(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7349981号
(P7349981)

(45)発行日　令和5年9月25日(2023.9.25)

(24)登録日　令和5年9月14日(2023.9.14)

(51)国際特許分類

Ｃ０７Ｃ　381/10　(2006.01)	Ｃ０７Ｃ	381/10
Ａ６１Ｋ　31/18　(2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/18
Ａ６１Ｋ　31/381 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/381
Ａ６１Ｋ　31/416 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/416
Ａ６１Ｋ　31/426 (2006.01)	Ａ６１Ｋ	31/426

ＦＩ　ＣＳＰ

請求項の数　15　（全645頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2020-502955(P2020-502955)
(86)(22)出願日　平成30年7月23日(2018.7.23)
(65)公表番号　特表2020-528889(P2020-528889A)
(43)公表日　令和2年10月1日(2020.10.1)
(86)国際出願番号　PCT/US2018/043330
(87)国際公開番号　WO2019/023145
(87)国際公開日　平成31年1月31日(2019.1.31)
審査請求日　令和3年7月21日(2021.7.21)
(31)優先権主張番号　62/536,352
(32)優先日　平成29年7月24日(2017.7.24)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)
(31)優先権主張番号　62/573,935
(32)優先日　平成29年10月18日(2017.10.18)
最終頁に続く

(73)特許権者　504389991
ノバルティス アーゲー
スイス国 バーゼル リヒトシュトラーセ３５
(74)代理人　100092783
弁理士　小林 浩
(74)代理人　100095360
弁理士　片山 英二
(74)代理人　100120134
弁理士　大森 規雄
(74)代理人　100135943
弁理士　三橋 規樹
(74)代理人　100104282
弁理士　鈴木 康仁
(72)発明者　グリック，ギャリー
最終頁に続く

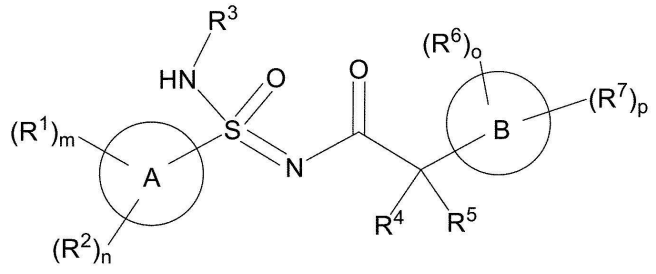
(54)【発明の名称】　ＮＬＲＰ活性に関連する状態を治療するための化合物及び組成物

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

式ＡＡ

【化１】



式 AA

（式中、

ｍ＝０、１、又は２であり；

ｎ＝０、１、又は２であり；

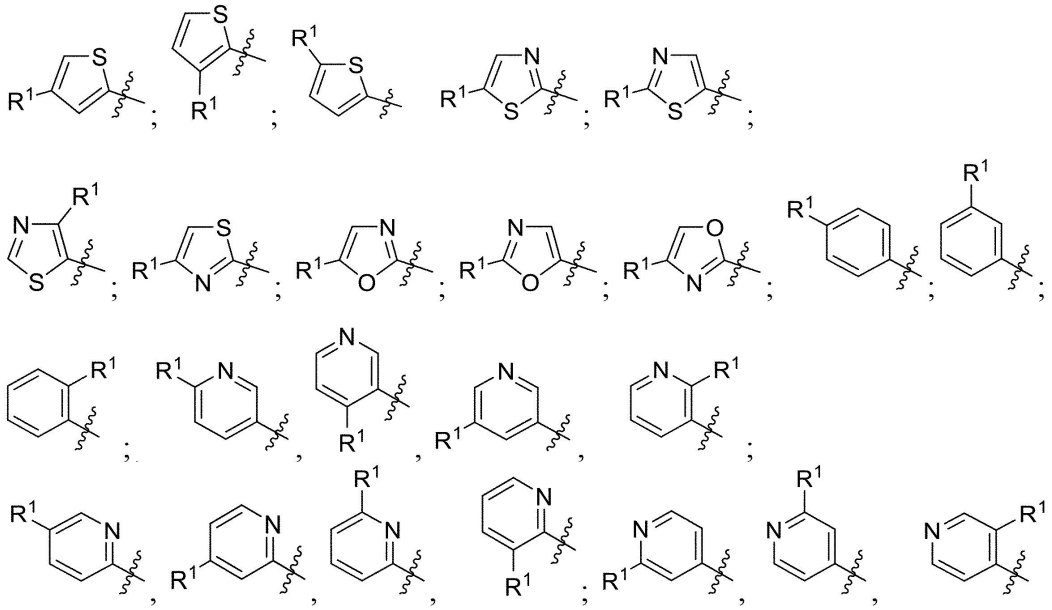
ｏ＝１又は２であり；

ｐ＝０、１、２、又は３であり、

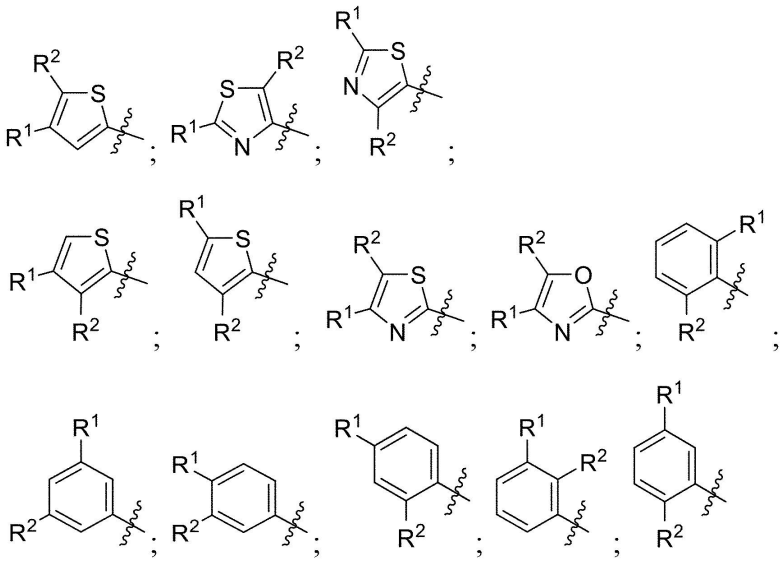
ここで、

Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたチオフェニル；
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたフェニル；
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたチアゾリル；
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたオキサゾリル；
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたピリジル；又は
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたピラゾリルであり；
Ｂは、フェニル、ピリジル又はピリミジニルであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、前記Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、前記Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する前記原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{5}$～Ｃ$_{8}$炭素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換され；
Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択され；
Ｒ^{8}及びＲ^{9}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{13}、ＣＯ$_{2}$Ｒ^{13}及びＣＯＮＲ^{11}Ｒ^{12}から選択され；ここで、前記Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はＲ^{8}及びＲ^{9}は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；
Ｒ^{13}は、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；
Ｒ^{11}及びＲ^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択され；
Ｒ^{3}は、水素である
の化合物、
又はその薬学的に許容される塩。
【請求項２】
Ａは、
１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置

換されたチオフェニル；
　１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたオキサゾリル；
　１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたチアゾリル；又は
　１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されたフェニル
のいずれか１つである、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
　ｍ＝１であり、ｎ＝０であり；任意選択的に、前記置換された環Ａは、
【化２】

