【０２３８】
３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１５６）の合成（光延）。
【化６５】



【０２３９】
ステップ１：ＴＨＦ（２０ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（４００ｍｇ、１．９３９ｍｍｏｌ）及び（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メタノール（０．２４４ｍｌ、２．５２２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＡＤＤＰ（９７８．４２ｍｇ、３．８７８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１５分間撹拌した。ＴＨＦ（２ｍｌ）中のトリブチルホスフィン（０．９５７ｍｌ、３．８７８ｍｍｏｌ）を、０℃でＲＭに滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを水でクエンチし、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機層をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。粗製物をＦＣＣ（１００～２００メッシュシリカゲルを使用、３０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）により精製して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４５０ｍｇ、７７％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ［ｐｐｍ］：７．８１（ｓ，１Ｈ），７．６８－７．６６（ｄ，１Ｈ），７．５２（ｓ，１Ｈ），７．３４（ｓ，１Ｈ），７．０３－７．０１（ｍ，１Ｈ），５．０１（ｓ，２Ｈ），４．３７（ｓ，３Ｈ），３．９７（ｓ，３Ｈ），３．７８（ｓ，３Ｈ），１．９８（ｂｓ，１Ｈ）．
【０２４０】
ステップ２：ＴＨＦ：ＭｅＯＨ：Ｈ２Ｏ（１２ｍｌ、１：１：１）中の２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキシレート（４５０ｍｇ、１．４９８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ．Ｈ２Ｏ（１５７．３３ｍｇ、３．７４６ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを濃縮し、ＰＨ＜７になるまでＮａＨＳＯ４飽和溶液で酸性化した。固体を濾過し、エーテルで洗浄して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（３７０ｍｇ、６４％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ［ｐｐｍ］：１３．４５（ｓ，１Ｈ），７．６６－７．６４（ｄ，１Ｈ），７．３９（ｓ，１Ｈ），７．０４－７．０１（ｍ，１Ｈ），６．３１（ｓ，２Ｈ），４．３６（ｓ，３Ｈ），３．８３（ｓ，３Ｈ）．
【０２４１】

ステップ３：ＤＭＦ（４ｍｌ）中の２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（３７０ｍｇ、１．２９２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（６３８．６５ｍｇ、１．６８０ｍｍｏｌ）、続いてＤＩＰＥＡ（０．６７７ｍｌ、３．８７６ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを１５分間撹拌した。２－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチルプロパンアミド（Ｉｎｔ－０２）（３９０．４４ｍｇ、１．６８０ｍｍｏｌ）を室温でＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを氷冷水でクエンチし、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機部分をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。粗製物をＦＣＣ（８０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）により精製して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸［２－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－１－カルバモイル－１－メチル－エチル］－アミド（４００ｍｇ、６２％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ　［ｐｐｍ］：８．０３（ｓ，１Ｈ），７．６８－７．６３（ｍ，３Ｈ），７．５３（ｓ，１Ｈ），７．４０（ｓ，１Ｈ），７．０４－７．０２（ｄ，１Ｈ），６．３５（ｓ，１Ｈ），５．０３－４．９５（ｍ，２Ｈ），４．３０（ｓ，４Ｈ），４．０４－４．０１（ｍ，１Ｈ），３．７７（ｓ，３Ｈ），１．５７（ｓ，３Ｈ），０．８７５（ｓ，３Ｈ），０．７７（ｓ，９Ｈ），－０．０１２－０．０６（ｄ，６Ｈ）．

【０２４２】

ステップ４：ＤＣＭ（３ｍｌ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（２００ｍｇ、０．４６４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＦＡ（２ｍｌ）を０℃で添加した。反応混合物を室温で１６時間撹拌した。ＲＭを濃縮し、エーテルで粉砕した。粗製物を、分取ＳＦＣによって精製して、オフホワイト色の固体として３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１５６）（５０ｍｇ、３２％）を得た。

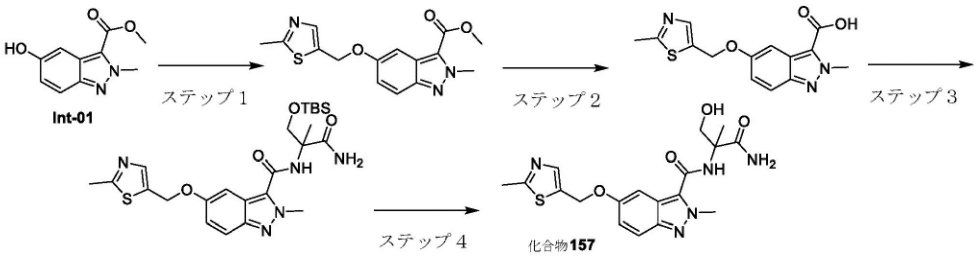
【０２４３】

以下の化合物は、化合物１５６について記載したものと同様の様式（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１５１－Ｅｎ１、化合物１５１－Ｅｎ２、化合物１５４－Ｅｎ１、化合物１５４－Ｅｎ２、化合物１５５－Ｅｎ１、化合物１５５－Ｅｎ２。

【０２４４】

３－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１５７）の合成。

【化６６】



【０２４５】

ステップ１：ＤＭＦ（８ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（３００ｍｇ、１．４５５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、炭酸カリウム（５０３ｍｇ、３．６３７ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１５分間撹拌した。ＤＭＦ（２ｍｌ）中の５－（ブロモメチル）－２－メチルチアゾー

ル（３１３ｍｇ、１．７４６ｍｍｏｌ）をＲＭに添加し、室温で１６時間撹拌した。ＲＭを氷冷水でクエンチし、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。粗製物をＦＣＣ（６０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）により精製して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（２－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１５０ｍｇ、３２％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ［ｐｐｍ］：７．７５（ｓ，１Ｈ），７．７１－７．６９（ｄ，１Ｈ），７．３８（ｓ，１Ｈ），７．０７－７．０４（ｄ，１Ｈ），５．３８（ｓ，２Ｈ），４．３８（ｓ，３Ｈ），３．９７（ｓ，３Ｈ），２．６４（ｓ，３Ｈ）．

【０２４６】

ステップ２：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ：ＭｅＯＨ（１２ｍｌ、１：１：１）中の２－メチル－５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチルエステル（１５０ｍｇ、０．４７３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ．H_2O（５０ｍｇ、１．１８２ｍｍｏｌ））を室温で添加した。反応混合物を室温で１６時間撹拌した。ＲＭを濃縮し、ｐＨ＜７になるまで飽和重硫酸ナトリウムでクエンチした。結果として得られた固体を濾過し、ヘキサン：エーテル（１０ｍｌ、９：１）で洗浄して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（２－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１５０ｍｇ）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ［ｐｐｍ］：７．７１（ｓ，１Ｈ），７．６８－７．６５（ｄ，１Ｈ），７．３８（ｓ，１Ｈ），７．０４－７．０２（ｄ，１Ｈ），５．３４（ｓ，２Ｈ），４．３７（ｓ，３Ｈ），２．６３（ｓ，３Ｈ）．

【０２４７】

ステップ３：ＤＭＦ（５ｍｌ）中の２－メチル－５－（（２－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１５０ｍｇ、０．４９５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（２２６ｍｇ、０．５９４ｍｍｏｌ））、続いてＤＩＰＥＡ（０．２４６ｍｌ、１．４８５ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１５分間撹拌した。２－アミノ－３－（ｔｅｒｔ－ブチル－ジメチル－シラニルオキシ）－２－メチル－プロピオンアミド（Ｉｎｔ－０２）（１３８ｍｇ、０．５９３ｍｍｏｌ）を室温でＲＭに添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを氷冷水でクエンチした。固体を濾過し、ヘキサン：エーテル（１０ｍｌ、９：１）で洗浄して、オフホワイト色の固体としてＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－２－メチル－５－（（２－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（１９０ｍｇ、７４％）を得た。１Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ［ｐｐｍ］：８．００（ｓ，１Ｈ），７．７４（ｓ，１Ｈ），７．６７－７．６２（ｍ，２Ｈ），７．５３（ｓ，１Ｈ），７．３９（ｓ，１Ｈ），７．０７－７．０５（ｍ，１Ｈ），５．３１－５．３０（ｍ，２Ｈ），４．３０－４．２６（ｍ，４Ｈ），４．０３－４．０１（ｍ，１Ｈ），２．６６－２．６３（ｍ，３Ｈ），１．５７（ｓ，３Ｈ），０．７７（ｓ，９Ｈ），－０．００６（ｓ，３Ｈ），－０．０５８５（ｓ，３Ｈ）．

【０２４８】

ステップ４：ＤＣＭ（５ｍｌ）中のＮ－（１－アミノ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）－２－メチル－５－（（２－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（１９０ｍｇ、０．３６７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＴＦＡ（２ｍｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。ＲＭを濃縮した。粗製物を、分取ＨＰＬＣ（逆相）によって精製して、－ヒドロキシ－２－メチル－２－（｛２－メチル－５－［（２－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１５７）（１００ｍｇ、６７％）を得た。

【０２４９】

分取キラルＳＦＣを、化合物１５７のラセミ混合物に対して実行して、化合物１５７－

Ｅｎ１及び化合物１５７－Ｅｎ２を得た。

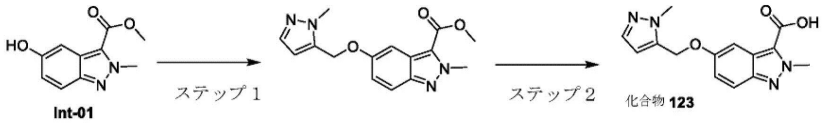
【０２５０】

以下の化合物は、化合物１５７－Ｅｎ１及び化合物１５７－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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１５８－Ｅｎ１、化合物１５８－Ｅｎ２、化合物１６０－Ｅｎ１、化合物１６０－Ｅｎ２、化合物１６２－Ｅｎ１、化合物１６２－Ｅｎ２、化合物１６７－Ｅｎ１、化合物１６７－Ｅｎ２、化合物１７９－Ｅｎ１、化合物１７９－Ｅｎ２、化合物１８１－Ｅｎ１、化合物１８１－Ｅｎ２、化合物１９６。

【０２５１】

２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１２３）の合成（光延）。

【化６７】



【０２５２】

ステップ１：ＴＨＦ（２０ｍｌ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（４００ｍｇ、１．９３９ｍｍｏｌ）及び（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メタノール（２８３ｍｇ、２．５２２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＡＤＤＰ（９７８．４２ｍｇ、３．８７８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１５分間撹拌した。ＴＨＦ（２ｍｌ）中のトリブチルホスフィン（０．９５７ｍｌ、３．８７８ｍｍｏｌ）を、０℃で滴加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを水でクエンチし、ＥｔＯＡｃで抽出した。有機部分をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。粗製物をＦＣＣ（１００～２００メッシュシリカゲルを使用、３０％ＥｔＯＡｃ－ヘキサンで溶出）により精製して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４５０ｍｇ、７７％）を得た。^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ［ｐｐｍ］：７．７２－７．６９（ｄ，１Ｈ），７．４１－７．３９（ｄ，１Ｈ），７．１０－７．０８（ｄ，１Ｈ），６．４１（ｓ，１Ｈ），４．３８（ｓ，３Ｈ），３．９８（ｓ，３Ｈ），３．８５（ｓ，３Ｈ），１．６２－１．６４（ｍ，１Ｈ），２．４２（ｓ，３Ｈ）．

【０２５３】

ステップ２：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ：ＭｅＯＨ（１２ｍｌ、１：１：１）中の２－メチル－５－（（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（３）（４５０ｍｇ、１．４９８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、$LiOH.H_2O$（１５８ｍｇ、３．７４６ｍｍｏｌ））を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。ＲＭを濃縮し、ｐＨ＜７になるまで飽和重硫酸ナトリウムでクエンチした。固体を濾過し、ヘキサン：エーテル（１０ｍｌ、９：１）で洗浄して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－［（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１２３）（３７０ｍｇ、８６％）を得た。

【０２５４】

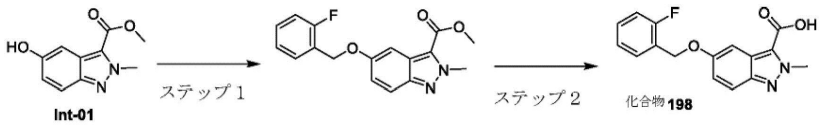
以下の化合物は、化合物１２３について記載したものと同様の様式（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物１２２、化合物１９９。

【０２５５】

５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－

カルボン酸（化合物１９８）の合成。

【化６８】



【０２５６】

ステップ１：ＭｅＣＮ（４０ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（２．０ｇ、９．７０８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ｃｓ２ＣＯ３（１２．５ｇ、３８．８３２ｍｍｏｌ）を添加し、続いて２－フルオロベンジルメタンスルホネート（２．９ｇ、１４．５６３ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを８０℃に加熱し、８０℃で１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物をセライト床で濾過し、セライト床を酢酸エチル（２×３０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。粗製物を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲル（１００～２００メッシュ）でのカラムクロマトグラフィーにより精製して、淡黄色のガムとして５－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（２．０ｇ、４７％）を得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、ＲＦ：０．７。

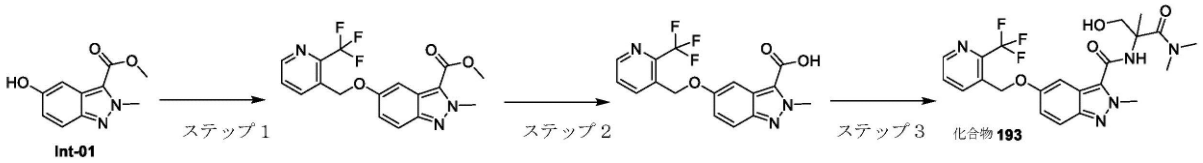
【０２５７】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ（１：１：０．５、７５ｍＬ）中の５－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（２．０ｇ、６．３６９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＯＨ（１．０ｇ、２５．４７７ｍｍｏｌ）を室温で添加した。反応混合物を６０℃で３時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮し、１Ｎ　ＨＣｌ水溶液でｐＨ約２まで酸性化し、３０分間撹拌した。沈殿した固体を濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、淡黄色の固体として５５－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１９８）（１．５ｇ、６０％）を得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、ＲＦ：０．１。

【０２５８】

３－ヒドロキシ－Ｎ，Ｎ，２－トリメチル－２－［（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｝－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド（化合物１９３）の合成（光延）。

【化６９】



【０２５９】

ステップ１：ＡＤＤＰ（１．７６ｍｇ、６．９９ｍｍｏｌ）及びＴＢＰ（１．７０ｍＬ、６．９９ｍｍｏｌ）を、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（９００ｍｇ、４．３６ｍｍｏｌ）及び（２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノールの撹拌溶液に０℃で添加した。得られた反応混合物を室温で２時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×８０ｍＬ）で抽出した。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、無色の液体として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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．４ｇ、８８％）を得た。粗製物を精製することなく次のステップで使用した。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の２０％メタノール、ＲＦ：０．８。

【０２６０】
ステップ２：２Ｎ　ＮａＯＨ（３ｍＬ）の水溶液を、ＴＨＦ：ＥｔＯＨ（１：１、１０ｍＬ）中の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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．４ｇ、３．８３ｍｍｏｌ）の溶液に添加し、７０℃で１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水（３０ｍＬ）で希釈し、ｐＨを１Ｎ　ＨＣｌ水溶液で約２に調整した。沈殿した固体を濾過によって収集し、真空下で乾燥させて、淡黄色固体として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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（１．２ｇ、粗製物）を得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．２。

【０２６１】
ステップ３：２－アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ，Ｎ，２－トリメチルプロパンアミド（１４４．５ｍｇ、０．９８８ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（５ｍＬ）中の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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．６５９３ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（３２４．７ｍｇ、０．８５ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（０．２９ｍＬ、１．７０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加し、得られた反応混合物を室温で１６時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、３０％アセトニトリル（ＡＣＮ）及び水中０．１％ギ酸を溶離液として使用するＧＲＡＣＥフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、白色固体として３－ヒドロキシ－Ｎ，Ｎ，２－トリメチル－２－［（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｝－２Ｈ－インダゾール－３－イル）ホルムアミド］プロパンアミド（化合物１９３）（５０ｍｇ、１８％）を得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．１。

【０２６２】
分取キラルＳＦＣを、化合物１９３のラセミ混合物に対して実行して、化合物１９３－Ｅｎ１及び化合物１９３－Ｅｎ２を得た。

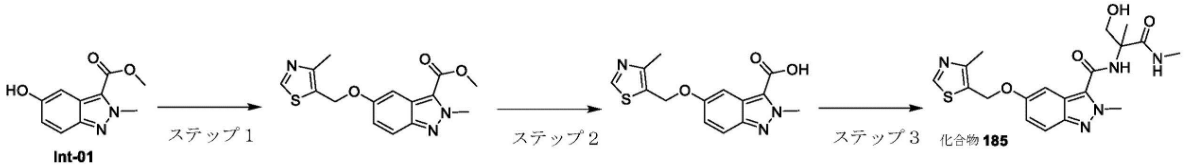
【０２６３】
以下の化合物は、化合物　１９３－Ｅｎ１及び化合物　１９３－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物　００４，化合物　００６，化合物　００７，化合物　００８，化合物　００９，化合物　０１０－Ｄｉａ１，化合物　０１０－Ｄｉａ２，化合物　０１１－Ｄｉａ１，化合物　０１１－Ｄｉａ２，化合物　０１２，化合物　０１３，化合物　０１４，化合物　０１５，ｐｄ　０１６，ｐｄ　０１７，化合物　０１９，化合物　０２０，化合物　０２２，化合物　０２３，化合物　０２５，化合物　０２６，化合物　０２７，化合物　０２８，化合物　０２９，化合物　０３０，化合物　０３３，化合物　０３４，化合物　０３５，化合物　０３６，化合物　０３８，化合物　０３９，化合物　０４０，化合物　０４１，化合物　０４２，化合物　０４４，化合物　０４５，化合物　０４６，化合物　０４９，化合物　０５０，化合物　０５１，化合物　０５４，化合物　０５５，化合物　０５６－Ｄｉａ１，化合物　０５６，Ｄｉａ２，化合物　０５８，化合物　０５９，化合物　０６０，化合物　０６１，化合物　０６２，化合物　０６５，化合物　０６６，化合物　０６７，化合物　０６８，化合物　０６９，化合物　０７１，化合物　０７３，化合物　０７４，化合物　０７６，化合物　０７７，化合物　０７８，化合物　０７９，化合物　０８１，ｓ　化合物　０８２，化合物　０８３，化合物　０８４，化合物　０８５，化合物　０８６，化合物　０８７，化合物　０８８，化合物　０９０，化合物　０９１，化合物　０９２，化合物　１００，化合物　１０２，化合物　１０３，化合物　１０４，化合物　１０５，化合物　１０６，化合物　１０８，化合物　１１１，化合物　１１４，化合物　１１７，化合物　１１９，化合物　１２０，化合物　１２４，化合物　１２５，化合物　１２６，化合物　１２７，化合物　１４７，化合物　１４９，化合物　１５０，化合物　１５２，化合物　１５

３，化合物　２０２－Ｅｎ１，化合物　２０２－Ｅｎ２，化合物　２０４，化合物　２０５，化合物　２０６，化合物　２０７，化合物　２０８，化合物　２０９，化合物　２１０，化合物　２１７，化合物　２１８，化合物　２１９，化合物　２２０－Ｅｎ１，化合物　２２０－Ｅｎ２，化合物　２２１－Ｅｎ１，化合物　２２１－Ｅｎ２，，化合物　２２３－Ｅｎ１，化合物　２２３－Ｅｎ２，化合物　２２６－Ｅｎ１，化合物　２２６－Ｅｎ２，化合物　２２７－Ｅｎ１，化合物　２２７－Ｅｎ２，化合物　２２８－Ｅｎ１，化合物　２２８－Ｅｎ２，化合物　２３０－Ｅｎ１，化合物　２３０－Ｅｎ２，化合物　２３２－Ｅｎ１，化合物　２３２－Ｅｎ２，化合物　２３４，化合物　２３８－Ｅｎ１，化合物　２３８－Ｅｎ２，，化合物　２４５－Ｅｎ１，化合物　２４５－Ｅｎ２，化合物　２５４－Ｅｎ１，化合物　２５４－Ｅｎ２，化合物　２５８－Ｅｎ１，化合物　２５８－Ｅｎ２，化合物　２５９，化合物　２６２．

【０２６４】

３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１８５）の合成。

【化７０】



【０２６５】

ステップ１：Cs_2CO_3（８．８６ｇ、２７．２７ｍｍｏｌ）を、ＭｅＣＮ（２０ｍＬ）中の（４－メチルチアゾール－５－イル）メチルメタンスルホネート（２．６１ｇ、１３．６３５ｍｍｏｌ）及び５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（２．０ｇ、９．０９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加した。ＲＭを８０℃に加熱し、１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物をセライト床で濾過し、濾液を減圧下で濃縮して、淡黄色の固体として２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．８ｇ、６０％）を得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の３０％酢酸エチル、ＲＦ：０．８。

【０２６６】

ステップ２：水（２０ｍＬ）中のＮａＯＨ（１．５ｇ、４５．１ｍｍｏｌ）の溶液を、ＭｅＯＨ（１０ｍＬ）及びＴＨＦ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．９ｇ、５．２７ｍｍｏｌ）の溶液に室温で添加した。得られた反応混合物を室温で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水（５０ｍＬ）で希釈し、ｐＨを　１Ｎ　ＨＣｌ水溶液で約４に調整した。沈殿した固体を濾過し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（１．４ｇ、９７％）を得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ、ＲＦ：０．２。

【０２６７】

ステップ３：２－アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチルプロパンアミド（１３０．６８ｍｇ、０．９８９３ｍｍｏｌ）を、ＤＭＦ（５ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．６５９３ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（３７６．２ｍｇ、０．９８９３ｍｍｏｌ）、及びＤＩＰＥＡ（２５６．４ｍｇ、１．９７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に室温で添加し、得られた反応混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、０．１％ギ酸水中の３０％アセトニトリルを溶離液として

使用するＧＲＡＣＥフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、白色の固体として３－ヒドロキシ－Ｎ，２－ジメチル－２－（｛２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）プロパンアミド（化合物１８５）（１００ｍｇ、３６％）を得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の２０％ＭｅＯＨ、ＲＦ：０．６。