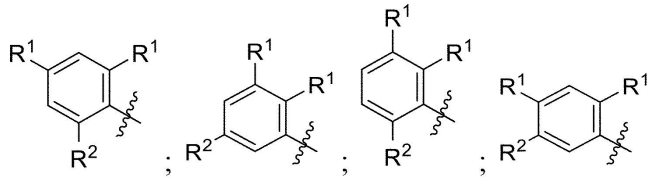


のいずれか１つである、請求項１又は２に記載の化合物。
【請求項４】
　ｍ＝１であり、ｎ＝１であり；任意選択的に、前記置換された環Ａは、
【化３】

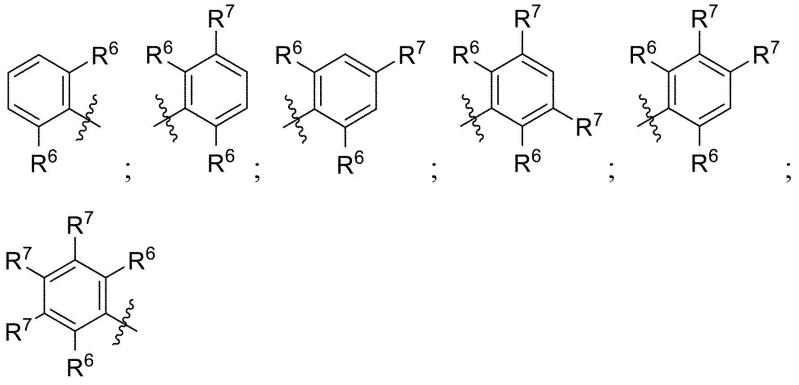


のいずれか１つである、請求項１又は２に記載の化合物。

【請求項５】
ｍ＝２であり、ｎ＝１であり；任意選択的に、前記置換された環Ａは、
【化４】

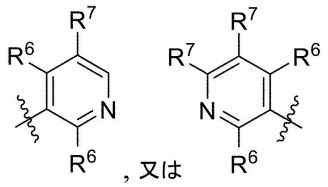


のいずれか１つである、請求項１又は２に記載の化合物。
【請求項６】
Ｒ^{1}は、１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}からなる群から選択される、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項７】
Ｒ^{2}は、フルオロ、クロロ、シアノ、メチル；メトキシ；エトキシ；イソプロピル；１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＰｈ；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}からなる群から選択される、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項８】
Ｂは、１つ又は２つのＲ^{6}で置換され、且つ１、２、又は３つのＲ^{7}で任意選択的に置換されたフェニルであり；任意選択的に、前記置換された環Ｂは、
【化５】



のいずれか１つである、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項９】
Ｂはピリジルであり；ｏ＝１又は２であり；ｐ＝０、１、又は２であり；任意選択的に、前記置換された環Ｂは、

【化６】



, 又は

である、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

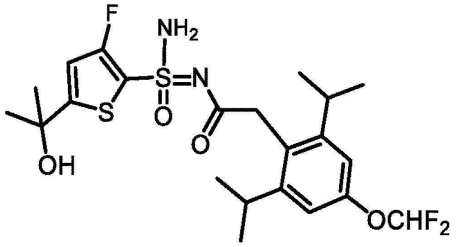
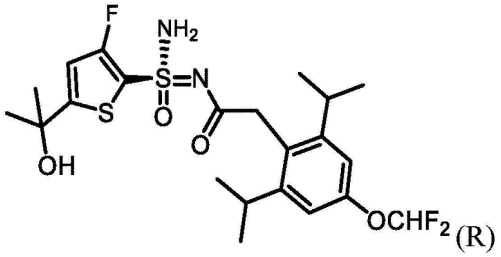
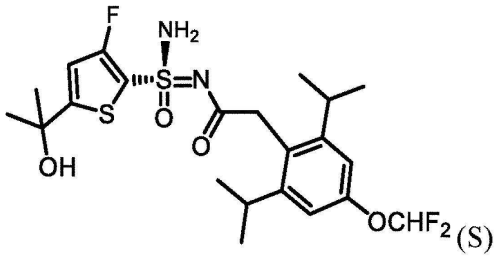
【請求項１０】

Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは水素である、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。

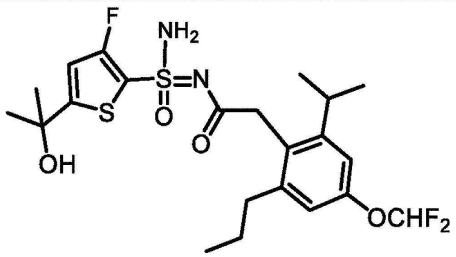
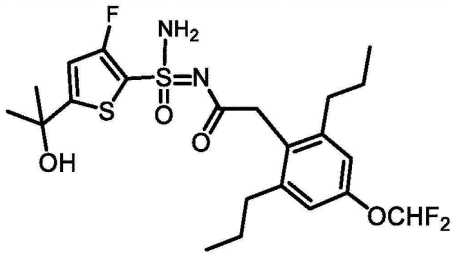
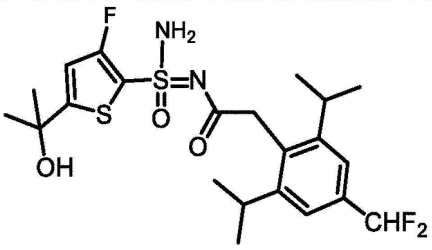
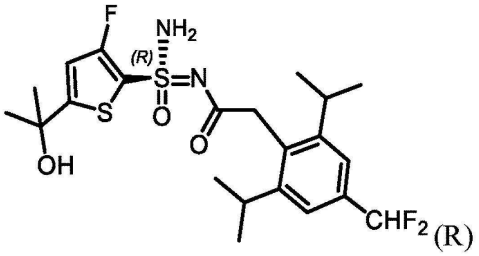
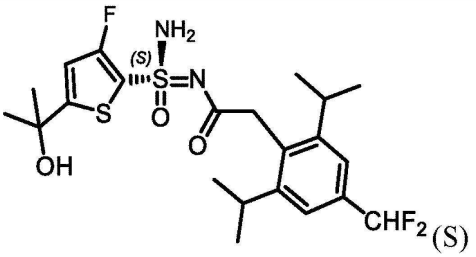
【請求項１１】

以下の化合物：

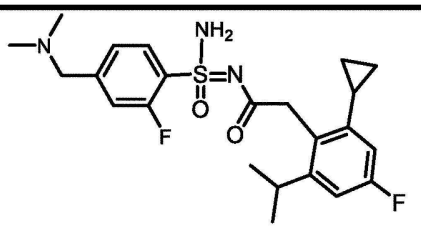
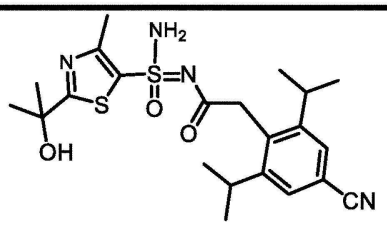
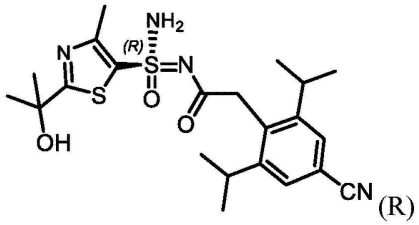
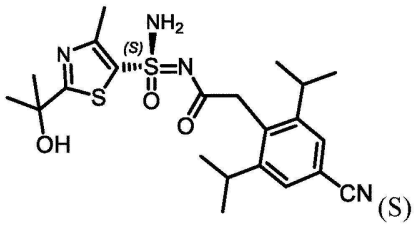
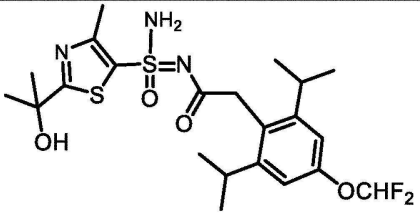
【表１】

化合物	構造
101	
101a	
101b	

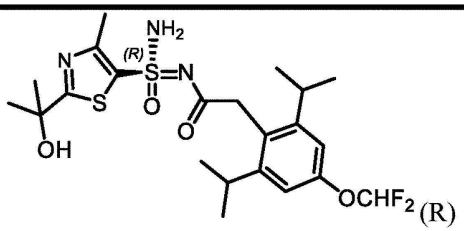
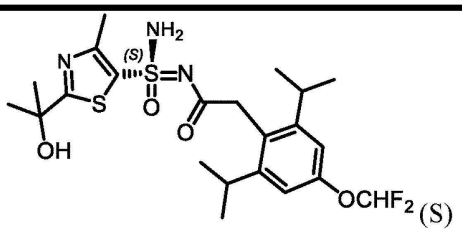
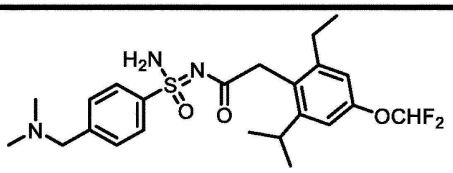
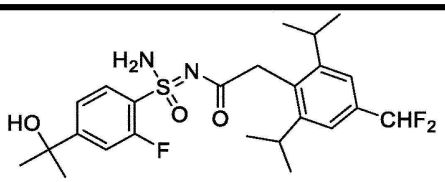
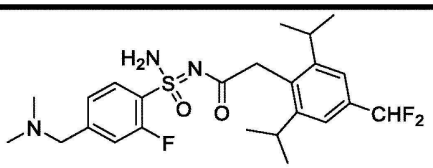
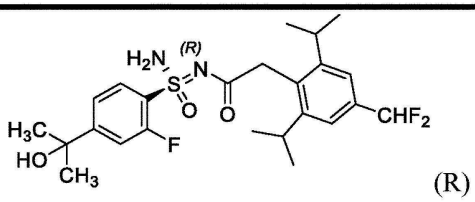
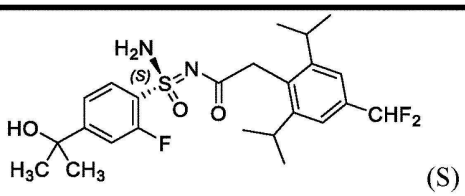
【表２】

102	
103	
104	
104a	
104b	

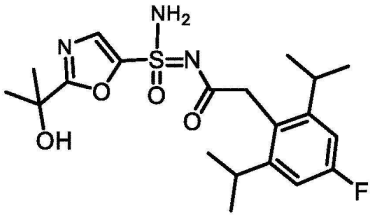
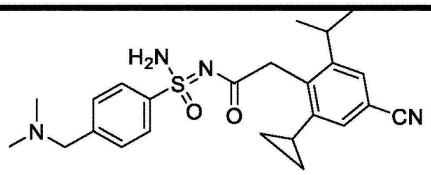
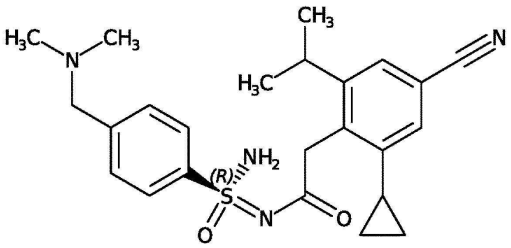
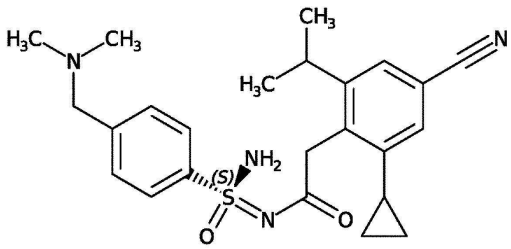
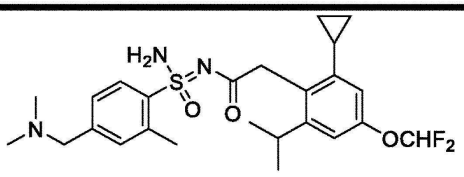
【表３】

105	
106	
106a	
106b	
107	

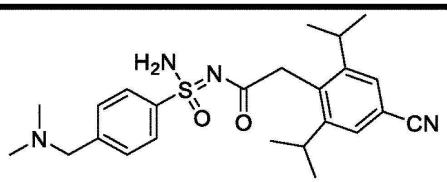
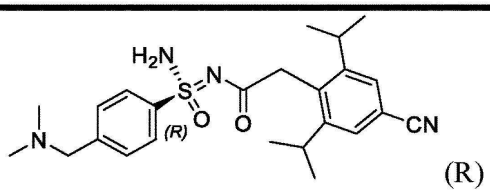
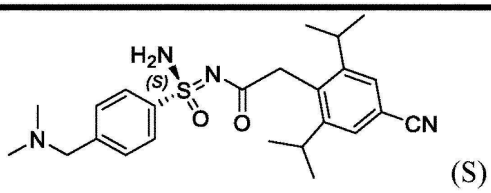
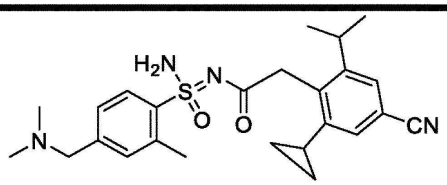
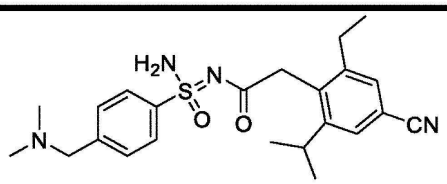
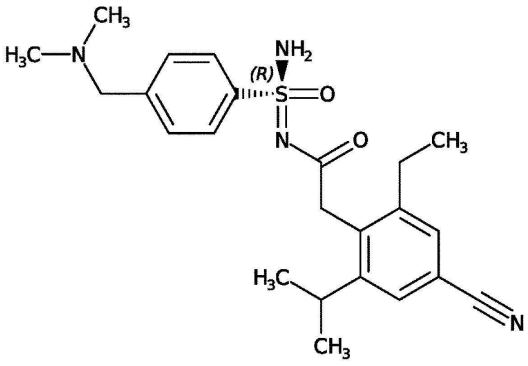
【表４】