【０２６８】

分取キラルＳＦＣを、化合物１８５のラセミ混合物に対して実行して、化合物１８５－Ｅｎ１及び化合物１８５－Ｅｎ２を得た。

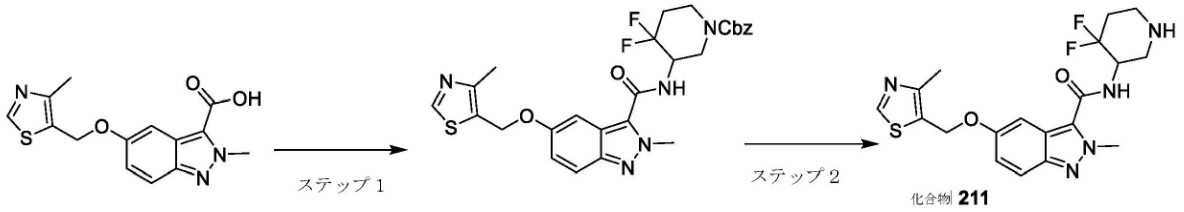
【０２６９】

以下の化合物は、化合物１８５－Ｅｎ１及び化合物　１８５－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物　００５，化合物　０１８，化合物　０２１，化合物　０２４，化合物　０３１，化合物　０３２，化合物　０３７，化合物　０４３，化合物　０４７，化合物　０４８，化合物　０５２，化合物　０５３，化合物　０５７，化合物　０６３，化合物　０６４，化合物　０７０，化合物　０７２，化合物　０７５，化合物　０８０－Ｄｉａ１，化合物　０８０－Ｄｉａ２，化合物　０８９，化合物　０９３，化合物　０９４，化合物　０９５，化合物　０９６，化合物　０９７，化合物　０９８，化合物　０９９，化合物　１０１，化合物　１０７　，化合物　１０９，化合物　１１０，化合物　１１２，化合物　１１３，化合物　１１５，化合物　１１６，化合物　１１８，化合物　１２１，化合物　１２９，化合物　１３０，化合物　１３１，化合物　１３３，化合物　１３４，化合物　１３５，化合物　１３６，化合物　１３７，化合物　１３８，化合物　１３９，化合物　１４０，化合物　１４１，化合物　１４２，化合物　１４３，化合物　１４４，化合物　１４５，化合物　１４６，化合物　１４８，化合物　１８２－Ｅｎ１，化合物　１８２－Ｅｎ２，化合物　１８４－Ｅｎ１，化合物　１８４－Ｅｎ２，化合物　１８７－Ｅｎ１，化合物　１８７－Ｅｎ２，化合物　１８９，化合物　１９０－Ｅｎ１，化合物　１９０－Ｅｎ２，化合物　１９１－Ｅｎ１，化合物　１９１－Ｅｎ２，化合物　１９２－Ｅｎ１，化合物　１９２－Ｅｎ２，化合物　１９４－Ｅｎ１，化合物　１９４－Ｅｎ２，化合物　２０３－Ｅｎ１，化合物　２０３－Ｅｎ２．

【０２７０】

Ｎ－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２１１）の合成。

【化７１】



【０２７１】

ステップ１：ＤＭＦ（１５ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（４００ｍｇ、１．３１９ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（７５０ｍｇ、１．９７８ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．１５ｍＬ、６．５９３ｍｍｏｌ）、及び３－アミノ－４，４－ジフルオロピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４４５ｍｇ、１．６４８ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを氷冷水（５０ｍＬ）中に注いで、ＤＣＭ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を、$NaHCO_3$の飽和溶液（５０ｍＬ）、水（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減

圧下で濃縮して、粗化合物を得、これをｎ－ペンタン（３０ｍＬ）で粉砕し、乾燥させて、オフホワイト色の固体として４，４－ジフルオロ－３－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシド）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（５５０ｍｇ、７５．０７％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）δ　ｐｐｍ：８．９９（ｓ，１　Ｈ），８．８６（ｄ，１　Ｈ），７．６４（ｄ，１　Ｈ），７．３８－７．３４（ｍ，５　Ｈ），７．１８（ｂｒｓ，１　Ｈ），７．０７－７．０５（ｍ，１　Ｈ），５．３２（ｄ，２　Ｈ），５．１３－５．１０（ｍ，２　Ｈ），４．５６（ｂｒｓ，１　Ｈ），４．２１（ｓ，３　Ｈ），３．８６（ｄ，１　Ｈ），３．７２（ｓ，１　Ｈ），３．５８－３．３６（ｍ，２　Ｈ），２．４１（ｓ，３　Ｈ），２．３６－２．３２（ｍ，１　Ｈ），２．３２－２．１３（ｍ，１　Ｈ）．

【０２７２】

ステップ２：ＴＦＡ（１５ｍＬ）中の４，４－ジフルオロ－３－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボン酸ベンジル（４５０ｍｇ、０．８１０ｍｍｏｌ）の溶液を６０℃に加熱し、４時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣に、$NaHCO_3$の飽和溶液（５０ｍＬ）を添加した。水層をＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。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、濾過し、減圧下で濃縮した。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中１０ｍＭ　ＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：Ｘ－Ｓｅｌｅｃｔ　ＣＳＨ　Ｃ１８（２５０×１９ｍｍ）５μｍ、流量：１４ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％）：０／１５、２／１５、１０／５０、１３／５０、１３．２０／９８、１７／９８、１７．１０／１５、２０／１５、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２１１）（１９０ｍｇ、５５．６６％）を得た。

【０２７３】

分取キラルＳＦＣを、化合物２１１のラセミ混合物に対して実行して、化合物２１１－Ｅｎ１及び化合物２１１－Ｅｎ２を得た。

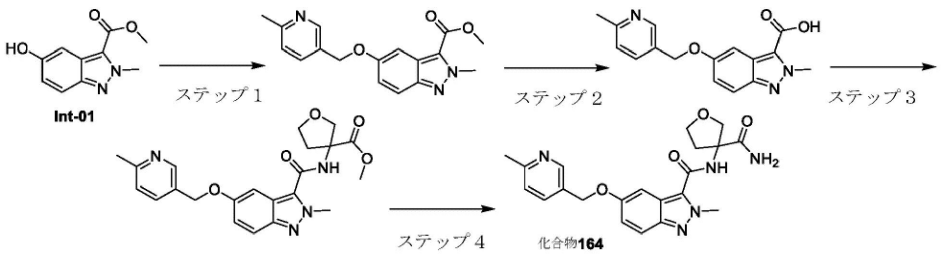
【０２７４】

以下の化合物は、化合物２１１－Ｅｎ１及び化合物２１１－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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２４８－Ｅｎ１、化合物２４８－Ｅｎ２。

【０２７５】

Ｎ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－２－メチル－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１６４）の合成。

【化７２】



【０２７６】

ステップ１：ＭｅＣＮ（１００ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダ

ゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（１．５ｇ、７．２８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、室温でCs_2CO_3（８．０ｇ、２４．７５ｍｍｏｌ）を添加し、続いて（６－メチルピリジン－３－イル）メチルメタンスルホネート（２．９２ｇ、１４．５６３ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを１００℃に加熱し、１００℃で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物をセライト床で濾過し、セライト床をＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。粗製物を、ｐｅｔエーテル中の１５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するＦＣＣ（１００～２００メッシュ）により精製して、褐色の残渣として２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（８００ｍｇ、２ステップで３１％）を得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の５０％酢酸エチル、ＲＦ：０．２。

【０２７７】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ（１：１：０．５、５０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．５ｇ、４．８２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＯＨ（１．９２ｇ、４８．２３ｍｍｏｌ）を室温で添加した。反応混合物を５０℃で４時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮し、１Ｎの　ＨＣｌ水溶液でｐＨ約２に酸性化し、３０分間撹拌した。沈殿した固体を濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（１．０ｇ）を得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル、ＲＦ：０．１。

【０２７８】

ステップ３：ＤＭＦ（２０．０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（８００ｍｇ、２．６９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（１．９ｍＬ、１０．７６ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１．５３ｇ、４．０４ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、続いて、３－アミノテトラヒドロフラン－３－カルボン酸メチル（５８５ｍｇ、４．０４ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭを水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた抽出物をブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、溶出剤としてｐｅｔエーテル中の６５％酢酸エチルを用いたＦＣＣにより精製して、オフホワイト色の固体としてメチル－３－（２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、５６％）を得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル、ＲＦ：０．３４。

【０２７９】

ステップ４：ＭｅＯＨ（５ｍＬ）中のメチル－３－（２－メチル－５－（（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボキシレート（４００ｍｇ、０．９４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＭｅＯＨ（７Ｍ、２０ｍＬ）中のＮＨ３を０℃で添加した。反応混合物を１００℃で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮した。粗製物を、アセトニトリル中の０．１％ギ酸を溶離液として使用するＦＣＣにより精製して、オフホワイト色の固体としてＮ－（３－カルバモイルオキソラン－３－イル）－２－メチル－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１６４）（２００ｍｇ、５１％）を得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル、ＲＦ：０．２。

【０２８０】

分取キラルＳＦＣを、化合物１６４のラセミ混合物に対して実行して、化合物１６４－Ｅｎ１及び化合物１６４－Ｅｎ２を得た。

【０２８１】

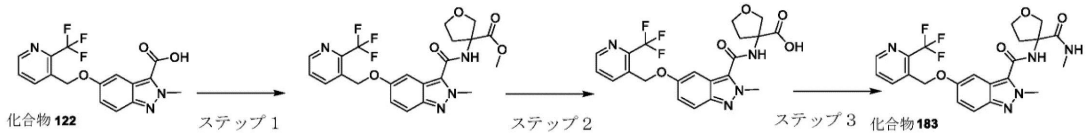
以下の化合物は、化合物１６４－Ｅｎ１及び化合物　１６４－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式で（当業者に既知の適切な試薬（キラル又はラセミ）及び精製方法（キ

ラルＨＰＬＣ又はキラルＳＦＣを含む）の使用）で調製した：化合物　１６５－Ｅｎ１，化合物　１６５－Ｅｎ２，化合物　１６６－Ｅｎ１，化合物　１６６－Ｅｎ２，化合物　１６８－Ｅｎ１，化合物　１６８－Ｅｎ２，化合物　１７０－Ｅｎ１，化合物　１７０－Ｅｎ２，化合物　１７２－Ｅｎ１，化合物　１７２－Ｅｎ２，化合物　１７３－Ｅｎ１，化合物　１７３－Ｅｎ２，化合物　１７４－Ｅｎ１，化合物　１７４－Ｅｎ２，化合物　１７５－Ｅｎ１，化合物　１７５－Ｅｎ２，化合物　１７８－Ｅｎ１，化合物　１７８－Ｅｎ２．

【０２８２】

２－メチル－Ｎ［３－（メチルカルバモイル）オキソラン－３－イル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１８３）の合成。

【化７３】



【０２８３】

ステップ１：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（化合物１２２）（７５０ｍｇ、２．１３６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（１．４８ｍＬ、８．５４ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１．６ｇ、４．２７ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、１５分後、３－アミノテトラヒドロフラン－３－カルボン酸メチル塩酸塩（４６４ｍｇ、３．２０５ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を室温で２時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を、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、オフホワイト色の固体として３－（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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボン酸メチル（８００ｍｇ、７８％）を得た。ＴＬＣ系：１００％酢酸エチル、Ｒｆ：０．７１。

【０２８４】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１、１４ｍＬ）中の３－（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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボン酸メチル（１．０ｇ、２．０９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、Ｈ２Ｏ（７ｍＬ）中のＮａＯＨ（１６７ｍｇ、４．１８４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。反応混合物を室温で２時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、ジエチルエーテル（２×５０ｍＬ）で洗浄した。水層を、１Ｎの　ＨＣｌ水溶液でｐＨ約１に酸性化し、酢酸エチル（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を、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、オフホワイト色の固体として３－（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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボン酸（９００ｍｇ、９２％）を得た。ＴＬＣ系：１００％ＥｔＯＡｃ、Ｒｆ：０．２１。

【０２８５】

ステップ３：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の３－（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）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）テトラヒドロフラン－３－カルボン酸（２３９１－６）（５００ｍｇ、１．０７ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＰＥＡ（０．７５ｍＬ、４．３０ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（８１８ｍｇ、２．１５５ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、１５分間後メタンアミン塩酸塩（１４５ｍｇ、２．１５５ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を室温で２時間撹拌し、反応進行をＴＬ

Ｃによって監視した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（３×８０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（８０ｍＬ）、ブライン（８０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗製物を得た。粗製物をジエチルエーテル（２０ｍＬ）で粉砕し、減圧下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－メチル－Ｎ－［３－（メチルカルバモイル）オキソラン－３－イル］－５－｛［２－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル］メトキシ｝－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１８３）（４００ｍｇ、７７％）を得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の１０％メタノール、Ｒｆ：０．５１。

【０２８６】

分取キラルＳＦＣを、化合物１８３のラセミ混合物に対して実行して、化合物１８３－Ｅｎ１及び化合物１８３－Ｅｎ２を得た。

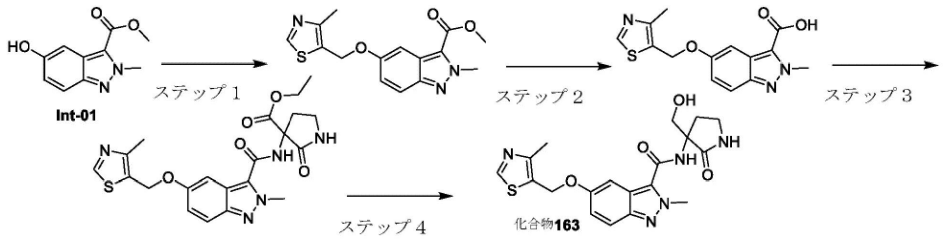
【０２８７】

以下の化合物は、化合物１８３－Ｅｎ１及び化合物１８３－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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１８６－Ｅｎ１、化合物１８６－Ｅｎ２

【０２８８】

Ｎ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１６３）の合成。

【化７４】



【０２８９】

ステップ１：ＭｅＣＮ（１５ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（８００ｍｇ、３．８８３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、室温でCs_2CO_3（５．０ｇ、１５．５３２ｍｍｏｌ）を添加し、続いて（４－メチルチアゾール－５－イル）メチルメタンスルホネート（４）（１．１ｇ、５．８２５ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で１６時間、８０℃で２時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（３０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。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、褐色のガムとして２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４００ｍｇ、粗製物）を得た。更に精製することなく次のステップに進んだ。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、Ｒｆ：０．４。

【０２９０】

ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ（１：１、３２ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４００ｍｇ、１．２０８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水（８ｍＬ）中のＮａＯＨ（１９３．４ｍｇ、４．８３４ｍｍｏｌ）の溶液を室温で添加した。反応混合物を６０℃で３時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮し、１Ｎの　ＨＣｌ水溶液でｐＨ約２に酸性化し、沈殿した固体を濾過し、水（１０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の半固体として２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（３００ｍｇ、粗製物）を得た。ＴＬＣ系：ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、ＲＦ：０．１。

【０２９１】
ステップ３：ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（３００ｍｇ、０．９４３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（５３７．７ｍｇ、１．４１５ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（０．５ｍＬ、２．８２９ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、続いて、３－アミノ－２－オキソピロリジン－３－カルボン酸エチル（２２０．８ｍｇ、１．４１５ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を室温で２時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（２×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた抽出物を水（２×２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗製物を得た。粗製物を、シリカゲル（１００～２００メッシュサイズ）及び溶離液としてｐｅｔエーテル中の１５％酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーにより精製して、オフホワイト色の固体として３－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）－２－オキソピロリジン－３－カルボン酸エチル（２００ｍｇ、粗製物）を得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の５％メタノール、ＲＦ：０．４。

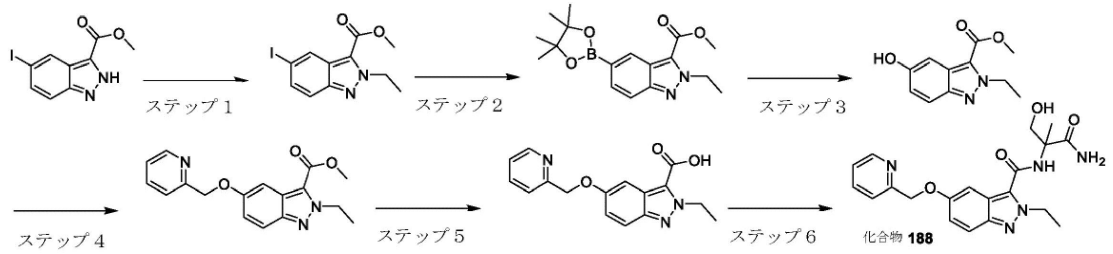
【０２９２】
ステップ４：メタノール（１０ｍＬ）中の３－（２－メチル－５－（（４－メチルチアゾール－５－イル）メトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）－２－オキソピロリジン－３－カルボン酸エチル（２００ｍｇ、０．４３６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＢＨ４（１３９．４ｍｇ、３．４９３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。反応混合物を室温で１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮し、水（１０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（２×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、真空下で濃縮して、粗製物を得た。粗製物を、アセトニトリル中の０．１％ギ酸を溶離液として使用するＧｒａｃｅフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、オフホワイト色の固体として（６０ｍｇ、４ステップで４％）のＮ－［３－（ヒドロキシメチル）－２－オキソピロリジン－３－イル］－２－メチル－５－［（４－メチル－１，３－チアゾール－５－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物１６３）を得た。ＴＬＣ系：ジクロロメタン中の５％メタノール、ＲＦ：０．４。

【０２９３】
分取キラルＳＦＣを、化合物１６３のラセミ混合物に対して実行して、化合物１６３－Ｅｎ１及び化合物１６３－Ｅｎ２を得た。

【０２９４】
以下の化合物は、化合物１６３－Ｅｎ１及び化合物　１６３－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式で（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　１５９－Ｅｎ１，化合物　１５９－Ｅｎ２，化合物　１６１－Ｅｎ１，化合物　１６１－Ｅｎ２，化合物　１７１－Ｅｎ１，化合物　１７１－Ｅｎ２，化合物　１７５－Ｅｎ１，化合物　１７５－Ｅｎ２，化合物　１７６－Ｅｎ１，化合物　１７６－Ｅｎ２，化合物　１７７－Ｅｎ１，化合物　１７７－Ｅｎ２，化合物　１８０－Ｅｎ１，化合物　１８０－Ｅｎ２，化合物　２５３－Ｅｎ１，化合物　２５３－Ｅｎ２．

【０２９５】
２－（｛２－エチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物１８８）の合成。

【化７５】



【０２９６】

ステップ１：ＥｔＯＡｃ（１５０ｍＬ）中の（５－ヨード－１Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（５．０ｇ、１６．５５ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、トリエチルオキソニウムテトラフルオロボラート（７．６ｇ、４１．３９ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（１５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×１５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、ｐｅｔエーテル中の１０％酢酸エチルを溶離液として使用するシリカゲル（１００～２００メッシュ）クロマトグラフィーにより精製して、オフホワイト色の固体として２－エチル－５－ヨード－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（２．０ｇ、３６％）を得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、ＲＦ：０．７。

【０２９７】

ステップ２：１，４－ジオキサン（３０ｍＬ）中の２－エチル－５－ヨード－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．５ｇ、４．５４ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、室温でビス－ピナコラートジボラン（１．３ｇ、４．９９ｍｍｏｌ）を添加し、続いて酢酸カリウム（１．３４ｇ、１３．６３ｍｍｏｌ）を添加し、アルゴンで１０分間脱気し、ｐｄ（ｄｐｐｆ）ｃｌ２．ＣＨ２Ｃｌ２を室温で添加した。反応混合物を１１０℃に加熱し、１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物をセライトパッドで濾過し、セライト床をＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で洗浄した。合わせた濾液を減圧下で濃縮して、褐色固体として２－エチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸エチル（３．１ｇ）を得た。精製することなく次のステップに進んだ。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の２０％酢酸エチル、Ｒｆ：０．３。

【０２９８】

ステップ３：アセトン（８０ｍＬ）中の２－エチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４．０ｇ、１２．１２１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水（８０ｍＬ）中のオキソン（７．４ｇ、１２．１２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。ＲＭをＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）で希釈し、水層をＥｔＯＡｃ（２×２００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、ｐｅｔエーテル中の２５％ＥｔＯＡｃを溶離液として用いたシリカゲル（１００～２００）を使用するカラムクロマトグラフィーにより精製して、淡黄色の固体として２－エチル－５－ヒドロキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１．０ｇ、２ステップで５０％）を得た。ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、Ｒｆ：０．３。

【０２９９】

ステップ４：ＭｅＣＮ（５０ｍＬ）中の２－エチル－５－ヒドロキシ－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４００ｍｇ、１．８１８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、室温でCs_2CO_3（１．７ｇ、５．４５ｍｍｏｌ）を添加し、続いてピリジン－２－イルメチルメタンスルホネート（６１０ｍｇ、５．４５ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を８０℃に１６時間加熱した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物をセライト床を

通して濾過し、セライト床を酢酸エチル（２×３０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。粗製物を、ｐｅｔ－エーテル中の１５％酢酸エチルを溶離液として使用するシリカゲル（１００～２００メッシュ）でのカラムクロマトグラフィーにより精製して、褐色の残渣として２－エチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１５０ｍｇ、２６％）を得た、ＴＬＣ系：Ｐｅｔエーテル中の４０％酢酸エチル、ＲＦ：０．２。

【０３００】

ステップ５：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ：Ｈ２Ｏ（１：１：０．５、２０ｍＬ）中の２－エチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（１５０ｍｇ、０．４８２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＯＨ（１９２ｍｇ、４．８２３ｍｍｏｌ）を室温で添加した。反応混合物を室温で１６時間撹拌し、反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を濃縮し、１Ｎ　ＨＣｌでｐＨ約２に酸性化し、３０分間撹拌した。沈殿した固体を濾過し、水（５ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－エチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（１００ｍｇ）を得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ、ＲＦ：０．１。

【０３０１】

ステップ６：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の２－エチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（１００ｍｇ、０．３３６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＡＴＵ（１９１ｍｇ、０．５０５ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（０．３ｍＬ、１．３４ｍｍｏｌ）を０℃で添加し、続いて、２－アミノ－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（３９７ｍｇ、３．３６ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を、室温で１６時間撹拌した。反応進行をＴＬＣによって監視した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（２×５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物を、水中０．０１％ギ酸及びＭｅＣＮを溶離液として使用する逆相カラムクロマトグラフィーにより精製して、オフホワイト色の固体として２－（｛２－エチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）－３－ヒドロキシ－２－メチルプロパンアミド（化合物１８８）（７０ｍｇ、５２％）を得た。ＴＬＣ系：ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ、ＲＦ：０．２。

【０３０２】

分取キラルＳＦＣを、化合物１８８のラセミ混合物に対して実行して、化合物１８８－Ｅｎ１及び化合物１８８－Ｅｎ２を得た。

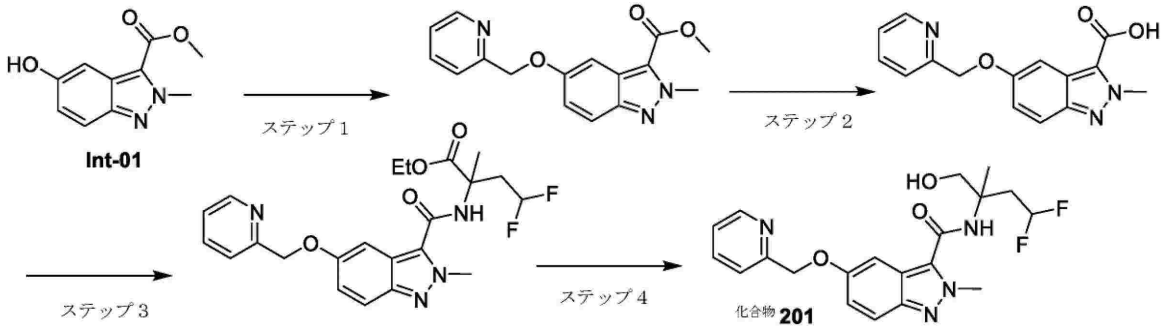
【０３０３】

以下の化合物は、化合物１８８－Ｅｎ１及び化合物１８８－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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１９５－Ｅｎ１、化合物１９５－Ｅｎ２。

【０３０４】

Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２０１）の合成。

【化７６】



【０３０５】

ステップ１：ＴＨＦ（７５ｍＬ）中の５－ヒドロキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（Ｉｎｔ－０１）（３ｇ、１４．５４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＡＤＤＰ（７．３４ｇ、２９．０９ｍｍｏｌ）、トリブチルホスフィン（５．８ｇ、２９．０９ｍｍｏｌ）、次いでＸＸＸイリジン－２－イルメタノール（１．６０ｇ、１４．６９ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを水（１００ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の１０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（３．１０ｇ、７１．６７％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：８．６２（ｄ，１　Ｈ），７．７４（ｄｔ，１　Ｈ），７．６８（ｄ，１　Ｈ），７．６０（ｄ，１　Ｈ），７．３４（ｄ，１　Ｈ），７．２５－７．２３（ｍ，１　Ｈ），７．１７（ｄｄ，１　Ｈ），５．２９（ｓ，２　Ｈ），４．４６（ｓ，３　Ｈ），４．００（ｓ，３　Ｈ）．ステップ２：ＭｅＯＨ：ＴＨＦ：H_2O（２：２：１、７５ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸メチル（４ｇ、１３．４５ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＯＨ（５．３２ｇ、１３４．５ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。完了後、ＲＭを濃縮し、水（５０ｍＬ）で希釈し、ＡｃＯＨで酸性化し（ｐＨ約６）、３０分間撹拌した。沈殿した固体を濾過し、水（５０ｍＬ）で洗浄し、真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体（３．０ｇ）として粗化合物を得、これをｎ－ペンタン（３０ｍＬ）で粉砕し、乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（２．６５０ｇ　収率：６９％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：８．５９（ｄ，１　Ｈ），７．８４（ｄｔ，１　Ｈ），７．６７（ｄ，１　Ｈ），７．５５（ｄ，１　Ｈ），７．３６－７．３３（ｍ，２　Ｈ），７．１２（ｄｄ，１　Ｈ），５．２１（ｓ，２　Ｈ），４．３６（ｓ，３　Ｈ）．

【０３０６】

ステップ３：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（６００ｍｇ、２．１１ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（１．２０８ｇ、３．１７ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（１．１７４ｍｇ、６．３５ｍｍｏｌ）、及び２－アミノ－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン酸エチル（５７５ｍｇ、３．１７ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１時間撹拌した。ＲＭを水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（４０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色ガムとして４，４－ジフルオロ－２－メチル－２－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ブタン酸エチル（７００ｍｇ、７４．０３％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＣＤ

Ｃｌ$_3$）δ　ｐｐｍ：８．６０－８．６１（ｍ，１Ｈ），７．６９－７．７５（ｍ，２Ｈ），７．５５（ｄ，１Ｈ），７．２２－７．２７（ｍ，２Ｈ），７．１５－７．１８（ｍ，２Ｈ），６．００－６．０２（ｍ，１Ｈ），５．２９（ｓ，２Ｈ），４．４０（ｓ，３Ｈ），４．３１－４．３７（ｍ，２Ｈ），３．１３－３．２３（ｍ，１Ｈ），２．６２－２．６８（ｍ，１Ｈ），１．７９（ｓ，３Ｈ），１．３９（ｔ，３　Ｈ）．

【０３０７】

ステップ４：ＥｔＯＨ（１５ｍＬ）中の４，４－ジフルオロ－２－メチル－２－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ブタン酸エチル（８７０ｍｇ、１．９４ｍｍｏｌ）の溶液に水素化ホウ素ナトリウム（２２１ｍｇ、５．８４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。次いで、ＲＭを室温で７時間撹拌した。ＲＭを水でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ｐｅｔエーテル中の３０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製した。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中０．１％ギ酸、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：Ｓｕｎｆｉｒｅ　Ｃ１８（１９×２５０ｍｍ）５μｍ、流量：１７ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％）：０／２０、２／２０、８／６０、１１／６０、１１．０１／１００、１５／１００、１５．１／２０、１８／２０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、Ｎ－（４，４－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２０１）（３５０ｍｇ、４４．４１％）を得た。

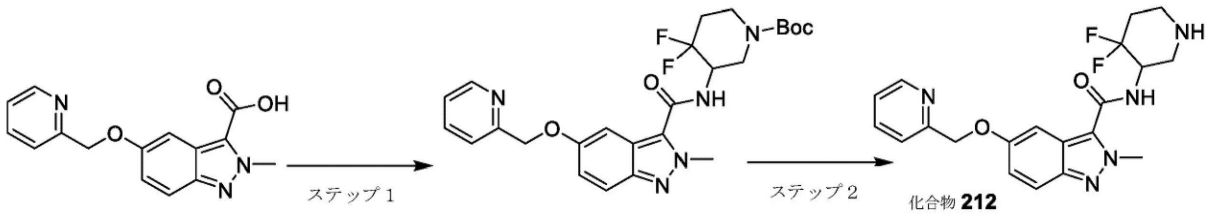
【０３０８】

分取キラルＳＦＣを、化合物２０１のラセミ混合物に対して実行して、化合物２０１－Ｅｎ１及び化合物２０１－Ｅｎ２を得た。

【０３０９】

Ｎ－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２１２）の合成。

【化７７】



【０３１０】

ステップ１：ＤＭＦ（８ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（２２５ｍｇ、０．７９４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＤＭＦ（２ｍＬ）中のＨＡＴＵ（４５０ｍｇ、１．１９１ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（０．４ｍＬ、２．３８３ｍｍｏｌ）、及び３－アミノ－４，４－ジフルオロピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３００ｍｇ、１．１９１ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で４時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（２５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を飽和重炭酸ナトリウム溶液（５０ｍＬ）、ブライン（５０ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、オフホワイト色の固体として４，４－ジフルオロ－３－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３５０ｍｇ、８７％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ$_6$）δ　ｐｐｍ：８．７４（ｄ，１　Ｈ），８．５９－８．５７（ｍ，１Ｈ），７．８７－７．８２（ｍ，１　Ｈ），７．６５（ｄ，１　Ｈ），７．５７（ｄ，１

Ｈ），７．３７－７．３４（ｍ，１　Ｈ），７．１４－７．１２（ｍ，２　Ｈ），５．１９（ｓ，２　Ｈ），４．５０－４．３７（ｍ，１　Ｈ），４．２４（ｓ，３　Ｈ），４．００－３．７０（ｍ，２　Ｈ），３．２－３．１４（ｍ，１　Ｈ），２．８９（ｍ，１　Ｈ），２．３２－１．９８（ｍ，２　Ｈ），１．４１（ｓ，９　Ｈ）．

【０３１１】

ステップ２：ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の４，４－ジフルオロ－３－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）ピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４００ｍｇ、０．７９８ｍｍｏｌ）の溶液に、ジオキサン（２ｍＬ）中の４Ｎ　ＨＣｌを０℃で添加した。ＲＭを室温で３時間撹拌した。完了後、反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた固体をｎ－ペンタン（２０ｍＬ）で粉砕して、オフホワイト色の固体として粗化合物（ＨＣｌ塩）を得て、これを水（２５ｍＬ）中に溶解させ、飽和重炭酸ナトリウム溶液（ｐＨ約１０）で塩基性化し、ＥｔＯＡｃ（２×２５ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を、水（３０ｍＬ）、ブライン（３０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮して、Ｎ－（４，４－ジフルオロピペリジン－３－イル）－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２１２）（３００ｍｇ、９３％）を得た。

【０３１２】

分取キラルＳＦＣを、化合物２１２のラセミ混合物に対して実行して、化合物２１２－Ｅｎ１及び化合物２１２－Ｅｎ２を得た。

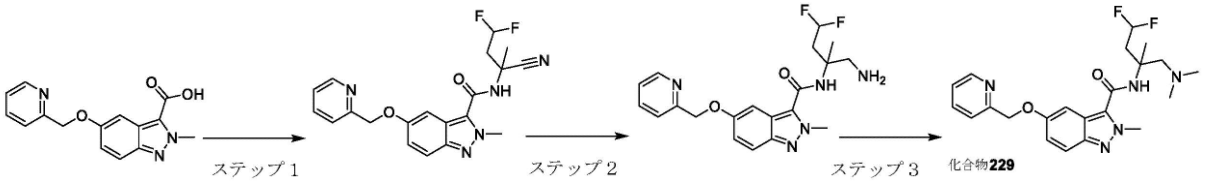
【０３１３】

以下の化合物は、化合物２１２－Ｅｎ１及び化合物２１２－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式（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　２１３－Ｅｎ１，化合物　２１３－Ｅｎ２，化合物　２１４－Ｅｎ１，化合物　２１４－Ｅｎ２，化合物　２１５－Ｅｎ１，化合物　２１５－Ｅｎ２，化合物　２１６－Ｅｎ１，化合物　２１６－Ｅｎ２．

【０３１４】

Ｎ－［１－（ジメチルアミノ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２２９）の合成。

【化７８】



ステップ１：ＡＣＮ（１０ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（５００ｍｇ、１．７６７ｍｍｏｌ）の溶液に、三塩化リン（０．５ｍＬ）及びアミノ－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタンニトリル（６００ｍｇ、３．５３４ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを密封管中で１００℃で１６時間撹拌した。室温まで冷却した後、ＲＭを飽和$NaHCO_3$（２０ｍＬ）で塩基性化し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を重炭酸ナトリウム溶液（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔ．エーテル中の７０％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色のガム状物としてＮ－（２－シアノ－４，４－ジフルオロブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミドを得た（２５０ｍｇ、収率８７．４５％）。^1H　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：８．６０－８．５８（ｍ，１Ｈ），７．７５－７．７０（ｍ，２　Ｈ），７．５５（ｄ，１　Ｈ），７．２７－７．２４（ｍ，１　Ｈ），７．１６－７．１３（ｍ，１　Ｈ），６．９０（ｄ，１　Ｈ），６．

３５－６．０５（ｍ，２　Ｈ），５．２８（ｓ，２　Ｈ），４．４２（ｓ，３　Ｈ），２．８０－２．７１（ｍ，２　Ｈ），１．７８（ｓ，３　Ｈ）．
ステップ２：ＭｅＯＨ（２５ｍＬ）中のＮ－（２－シアノ－４，４－ジフルオロブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（２５０ｍｇ、０．６２６ｍｍｏｌ）の溶液に、水素化ホウ素ナトリウム（１６２．１１７ｍｇ、４．３８２ｍｍｏｌ）及び塩化ニッケル六水和物（４８．６３５ｍｇ、０．３７６ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で２時間撹拌した。完了後、ＭｅＯＨを減圧下で除去した。残渣を氷冷水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて、淡褐色の固体としてＮ－（１－アミノ－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（２６０ｍｇ）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ　ｐｐｍ：８．５９（ｄ，１　Ｈ），７．７２－７．６７（ｍ，２　Ｈ），７．５２（ｄ，１　Ｈ），７．１４（ｓ，１　Ｈ），７．２６－７．２０（ｍ，２　Ｈ），７．１５（ｄ，１　Ｈ），６．１２－５．８３（ｍ，１　Ｈ），５．２９（ｓ，２　Ｈ），４．４３（ｔ，３　Ｈ），４．１３－４．０９（ｍ，１　Ｈ），３．０４－２．７６（ｍ，１　Ｈ），２．７３－２．６３（ｍ，１　Ｈ），２．６２－２．５６（ｍ，１　Ｈ），２．５３－２．３２（ｍ，１　Ｈ），２．２８（ｓ，２　Ｈ），１．２７（ｓ，３　Ｈ）．
ステップ３：ＴＨＦ／ＭｅＯＨ（１：１）（６．０ｍＬ）中のＮ－（１－アミノ－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（２６０ｍｇ、０．６４５ｍｍｏｌ）の溶液に、パラホルムアルデヒド（１９３ｍｇ、６．４５２ｍｍｏｌ）、ＡｃＯＨ（０．０７４ｍＬ、１．２９０ｍｍｏｌ）、及びシアノ水素化ホウ素ナトリウム（１００ｍｇ、１．６１３ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、揮発物を減圧下で除去した。残渣を氷冷水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相を重炭酸ナトリウム溶液（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中１０ｍＭ　ＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＬＵＮＡ　Ｃ１８（２５０×２１．２）ｍｍ、５μｍ、流量：１８ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％　０／３０、２／３０、１０／６０、１７／６０、１７．２０／９８、２３／９８、２３．２０／３０、２６／３０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、Ｎ－［１－（ジメチルアミノ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－イル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２２９）（７０ｍｇ）を得た。

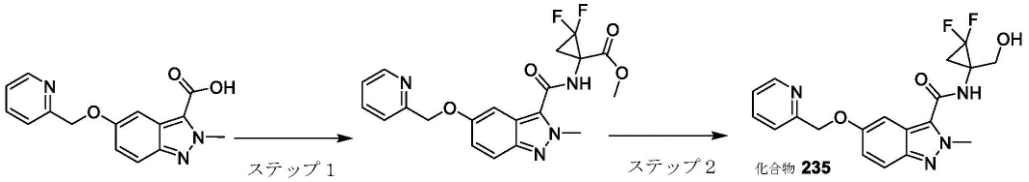
【０３１５】

分取キラルＳＦＣを、化合物２２９のラセミ混合物に対して実行して、化合物２２９－Ｅｎ１及び化合物２２９－Ｅｎ２を得た。

【０３１６】

Ｎ－［２，２－ジフルオロ－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２３５）の合成。

【化７９】



ステップ１：ＤＭＦ（５．０ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（５００ｍｇ、１．７６５ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（１．３４２ｇ、３．５３０ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（２．１５４ｍＬ、１２．３５５ｍｍｏｌ）を室温で添加し、１０分間撹拌した。１０分後、１－アミノ－２，２－ジフルオロシクロプロパン－１－カルボン酸メチル臭化水素酸塩（Ｉｎｔ－０８）（６９６．１８ｍｇ、３．０００ｍｍｏｌ）を添加した。ＲＭを室温で２４時間撹拌した。完了後、ＲＭを氷冷水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×３０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を飽和$NaHCO_3$（２０ｍＬ）、ブライン（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣を、ＤＣＭ中の３％ＭｅＯＨを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、淡黄色の固体として２，２－ジフルオロ－１－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）シクロプロパン－１－カルボン酸メチル（３００ｍｇ、４０．８２％）を得た。

ステップ２：エタノール（５．０ｍＬ）中の２，２－ジフルオロ－１－（２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド）シクロプロパン－１－カルボン酸メチル（３００ｍｇ、０．７２０ｍｍｏｌ）の溶液に、$NaBH_4$（８１．７０ｍｇ、２．１６１ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮し、得られた残渣を水（３０ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ（２×３０ｍＬ）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。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中１０ｍＭ　ＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＹＭＣ　ＴＲＩＡＲＴ　Ｃ１８（１５０×２５ｍｍ）、１０μｍ、流量：２０ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％）：０／２０、２／２０、１０／４０、１４．６０／４０、１４．６１／９８、１８／９８、１８．１０／２０、２１／２０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、Ｎ－［２，２－ジフルオロ－１－（ヒドロキシメチル）シクロプロピル］－２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２３５）（１４０ｍｇ、５０．０３％）を得た。

【０３１７】

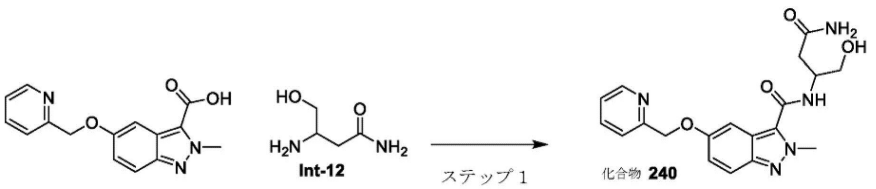
分取キラルＳＦＣを、化合物２３５のラセミ混合物に対して実行して、化合物２３５－Ｅｎ１及び化合物２３５－Ｅｎ２を得た。

以下の化合物は、化合物２３５－Ｅｎ１及び化合物　２３５－Ｅｎ２について記載したものと同様の様式で（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　２３７－Ｅｎ１，化合物　２３７－Ｅｎ２，化合物　２３９－Ｅｎ１，化合物　２３９－Ｅｎ２，化合物　２４１－Ｅｎ１，化合物　２４１－Ｅｎ２，化合物　２４２，化合物　２４３－Ｅｎ１，化合物　２４３－Ｅｎ２，化合物　２５１－Ｅｎ１，化合物　２５１－Ｅｎ２，化合物　２５２－Ｅｎ１，化合物　２５２－Ｅｎ２

【０３１８】

４－ヒドロキシ－３－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド（化合物２４０）の合成。

【化８０】



ステップ１：ＤＭＦ（１４ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（０．３５ｇ、１．２３ｍｍｏｌ）及び３－アミ

ノ－４－ヒドロキシブタンアミドトリフルオロ酢酸（Ｉｎｔ－１２）（０．６５７ｇ、５．５６ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（０．９４ｇ、２．４７ｍｍｏｌ）及びＤＩＰＥＡ（１．１ｍＬ、６．１７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭ混合物を窒素雰囲気下、室温で１６時間撹拌した。完了後、、ＲＭを冷水（５０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を飽和重炭酸ナトリウム溶液（２０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、２－メチル－Ｎ－（５－オキソテトラヒドロフラン－３－イル）－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミドを得た。アンモニア水溶液２５％（１５ｍＬ）中の２－メチル－Ｎ－（５－オキソテトラヒドロフラン－３－イル）－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（７００ｍｇ、１．９１ｍｍｏｌ）を室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中１０ｍＭ　ＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＹＭＣ　Ｔｒｉａｎｔ　Ｃ１８（２５×１５０）：５μｍ、流量：２０ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％）：０／３０、２／３０、８／４５、１７／４５、１７．１０．／９８、１８／９８、１８．１０／３０、２１／３０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、４－ヒドロキシ－３－（｛２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－２Ｈ－インダゾール－３－イル｝ホルムアミド）ブタンアミド（化合物２４０）（１２０ｍｇ、１６％）を得た。

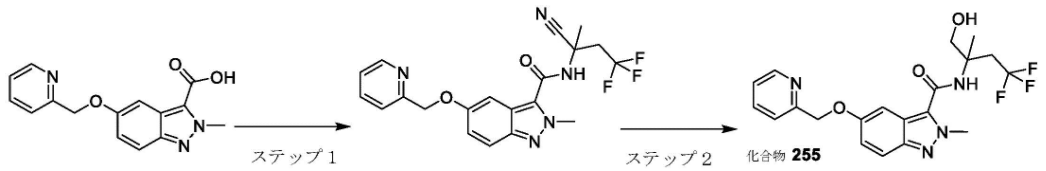
【０３１９】

分取キラルＳＦＣを、化合物２４０のラセミ混合物に対して実行して、化合物２４０－Ｅｎ１及び化合物２４０－Ｅｎ２を得た。

【０３２０】

２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－イル）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２５５）の合成。

【化８１】



ステップ１：ＡＣＮ（２５ｍＬ）中の２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボン酸（２００ｍｇ、０．７０６ｍｍｏｌ）の溶液に、２－アミノ－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタンニトリル塩酸塩（Ｉｎｔ－１７）（２６５．４ｍｇ、１．４１２ｍｍｏｌ）及び三塩化リン（０．２ｍＬ）を室温で添加した。ＲＭを密封管中で１００℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを氷冷水（１５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２５ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相を飽和重炭酸ナトリウム溶液（２５ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の２５％ＥｔＯＡｃを溶離液として使用するシリカゲルでのＦＣＣにより精製して、Ｎ－（２－シアノ－４，４，４－トリフルオロブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（１００ｍｇ、３３．９３％）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ　ｐｐｍ：８．５９（ｄ，１　Ｈ），７．７１－７．７５（ｍ，２Ｈ），７．５３（ｄ，１　Ｈ），７．２７（ｔ，１　Ｈ），７．１６（ｄｄ，１　Ｈ），６．８８（ｄ，１　Ｈ），６．１２（ｓ，１Ｈ），５．３１（ｓ，２　Ｈ），４．４３（ｓ，３　Ｈ），３．２６－３．３３（ｍ，１　Ｈ），３．０４－３．１０（ｍ，１　Ｈ），２．０３（ｓ，３　Ｈ）．

ステップ２：トルエン（２０ｍＬ）、水（２０ｍＬ）中のＮ－（２－シアノ－４，４，４－トリフルオロブタン－２－イル）－２－メチル－５－（ピリジン－２－イルメトキシ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（３００ｍｇ、０．７１９ｍｍｏｌ）の溶

液にパラホルムアルデヒド（２１５．９１７ｍｇ、７．１９４ｍｍｏｌ）及び［Ｒｕ（ｐ－シメン）Ｃｌ$_2$］$_2$（４４．０５ｍｇ、０．０７２ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを９０℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを室温に冷却し、セライト床で濾過し、ＥｔＯＡｃ（１５ｍＬ）で洗浄し、ＥｔＯＡｃ（２×２５ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブライン溶液（２５ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。化合物を、分取　ＨＰＬＣによって精製した。［分取　ＨＰＬＣ条件：移動相：水中１０ｍＭ　ＡＢＣ、移動相Ｂ：ＡＣＮ、カラム：ＹＭＣ　ＴＲＩＡＲＴ　Ｃ１８（１５０×２５ｍｍ）、１０μｍ、流量：２０ｍｌ／分、方法：（Ｔ（分）／Ｂの％）：０／６０、２／６０、１０／６０、１３／６０、１３．２／１００．１８／１００、１８．１０／４０、２２／４０、溶解度：ＡＣＮ＋水＋ＴＨＦ、温度：室温］。所望の画分を蒸発させ、凍結乾燥させて、２－メチル－５－［（ピリジン－２－イル）メトキシ］－Ｎ－（４，４，４－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－メチルブタン－２－ｙｌ）－２Ｈ－インダゾール－３－カルボキサミド（化合物２５５）（１５０ｍｇ、４９．３６％）を得た。