107a	
107b	
108	
109	
110	
110a	
110b	

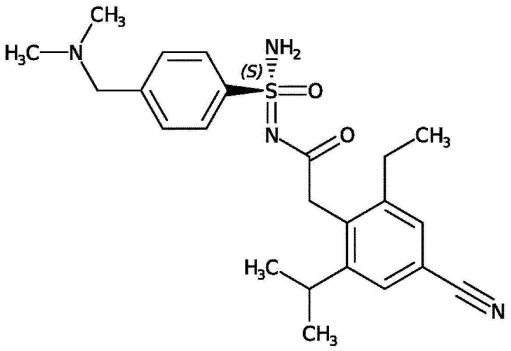
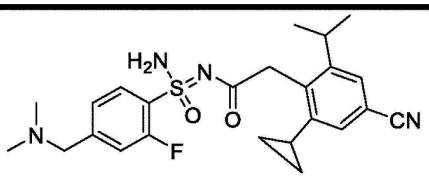
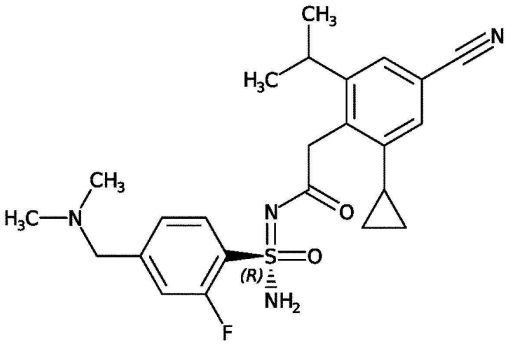
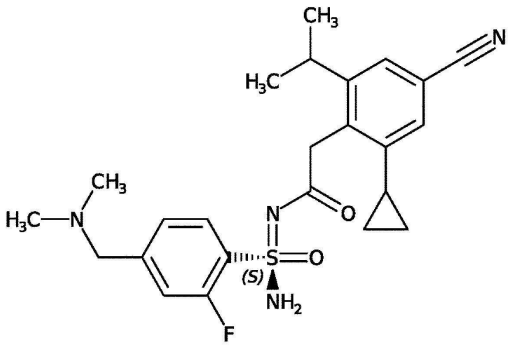
【表５】

111	
112	
112a	 (R)
112b	 (S)
113	

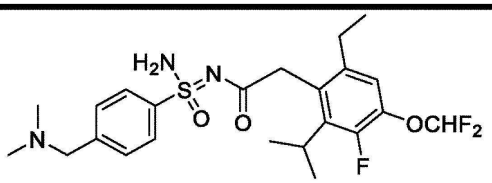
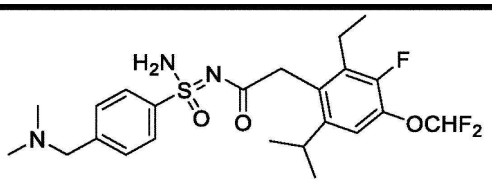
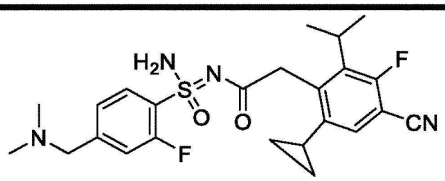
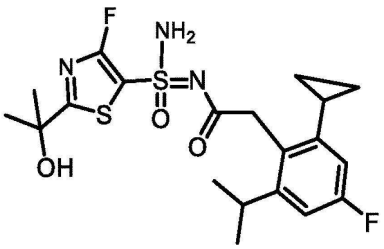
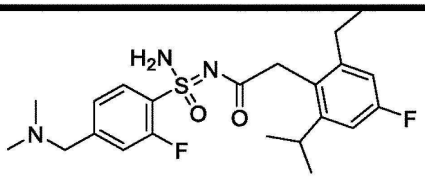
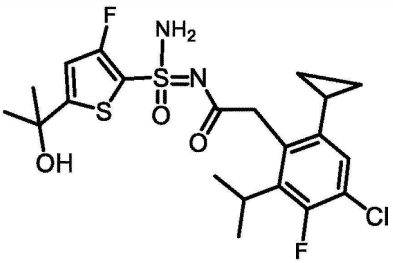
【表６】

114	
114a	 (R)
114b	 (S)
115	
116	
116a	 (R)

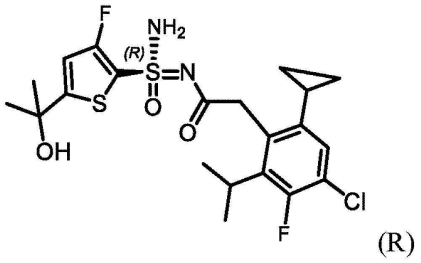
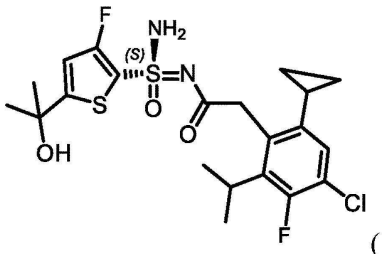
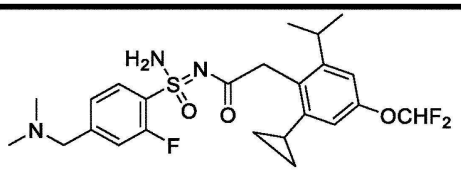
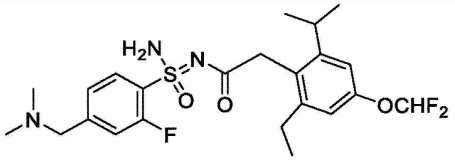
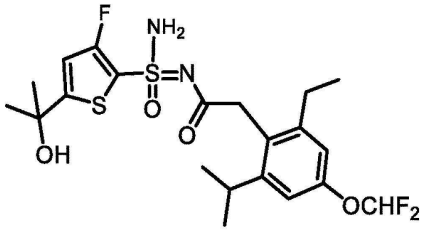
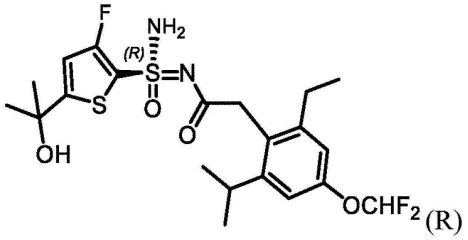
【表７】

116b	 (S)
117	
117a	 (R)
117b	 (S)