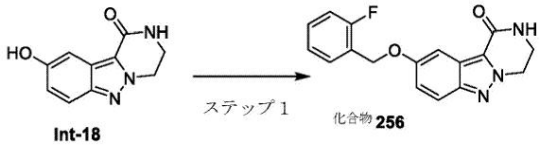
【０３２１】

分取キラルＳＦＣを、化合物２５５のラセミ混合物に対して実行して、化合物２５５－Ｅｎ１及び化合物２５５－Ｅｎ２を得た。

【０３２２】

９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２５６）の合成。

【化８２】



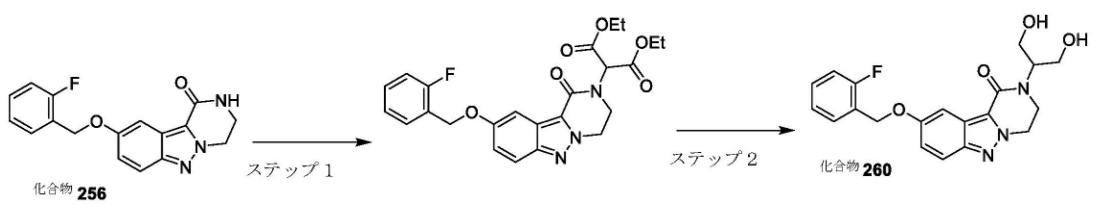
ステップ１：ＤＭＦ（１０．０ｍＬ）中の９－ヒドロキシ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１（２Ｈ）－オン（Ｉｎｔ－１８）（１５０ｍｇ、０．７３８ｍｍｏｌ）の溶液に、１－（ブロモメチル）－２－フルオロベンゼン（１５３．４９ｍｇ、０．８１２ｍｍｏｌ）及び炭酸カリウム（３０６．０７５ｍｇ、２．２１５ｍｍｏｌ）を室温で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（１０ｍＬ）でクエンチし、ＤＣＭ中の１０％ＭｅＯＨ（３×１０ｍＬ）で抽出し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の７０～８０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲルでのＦＣＣによって精製し、９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２５６）（１１５ｍｇ、５０％）を得た。

化合物２５７は、化合物２５６について記載したものと同様の様式（当業者に公知の適切な試薬及び精製方法の使用）で調製した。

【０３２３】

２－（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）－９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２６０）の合成。

【化８３】



ステップ１：ＤＭＦ（５．０ｍＬ）中の９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１

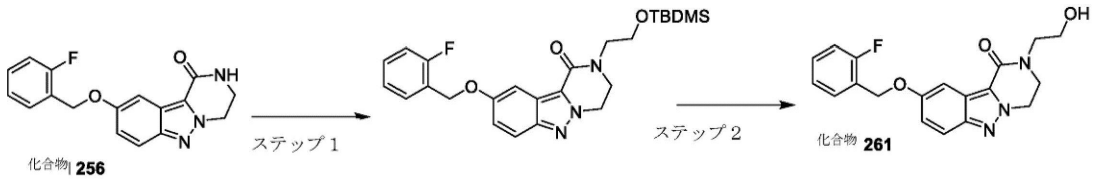
Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２５６）（２００ｍｇ、０．６４２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＨ（４６．２５ｍｇ、１．９２７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１５分間撹拌した。次いで、ＤＭＦ（２ｍＬ）中の２－ブロモマロン酸ジエチル（２３０．３７５ｍｇ、０．９６４ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを６０℃で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（１０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×１０ｍＬ）で抽出し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を、ｐｅｔエーテル中の７０～８０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲルでのＦＣＣによって精製し、固体として２－（９－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－１－オキソ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－２（１Ｈ）－イル）マロン酸ジエチル（１５０ｍｇ、９６％）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－D_6）δ ｐｐｍ：７．６７（ｄ，１ Ｈ），７．５２－７．５７（ｍ，２ Ｈ），７．３０－７．３４（ｍ，１ Ｈ），７．０８－７．１９（ｍ，３ Ｈ），６．２２（ｓ，１ Ｈ），５．１９（ｓ，２ Ｈ），４．６９－４．７２（ｍ，２ Ｈ），４．２８－４．３５（ｍ，４ Ｈ），４．１２－４．１５（ｍ，２ Ｈ），１．３４（ｔ，６ Ｈ）．

ステップ２：エタノール（２０．０ｍＬ）中の２－（９－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－１－オキソ－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－２（１Ｈ）－イル）マロン酸ジエチル（１５０ｍｇ、０．３２０ｍｍｏｌ）の溶液に、$NaBH_4$（７５．５２ｍｇ、１．９１７ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを室温で２０時間撹拌した。完了後、ＲＭを冷水（３ｍＬ）でクエンチし、減圧下で濃縮した。残渣を、石油エーテル中の７０～８０％ＥｔＯＡｃの勾配を使用するシリカゲルでのＦＣＣによって精製し、オフホワイト色の固体として２－（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）－９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２６０）（８３ｍｇ、５５％）を得た。

【０３２４】

９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－（２－ヒドロキシエチル）－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２６１）の合成。

【化８４】



ステップ１：ＤＭＦ（６ｍＬ）中の９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２５６）（１００ｍｇ、０．３２１ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＮａＨ（鉱油中６０％分散液、１５．４ｍｇ、０．６４２ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを０℃で１５分間撹拌した。次いで、ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（２－ブロモエトキシ）（ｔｅｒｔ－ブチル）ジメチルシラン（１１５．２ｍｇ、０．４８２ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で添加した。ＲＭを７０℃で１６時間加熱した。完了後、ＲＭを氷冷水（１０ｍＬ）でクエンチし、得られた固体を濾過し、冷水（１０ｍＬ）、ｎ－ペンタン（１０ｍＬ）で洗浄し、高真空下で乾燥させて、オフホワイト色の固体として２－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）－９－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１（２Ｈ）－オン（９０ｍｇ、６０％）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ ｐｐｍ：７．６７（ｄ，１ Ｈ），７．５６－－７．５４（ｍ，２ Ｈ），７．３３－７．３１（ｍ，１ Ｈ），７．２０－７．１７（ｍ，１ Ｈ），７．１６－７．０７（ｍ，２ Ｈ），５．１９（ｓ，２ Ｈ），４．６２（ｄ，２ Ｈ），４．０５－４．０１（ｍ，２ Ｈ），３．９１（ｔ，２ Ｈ），３．７５（ｔ，２

Ｈ），０．８８（ｓ，９　Ｈ），０．０７（ｓ，６　Ｈ）．
ステップ２：ＴＨＦ（３ｍＬ）中のフッ化水素－ピリジン（６５～７０％、０．２９８ｍＬ、１．７０３ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ピリジン（０．３８６ｍＬ、１．７０３ｍｍｏｌ）を０℃で添加した。ＲＭを１０分間撹拌した。次いで、ＴＨＦ（１ｍＬ）中の２－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）－９－（（２－フルオロベンジル）オキシ）－３，４－ジヒドロピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１（２Ｈ）－オン（８０ｍｇ、０．１７０ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で添加した。ＲＭを室温で１６時間撹拌した。完了後、ＲＭを減圧下で濃縮した。残渣を水（１ｍＬ）で希釈し、飽和ＮａＨＣＯ$_3$溶液（ｐＨ約７）で中和した。固体を濾過し、冷水（１０ｍＬ）、続いて、ｎ－ペンタンで洗浄し、次いで、高真空下で乾燥させた。化合物を、分取　ＨＰＬＣ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、オフホワイト色の固体として９－［（２－フルオロフェニル）メトキシ］－２－（２－ヒドロキシエチル）－１Ｈ，２Ｈ，３Ｈ，４Ｈ－ピラジノ［１，２－ｂ］インダゾール－１－オン（化合物２６１）（３０ｍｇ、４９％）を得た。

【表５－１】

分析データ

化合物コード	[M+H]+ (m/z):	^{1}H NMR (δppm)
化合物001	417.2	(400MHz,DMSO)δ = 1.61-1.68(m,2H),2.25(d,J=14.4 Hz,2H),2.41(s,3H),3.64-3.76(m,6H),4.22(s,3H),4.95(s,1H),5.30(s,2H),7.04(dd,J=2.4.-9.6 Hz,1H),7.26(d,J=2.0 Hz,1H),7.61(d,J=9.2,1H),7.87(s,1H),9.00(s,1H).
化合物002-En1	387.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ = 2.91-3.06(m,3H),3.23-3.32(m,2H),4.24(s,3H),4.58-4.68(m,1H),5.10-5.16(m,2H),7.08(dd,J = 2.4 Hz,J=2.4 Hz,1H),7.15-7.16(m,1H),7.33-7.36(m,1H),7.38-7.42(m,2H),7.46-7.49(m,2H),7.63(d,J = 9.2 Hz,1H),8.62(d,J = 8.4 Hz,1H).
化合物002-En2	387.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ =2.91-3.06(m,3H),3.27-3.32(m,2H),4.24(s,3H),4.60-4.68(m,1H),5.10-5.16(m,2H),7.09-7.10(m,1H),7.15-7.16(m,1H),7.33-7.36(m,1H),7.38-7.39(m,2H),7.46-7.49(m,2H),7.63(d,J = 9.2 Hz,1H),8.63(d,J = 8.8 Hz,1H).
化合物003-En1	470.1	:(400 MHz,DMSO-d6)δ = 1.73-1.80(m,2H),2.49-2.50(m,1H),2.62-2.67(m,1H),2.80-2.94(m,2H),3.08-3.15(m,1H),4.23(s,3H),4.46-4.53(m,1H),5.27-5.35(m,2H),7.10-7.15(m,2H),7.66(d,J = 9.2 Hz,1H),7.77-7.80(m,1H),8.27(d,J = 8 Hz,1H),8.73-8.75(m,2H).
化合物003-En2	470.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ = 1.73-1.83(m,2H),2.49-2.51(m,1H),2.59-2.67(m,1H),2.80-2.94(m,2H),3.07-3.15(m,1H),4.23(s,3H),4.45-4.55(m,1H),5.27-5.35(m,2H),7.10-7.15(m,2H),7.66(d,J = 9.2 Hz,1H),7.77-7.80(m,1H),8.27(d,J = 8 Hz,1H),8.73-8.75(m,2H).
化合物104	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.588(ddd,1H),8.536(s,1H),7.843(td,1H),7.581(dd,2H),7.356(ddd,1H),7.161(d,1H),7.085(dd,1H),5.237(s,2H),4.798(t,1H),4.224(s,3H),3.594(d,2H),0.815(dt,4H).
化合物120	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.353(d,1H),7.711(s,1H),7.606(dd,1H),7.139(d,1H),7.025(dd,1H),5.346(s,2H),4.236(s,3H),4.114-4.014(m,1H),3.907(ddd,2H),3.433(td,2H),2.642(s,3H),1.873(ddt,2H),1.678(dtd,2H).
化合物122	-	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:13.5(Br S,1H),8.73(d,1H),8.26(d,1H).7.80-7.70(m,2H),7.34(d,1H),7.11(d,1H),5.32(s,2H),4.37(s,3H).
化合物123	287.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:13.11(bs,1H),7.68-7.66(d,1H),7.42-7.38(d,2H),7.07-7.05(d,1H),6.387(s,1H),5.22(s,2H),4.38(s,3H),3.85(s,3H).
化合物124	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.827(s,1H),7.705(s,1H),7.594(d,1H),7.234(d,1H),7.014(dd,1H),5.313(s,2H),4.934(td,1H),4.213(s,3H),3.761-3.706(m,2H),3.691(d,2H),3.660(dd,2H),2.635(s,3H),2.240(d,2H),1.655(ddd,2H).

【表５－２】

化合物125	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.611-8.565(m,1H),8.044(d,1H),7.857(td,1H),7.633(dd,2H),7.512(s,1H),7.436(d,1H),7.363(ddd,1H),7.218(s,1H),7.122(dd,1H),5.205(s,2H),4.523(dt,1H),4.278(s,3H),3.813(d,2H).
化合物126	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.066(d,1H),7.757(s,1H),7.618(d,1H),7.585(s,1H),7.427(s,1H),7.229(s,1H),7.020(d,1H),5.334(s,2H),4.539(s,1H),4.271(s,3H),3.820(d,2H),2.628(s,3H).
化合物127	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.587(d,1H),7.850(td,1H),7.623(d,1H),7.587(d,1H),7.394-7.334(m,2H),7.232(d,1H),7.099(dd,1H),5.182(s,2H),4.942(t,2H),4.237(s,3H),3.679(dd,2H),3.606(dd,2H),1.351(s,3H).
化合物128-En1	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.628(d,1H),8.580(ddd,1H),7.845(td,1H),7.638(d,1H),7.567(dd,1H),7.354(ddd,1H),7.188-7.085(m,2H),5.181(q,2H),4.515(s,1H),4.229(s,3H),3.152(d,1H),2.952(d,1H),2.876(dd,1H),2.704-2.584(m,1H),1.791(ddd,2H).
化合物128-En2	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.624(d,1H),8.580(ddd,1H),7.844(td,1H),7.638(d,1H),7.568(d,1H),7.353(ddd,1H),7.189-7.084(m,2H),5.181(q,2H),4.554-4.458(m,1H),4.229(s,3H),3.201-3.092(m,1H),2.944(d,1H),2.859(dd,1H),2.634(t,1H),1.877-1.714(m,2H).
化合物129	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.597-7.547(m,1H),7.350(s,1H),7.120(d,1H),6.976(dd,1H),4.959(td,2H),4.237(s,3H),3.958(d,2H),3.679(dd,2H),3.596(dd,2H),2.761(h,1H),2.136-2.050(m,2H),1.982-1.802(m,4H),1.360(s,3H).
化合物130	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.967(d,1H),7.621-7.572(m,1H),7.513(s,1H),7.271(d,1H),7.208(s,1H),7.004(dd,1H),5.037(t,1H),4.513(d,1H),4.266(s,3H),4.033-3.953(m,2H),3.800(t,2H),2.854-2.699(m,1H),2.139-2.050(m,2H),1.982-1.799(m,4H).
化合物131	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.607(d,1H),7.411(s,1H),7.267(d,1H),7.208(s,1H),7.015(dd,1H),5.106(s,2H),4.969(tt,2H),4.244(d,3H),3.696(dd,2H),3.614(dd,2H),2.419(s,3H),1.372(s,3H).
化合物132-En1	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 9.001(s,1H),8.837(d,1H),7.651(d,1H),7.169(d,1H),7.082(dd,1H),5.359-5.251(m,2H),4.249(s,3H),3.775(s,2H),3.317(s,1H),3.168(s,2H),2.539(s,1H),2.424(s,3H),2.161-2.000(m,2H).
化合物132-En2	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 9.001(s,1H),8.828(d,1H),7.650(d,1H),7.169(d,1H),7.081(dd,1H),5.359-5.241(m,2H),4.833(s,1H),4.248(s,3H),3.786(d,1H),3.459-3.266(m,2H),2.424(s,3H),2.176-1.963(m,4H).

【表５－３】

化合物141	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.020(d,1H),7.630(d,1H),7.541(s,1H),7.437(d,1H),7.254(s,1H),7.247-7.203(m,1H),7.037(dd,1H),5.141(s,2H),5.094-5.041(m,1H),4.618-4.484(m,1H),4.274(d,3H),3.816(t,2H),2.414(d,3H).
化合物142	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.744(d,1H),7.648(d,1H),7.534(s,1H),7.491(d,1H),7.258(s,1H),7.219(s,1H),7.048(dd,1H),5.132(s,2H),4.434(dd,1H),4.278(s,3H),4.194(qd,1H),2.409(s,3H),1.187(d,3H).
化合物143	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.963(d,1H),7.596(dd,1H),7.506(s,1H),7.265(d,1H),7.202(s,1H),7.000(dd,1H),5.024(t,1H),4.508(dt,1H),4.265(s,3H),3.939-3.859(m,2H),3.794(t,2H),2.360(dt,1H),1.800(dq,2H),1.619(tdd,2H),1.588-1.489(m,2H),1.347(ddd,2H).
化合物144	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.572(d,1H),7.347(s,1H),7.115(d,1H),6.974(dd,1H),4.236(s,3H),3.861(d,2H),3.673(d,2H),3.591(d,2H),2.354(p,1H),1.842-1.747(m,2H),1.655-1.581(m,2H),1.609-1.512(m,2H),1.398-1.308(m,2H),1.356(s,3H).
化合物145	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.168(s,1H),7.598(d,1H),7.407(s,1H),7.199-7.143(m,2H),7.001(dd,1H),4.268(s,2H),3.918(d,2H),2.366(p,1H),1.799(ddd,3H),1.598(s,6H),1.675-1.489(m,4H),1.357(dq,2H).
化合物146	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.644-7.598(m,1H),7.381(s,1H),7.125(d,1H),7.059(dd,1H),4.932(t,2H),4.246(s,3H),4.028(s,2H),3.683(dd,2H),3.595(dd,2H),1.422-1.373(m,2H),1.360(s,3H),1.225-1.175(m,2H).
化合物147	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.740(s,1H),7.616(d,1H),7.296(d,1H),7.274(s,1H),7.011(dd,1H),5.286(s,2H),4.890(t,1H),4.259(s,3H),3.769(d,6H),2.635(s,3H).
化合物148	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.024(d,1H),7.643(d,1H),7.508(s,1H),7.273(d,1H),7.202(s,1H),7.082(dd,1H),5.040(d,1H),4.509(dt,1H),4.272(s,3H),4.066(s,2H),3.798(t,2H),1.448-1.354(m,2H),1.219-1.165(m,2H).
化合物149	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 7.765(s,1H),7.721(d,1H),7.645(d,1H),7.524(s,1H),7.486(d,1H),7.219(s,1H),7.041(dd,1H),5.328(s,2H),5.124(d,1H),4.427(dd,1H),4.277(s,3H),4.196(td,1H),2.626(s,3H),1.186(d,3H).
化合物150	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.610(t,1H),7.722(s,1H),7.638(d,1H),7.263(d,1H),7.046(dd,1H),6.232(tt,1H),5.344(s,2H),4.275(s,3H),3.789(tdd,2H),2.642(s,3H).
化合物151-En1	404.3	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:9.00(s,3H),7.94(s,1H),7.65-7.63(d,1H),7.51(s,1H),7.42(s,1H),7.34(s,1H),7.06-7.04(d,1H),5.32(s,2H),5.18-5.17(t,1H),4.29(s,3H),3.98-3.77(m,4H),2.32(s,3H),1.56(m,3H).

【表５－４】

化合物151-En2	404.3	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:9.00(s,3H),7.94(s,1H),7.65-7.63(d,1H),7.51(s,1H),7.42(s,1H),7.34(s,1H),7.06-7.04(d,1H),5.32(s,2H),5.18-5.17(t,1H),4.29(s,3H),3.98-3.77(m,4H),2.32(s,3H),1.56(m,3H).
化合物152	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.612-8.545(m,2H),7.855(td,1H),7.636(d,1H),7.598(dt,1H),7.360(ddd,1H),7.324(d,1H),7.119(dd,1H),5.220(s,2H),4.770-4.678(m,2H),4.269(s,3H),3.543(q,2H),3.503-3.398(m,3H),3.193(dt,1H),2.438-2.355(m,1H),2.086-1.984(m,1H).
化合物153	-	1H NMR(600 MHz,DMSO)d 8.616-8.542(m,2H),7.855(td,1H),7.636(d,1H),7.598(dd,1H),7.392-7.302(m,2H),7.119(dd,1H),5.220(s,2H),4.773-4.673(m,2H),4.269(s,3H),3.543(q,2H),3.502-3.391(m,3H),3.193(dt,1H),2.441-2.351(m,1H),2.035(dq,1H).
化合物154-En1	387.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.96(s,1H),7.66-7.64(d,1H),7.54(s,1H),7.46(s,1H),7.37(s,2H),7.08-7.06(d,2H),5.31-5.17(m,3H),4.29(s,3H),4.02-3.98(m,1H),3.82(s,3H),3.78(m,1H),1.57(m,3H).
化合物154-En2	387.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.96(s,1H),7.66-7.64(d,1H),7.54(s,1H),7.46(s,1H),7.37(s,2H),7.08-7.06(d,2H),5.31-5.17(m,3H),4.29(s,3H),4.02-3.98(m,1H),3.82(s,3H),3.78(m,1H),1.57(m,3H).
化合物155-En1	387.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.95(s,1H),7.67-7.65(d,1H),7.63-7.61(d,1H),7.42(s,1H),7.03-7.00(d,1H),6.37(s,1H),5.17-5.16(t,1H),5.01(s,2H),4.29(s,3H),3.98-3.97(m,1H),3.83-3.79(m,4H),1.57(s,3H).
化合物155-En2	387.4	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.95(s,1H),7.67-7.64(d,1H),7.63-7.61(d,1H),7.52(s,1H),7.36(s,1H),7.03-7.00(d,1H),6.37(s,1H),5.17-5.16(t,1H),5.01(s,2H),4.29(s,3H),3.98-3.97(m,1H),3.83-3.79(m,4H),1.57(s,3H).
化合物156	387.3	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.97(s,1H),7.85(s,1H),7.62-7.53(m,3H),7.39(s,1H),6.99-6.96(m,1H),5.22(m,1H),4.99(s,2H),4.28(s,3H),4.05-4.01(m,1H),3.81(s,3H),1.57(s,3H).
化合物157-En1	404.1	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.94(s,1H),7.76(s,1H),7.65-7.62(d,1H),7.54(bs,1H),7.42-7.38(m,2H),7.04-7.02(d,1H),5.33(s,2H),5.20(s,1H),4.29(s,3H),4.00-3.98(d,1H),3.81-3.78(d,1H),2.63(s,3H),1.56(s,3H).
化合物157-En2	404.1	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.94(s,1H),7.76(s,1H),7.65-7.62(d,1H),7.54(bs,1H),7.42-7.38(m,2H),7.04-7.02(d,1H),5.33(s,2H),5.19(s,1H),4.29(s,3H),4.00-3.98(d,1H),3.81-3.78(d,1H),2.63(s,3H),1.56(s,3H).
化合物158-En1	391	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.91(s,1H),7.63-7.60(m,1H),7.51(s,1H),7.34(s,1H),7.26(s,1H),7.02-7.00(d,1H),5.14(t,1H),4.28(s,3H),3.99-3.96(m,1H),3.89-3.88(m,4H),3.79-3.76(m,2H),2.07(m,1H),1.71-1.68(d,2H),1.55(s,3H),1.39-1.31(m,2H).

【表５－５】

化合物158-En2	391	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.91(s,1H),7.63-7.60(m,1H),7.51(s,1H),7.34(s,1H),7.26(s,1H),7.02-7.00(d,1H),5.14(t,1H),4.28(s,3H),3.99-3.96(m,1H),3.89-3.88(m,4H),3.79-3.76(m,2H),2.06(m,1H),1.71-1.68(d,2H),1.55(s,3H),1.39-1.31(m,2H).
化合物159-En1	373.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(s,1H),7.85(s,1H),7.59(d,1H),7.04(d,1H),7.01-6.97(dd,1H),5.29(bs,1H),4.22(s,3H),3.97(d,2H),3.68-3.60(m,2H),3.30(s,1H),3.26-3.18(m,1H),2.80-2.75(m,1H),2.46-2.39(m,2H),2.13-2.06(m,2H),1.94-1.86(m,4H).
化合物159-En2	373.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.50(s,1H),7.99(s,1H),7.84(s,1H),7.59(d,1H),7.04(d,1H),7.00(dd,1H),5.36(bs,1H),4.22(s,3H),3.97(d,2H),3.68-3.61(m,2H),3.31(s,1H),3.25-3.20(m,1H),2.81-2.66(m,1H),2.46-2.38(m,2H),2.12-2.06(m,2H),1.96-1.88(m,4H).
化合物160-En1	404.1	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.96(s,1H),7.62-7.52(m,3H),7.40-7.37(d,2H),7.04-7.02(d,1H),5.18-5.10(m,3H),4.26(s,3H),3.98-3.77(m,2H),2.64(s,3H),1.54(s,3H).
化合物160-En2	404.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.93(s,1H),7.64-7.55(m,3H),7.42-7.40(m,2H),7.07-7.05(d,1H),5.19-5.17(m,3H),4.29(s,3H),4.01-3.77(m,2H),2.66(s,3H),1.57(s,3H).
化合物161-En1	359.2	(500 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(s,1H),7.83(s,1H),7.60-7.58(m,1H),7.02-7.00(m,2H),5.38(bs,1H),4.22(s,3H),3.84(d,2H),3.67-3.59(m,2H),3.31(s,1H),3.25-3.19(m,2H),1.29-1.23(m,1H),0.61-0.53(m,2H),0.37-0.35(m,2H).
化合物161-En2	359.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.91-7.83(m,2H),7.61-7.57(m,1H),7.02-7.00(m,2H),5.27(bs,1H),4.22(s,3H),3.84(d,2H),3.67-3.59(m,2H),3.31-3.18(m,2H),2.50-2.32(m,2H),1.29-1.24(m,1H),0.62-052(m,2H),0.35(d,2H).
化合物162-En1	384.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:8.59-8.58(d,1H),7.94(s,1H),7.87-7.84(m,1H),7.67-7.62(d,2H),7.51-(s,2H),7.40-7.37(m,3H),7.14-7.11(d,1H),5.19-5.17(m,3H),4.28(m,3H),4.04-3.96(m,1H),3.81-3.77(m,1H),1.55(s,3H).
化合物162-En2	384.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:8.59-8.58(d,1H),7.94(s,1H),7.87-7.84(m,1H),7.67-7.62(d,2H),7.51-(s,1H),7.40-7.36(m,3H),7.13-7.11(d,1H),5.19-5.17(m,3H),4.28(m,3H),4.04-3.96(m,1H),3.81-3.77(m,1H),1.55(s,3H).
化合物163-En1	414.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.0(s,1H),8.02(s,1H),7.83(s,1H),7.62(d,1H),7.19(d,1H),7.05(dd,1H),5.32(s,2H),5.27(s,1H),4.23(s,3H),3.70-3.62(m,2H),3.35-3.32(m,1H),3.26-3.20(m,1H),2.51-2.43(m,5H)
化合物163-En2	414.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.01(s,1H),8.04(s,1H),7.83(s,1H),7.63(d,1H),7.20(d,1H),7.06(dd,1H),5.33(s,3H),4.23(s,3H),3.70-3.62(m,2H),3.32(s,1H),3.25-3.21(m,1H),2.46-2.42(m,5H).

【表５－６】

化合物164-En1	410.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.67(s,1H),8.56(d,1H),7.78(dd,1H),7.62(d,1H),7.30-7.14(m,4H),7.07(dd,1H),5.15(s,2H),4.24(s,3H),4.17(d,1H),4.02(d,1H),3.90(t,2H),2.47(s,3H),2.43-2.38(m,2H).
化合物164-En2	410.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.68(s,1H),8.56(d,1H),7.78(dd,1H),7.62(d,1H),7.30-7.26(m,2H),7.21(d,1H),7.14(bs,1H),7.07(dd,1H),5.15(s,2H),4.24(s,3H),4.17(d,1H),4.02(d,1H),3.90(t,2H),2.47(s,3H),2.41-2.38(m,2H).
化合物165-En1	359.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.69(s,1H),7.59(d,1H),7.29(bs,1H),7.13(bs,1H),7.06(d,1H),7.01(dd,1H),4.23(s,3H),4.15(d,1H),4.00(d,1H),3.92-3.84(m,4H),2.45-2.32(m,2H),1.32-1.25(m,1H),0.63-0.56(m,2H),0.36-0.33(m,2H).
化合物165-En2	359.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(s,1H),7.59(d,1H),7.31(bs,1H),7.13(s,1H),7.06-7.00(m,2H),4.23(s,3H),4.15(d,1H),4.01(d,1H),3.93-3.82(m,4H),2.46-2.32(m,2H),1.33-1.22(m,1H),0.62-0.56(m,2H),0.37-0.31(m,2H)
化合物166-En1	413.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(s,1H),7.64-7.56(m,2H),7.46-7.40(m,1H),7.30-7.23(m,4H),7.14(bs,1H),7.06(dd,1H),5.20(s,2H),4.24(s,3H),4.18(d,1H),4.01(d,1H),3.92-3.86(m,2H),2.44-2.35(m,2H).
化合物166-En2	413.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(s,1H),7.64-7.56(m,2H),7.47-7.40(m,1H),7.30-7.23(m,4H),7.14(bs,1H),7.06(dd,1H),5.20(s,2H),4.24(s,3H),4.18(d,1H),4.01(d,1H),3.92-3.86(m,2H),2.44-2.35(m,2H)
化合物167-En1	363.1	1H-NMR(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.93(s,1H),7.64-7.62(d,1H),7.52(s,1H),7.35(s,1H),7.32-7.31(s,1H),7.04-7.01(d,1H),5.19(s,1H),4.75-4.72(m,2H),4.46-4.43(t,2H),4.29(s,3H),4.25-4.23(d,2H),3.98-3.96(d,1H),3.80-3.77(d,1H),3.47-3.42(m,1H),1.56(s,3H).
化合物167-En2	363.1	1H-NMR(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.94(s,1H),7.64-7.62(d,1H),7.51(s,1H),7.34-7.31(m,2H),7.04-7.01(d,1H),5.21(s,1H),4.75-4.72(m,2H),4.46-4.43(t,2H),4.29(s,3H),4.25-4.23(d,2H),3.99-3.96(d,1H),3.80-3.77(d,1H),3.47-3.44(m,1H),1.56(s,3H).
化合物168-En1	396.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.69(d,2H),8.56(d,1H),7.91(d,1H),7.63(d,1H),7.46-7.42(m,1H),7.27-7.22(m,2H),7.15-7.07(m,2H)5.21(s,2H),4.24(s,3H),4.17(d,1H),4.02(d,1H),3.90(t,2H),2.42-2.37(m,2H)
化合物168-En2	396.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.70(s,2H),8.56(d,1H),7.91(d,1H),7.63(d,1H),7.46-7.42(m,1H),7.29-7.22(m,2H),7.15-7.07(m,2H),5.21(s,2H),4.24(s,3H),4.17(d,1H),4.02(d,1H),3.90(t,2H),2.42-2.37(m,2H).
化合物169-En1	410.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.56(d,1H),7.97(bs,1H),7.84(bs,1H),7.80(dd,1H),7.62(d,1H),7.29(d,1H),7.18(d,1H),7.06(dd,1H),5.28(bs,1H),5.12(s,2H),4.23(s,3H),3.67-3.65(m,2H),3.36(s,1H),3.31-3.24(m,1H),2.47-2.43(m,5H).

【表５－７】

化合物169-En2	410.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.56(d,1H),7.97(bs,1H),7.84(bs,1H),7.80(dd,1H),7.62(d,1H),7.29(d,1H),7.18(d,1H),7.06(dd,1H),5.28(bs,1H),5.12(s,2H),4.23(s,3H),3.70-3.61(m,2H),3.35(s,1H),3.26-3.19(m,1H),2.46-2.38(m,5H).
化合物170-En1	416.2	1HNMR(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.01(s,1H),8.71(s,1H),7.63(d,1H),7.30-7.24(m,2H),7.14(bs,1H),7.05(dd,1H),5.35(s,2H),4.24(s,3H),4.19(d,1H),4.02(d,1H),3.93-3.87(m,2H),2.44-2.36(m,5H).
化合物170-En2	416.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.01(s,1H),8.73(s,1H),7.62(d,1H),7.29-7.25(m,2H),7.14(bs,1H),7.05(dd,1H),5.35(s,2H),4.24(s,3H),4.19(d,1H),4.02(d,1H),3.93-3.88(m,2H),2.44-2.37(m,5H),
化合物171-En1	413.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.00(s,1H),7.83(s,1H),7.64-7.60(m,2H),7.47-7.40(m,1H),7.30-7.22(m,2H),7.21(d,1H),7.06(dd,1H),5.24(t,1H),5.16(s,2H),4.23(s,3H),3.71-3.61(m,2H),3.37-3.35(m,1H),3.27-3.20(m,1H),2.47-2.40(m,2H).
化合物171-En2	413.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.02(s,1H),7.83(s,1H),7.64-7.60(m,2H),7.47-7.40(m,1H),7.30-7.22(m,2H),7.21(d,1H),7.06(dd,1H),5.24(t,1H),5.16(s,2H),4.23(s,3H),3.71-3.61(m,2H),3.37-3.35(m,1H),3.27-3.20(m,1H),2.47-2.40(m,2H).
化合物172-En1	307.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(bs,2H),7.62(d,1H),7.53(bs,1H),7.35(bs,1H),7.29(d,1H),7.01(dd,1H),5.16(bs,1H),4.29(s,3H),3.99(d,1H),3.82(s,4H),1.56(s,3H)
化合物172-En2	307.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(bs,2H),7.62(d,1H),7.53(bs,1H),7.35(bs,1H),7.28(d,1H),7.01(dd,1H),5.17(bs,1H),4.29(s,3H),3.99(d,1H),3.82(s,4H),1.56(s,3H).
化合物173-En1	361.3	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.91(s,1H),7.61(d,1H),7.51(bs,1H),7.35(bs,1H),7.26(d,1H),7.00(dd,1H),5.15(t,1H),4.28(s,3H),4.01-3.95(m,3H),3.85-3.74(m,1H),2.81-2.73(m,1H),2.13-2.05(m,2H),1.95-1.82(m,4H),1.56(s,3H),1.23(s,1H).
化合物173-En2	361.3	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.91(s,1H),7.61(d,1H),7.51(bs,1H),7.34(s,1H),7.26(d,1H),7.00(dd,1H),5.16(t,1H),4.28(s,3H),3.98(d,3H),3.82-3.75(m,1H),2.81-2.75(m,1H),2.13-2.05(m,2H),1.96-1.82(m,4H),1.56(s,3H),1.23(s,1H).
化合物174-En1	398.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.56(d,1H),7.94(s,1H),7.80(dd,1H),7.64(d,1H),7.53(bs,1H),7.43-7.36(m,2H),7.28(d,1H),7.06(dd,1H),5.21-5.12(m,3H),4.29(s,3H),4.02-3.96(m,1H),3.83-3.77(m,1H),2.47(s,3H),1.56(s,3H).
化合物174-En2	398.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.56(d,1H),7.94(s,1H),7.80(dd,1H),7.64(d,1H),7.53(bs,1H),7.43-7.36(m,2H),7.28(d,1H),7.06(dd,1H),5.18(t,1H),5.13(s,2H),4.29(s,3H),4.02-3.96(m,1H),3.83-3.77(m,1H),2.47(s,3H),1.56(s,3H).

【表５－８】

化合物175-En1	445.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(bs,1H),7.69-7.50(m,5H),7.39-7.07(m,5H),5.33(s,2H),4.24(s,3H),4.18(d,1H),4.01(d,1H),3.89-3.85(m,2H),2.41-2.37(m,2H).
化合物175-En2	445.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.73(bs,1H),7.69-7.50(m,5H),7.39-7.07(m,5H),5.33(s,2H),4.24(s,3H),4.18(d,1H),4.01(d,1H),3.91-3.85(m,2H),2.41-2.37(m,2H).
化合物176-En1	445.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.02(bs,1H),7.83(bs,1H),7.70-7.64(m,2H),7.62-7.60(m,1H),7.59-7.54(m,1H),7.52-7.51(m,1H),7.40-7.13(m,2H),7.07(dd,1H),5.30(s,3H),4.23(s,3H),3.66-3.64(m,2H),3.31(s,1H),3.24-3.22(m,1H),2.46-2.42(m,2H).
化合物176-En2	445.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.00(bs,1H),7.83(bs,1H),7.70-7.51(m,5H),7.40-7.11(m,2H),7.07(dd,1H),5.30(s,3H),5.26-5.23(m,1H),4.23(s,3H),3.67-3.64(m,2H),3.31(s,1H),3.24-3.22(m,1H),2.46-2.42(m,2H).
化合物177-En1	464.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,1H),8.29(d,1H),8.06(s,1H),7.84-7.82(m,2H),7.65(d,1H),7.16(d,1H),7.14-7.05(m,1H),5.33(s,3H),5.21(m,1H),4.23(s,3H),3.64(d,2H),3.34(s,1H),3.22-3.20(m,1H),2.54-2.40(m,2H).
化合物177-En2	464.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,1H),8.29(d,1H),8.05(s,1H),7.84-7.76(m,2H),7.65(d,1H),7.16(d,1H),7.14-7.05(m,1H),5.33(s,3H),5.19(m,1H),4.23(s,3H),3.64(d,2H),3.31(s,1H),3.21(m,1H),2.50(m,2H).
化合物178-En1	464.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.79-8.70(m,2H),8.28(d,1H),7.84-7.86(m,1H),7.66(d,1H),7.28(s,1H),7.20(d,1H),7.16-7.08(m,2H),5.36(s,2H),4.25(s,3H),4.17(d,1H),4.0(d,1H),3.92-3.80(m,2H),2.45-2.30(m,2H).
化合物178-En2	464.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.75-8.70(m,2H),8.28(d,1H),7.85-7.80(m,1H),7.66(d,1H),7.27(s,1H),7.20(d,1H),7.14-7.08(m,2H),5.36(s,2H),4.30(s,3H),4.28-4.14(m,1H),4.0(d,1H),3.93-3.80(m,2H),2.58-2.30(m,2H)
化合物179-En1	388.1	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.95(s,1H),7.66-7.64(d,1H),7.54(s,1H),7.41-7.37(m,2H),7.24(s,1H),7.05-7.03(d,1H),5.19-5.13(m,3H),4.29(s,3H),4.02-3.78(m,2H),3.41(s,3H),1.57(s,3H).
化合物179-En2	388.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.95(s,1H),7.66-7.64(d,1H),7.54(s,1H),7.41-7.37(m,2H),7.24(s,1H),7.05-7.03(d,1H),5.19-5.13(m,3H),4.29(s,3H),4.02-3.78(m,2H),3.41(s,3H),1.57(s,3H).
化合物180-En1	396.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(d,1H),8.56(dd,1H),8.02(bs,1H),7.95-7.90(m,1H),7.84(bs,1H),7.63(d,1H),7.46-7.41(m,1H),7.19(d,1H),7.08(dd,1H),5.34(bs,1H),5.18(s,2H),4.23(s,3H),3.71-3.61(m,2H),3.26-3.22(m,2H),2.52-2.48(m,1H).

【表５－９】

化合物180-En2	396.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.72(d,1H),8.56(dd,1H),8.04(bs,1H),7.95-7.91(m,1H),7.84(bs,1H),7.63(d,1H),7.46-7.41(m,1H),7.18(d,1H),7.08(dd,1H),5.34(bs,1H),5.18(s,2H),4.23(s,3H),3.71-3.61(m,2H),3.26-3.22(m,2H),2.46-2.42(m,1H).
化合物181-En1	398.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:8.42(s,1H),7.95(s,1H),7.67-7.64(d,2H),7.51-7.49(d,2H),7.40-7.37(d,2H),7.11-7.08(d,3H),5.14(m,3H),4.28(s,3H),3.99-3.78(m,2H),3.156(s,1H),2.312(s,3H),1.55(s,3H).
化合物181-En2	398.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:8.42(s,1H),7.95(s,1H),7.67-7.64(d,2H),7.51-7.49(d,2H),7.40-7.37(d,2H),7.11-7.08(d,3H),5.14(m,3H),4.28(s,3H),3.99-3.78(m,2H),3.156(s,1H),2.312(s,3H),1.55(s,3H).
化合物182-En1	425.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),7.86(s,1H),7.60(d,1H),7.21(d,1H),7.02(dd,1H),6.28(tt,1H),5.30-5.25(m,3H),4.22(s,3H),3.71-3.58(m,2H),2.62-2.54(m,1H),2.44-2.32(m,4H),1.44(s,3H).
化合物182-En2	425.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),7.86(s,1H),7.60(d,1H),7.21(d,1H),7.02(dd,1H),6.28(tt,1H),5.30(s,2H),5.24(t,1H),4.22(s,3H),3.71-3.58(m,2H),2.63-2.57(m,1H),2.43-2.30(m,4H),1.44(s,3H),
化合物183-En1	478.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(s,2H),8.28(d,1H),7.82-7.73(m,2H),7.66(d,1H),7.19(d,1H),7.11(dd,1H),5.37(s,2H),4.24(s,3H),4.14(d,1H),4.02(d,1H),3.94-3.81(m,2H),2.62(d,3H),2.45-2.30(m,2H).
化合物183-En2	478.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,2H),8.28(d,1H),7.82-7.77(m,1H),7.76-7.73(m,1H),7.66(d,1H),7.19(d,1H),7.12(dd,1H),5.37(s,2H),4.24(s,3H),4.13(d,1H),4.02(d,1H),3.96-3.82(m,2H),2.64(s,3H),2.42-2.33(m,2H).
化合物184-En1	430.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),8.55(s,1H),7.62(d,1H),7.29(s,1H),7.04(dd,1H),5.31(s,2H),5.06(t,1H),4.23(s,3H),3.91-3.87(m,1H),3.73-3.69(m,1H),2.96(bs,6H),2.43(s,3H),1.50(s,3H)
化合物184-En2	430.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),8.54(s,1H),7.62(d,1H),7.29(s,1H),7.04(dd,1H),5.31(s,2H),5.05(s,1H),4.23(s,3H),3.90(d,1H),3.71(d,1H),2.96(s,6H),2.43(s,3H),1.50(s,3H).
化合物185-En1	418.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),7.90-7.86(m,2H),7.65(d,1H),7.39(d,1H),7.06(dd,1H),5.34(s,2H),5.22(t,1H),4.28(s,3H),3.90-3.86(m,1H),3.79-3.74(m,1H),2.65(d,3H),2.43(s,3H),1.56(s,3H),
化合物185-En2	418.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.00(s,1H),7.91-7.86(m,2H),7.65(d,1H),7.39(d,1H),7.06(dd,1H),5.34(s,2H),5.23(t,1H),4.28(s,3H),3.90-3.86(m,1H),3.79-3.74(m,1H),2.65(d,3H),2.43(s,3H),1.56(s,3H),
化合物186-En1	492.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.15(s,1H),8.74(d,1H),8.26(d,1H),7.82-7.77(m,1H),7.68(d,1H),7.14(dd,1H),7.07(s,1H),5.36(s,2H),4.32(d,1H),4.20(s,3H),3.96(d,1H),3.92-3.82(m,2H),2.96-2.83(brm,6H),2.44-2.37(m,2H).

【表５－１０】

化合物186-En2	492.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 9.15(s,1H),8.73(d,1H),8.26(d,1H),7.81-7.78(m,1H),7.68(d,1H),7.12(dd,1H),7.07(s,1H),5.36(s,2H),4.32(d,1H),4.20(s,3H),3.95(d,1H),3.91-3.84(m,2H),2.95-2.84(brm,6H),2.44-2.38(m,2H)
化合物187-En1	357.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.94(s,1H),7.67(d,1H),7.51(bs,1H),7.35-7.32(m,2H),7.08(dd,1H),6.61-6.32(m,1H),5.14(t,1H),4.37-4.29(m,5H),3.99-3.95(m,1H),3.82-3.77(m,1H),1.56(s,3H).
化合物187-En2	357.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.94(s,1H),7.67(d,1H),7.51(bs,1H),7.35-7.33(m,2H),7.08(dd,1H),6.60-6.33(m,1H),5.14(t,1H),4.36-4.29(m,5H),3.99-3.95(m,1H),3.82-3.77(m,1H),1.56(s,3H).
化合物188-En1	398.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.58(d,1H),7.94(bs,1H),7.89-7.82(m,1H),7.67(d,1H),7.61(d,1H),7.47(bs,1H),7.40-7.33(m,3H),7.12(dd,1H),5.18(s,3H),4.71-4.65(m,2H),3.99-3.95(m,1H),3.81-3.77(m,1H),1.55(s,3H),1.44(t,3H)
化合物188-En2	398.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.58(d,1H),8.48(bs,1H),7.95(bs,1H),7.89-7.83(m,1H),7.67(d,1H),7.61(d,1H),7.47(bs,1H),7.40-7.33(m,3H),7.12(dd,1H),5.19(s,3H),4.71-4.65(m,2H),3.96(d,1H),3.79(d,1H),1.55(s,3H),1.44(t,3H).
化合物189	398.2	(500 MHz,DMSO-d6):δ 8.58-8.56(m,1H),8.52(bs,1H),7.87-7.82(m,2H),7.69-7.67(m,2H),7.61-7.58(m,2H),7.43(d,1H),7.37-7.34(m,1H),7.14(dd,1H),5.21-5.15(m,2H),5.05(bs,1H),4.30(s,3H),4.20-4.17(m,1H),3.81-3.78(m,2H),2.36-2.32(m,1H),1.80-1.76(m,1H).
化合物190-En1	384.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.71(d,1H),8.55(dd,1H),7.94-7.91(m,2H),7.65(d,1H),7.52(bs,1H),7.46-7.41(m,2H),7.36(bs,1H),7.08(dd,1H),5.18(s,3H),4.29(s,3H),3.98(d,1H),3.80(d,1H),1.56(s,3H)
化合物190-En2	384.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.71(d,1H),8.56(dd,1H),7.96-7.91(m,2H),7.65(d,1H),7.53-7.36(m,4H),7.08(dd,1H),5.18(s,3H),4.29(s,3H),3.98(d,1H),3.80(d,1H),1.56(s,3H).
化合物191-En1	433.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(bs,1H),7.68-7.64(m,3H),7.60-7.50(m,3H),7.42-7.06(m,4H),5.30(s,2H),5.19(bs,1H),4.29(s,3H),3.97(d,1H),3.79(d,1H),1.56(s,3H)
化合物191-En2	433.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.96(bs,1H),7.68-7.62(m,3H),7.60-7.50(m,3H),7.42-7.06(m,4H),5.30(s,2H),5.20(bs,1H),4.29(s,3H),3.97(d,1H),3.79(d,1H),1.56(s,3H).
化合物192-En1	452.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.76-8.73(m,1H),8.30(d,1H),7.96(s,1H),7.81-7.76(m,1H),7.67(d,1H),7.48(bs,1H),7.38(d,1H),7.30(bs,1H),7.08(dd,1H),5.32(s,2H),5.14(t,1H),4.29(s,3H),3.99-3.93(m,1H),3.82-3.76(m,1H),1.55(s,3H).
化合物192-En2	452.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,1H),8.30(d,1H),7.95(s,1H),7.80-7.76(m,1H),7.67(d,1H),7.48(bs,1H),7.38(d,1H),7.30(bs,1H),7.08(dd,1H),5.32(s,2H),5.13(t,1H),4.29(s,3H),3.98-3.94(m,1H),3.83-3.76(m,1H),1.55(s,3H).