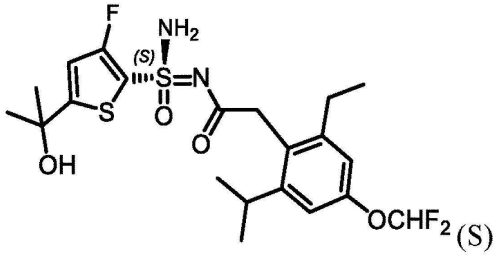
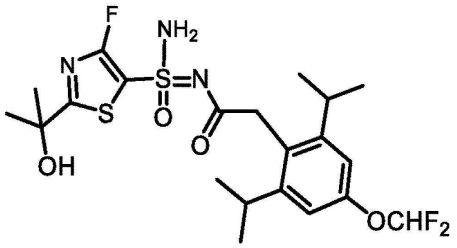
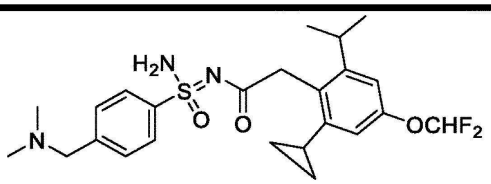
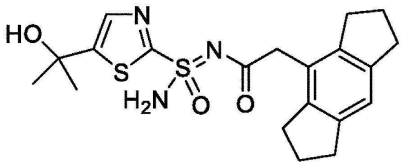
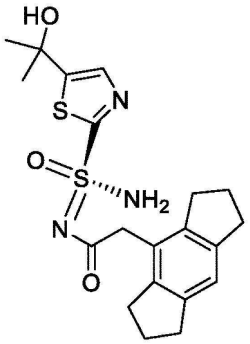
【表８】

118	
119	
120	
121	
122	
123	

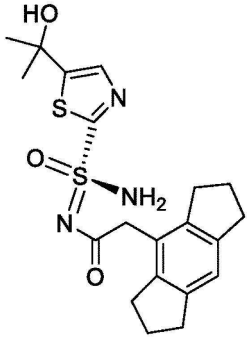
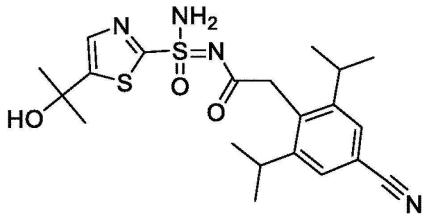
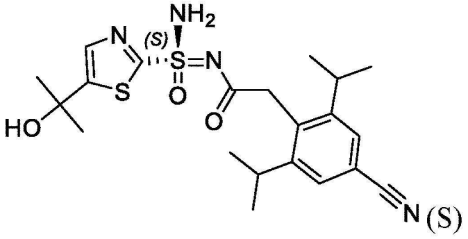
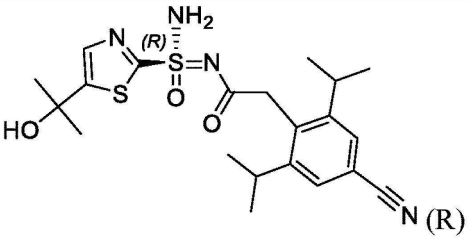
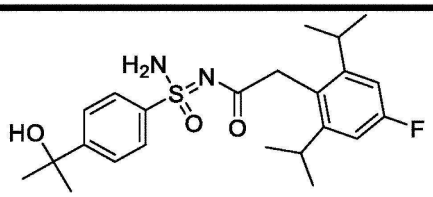
【表９】

123a	 (R)
123b	 (S)
124	
125	
126	
126a	 (R)

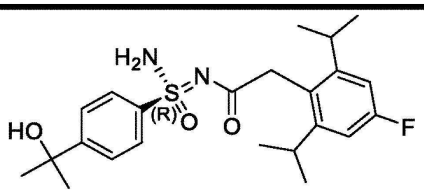
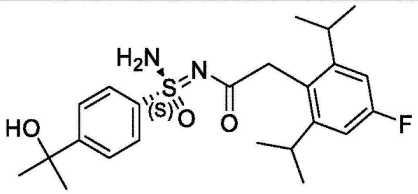
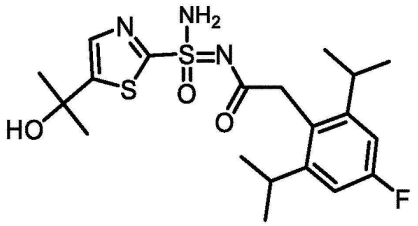
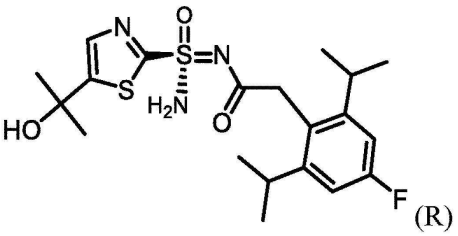
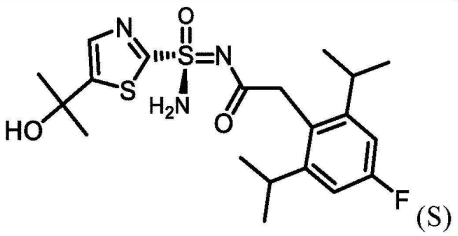
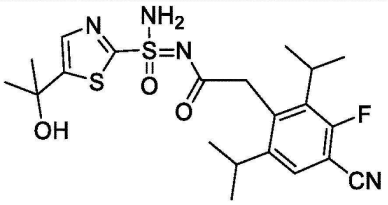
【表１０】

126b	
127	
128	
129	
129a	

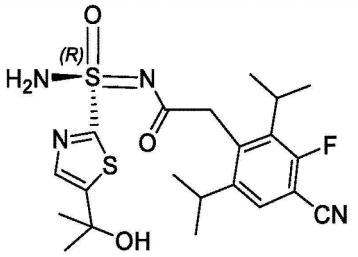
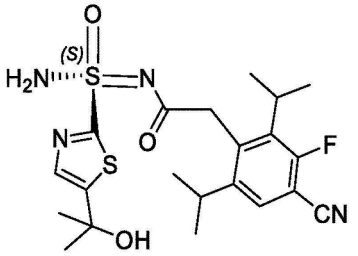
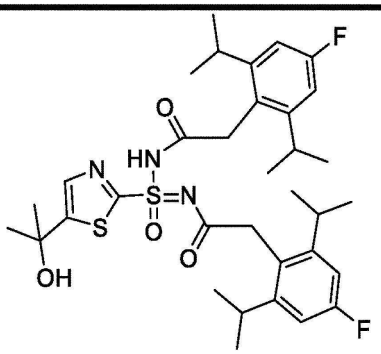
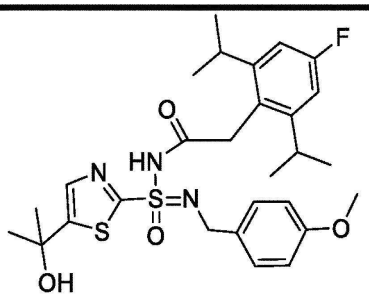
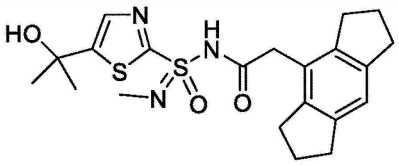
【表１１】