【表５－１１】

化合物193-En1	478.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,1H),8.60(s,1H),8.24(d,1H),7.80-7.75(dd,1H),7.65(d,1H),7.21(d,1H),7.10(dd,1H),5.35(s,2H),4.98(m,1H),4.22(s,3H),3.89-3.85(m,1H),3.72-3.67(m,1H),2.91(s,6H),1.47(s,3H).
化合物193-En2	478.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 8.74(d,1H),8.59(s,1H),8.24(d,1H),7.78(dd,1H),7.65(d,1H),7.21(d,1H),7.10(dd,1H),5.35(s,2H),4.96(s,1H),4.22(s,3H),3.90-3.84(m,1H),3.73-3.67(m,1H),2.91(s,6H),1.47(s,3H).
化合物194-En1	401.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.97(s,1H),7.66-7.60(m,2H),7.51(bs,1H),7.48-7.41(m,2H),7.35(bs,1H),7.30-7.22(m,2H),7.06(dd,1H),5.16(s,3H),4.29(s,3H),4.01-3.95(m,1H),3.83-3.77(m,1H),1.56(s,3H)
化合物194-En2	401.1	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.97(s,1H),7.66-7.60(m,2H),7.51(bs,1H),7.48-7.41(m,2H),7.35(bs,1H),7.30-7.22(m,2H),7.05(dd,1H),5.16(s,3H),4.29(s,3H),4.01-3.96(m,1H),3.82-3.77(m,1H),1.56(s,3H)
化合物195-En1	432.3	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.95(s,1H),7.75(s,1H),7.67(d,1H),7.49(bs,1H),7.41(d,1H),7.34(bs,1H),7.01(dd,1H),5.59-5.50(m,1H),5.32(s,2H),5.22(s,1H),3.97(d,1H),3.80(d,1H),2.63(s,3H),1.57(s,3H),1.52-1.47(m,6H).
化合物195-En2	432.3	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.96(s,1H),7.75(s,1H),7.66(d,1H),7.49(bs,1H),7.40(d,1H),7.34(bs,1H),7.01(dd,1H),7.59-7.50(m,1H),5.32(s,2H),5.24(s,1H),3.97(d,1H),3.80(d,1H),2.63(s,3H),1.57(s,3H),1.52-1.47(m,6H).
化合物196	375.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:7.90(s,1H),7.62-7.59(d,1H),7.51(s,1H),7.34(s,1H),7.27-7.23(d,1H),7.01-6.99(d,1H),5.15(s,1H),4.29(s,3H),4.03-3.91(m,3H),2.74(m,1H),2.56(m,1H),2.29-2.20(m,2H),2.02-1.98(m,1H),1.77-1.75(m,1H),1.55(s,3H),1.45-1.40(m,1H),1.12-1.03(dd,3H).
化合物197	-	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:13.6(Br S,1H),7.69(d 1H),7.49(d,2H),7.41(t,2H),7.36-7.33(m,2H),7.11(dd,1H),5.15(s,2H),4.37(s,3H).
化合物198	301.2	(400 MHz,DMSO-d6):δ 7.66(d,1H),7.60(t,1H),7.47-7.40(m,2H),7.29-7.21(m,2H),7.06(dd,1H),5.18(s,2H),4.37(s,3H).
化合物199	-	(400 MHz,DMSO-d6)δ [ppm]:13.52(bs,1H),8.99(s,1H),7.68-7.66(d,1H),7.37(s,1H),7.05-7.03(d,1H),5.35(s,2H),4.37(s,3H),2.32(s,3H).
化合物201-En1	405.36	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1H),7.83-7.86(m,2 H),7.56-7.63(m,2 H),7.34-7.37(m,1 H),7.08-7.14(m,2 H),6.09-6.34(m,1 H),5.20-5.23(m,3 H),4.21(s,3 H),3.59-3.68(m,2 H),2.49-2.57(m,1 H),2.32-2.41(m,1 H),1.23(s,3 H);
化合物201-En2	405.36	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57-8.58(m,1 H),7.82-7.86(m,2 H),7.56(d,1 H),7.62(dd,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.08-7.15(m,2 H),6.09-6.40(m,1 H),5.20-5.23(m,3 H),4.21(s,3 H),3.59-3.68(m,2 H),2.52-2.67(m,1 H),2.28-2.49(m,1 H),1.42(s,3 H)

【表５－１２】

化合物202-En1	473.23	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.73(d,1H),8.26(d,1H),7.91(S,1H),7.74-7.80(m,1H),7.64(d,1H),7.13(d,1H),7.07-7.10(m,1H),6.08-6.38(m,1H),5.32(s,2H),5.16(t,1H),4.21(s,3H),3.58-3.67(m,2H),2.50-2.58(m,1H),2.29-2.39(m,1H),1.41(s,3H)
化合物202-En2	473.23	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.73(d,1H),8.26(d,1H),7.91(S,1H),7.77-7.80(m,1H),7.64(d,1H),7.13(d,1H),7.07-7.10(m,1H),6.08-6.38(m,1H),5.32(s,2H),5.16(t,1H),4.21(s,3H),3.58-3.67(m,2H),2.49-2.67(m,1H),2.30-2.34(m,1H),1.41(s,3H)
化合物203-En1	422.26	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:7.87(S,1 H),7.57-7.61(M,2 H),7.41-7.46(m,1 H),7.19-7.28(m,3 H),7.04(dd,1 H),6.11-6.41(m,1 H),5.22(t,1 H),5.19(s,2 H),4.21(s,3 H),3.59-3.69(m,2 H),2.57-2.66(m,1 H),2.33-2.37(m,1 H),1.43(s,3 H);
化合物203-En2	422.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:7.87(S,1 H),7.57-7.61(M,2 H),7.41-7.47(m,1 H),7.19-7.28(m,3 H),7.04(dd,1 H),6.11-6.40(m,1 H),5.22(s,1 H),5.15(s,2 H),4.21(s,3 H),3.60-3.68(m,2 H),2.50-2.67(m,1 H),2.07-2.12(m,1 H),1.43(s,3 H);
化合物204	365.29	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.95(t,1 H),8.59(d,1 H),7.83-7.87(m,1 H),7.67(d,1 H),7.57(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.20(d,1 H),7.13-7.16(dd,1 H),5.23(s,2 H),4.27(s,3 H),4.13-4.22(m,2 H).
化合物205	327.33	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58-8.60(m,1 H),8.27(t,1 H),7.86(dt,1 H),7.58-7.63(m,2 H),7.35-7.38(m,1 H),7.27(d,1 H),7.10(dd,1 H),5.23(s,2 H),4.82(t,1 H),4.25(s,3 H),3.59(q,2 H),3.43(q,2 H).
化合物206	363.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:11.88(s,1 H),8.73(t,1 H),8.59(d,1 H),7.86(dt,1 H),7.59-7.65(m,1 H),7.51(d,1 H),7.35-7.38(m,1 H),7.12(dd,1 H),7.06(s,1 H),6.87(s,1 H),5.24(s,2 H),4.60(d,2 H),4.29(s,3 H).
化合物207	396.28	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57-8.58(m,1 H),8.44(t,1 H),7.83(dt,1 H),7.65(dd,1 H),7.52(d,1 H),7.33-7.35(m,1 H),7.12-7.15(t,2 H),5.22(s,2 H)4.24(s,3 H),3.25(s,2 H),2.49(s,6 H),2.23(s,2 H),0.90(s,6 H).
化合物208	423.19	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.83(t,1 H),8.60-8.62(m,1 H),7.85-7.90(m,1 H),7.58-7.67(m,4 H),7.49-7.52(m,3 H),7.36-7.39(m,1 H),7.10-7.13(dd,1 H),7.06(d,1 H),5.15(s,2 H),4.09-4.16(m,5 H).
化合物209	459.34	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.88(s,1 H),8.58-8.59(m,1 H),7.81-7.85(m,1 H),7.60-7.64(m,4 H),7.52(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.08(dt,2 H),5.11(s,2 H),4.70(d,2 H),4.22(s,3 H)
化合物210	439.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.90(t,1 H),8.57(d,1 H),7.84(dt,1 H),7.66(d,1 H),7.57(d,1 H),7.11-7.43(m,8 H),5.22(s,2 H),4.59(d,2 H),4.27(s,3 H)
化合物211-En1	422.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.0(s ,1 H),8.55(d,1 H),7.63(d,1 H),7.17(s,1 H),7.05(dd,1 H),5.30(s,2 H),4.43-4.36(m,1 H),4.23(s,3 H),3.02-2.99(m,2 H),2.94-2.90(m,1 H),2.76(t,1 H),2.59(t,1 H),2.42(s,3 H),2.13-2.07(m,1H),1.97-1.91(m,1 H).
化合物211-En2	422.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.0(s ,1 H),8.55(d,1 H),7.63(d,1 H),7.17(s,1 H),7.05(dd,1 H),5.30(s,2 H),4.43-4.36(m,1 H),4.23(s,3 H),3.02-2.90(m,2 H),2.75(t,1 H),2.66(t,1 H),2.42(s,3 H),2.17-2.07(m,1H),1.96-1.90(m,1H).
化合物212-En1	402.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.53(d,1 H),7.86(t,1 H),7.66-7.63(m,1 H),7.56(d,1 H),7.36(t,1H),7.13-7.12(m,2 H),5.19(q,2 H),4.40-4.35(m,1 H),4.23(s,3 H),3.00-2.89(m,2 H),2.77-2.67(m,2 H),2.5(m,1 H),2.12-2.07(m,1 H),1.95-1.88(m,1 H).

【表５－１３】

化合物212-En2	402.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.53(d,1 H),7.86-7.82(m,1 H),7.66-7.63(m,1H),7.56(d,1H),7.37-7.34(m,1 H),7.14-7.11(m,1 H),7.18(d,2 H),4.41-4.34(m,1 H),4.23(s,3 H),3.0-2.92(m,2 H),2.89-2.64(m,2 H),2.64(m,1 H),2.12-2.06(m,1 H),1.98-1.87(m,1 H)
化合物213-En1	422.3	(400.32 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.01(s,1 H),8.32(d,1 H),7.62(d,1 H),7.19(d,1 H),7.02-7.05(dd,1 H),5.33(s,2 H),4.24(s,3 H),4.17(t,1H),3.02(t,2H),2.83(d,2 H),2.58(t,1 H),2.43(s,4 H),2.05-2.19(m,1 H).
化合物213-En2	422.3	(400.32 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.01(s,1 H),8.32(d,1 H),7.62(d,1 H),7.19(d,1 H),7.02-7.05(dd,1 H),5.33(s,2 H),4.24(s,3 H),4.17(t,1H),3.02(t,2H),2.83(d,2 H),2.58(t,1 H),2.43(s,4 H),2.05-2.19(m,1 H).
化合物214-En1	402.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57(d,1 H),8.32(d,1 H),7.84-7.87(t,1 H),7.63(d,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.13(s,1 H),7.10(s,1H),5.23(s,2 H),4.23(s,3 H),4.14(bs,1H),3.01(d,2 H),2.7(bs,2 H),2.49-2.55(m,1 H),2.38(t,1 H),2.05-2.12(m,1 H).
化合物214-En2	402.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57(d,1 H),8.32(d,1 H),7.84-7.87(t,1 H),7.63(d,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.13(s,1 H),7.10(s,1H),5.23(s,2 H),4.23(s,3 H),4.14(bs,1H),3.01(d,2 H),2.7(bs,2 H),2.49-2.55(m,1 H),2.38(t,1 H),2.05-2.12(m,1 H).
化合物215-En1	372.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.00(d,1 H),8.43(d,1 H),7.60(d,1 H),7.13(t,1 H),7.01-7.04(dd,1 H),5.13(d,2 H),4.37(t,1 H),4.23(s,3 H),3.32(s,1 H),2.91-3.02(m,3 H),2.77-2.79(m,2 H),2.43(s,3 H),2.78(d,1 H).
化合物215-En2	372.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:9.00(d,1 H),8.43(d,1 H),7.60(d,1 H),7.13(t,1 H),7.01-7.04(dd,1 H),5.13(d,2 H),4.37(t,1 H),4.23(s,3 H),3.32(s,1 H),2.91-3.02(m,3 H),2.77-2.79(m,2 H),2.43(s,3 H),2.78(d,1 H)
化合物216-En1	352.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(d,1 H),8.39(d,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.61(d,1 H),7.55(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.08-7.11(m,2 H),5.23(s,2 H),4.35-4.36(m,1 H),4.22(s,3 H),2.91-2.98(m,2 H),2.72-2.78(m,2 H),1.98-2.03(m,1 H),1.70-1.72(m,1 H)
化合物216-En2	352.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.60(dd,1 H),8.39(d,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.61(d,1 H),7.55(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.07-7.12(m,2 H),5.24(s,2 H),4.35-4.39(m,1 H),4.22(s,3 H),2.92-2.99(m,2 H),2.74-2.79(m,2 H),1.96-2.03(m,1 H),1.68-1.75(m,1 H);
化合物217	403	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.68(S,1 H),8.59(d,1 H),7.83-7.87(m,1 H),7.63(d,1 H),7.58(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.22(d,1H),7.11(dd,1 H)5.27(t,1 H),5.20(s,2 H),4.23(s,3 H),3.67(d,2 H),2.90(t,4 H).
化合物218	444.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:12.85(s,1 H),9.50(s,1 H),8.59(d,1 H),8.44(d,1 H),7.89-7.83(m,2 H),7.77(d,1 H),7.65(d,1 H),7.54(d,1 H),7.38-7.36(m,1 H),7.21(d,1 H),5.25(s,2 H),4.39(s,3 H).
化合物219	427.25	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57-8.59(m,1 H),7.83-7.87(m,2 H),7.63(d,1 H),7.58(d,1 H),7.34-7.38(m,1 H),7.28(d,1 H),7.12(dd,1 H),5.19(s,2 H),5.03(brs,1 H),4.23-4.26(m,2 H),4.24(s,3 H),3.91-3.94(m,2 H),3.79(s,2 H),1.43(s,3 H),1.37(s,3 H).
化合物220-En1	421.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.76(d,1 H),8.58-8.60(m,1 H),7.83-7.87(dt,1 H),7.64(d,1 H),7.57(d,1 H),7.47-7.50(m,2 H),7.35-7.38(m,1 H),7.28(d,1 H),7.10-7.20(m,3 H),5.22(s,2 H),5.07-5.12(q,2 H),4.20(s,3 H),3.73(br s,2 H),

【表５－１４】

化合物220-En2	421.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.77(d,1 H),8.58-8.60(m,1 H),7.83-7.87(dt,1 H),7.64(d,1 H),7.57(d,1 H),7.47-7.50(m,2 H),7.35-7.38(m,1 H),7.28(d,1 H),7.10−7.20(m,3 H),5.22(s,2 H),5.07-5.12(q,2 H),4.20(s,3 H),3.68-3.76(m,2 H).
化合物221-En1	404.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.64(d,1 H),8.60(d,2 H),7.77(m,2 H),7.66(d,1 H),7.60(d,1 H),7.50(d 1 H),7.44(s 1 H),7.38-7.35(m,1 H),7.33-7.30(m,1 H),7.14(dd,1 H),5.28-5.19(m,3 H),5.05(t,1 H),4.26(s,3 H),3.89-3.81(m,2 H)
化合物221-En2	404.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.64(d,1 H),8.60(d,2 H),7.77(m,2 H),7.66(d,1 H),7.60(d,1 H),7.50(d 1 H),7.44(s 1H),7.35-7.38(m,1 H),7.30-7.33(m,1 H),7.14(dd,1 H),5.19-5.28(m,3 H),5.05(t,1 H),4.26(s,3 H),3.81-3.89(m,2 H).
化合物223-En1	435.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.87(d,1 H),8.60-8.59(m,1 H),7.87-7.83(m,1 H)7.64(d,1 H),7.56(d,1 H),7.48-7.44(m,2 H),7.38-7.35(m,1 H),7.19-7.10(m,4 H),5.24-5.18(m,3 H),4.76(t,1 H),4.18(s,3 H),3.53-3.43(m,2 H),2.10-2.03(m,1 H),1.98-1.91(m,1 H).
化合物223-En2	435.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.87(d,1 H),8.60-8.59(m,1 H),7.87-7.83(m,1 H)7.64(d,1 H),7.56(d,1 H),7.48-7.44(m,2 H),7.38-7.35(m,1 H),7.19-7.10(m,4 H),5.24-5.18(m,3 H),4.76(t,1 H),4.18(s,3 H),3.53-3.43(m,2 H),2.10-2.03(m,1 H),1.98-1.91(m,1 H).
化合物226-En1	409.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59-8.57(m,1 H),8.37(d,1 H),7.87-7.82(m,1 H),7.65(d,1 H),7.57(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.18(d,1 H),7.13-7.10(m,1 H),5.24-5.13(m,3 H),4.38-4.34(m,1 H),4.24(s,3 H),3.60-3.55(m,1 H),3.48-3.42(m,1 H),2.70-2.60(m,2 H).
化合物226-En2	409.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59-8.58(m,1 H),8.37(d,1 H),7.87-7.82(m,1 H),7.65(d,1 H),7.57(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.18(d,1 H),7.13-7.10(m,1 H),5.24-5.14(m,3 H),4.37-4.34(m,1 H),4.22(s,3 H),3.59-3.56(m,1 H),3.46-3.45(m,1 H),2.67-2.60(m,2 H).
化合物227-En1	477.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57(d,2H),7.84(t,1 H),7.65(d,1 H),7.55(d,1 H),7.034(m,1 H),7.11-7.15(m,2 H),5.28(t,1 H),5.10-5.19(m,2 H),4.90(d,1 H),4.27(s,4 H),3.67(d,2 H);
化合物227-En2	477.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57(d,2H),7.84(t,1 H),7.65(d,1 H),7.55(d,1 H),7.034(m,1 H),7.11-7.15(m,2 H),5.28(t,1 H),5.10-5.19(m,2 H),4.90(d,1 H),4.27(s,4 H),3.67(d,2 H)
化合物228-En1	391.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59-8.57(m,1 H),8.27(d,1 H),7.87-7.83(m,1 H),7.63(d,1 H),7.57(d,1 H),7.38-7.34(m,1 H),7.20(d,1 H),7.12-7.09(m,1 H),6.36-6.05(m,1 H),5.21(s,2 H),5.05(t,1 H),4.23(s,4 H),3.59-3.47(m,2 H),2.25-2.16(m,2 H).
化合物228-En2	391.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59-8.57(m,1 H),8.27(d,1 H),7.87-7.83(m,1 H),7.63(d,1 H),7.57(d,1 H),7.38-7.34(m,1 H),7.20(d,1 H),7.12-7.09(m,1 H),6.36-6.05(m,1 H),5.21(s,2 H),5.05(t,1 H),4.23(s,4 H),3.60-3.46(m,2 H),2.25-2.12(m,2H).
化合物229-En1	432.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),7.96(s,1 H),7.86-7.81(m,1 H),7.64(d,1 H),7.55(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.10(t,3 H),6.36-6.06(m,1 H),5.21(s,2 H),4.20(s,3 H),2.78(d,1 H),2.70-2.62(m,2 H),2.32-2.18(m,7 H),1.42(s,3 H).
化合物229-En2	432.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59-8.57(m,1 H),7.96(s,1 H),7.84(t,1 H)7.82(d,1 H),7.36-7.34(m,1 H),7.10(t,2 H),6.36-6.06(m,1 H),5.21(s,2 H),4.20(s,3 H),2.78-2.70(m,1 H),2.68-2.61(m,2 H),2.33-2.16(m,7 H),2.15(s,3 H).

【表５－１５】

化合物230-En1	419.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57-8.59(m,1 H),8.02(s,1 H),7.82-7.86(m,1H),7.61-7.64(m,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.09-7.12(m,2 H),6.08-6.39(m,1 H),5.21(s,2 H),4.21(s,3 H),3.62(d,1 H),3.53-3.56(d,1 H),3.27-3.39(m,3 H),2.67(s,1 H),2.31-2.61(m,1 H),1.31(s,3 H)
化合物230-En2	419.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57-8.59(m,1 H),8.02(s,1 H),7.82-7.86(m,1H),7.61-7.64(m,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.09-7.12(m,2 H),6.08-6.39(m,1 H),5.21(s,2 H),4.21(s,3 H),3.62(d,1 H),3.53-3.56(d,1 H),3.27-3.39(m,3 H),2.67(s,1 H),2.31-2.61(m,1 H),1.31(s,3 H)
化合物232-En1	383.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(d,1 H),8.46(s,1 H),7.84(dt,1 H),7.65(d,1 H),7.57(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.23(d,1 H),7.12-7.14(dd,1H),5.23(s,2 H),5.16(t,1 H),4.23(s,3 H),3.76(d,2 H),2.14(s,3 H),1.42(s,3 H)
化合物232-En2	383.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(d,1 H),8.46(s,1 H),7.82-7.86(dt,1 H),7.65(d,1 H),7.57(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.23(d,1 H),7.12-7.14(dd,1H),5.23(s,2 H),5.16(t,1 H),4.23(s,3 H),3.76(d,2 H),2.14(s,3 H),1.42(s,3 H)
化合物234	416.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(d,1 H),7.95(s,1 H),7.87-7.83(dt,1 H),7.70-7.67(m,2 H),7.62-7.58(m,2 H),7.42(d,1 H),7.38-7.35(m,1 H),7.15-7.12(dd,1 H),5.20-5.17(m,3 H),4.57-4.18(m,2 H),4.29(s,3 H),4.17-4.13(q,1 H),3.84-3.79(q,1 H),2.74-2.63(m,1 H),2.39-2.32(m,1H).
化合物235-En1	389.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.89(s,1 H),8.59(d,1 H),7.83-7.87(dt,1 H),7.63(d,1 H),7.57(d,1 H),7.34-7.37(dt,1 H),7.21(d,1 H),7.09-7.12(dd,1 H),5.22(s,2 H),5.15(t,1 H),4.25(s,3 H),3.85-3.89(m,1 H),3.64-3.69(m,1 H),1.89-1.96(m,1 H),1.73-1.80(m,1 H).
化合物235-En2	389.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.89(s,1 H),8.59(d,1 H),7.83-7.87(dt,1 H),7.63(d,1 H),7.57(d,1 H),7.34-7.37(dt,1 H),7.21(d,1 H),7.09-7.12(dd,1 H),5.22(s,2 H),5.15(t,1 H),4.25(s,3 H),3.85-3.89(m,1 H),3.64-3.69(m,1 H),1.73-1.96(m,2 H).
化合物237-En1	403.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.75(s,1H),8.59-8.58(m,1 H),7.87-7.83(dt,1 H),7.61-7.57(q,2 H),7.37-7.34(dt,1 H),7.18(q,1 H),7.10-7.07(dd,1 H),6.16-5.87(dt,1 H),5.24(s,2 H),5.07(t,1 H),4.22(s,3 H),3.85-3.81(dd,1 H),3.77-3.73(dd,1 H),1.81-1.75(m,1 H),1.26(d,2 H).
化合物237-En2	403.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.75(s,1H),8.59-8.58(m,1 H),7.87-7.83(dt,1 H),7.61-7.57(q,2 H),7.37-7.34(dt,1 H),7.18(q,1 H),7.10-7.07(dd,1 H),6.16-5.87(dt,1 H),5.24(s,2 H),5.07(t,1 H),4.22(s,3 H),3.85-3.81(dd,1 H),3.77-3.73(dd,1 H),1.79-1.75(m,1 H),1.25(d,2 H).
化合物238-En1	433.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.63(d,1 H),8.59(t,1 H),7.87-7.83(m,1 H),7.63-7.58(m,2 H),7.45(d,1 H),7.38-7.34(m,1 H),7.12-7.08(m,2 H),6.84(d,1 H),5.55(q,1 H),5.22(q,2 H),5.04(t,2 H),4.24(s,3 H),3.91-3.87(m,2 H),3.47-3.44(m,1 H),1.06-0.98(m,4 H).
化合物238-En2	433.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.64(d,1 H),8.60(d,1 H),7.87-7.83(m,1 H),7.61(t,2 H),7.45(d,1 H),7.38-7.35(m,1 H),7.12-7.08(m,2 H),6.84(d,1 H),5.55(q,1 H),5.22(q,2 H),5.04(t,2 H),4.24(s,3 H),3.89(t,2 H),3.49-3.43(m,1 H),1.06-0.97(m,4 H).
化合物239-En1	421.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58-8.56(m,1 H),7.97(s,1 H),7.87-7.83(dt,1 H),7.66(d,1 H),7.61-7.58(m,2 H),7.39-7.34(m,2 H),7.15-7.12(dd,1 H),6.17(d,1 H),5.23(s,2 H),5.06(bs,1 H),4.25(s,3 H),3.80(s,5 H),1.72(s,3 H).
化合物239-En2	421.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58-8.56(m,1 H),7.97(s,1 H),7.87-7.83(dt,1 H),7.66(d,1 H),7.61-7.58(m,2 H),7.39-7.34(m,2 H),7.15-7.12(dd,1 H),6.17(d,1 H),5.23(s,2 H),5.06(bs,1 H),4.25(s,3 H),3.80(s,5 H),1.72(s,3 H).

【表５－１６】

化合物240-En1	384.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.22(d,1 H),7.86-7.84(m,1 H),7.61(t,2 H),7.46(br s,1H),7.38-7.33(m,2 H),7.08(dd,1 H),6.96(br s,1 H),5.21(s,2 H),4.90(t,1 H),4.34-4.32(m,1 H),4.25(s,3 H),3.56-3.54(m,1 H),3.48-3.46(m,1 H),2.49-2.46(m,2 H);
化合物240-En2	384.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.21(d,1 H),7.86-7.84(m,1 H),7.61(t,2 H),7.46(br s,1H),7.38-7.34(m,2 H),7.08(dd,1 H),6.94(br s,1 H),5.21(s,2 H),4.90(t,1 H),4.36-4.32(m,1 H),4.25(s,3 H),3.57-3.44(m,2 H),2.48-2.44(m,2 H)
化合物241-En1	411.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.61(dd,1 H),8.54-8.59(m,1 H),8.08(d,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.62(d,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.22(d,1 H),7.09-7.12(m,1H),5.16-5.23(t,2 H),4.76(d,1 H),4.22(s,3 H),3.86-3.93(m,3 H),3.59-3.63(m,2 H),3.16-3.17(m,2 H),1.86-1.94(m,1 H),1.62-1.65(m,2 H),1.38-1.41(m,2 H)
化合物241-En2	411.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(dd,1 H),8.08(d,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.62(d,1 H),7.56(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.22(d,1 H),7.09-7.12(m,1H),5.16-5.23(t,2 H),4.76(d,1 H),4.22(s,3 H),3.86-3.93(m,3 H),3.59-3.63(m,2 H),3.16-3.17(m,2 H),1.86-1.94(m,1 H),1.62-1.65(m,2 H),1.38-1.41(m,2 H).
化合物242	475.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.60(d,1 H),8.36(d,1 H),7.85-7.89(dt,1 H),7.59-7.64(m,2 H),7.43(s,1 H),7.36-7.39(m,1 H),7.10-7.13(m,1 H),7.07(s,1 H),5.22-5.26(m,3 H),4.42-4.51(m,2 H),4.22-4.27(m,1 H),4.09(s,3 H),3.61-3.69(m,2 H).
化合物243-En1	419.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.73(d,2 H),8.61-8.59(m,1 H),8.25(d,1 H),7.90-7.85(m,1 H),7.61(t,2 H),7.39-7.36(m,1 H),7.32(t,1 H),7.18(d,1 H),7.10-7.07(dd,1 H),5.23-5.14(m,2 H),4.95(t,1 H),4.63-4.57(m,1 H),4.14(s,3 H),3.66-3.61(m,1 H),3.56-3.50(m,1 H),3.35-3.29(m,1 H),3.15-3.09(m,1 H).
化合物243-En2	419.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.73(d,2 H),8.61-8.59(m,1 H),8.25(d,1 H),7.90-7.85(m,1 H),7.61(t,2 H),7.39-7.36(m,1 H),7.32(t,1 H),7.18(d,1 H),7.10-7.07(dd,1 H),5.23-5.14(m,2 H),4.95(t,1 H),4.63-4.57(m,1 H),4.14(s,3 H),3.66-3.61(m,1 H),3.56-3.50(m,1 H),3.35-3.29(m,1 H),3.15-3.09(m,1 H).
化合物245-En1	409.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.38(t,1 H),7.86(dt,1 H),7.59-7.64(m,2 H),7.35-7.38(m,1 H),7.28(d,1 H),7.11(dd,1 H),5.40(br s,1 H),5.21(s,2 H),4.26(s,3 H),4.06-4.07(m,1 H),3.35-3.45(m,2 H),2.49-2.57(m,1 H),2.33-2.38(m,1 H)
化合物245-En2	409.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.38(t,1 H),7.86(dt,1 H),7.59-7.64(m,2 H),7.35-7.38(m,1 H),7.28(d,1 H),7.11(dd,1 H),5.41(br s,1 H),5.21(s,2 H),4.26(s,3 H),4.06-4.07(m,1 H),3.36-3.45(m,2 H),2.54-2.55(m,1 H),2.36-2.50(m,1 H);
化合物246-En1	420.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ 8.65(d,1 H),8.58-8.56(m,1 H),7.86-7.82(m,1H),7.65(d,1 H),7.56(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.14-7.11(m,2 H),5.28(s,2 H),4.56-4.52(m,1H),4.23(s,3 H),3.31-3.23(m,1 H),3.15-3.06(m,2 H),2.91-2.87(m,1 H),2.80-2.67(m,2 H);
化合物246-En2	420.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.65(d,1 H),8.58-8.56(m,1 H),7.86-7.82(m,1H),7.65(d,1 H),7.56(d,1 H),7.37-7.34(m,1 H),7.14-7.11(m,2 H),5.28(s,2 H),4.56−4.52(m,1H),4.23(s,3 H),3.29-3.23(m,1 H),3.16-3.06(m,2 H),2.91-2.87(m,1 H)2.80-2.67(m,2 H);
化合物248-En1	430.4	1H NMR(400 MHz,CDCl3)δ ppm:8.58(d,1 H),7.86-7.81(m,1 H),7.68-7.64(m,2 H),7.55(d,1 H),7.46(s,1 H),7.36-7.33(m,1 H),7.12(dd,1 H),6.34-6.04(m,1 H),5.26-5.17(m,2 H),4.24(s,3 H),3.14(d,1 H),2.90(d,1 H),2.67-2.54(m,3 H),2.39-2.23(m,2 H),1.59-1.54(m,1 H),1.46-1.39(m,2 H)

【表５－１７】

化合物248-En2	430.4	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58(d,1 H),7.86-7.81(m,1 H),7.68-7.64(m,2 H),7.55(d,1 H),7.46(s,1 H),7.36-7.33(m,1 H),7.12(dd,1 H),6.34-6.03(m,1 H),5.26-5.17(m,2 H),4.24(s,3 H),3.13(d,1 H),2.90(d,1 H),2.71-2.61(m,3 H),2.39-2.32(m,1 H),2.28-2.23(m,1 H),1.59-1.54(m,3 H);
化合物251-En1	407.2	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.49(d,1 H),7.85(dt,1 H),7.64-7.57(m,3 H),7.38-7.34(m,2 H),7.13-7.10(dd,1 H),6.24(d,1 H),5.21-5.20(m,3 H),4.92(t,1 H),4.24(s,3 H),3.81-3.73(m,5 H).
化合物251-En2	407.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),8.49(d,1 H),7.85(dt,1 H),7.64-7.57(m,3 H),7.38-7.35(m,2 H),7.12-7.10(dd,1 H),6.24(d,1 H),5.21-5.18(m,3 H),4.92(bs,1 H),4.24(s,3 H),3.81-3.76(m,5 H).
化合物252-En1	418.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.60(d,1 H),8.49(d,1 H),8.24(d,1 H),7.85-7.90(m,1 H),7.68-7.73(m,1 H),7.58-7.62(m,2 H),7.33-7.39(m,2 H),7.17-7.20(m,1 H),7.08-7.10(m,2 H),5.12-5.22(m,2 H),4.96(brs,1 H),4.47-4.52(m,1 H),4.13(s,3 H),3.53-3.63(m,1 H),3.49-3.51(m,1H),3.14-3.18(m,1 H),2.98-3.04(m,1 H).
化合物252-En2	418.3	1H NMR(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.60(d,1 H),8.49(d,1 H),8.24(d,1 H),7.85-7.90(m,1 H),7.68-7.73(m,1 H),7.58-7.62(m,2 H),7.33-7.39(m,2 H),7.17-7.20(m,1 H),7.08-7.10(m,2 H),5.12-5.22(m,2 H),4.96(brs,1 H),4.47-4.52(m,1 H),4.13(s,3 H),3.53-3.63(m,1 H),3.49-3.51(m,1H),3.14-3.18(m,1 H),2.98-3.04(m,1 H).
化合物253-En1	396.3	(400 MHz,DMSO)δ ppm:8.59(d,1 H),7.96(s,1 H),7.87-7.83(m,2 H),7.65-7.59(m,2 H),7.38-7.35(m,1 H),7.17(s,1 H),7.13-7.10(m,1 H),5.24(s,1 H),5.20(s,2 H),4.22(s,3 H),3.69-3.62(m,2 H),3.34(s,1 H),3.25-3.19(m,1 H),2.49-2.41(m,2 H)
化合物253-En2	396.2	(400 MHz,DMSO)δ ppm:8.59(d,1 H),7.96(s,1 H),7.87-7.83(m,2 H),7.65-7.59(m,2 H),7.38-7.35(m,1 H),7.17(s,1 H),7.13-7.10(m,1 H),5.24(s,1 H),5.20(s,2 H),4.22(s,3 H),3.69-3.62(m,2 H),3.34(s,1 H),3.25-3.19(m,1 H),2.49-2.41(m,2 H)
化合物254-En1	395.1	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.79(d,1 H),8.58(d,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.66(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.12-7.17(m,2 H),5.27(t,1 H),5.20(s,2H),4.79-4.85(m,1 H),4.24(s,3 H),3.83-3.87(m,1 H),3.12-3.81(m,1H).
化合物254-En2	395.1	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.79(d,1 H),8.57-8.58(m,1 H),7.82-7.86(m,1 H),7.66(d,1 H),7.34-7.37(m,1 H),7.12-7.17(m,2 H),5.27(t,1 H),5.18(s,2H),4.79-4.85(m,1 H),4.25(m,3 H),3.83-3.87(m,1 H),3.76-3.81(m,1H).
化合物255-En1	423.4	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.64(d,1 H),8.07(s,1 H),7.97(t,1 H),7.62-7.68(m,2 H),7.48(t,1 H),7.09-7.13(m,2 H),5.24(s,2 H),4.19(s,3 H),3.62-3.69(m,2 H),3.09-3.19(m,1 H),2.66-2.74(m,3 H),1.44(s,3 H).
化合物255-En2	423.5	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.57(d,1 H),8.05(s,1 H),7.84(dt,1 H),7.61(d,2 H),7.55(t,1 H),7.34-7.37(m,2 H),7.09-7.12(m,2 H),5.20-5.23(m,1 H),5.18(s,2 H),4.19(s,3 H),3.64-3.66(m,2 H),3.12-3.19(m,1 H),2.68-2.74(m,1 H),1.45(s,3 H).
化合物256	312.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.20(s,1 H),7.79(d,1 H),7.57-7.61(dt,1 H),7.39-7.45(m,2 H),7.23-7.29(m,2 H),7.07-7.09(dd,1 H),5.18(s,2 H),4.58(t,2 H),3.69-3.72(m,2 H)
化合物257	294.1	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.19(s,1 H),7.68(d,1 H),7.49(d,2 H),7.32-7.42(m,4 H),7.10(dd,1 H),5.14(s,2 H),4.57(t,2 H),3.68-3.72(m,2 H)
化合物258-En1	385.4	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),7.85(t,1 H),7.55-7.64(m,3 H),7.36(t,1 H),7.18(s,1 H),7.11(dd,1 H),5.19(s,2 H),4.99(s,1 H),4.22(s,3 H),3.54-3.68(m,4 H),3.31(s,3 H),1.37(s,3 H).

【表５－１８】

化合物258-En2	385.3	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.59(d,1 H),7.85(t,1 H),7.55-7.64(m,3 H),7.36(t,1 H),7.18(s,1 H),7.11(dd,1 H),5.19(s,2H),4.99(s,1 H),4.22(s,3 H),3.54-3.68(m,4 H),3.31(s,3 H),1.37(s,3 H).
化合物259	357.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:8.58-8.59(d,1 H),792-7.94(d,1 H),7.83-7.87(t,1 H),7.58-7.63(t,2 H),7.35-7.38(t,1 H),7.25(s,1 H),7.08-7.11(dd,1 H),5.19(s,2 H),4.76-4.79(t,2 H),4.24(s,3 H),4.01-4.06(m,1 H),3.57-3.60(t,4 H)
化合物260	386.2	(400 MHz,DMSO-D6)δ ppm:7.66(d,1 H),7.61-7.57(m,1 H),7.40-7.44(m,2 H),7.23-7.29(m,2 H),7.07-7.10(dd,1 H),5.19(s,2 H),4.77(t,2 H),4.55-4.63(m,3 H),3.86(t,2 H),3.61-3.64(m,4 H)
化合物261	356.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ ppm:7.69(d,1 H),7.59(dt,1 H),7.44−7.41(m,2 H),7.29−7.22(m,2 H),7.07(dd,1 H),5.18(s,2 H),4.82(brs,1 H),4.64(t,2 H),3.94(t,2 H),3.63−3.57(m,4 H)
化合物262	374.2	(400 MHz,DMSO-d6)δ ppm:7.98(d,1 H),7.62−7.59(m,2 H),7.47−7.42(m,1 H),7.29−7.23(m,3 H),7.04(dd,1 H),5.15(s,2 H),4.77(t,2 H),4.25(s,3 H),4.08−4.00(m,1 H),3.61−3.58(m,4 H).

【表６－１】

キラル分析データ

キラル SFC						
化合物コード	カラム名	共溶媒	共溶媒%	流量[g/分]	RT(分)	*純度[%]*
化合物 002-En1	(8)	MeOH	40	3	1.13	99.7
化合物 002-En2	(8)	MeOH	40	3	3.1	97.7
化合物 003-En1	(9)	MeOH	15	3	5.29	99.3
化合物 003-En2	(9)	MeOH	15	3	6.53	96.4
化合物 151-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	50	2	3.4	99.7
化合物 151-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	50	2	3.82	99.9
化合物 154-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	2.62	>99.9
化合物 154-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	3.09	99.8
化合物 155-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	5.08	>99.9
化合物 155-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	6.14	99.7
化合物 157-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	70	2	3.12	>99.9
化合物 157-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	70	2	3.88	99.8
化合物 159-En1	(1)	MeOH	30	3	2.91	98.8
化合物 159-En2	(1)	MeOH	30	3	3.52	95.9
化合物 160-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	3.89	>99.9
化合物 160-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	60	2	4.73	98.1
化合物 161-En1	(6)	MeOH	70	3	2.8	99.8
化合物 161-En2	(6)	MeOH	70	3	3.54	99.5
化合物 162-En1	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	70	2	10.57	>99
化合物 162-En2	(11)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	70	2	12.87	>99
化合物 163-En1	(4)	MeOH	40	4	6.99	99
化合物 163-En2	(4)	MeOH	40	4	9.13	95.5
化合物 164-En1	(1)	MeOH	40	3	2.53	99.9
化合物 164-En2	(1)	MeOH	40	3	4.76	99.8

【表６－２】

化合物 165-En1	(9)	EtOH	25	3	6.49	99.8
化合物 165-En2	(9)	EtOH	25	3	7.62	99.6
化合物 166-En1	(7)	MeOH	50	4	3.99	99.9
化合物 166-En2	(7)	MeOH	50	4	5.45	99.7
化合物 167-En1	(7)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	50	2	4.58	99.5
化合物 167-En2	(7)	MeOH 中の 0.3%IP アミン	50	2	5.11	99.3
化合物 168-En1	(1)	MeOH	40	3	2.41	99.5
化合物 168-En2	(1)	MeOH	40	3	3.64	96
化合物 169-En1	(10)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	2.68	99.9
化合物 169-En2	(10)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	3.56	99.8
化合物 170-En1	(5)	MeOH	35	3	3.41	99.9
化合物 170-En2	(5)	MeOH	35	3	4.29	99.2
化合物 171-En1	(5)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.58	99.9
化合物 171-En2	(5)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	4.15	99.1
化合物 172-En1	(2)	MeOH	40	3	2.9	99.5
化合物 172-En2	(2)	MeOH	40	3	6.8	99.8
化合物 173-En1	(2)	IPA	30	3	2.62	99.7
化合物 173-En2	(2)	IPA	30	3	3.87	97.9
化合物 174-En1	(1)	MeOH	40	3	2.04	98.9
化合物 174-En2	(1)	MeOH	40	3	2.91	88.4
化合物 175-En1	(10)	MeOH	40	3	2.25	99.9
化合物 175-En2	(10)	MeOH	40	3	3.01	99.7
化合物 177-En1	(5)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.03	99.8
化合物 177-En2	(5)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.68	99.2
化合物 178-En1	(9)	MeOH	30	3	4.3	99.9
化合物 178-En2	(9)	MeOH	30	3	4.87	97.7

【表６－３】

化合物 179-En1	(11)	MeOH 中 0.5%の IP アミン	25	2	10.2	>99.9
化合物 179-En2	(11)	MeOH 中 0.5%の IP アミン	25	2	11.56	97.6
化合物 180-En1	(3)	MeOH	40	3	4.42	99.8
化合物 180-En2	(3)	MeOH	40	3	5.44	99.3
化合物 181-En1	(11)	MeOH 中の 0.1%NH3	70	2	5.91	92.3
化合物 181-En2	(11)	MeOH 中の 0.1%NH3	70	2	7.07	96.8
化合物 183-En1	(7)	MeOH	30	3	2.57	99.9
化合物 183-En2	(7)	MeOH	30	3	3.46	99.5
化合物 185-En1	(1)	MeOH	35	3	1.56	99.5
化合物 185-En2	(1)	MeOH	35	3	2.4	99.3
化合物 186-En1	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	4.1	99.9
化合物 186-En2	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	7.18	99.8
化合物 188-En1	(10)	MeOH	40	3	1.88	99.7
化合物 188-En2	(10)	MeOH	40	3	2.29	99.3
化合物 190-En1	(1)	MeOH	35	3	2.45	99.3
化合物 190-En2	(1)	MeOH	35	3	3.21	97.4
化合物 192-En1	(1)	IPA	20	3	4.2	99.5
化合物 192-En2	(1)	IPA	20	3	5.63	95.2
化合物 193-En1	(1)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	2.47	99.2
化合物 193-En2	(1)	MeOH 中の 0.5%DEA	20	3	3.29	95.1
化合物 194-En1	(1)	MeOH	40	3	1.82	99
化合物 194-En2	(1)	MeOH	40	3	2.52	97.5
化合物 195-En1	(7)	MeOH	40	3	5.13	99.9
化合物 195-En2	(7)	MeOH	40	3	7.25	98.8
化合物 201-En1	(13)	MeOH	25	3	2.33	99.9
化合物 201-En2	(13)	MeOH	25	3	3.35	99.7

【表６－４】

化合物 203-En1	(16)	IPA 中の 0.5%IP アミン	15	3	4.32	99.9
化合物 203-En2	(16)	IPA 中の 0.5%IP アミン	15	3	5.22	96.5
化合物 211-En1	(15)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	1.97	99.9
化合物 211-En2	(15)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	3.29	99.8
化合物 212-En1	(2)	IPA 中の 0.5%IP アミン	30	3	2.21	99.7
化合物 212-En2	(2)	IPA 中の 0.5%IP アミン	30	3	3.71	99.2
化合物 213-En1	(2)	IPA 中の 0.5%IP アミン	25	3	4.16	99.2
化合物 213-En2	(2)	IPA 中の 0.5%IP アミン	25	3	6.7	99.4
化合物 214-En1	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	1.64	99.9
化合物 214-En2	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	3.59	99.9
化合物 215-En1	(3)	IPA 中の 0.5%IP アミン	35	3	7.08	99.9
化合物 215-En2	(3)	IPA 中の 0.5%IP アミン	35	3	10.68	99.6
化合物 216-En1	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	4.64	99.5
化合物 216-En2	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	6.57	98.6
化合物 220-En1	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	1.85	99.7
化合物 220-En2	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	6.96	99.9
化合物 221-En1	(2)	MeOH	50	3	4.76	99.7
化合物 221-En2	(2)	MeOH	50	3	9.25	97
化合物 223-En1	(7)	MeOH	40	4	3.81	99.8
化合物 223-En2	(7)	MeOH	40	4	5.7	98.6
化合物 226-En1	(7)	MeOH	20	3	4.97	99.7
化合物 226-En2	(7)	MeOH	20	3	8.22	99.1
化合物 227-En1	(7)	MeOH	15	3	1.8	99.9
化合物 227-En2	(7)	MeOH	15	3	2.84	99.5
化合物 228-En1	(7)	MeOH	30	3	4.92	98.4
化合物 228-En2	(7)	MeOH	30	3	7.26	99.9