129b	
130	
130a	
130b	
131	

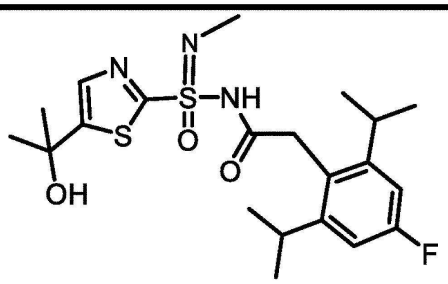
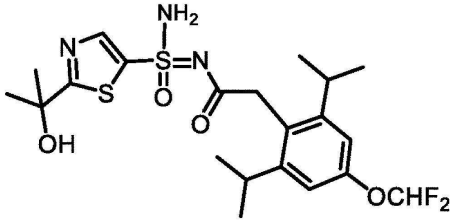
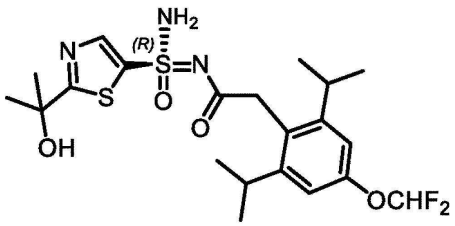
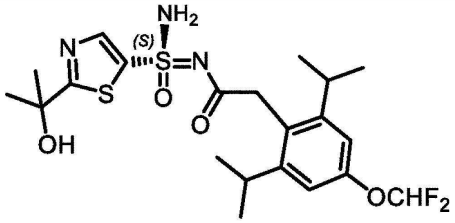
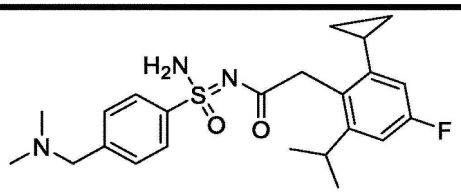
【表１２】

131a	
131b	
132	
132a	
132b	
133	

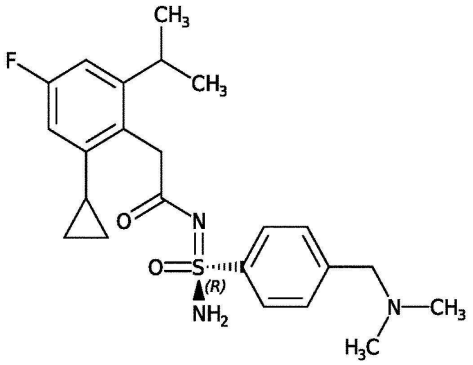
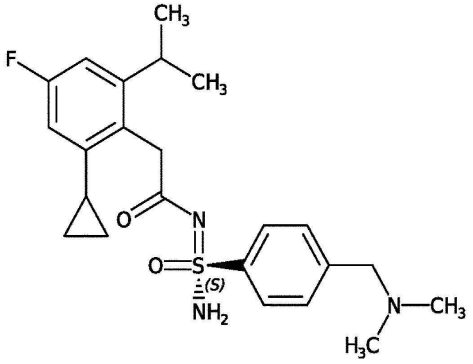
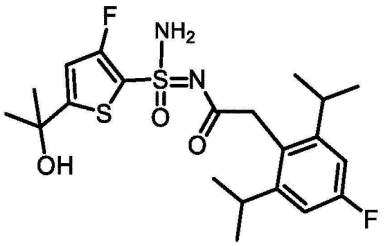
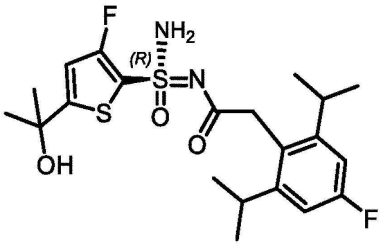
【表１３】

133a	
133b	
134	
135	
136	

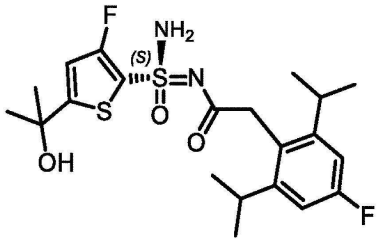
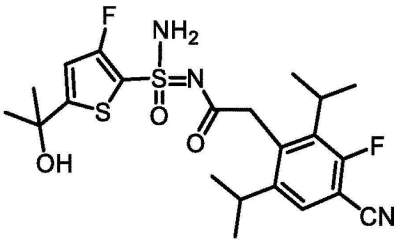
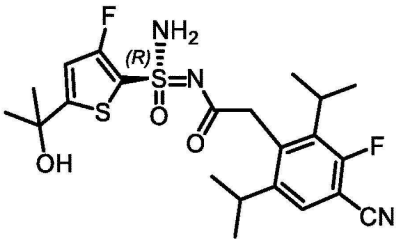
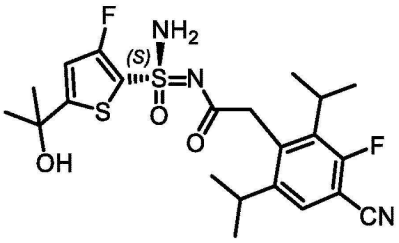
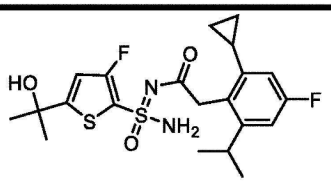
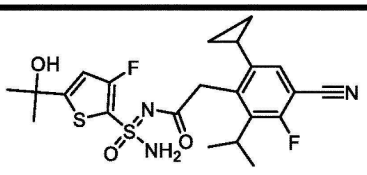
【表１４】

137	
138	
138a	
138b	
139	

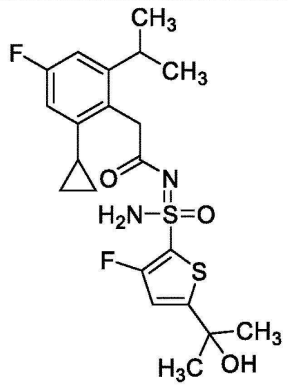
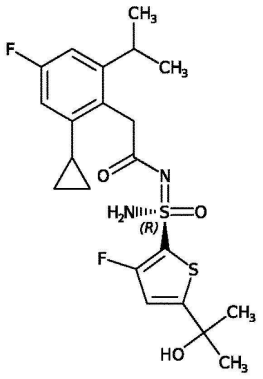
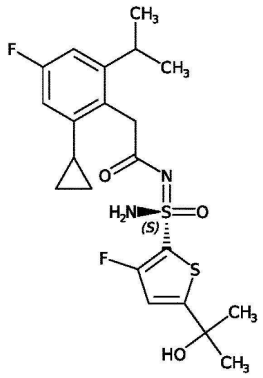
【表１５】

139a	
139b	
140	
140a	

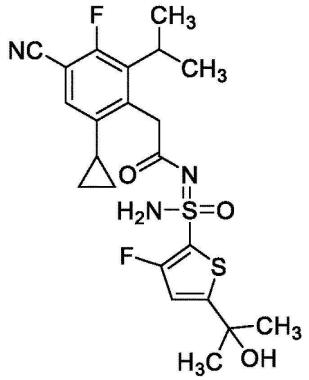
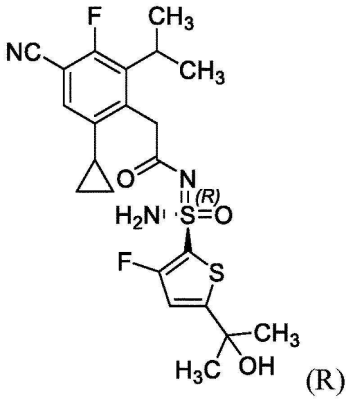
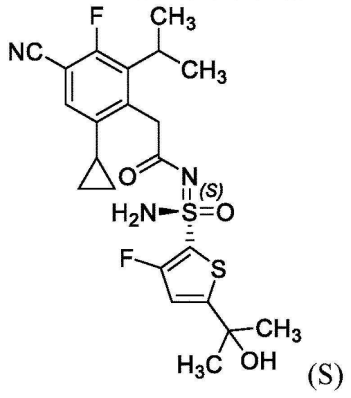
【表１６】