【表６－５】

化合物 229-En1	(7)	MeOH	30	3	2.36	99.9
化合物 229-En2	(7)	MeOH	30	3	6.9	99.9
化合物 230-En1	(7)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	2.8	99.7
化合物 230-En2	(7)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	5.02	99.1
化合物 232-En1	(17)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	6.5	99.9
化合物 232-En2	(17)	EtOH 中の 0.5%DEA	20	3	7.6	99.4
化合物 235-En1	(2)	MeOH	30	3	1.68	99.9
化合物 235-En2	(2)	MeOH	30	3	3.8	99.9
化合物 237-En1	(3)	IPA 中の 0.5%IP アミン	25	3	2.24	99.9
化合物 237-En2	(3)	IPA 中の 0.5%IP アミン	25	3	4.06	99.4
化合物 238-En1	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	4	2.29	99.8
化合物 238-En2	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	4	3.94	98.5
化合物 239-En1	(7)	MeOH	30	3	12.16	99.9
化合物 239-En2	(7)	MeOH	30	3	15.79	99.8
化合物 240-En1	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	4.14	99.4
化合物 240-En2	(3)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	4.85	95.1
化合物 241-En1	(5)	MeOH	25	3	2.11	99.1
化合物 241-En2	(5)	MeOH	25	3	2.56	94
化合物 243-En1	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	9.36	99.9
化合物 243-En2	(7)	IPA 中の 0.5%IP アミン	40	3	12.19	99.4
化合物 245-En1	(14)	MeOH	10	3	1.82	99.8
化合物 245-En2	(14)	MeOH	10	3	2.37	98.5
化合物 246-En1	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	1.69	99.9
化合物 246-En2	(2)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.31	97.1
化合物 248-En1	(7)	EtOH	35	3	3.58	99.7
化合物 248-En2	(7)	EtOH	35	3	4.47	99.8

【表６－６】

化合物 251-En1	(17)	MeOH	40	3	3.65	99.8
化合物 251-En2	(17)	MeOH	40	3	4.79	99.4
化合物 252-En1	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	6.43	97.7
化合物 252-En2	(4)	MeOH 中の 0.5%DEA	40	3	7.84	99.9
化合物 253-En1	(12)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	2.83	99.9
化合物 253-En2	(12)	MeOH 中の 0.5%DEA	30	3	3.21	99.9
化合物 254-En1	(7)	MeOH	15	3	4.41	99.9
化合物 254-En2	(7)	MeOH	15	3	5.71	99.8
化合物 258-En1	(3)	MeOH	30	3	3.32	99.9
化合物 258-En2	(3)	MeOH	30	3	4.01	99.5

【０３２５】

Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＡＤ－３（４．６×１５０ｍｍ）３．５μｍ＝（１）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＡＤ－Ｈ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（２）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＩＣ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（３）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＩＥ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（４）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＩＦ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（５）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＩＦ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（６）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ ＩＧ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（７）、ＣｈｉｒａｌＣｅｌ ＯＤ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（８）、ＣｈｉｒａｌＣｅｌ ＯＨ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（９）、ＣｈｉｒａｌＣｅｌ ＯＺ－３（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（１０）、Ｃ－ＡＭＹＬＯＳＥ Ａ＝（１１）、（Ｒ，Ｒ）ＷＨＥＬＫ－０１（４．６×１５０ｍｍ）３．５μｍ＝（１２）ＣＨＩＲＡＬＡＲＴ Ａｍｙｌｏｓｅ－Ｃ－Ｎｅｏ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（１３）、ＣＨＩＲＡＬＣＥ ＯＪ－Ｈ（４．６×１５０ｍｍ）５μｍ＝（１４）、ＣＨＩＲＡＬＣＥＬ ＯＤ－Ｈ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（１５）、ＬＵＸ ＣＥＬＬＵＬＯＳＥ－２（４．６×１５０ｍｍ）３μｍ＝（１６）、ＬＵＸ ＣＥＬＬＵＬＯＳＥ－４（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（１７）。

【表７】

キラル HPLC						
化合物コード	カラム	相 A/B	比率 A/B	流量[mL/分]	RT(分)	*純度[%]*
化合物 158-En1	(2)	Hex/EtOAc/EtOH/IP アミン	70/15/15/0.1	1	5.96	>99
化合物 158-En2	(2)	Hex/EtOAc/EtOH/IP アミン	70/15/15/0.1	1	6.87	98.1
化合物 176-En1	(3)	n-Hex/IPA	50/50	1	7.95	99.9
化合物 176-En2	(3)	n-Hex/IPA	50/50	1	15.98	99.9
化合物 182-En1	(1)	n-Hex/EtOH	90/10	1	19.71	99.8
化合物 182-En2	(1)	n-Hex/EtOH	90/10	1	25.94	99.8
化合物 187-En1	(5)	nHex/EtOH	80/20	1	12.61	99.6
化合物 187-En2	(5)	nHex/EtOH	80/20	1	16.15	97.6
化合物 191-En1	(4)	nHex/EtOH	90/10	1	14.25	98.7
化合物 191-En2	(4)	nHex/EtOH	90/10	1	16.89	99.1
化合物 202-En1	(6)	nHex/EtOH:IPA(1:1)	90/10	1	18.44	99.6
化合物 202-En2	(6)	nHex/EtOH:IPA(1:1)	90/10	1	20.33	95
化合物 255-En1	(7)	MeOH.NH3/ACN	0.2/99.8	0.5	12.4	99.8
化合物 255-En2	(7)	MeOH.NH3/ACN	0.2/99.8	0.5	14.35	99.6

【０３２６】

Ｃｈｉｒａｌｃｅｌ　ＯＤＨ（２５０×４．６ｍｍ）５μｍ＝（１）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ　ＩＡ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（２）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ　ＩＧ（２５０×４．６ｍｍ）５μｍ＝（３）、Ｌｕｘ　Ａｍｙｌｏｓｅ－２（２５０×４．６ｍｍ）５μｍ＝（４）、Ｌｕｘ　Ｃｅｌｌｕｌｏｓｅ－２（２５０×４．６ｍｍ）５μｍ＝（５）、Ｃｈｉｒａｌｃｅｌ　ＯＸ－Ｈ（２５０×４．６ｍｍ）５μｍ＝（６）、Ｃｈｉｒａｌｐａｋ　ＩＣ（４．６×２５０ｍｍ）５μｍ＝（７）。

【０３２７】

パートＢ

ＴＲＰＭ３イオンチャネル駆動型Ｃａ２＋取り込みのモニタリング。

【０３２８】

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、硫酸プレグネノロン（ＰＳ）（５０μＭ）で刺激／開放し、Ca^{2+}流入をもたらした。

【０３２９】

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）との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。

【０３３０】

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のCa^{2+}アッセイ溶液を得た。細胞添加の直後に、プレートを、４８５ｎＭの励起及び５３５ｎＭでの放射によってＥｎｖｉｓｉｏｎ蛍光リーダー（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）上で読み取った。

【０３３１】

チャネル阻害は、非ＰＳ刺激対照と、ＰＳ（５０μＭ）及びビヒクルで刺激された条件を比較して計算された。この活性を阻害する本発明の化合物の能力は、以下のように決定された：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。

【０３３２】

試験した実施例の化合物００１～２６２の活性を以下の表に示す。試験した全ての化合物は、Ｆｌｕｏ－４　ＡＭアッセイにおいて活性を示す。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８－１】

化合物コード	IC50	化合物コード	IC50	化合物コード	IC50
化合物 001	B	化合物 100	B	化合物 178-En2	A
化合物 002-En1	C	化合物 101	B	化合物 179-En1	B
化合物 002-En2	B	化合物 102	C	化合物 179-En2	A
化合物 003-En1	A	化合物 103	B	化合物 180-En1	A
化合物 003-En2	B	化合物 104	C	化合物 180-En2	B
化合物 004	B	化合物 105	B	化合物 181-En1	C
化合物 005	B	化合物 106	B	化合物 181-En2	B
化合物 006	C	化合物 107	B	化合物 182-En1	A
化合物 007	A	化合物 108	B	化合物 182-En2	A
化合物 008	B	化合物 109	B	化合物 183-En1	A
化合物 009	B	化合物 110	B	化合物 183-En2	B
化合物 010-Dia1	B	化合物 111	C	化合物 184-En1	B
化合物 010-Dia2	B	化合物 112	C	化合物 184-En2	B
化合物 011-Dia1	B	化合物 113	B	化合物 185-En1	B
化合物 011-Dia2	B	化合物 114	C	化合物 185-En2	A
化合物 012	B	化合物 115	B	化合物 186-En1	B
化合物 013	B	化合物 116	A	化合物 186-En2	B
化合物 014	B	化合物 117	C	化合物 187-En1	C
化合物 015	B	化合物 118	B	化合物 187-En2	B
化合物 016	A	化合物 119	B	化合物 188-En1	B
化合物 017	B	化合物 120	C	化合物 188-En2	A
化合物 018	B	化合物 121	A	化合物 189	A
化合物 019	C	化合物 122	B	化合物 190-En1	B
化合物 020	B	化合物 123	C	化合物 190-En2	A
化合物 021	A	化合物 124	C	化合物 191-En1	A
化合物 022	B	化合物 125	B	化合物 191-En2	A
化合物 023	B	化合物 126	B	化合物 192-En1	A
化合物 024	B	化合物 127	A	化合物 192-En2	A
化合物 025	A	化合物 128-En1	B	化合物 193-En1	B
化合物 026	A	化合物 128-En2	C	化合物 193-En2	C
化合物 027	B	化合物 129	B	化合物 194-En1	A
化合物 028	B	化合物 130	A	化合物 194-En2	A
化合物 029	B	化合物 131	B	化合物 195-En1	C
化合物 030	C	化合物 132-En1	B	化合物 195-En2	A
化合物 031	B	化合物 132-En2	B	化合物 196	B
化合物 032	B	化合物 133	C	化合物 197	B
化合物 033	B	化合物 134	B	化合物 198	B
化合物 034	B	化合物 135	B	化合物 199	C

【表８－２】

化合物 035	B	化合物 136	B		
化合物 036	B	化合物 137	A		
化合物 037	C	化合物 138	B		
化合物 038	B	化合物 139	B		
化合物 039	C	化合物 140	C		
化合物 040	B	化合物 141	A		
化合物 041	B	化合物 142	B		
化合物 042	B	化合物 143	A		
化合物 043	B	化合物 144	C		
化合物 044	B	化合物 145	B		
化合物 045	C	化合物 146	C		
化合物 046	B	化合物 147	B		
化合物 047	B	化合物 148	B		
化合物 048	B	化合物 149	A		
化合物 049	C	化合物 150	B		
化合物 050	B	化合物 151-En1	A		
化合物 051	B	化合物 151-En2	B		
化合物 052	B	化合物 152	B		
化合物 053	C	化合物 153	C		
化合物 054	B	化合物 154-En1	C		
化合物 055	B	化合物 154-En2	A		
化合物 056-Dia1	B	化合物 155-En1	C		
化合物 056-Dia2	C	化合物 155-En2	B		
化合物 057	B	化合物 156	B		
化合物 058	C	化合物 157-En1	B		
化合物 059	C	化合物 157-En2	A		
化合物 060	B	化合物 158-En1	B		
化合物 061	B	化合物 158-En2	C		
化合物 062	C	化合物 159-En1	B		
化合物 063	B	化合物 159-En2	A		
化合物 064	B	化合物 160-En1	B		
化合物 065	B	化合物 160-En2	A		
化合物 066	C	化合物 161-En1	A		
化合物 067	C	化合物 161-En2	C		
化合物 068	B	化合物 162-En1	B		
化合物 069	C	化合物 162-En2	A		
化合物 070	A	化合物 163-En1	A		
化合物 071	B	化合物 163-En2	B		
化合物 072	B	化合物 164-En1	B		
化合物 073	B	化合物 164-En2	B		
化合物 074	B	化合物 165-En1	B		
化合物 075	B	化合物 165-En2	C		

【表８－３】

化合物 076	B	化合物 166-En1	B		
化合物 077	B	化合物 166-En2	A		
化合物 078	B	化合物 167-En1	C		
化合物 079	C	化合物 167-En2	C		
化合物 080-Dia1	B	化合物 168-En1	B		
化合物 080-Dia2	C	化合物 168-En2	A		
化合物 081	B	化合物 169-En1	C		
化合物 082	B	化合物 169-En2	A		
化合物 083	B	化合物 170-En1	B		
化合物 084	B	化合物 170-En2	B		
化合物 085	B	化合物 171-En1	A		
化合物 086	B	化合物 171-En2	B		
化合物 087	B	化合物 172-En1	C		
化合物 088	C	化合物 172-En2	B		
化合物 089	A	化合物 173-En1	A		
化合物 090	B	化合物 173-En2	B		
化合物 091	B	化合物 174-En1	B		
化合物 092	B	化合物 174-En2	A		
化合物 093	B	化合物 175-En1	A		
化合物 094	B	化合物 175-En2	B		
化合物 095	B	化合物 176-En1	A		
化合物 096	B	化合物 176-En2	B		
化合物 097	A	化合物 177-En1	A		
化合物 098	B	化合物 177-En2	B		
化合物 099	A	化合物 178-En1	A		

【表９】

化合物コード	IC50
化合物 201-En1	A
化合物 201-En2	A
化合物 202-En1	A
化合物 202-En2	A
化合物 203-En1	A
化合物 203-En2	A
化合物 204	C
化合物 205	C
化合物 206	B
化合物 207	C
化合物 208	C
化合物 209	C
化合物 210	C
化合物 211-En1	B
化合物 211-En2	A
化合物 212-En1	B
化合物 212-En2	C
化合物 213-En1	B
化合物 213-En2	C
化合物 214-En1	C
化合物 214-En2	B
化合物 215-En1	C
化合物 215-En2	B
化合物 216-En1	C
化合物 216-En2	B
化合物 217	B
化合物 218	C
化合物 219	C
化合物 220-En1	C
化合物 220-En2	C

化合物コード	IC50
化合物 221-En1	B
化合物 221-En2	B
化合物 223-En1	C
化合物 223-En2	C
化合物 226-En1	A
化合物 226-En2	C
化合物 227-En1	A
化合物 227-En2	C
化合物 228-En1	A
化合物 228-En2	C
化合物 229-En1	B
化合物 229-En2	C
化合物 230-En1	C
化合物 230-En2	B
化合物 232-En1	B
化合物 232-En2	A
化合物 234	A
化合物 235-En1	C
化合物 235-En2	B
化合物 237-En1	B
化合物 237-En2	C
化合物 238-En1	B
化合物 238-En2	B
化合物 239-En1	C
化合物 239-En2	C
化合物 240-En1	C
化合物 240-En2	C
化合物 241-En1	B
化合物 241-En2	C

化合物コード	IC50
化合物 242	C
化合物 243-En1	C
化合物 243-En2	C
化合物 245-En1	C
化合物 245-En2	C
化合物 246-En1	C
化合物 246-En2	A
化合物 248-En1	C
化合物 248-En2	B
化合物 251-En1	C
化合物 251-En2	C
化合物 252-En1	C
化合物 252-En2	C
化合物 253-En1	A
化合物 253-En2	B
化合物 254-En1	B
化合物 254-En2	C
化合物 255-En1	B
化合物 255-En2	B
化合物 256	C
化合物 257	C
化合物 258-En1	B
化合物 258-En2	B
化合物 259	B
化合物 260	A
化合物 261	B
化合物 262	B

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 23/67443

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☒ Claims Nos.: 6-12, 15-17, 20, 23-29
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
(see supplemental page)

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
1, 5/1, 13 and 19

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

Form PCT/ISA/210 (continuation of first sheet (2)) (July 2022)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 23/67443

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC - INV. C07D 401/04, C07D 401/12 (2023.01)
ADD. A61K 31/437, A61P 29/00, A61P 25/08 (2023.01)

CPC - INV. C07D 401/04, C07D 401/12

ADD. A61K 31/437, A61P 29/00, A61P 25/08

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)
See Search History document

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
See Search History document

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5,684,003 A (Kikuchi et al.) 04 November 1997 (04.11.1997); col 20, ln 10-15	1, 5/1, 13, 19
A	Held et al. "Activation of TRPM3 by a potent synthetic ligand reveals a role in peptide release" PNAS. 02 March 2015 (02.03.2015) vol 112, pg. E1363-E1372; pg. E1363, abstract; pg. E1364, Fig. 1A	1, 5/1, 13, 19
A	US 2010/0016351 A1 (Nguyen et al.) 21 January 2010 (21.01.2010); para [0340]	1, 5/1, 13, 19
A	US 2014/0011840 A1 (Hydra Biosciences, Inc.) 09 January 2014 (09.01.2014); entire document	1, 5/1, 13, 19
P, A	WO 2022/112352 A1 (KATHOLIEKE UNIVERITEIT LEUVEN) 02 June 2022 (02.06.2022); entire document	1, 5/1, 13, 19

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"D" document cited by the applicant in the international application
"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
23 October 2023	JAN 30 2024
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. 571-273-8300	Authorized officer Karl Rodriquez Telephone No. PCT Helpdesk: 571-272-4300

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2022)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 23/67443

--continued from Box No. III--

This application contains the following inventions or groups of inventions which are not so linked as to form a single general inventive concept under PCT Rule 13.1. In order for all inventions to be searched, the appropriate additional search fees must be paid.

Group I+: Claims 1-5, 13-14, 18-19 and 21-22, directed to a compound of claim 1, formula I. The compound of claim 1 will be searched to the extent that it encompasses the first species of claim 1, represented by a compound of formula I wherein R1 is F; Q is OR2; R2 is RY; T is O; U is CR5R5*; R5 and R5* are RY; R6, R7 and R8 are F; V is 3 membered unsubstituted, saturated heterocycloalkyl; RY is H (wherein optional groups are omitted). It is believed that claims 1, 5/1, 13 and 19 read on this first named invention, and thus these claims will be searched without fee. This first named invention has been selected based on the guidance set forth in section 10.54 of the PCT International Search and Preliminary Examination Guidelines. Applicant is invited to elect additional compounds of claim 1, wherein each additional compound elected will require one additional invention fee. Applicants must specify the claims that encompass any additionally elected compound. Applicants must further indicate, if applicable, the claims which encompass the first named invention, if different than what was indicated above for this group. Failure to clearly identify how any paid additional invention fees are to be applied to the '+' group(s) will result in only the first claimed invention to be searched. Additionally, an exemplary election wherein different actual variables are selected is suggested. An exemplary election would be a compound of formula I wherein R1 is RW; Q is OR2; R2 is RY; T is O; U is CR5R5*; R5 and R5* are RY; R6, R7 and R8 are F; V is 3 membered unsubstituted, saturated heterocycloalkyl; RW is C1 alkyl; RY is H (wherein optional groups are omitted) (i.e., claims 1, (4-5)/1, 13 and 19).

The group of inventions listed above do not relate to a single general inventive concept under PCT Rule 13.1 because, under PCT Rule 13.2, they lack the same or corresponding special technical features for the following reasons:

Special Technical Features:

Group I+ includes the technical feature of a unique compound of formula I, which is not required by any other invention of Group I+.

Common Technical Features:

The inventions of Groups I+ share the technical feature of a compound of formula I.

These shared technical features, however, do not provide a contribution over the prior art, as being anticipated by US 5,684,003 A to Kikuchi et al. (hereinafter Kikuchi). Kikuchi discloses a compound of formula I wherein R1 is RW, wherein RW is H; Q is OR2; R2 is RY wherein RY is H; T is O and U is CR5R5*; V is 6 membered unsubstituted aryl; R5 and R5* are RY wherein RY is H; R6, R7 and R8 are RW wherein RW is H (col 20, ln 10-15: 1H-Benzyloxyindazole-3-carboxylic acid) (drawn as a tautomer thereof - when R1 is H; structures are tautomeric).

As said compound was known in the art at the time of the invention, these cannot be considered special technical features that would otherwise unify the inventions of Groups I+. The inventions of Group I+ thus lack unity under PCT Rule 13.

Item 4 continued: Claims 6-12, 15-17, 20, 23-29 have been found to be unsearchable because they are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

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 403/14 (2006.01)	C07D	403/14	
C07D 405/14 (2006.01)	C07D	405/14	
C07D 405/12 (2006.01)	C07D	405/12	
C07D 401/12 (2006.01)	C07D	401/12	
C07D 413/12 (2006.01)	C07D	413/12	
C07D 413/14 (2006.01)	C07D	413/14	
C07D 487/04 (2006.01)	C07D	487/04	141
A61K 31/427(2006.01)	C07D	487/04	154
A61K 31/416(2006.01)	A61K	31/427	
A61K 31/4545(2006.01)	A61K	31/416	
A61K 31/4439(2006.01)	A61K	31/4545	
A61K 31/5377(2006.01)	A61K	31/4439	
A61K 31/422(2006.01)	A61K	31/5377	
A61K 31/454(2006.01)	A61K	31/422	
A61K 31/444(2006.01)	A61K	31/454	
A61K 31/4985(2006.01)	A61K	31/444	
A61K 31/5517(2006.01)	A61K	31/4985	
A61P 25/04 (2006.01)	A61K	31/5517	
A61P 25/02 (2006.01)	A61P	25/04	
A61P 29/00 (2006.01)	A61P	25/02	
A61P 25/08 (2006.01)	A61P	29/00	
A61P 43/00 (2006.01)	A61P	25/08	
	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３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

(72)発明者 ファンヘルク，ジャン－クリストフ
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

(72)発明者 ライヒ，メラニー
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

(72)発明者 クリューガー，ゼバスティアン
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

(72)発明者 コークニ，モハメド
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

(72)発明者 フーツ，トーマス
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アー

ル・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン
(72)発明者　フリーンス，ヨーリス
ベルギー３０００ルーヴァン、ワーイストラート６－ブス５１０５、カーユー・ルーヴァン・アール・アンド・ディ、カトリーケ・ユニフェルシテイト・ルーヴァン

Ｆターム（参考）　4C086　AA01 AA02 AA03 BC37 BC38 BC73 BC82 CB05 CB11 GA02
GA07 GA08 GA09 GA10 GA12 MA01 MA04 NA14 ZA06 ZA08 ZA21
ZC41