140b	
141	
141a	
141b	
142	
143	

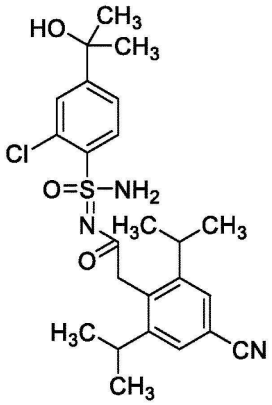
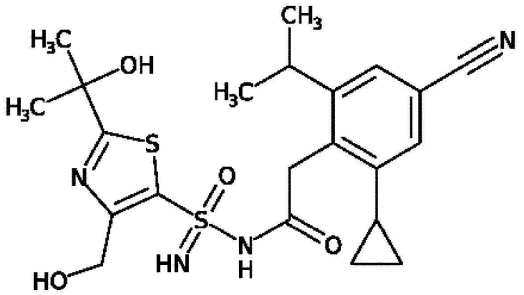
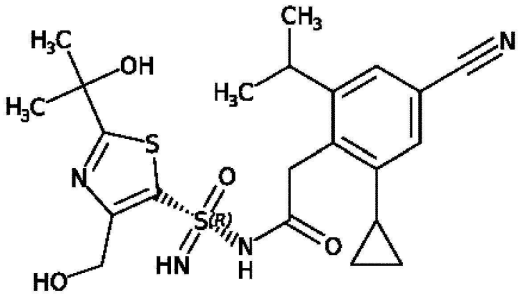
【表１７】

144	
144a	 (R)
144b	 (S)

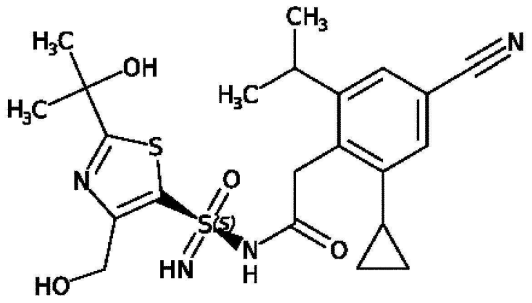
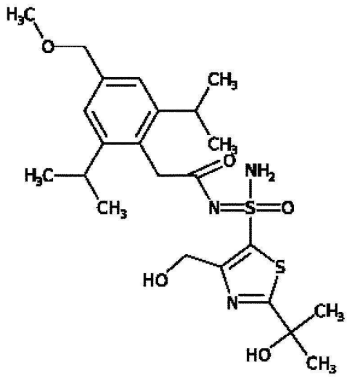
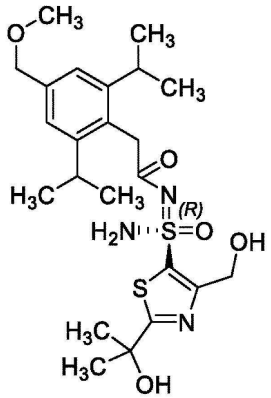
【表１８】

145	
145a	 (R)
145b	 (S)

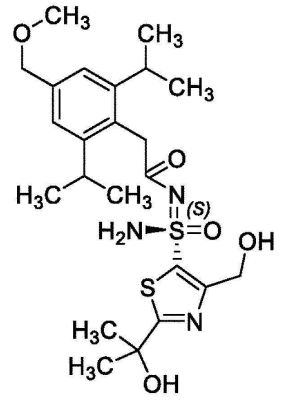
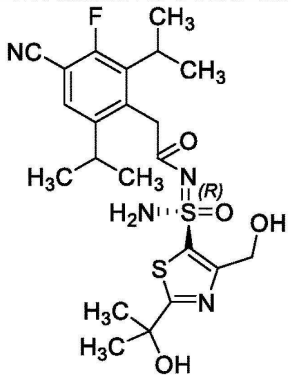
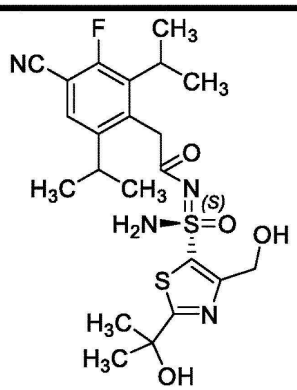
【表１９】

146	
147	
147a	

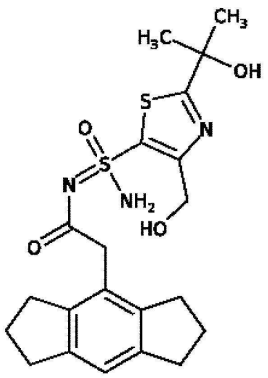
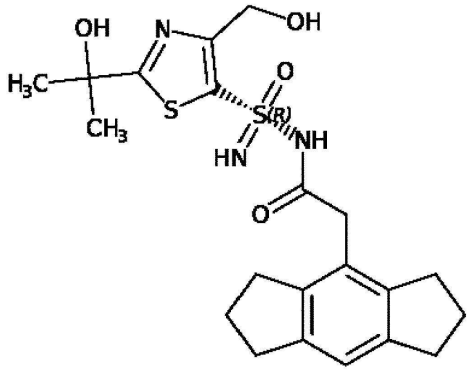
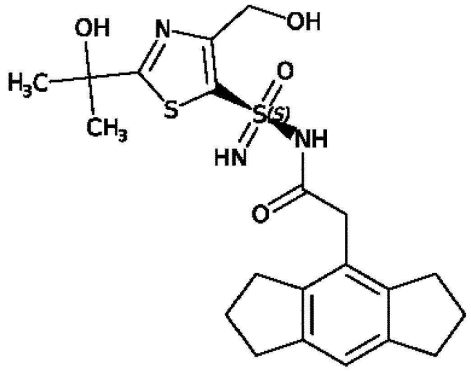
【表２０】

147b	
148	
148a	

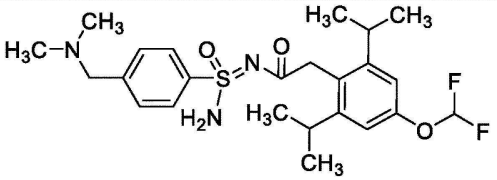
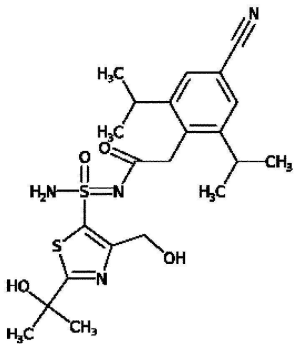
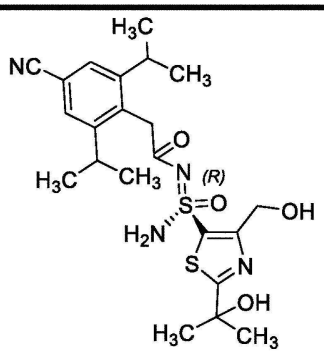
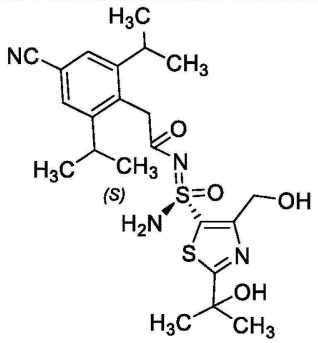
【表２１】

148b	
149a	
149b	

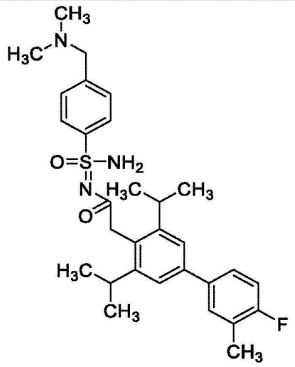
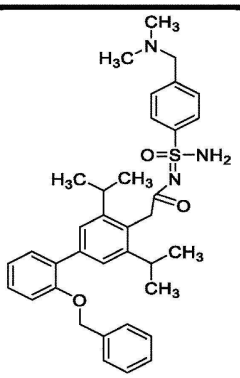
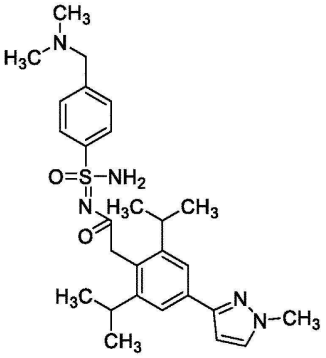
【表２２】

150	
150a	
150b	

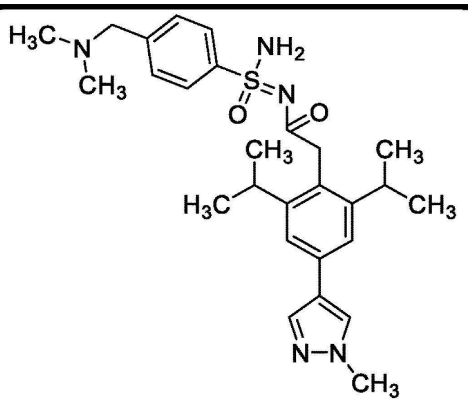
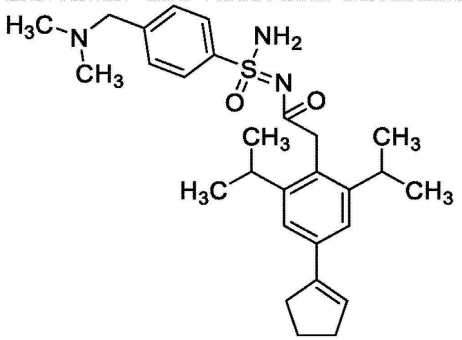
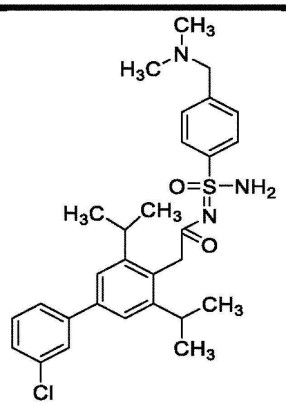
【表２３】

151	
152	
152a	
152b	

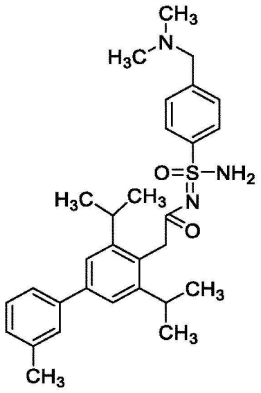
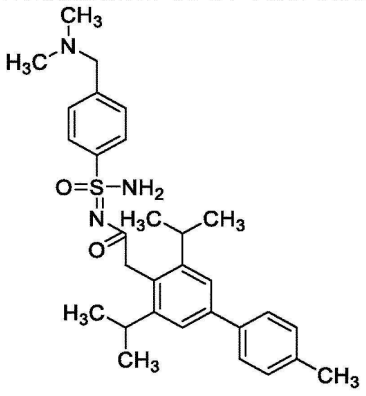
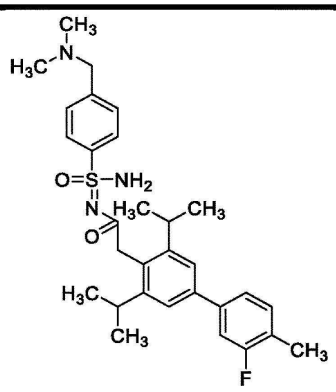
【表２４】

153	
154	
155	

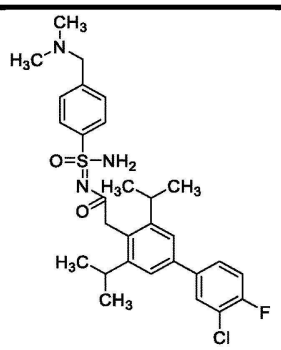
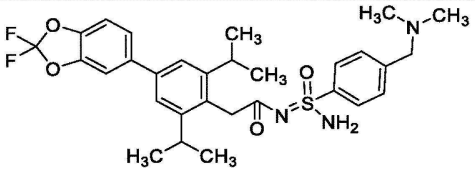
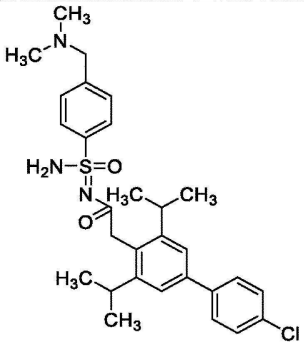
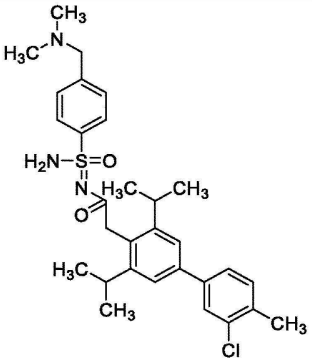
【表２５】

158	
159	
160	

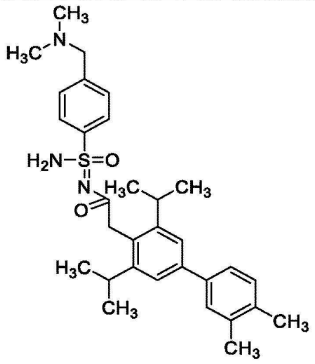
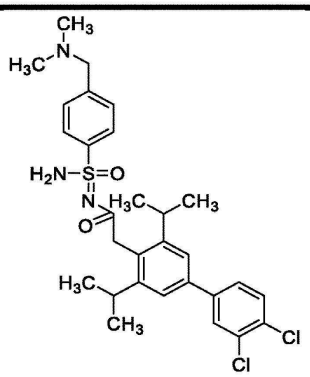
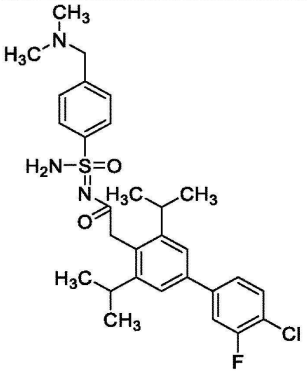
【表２６】

161	
162	
163	

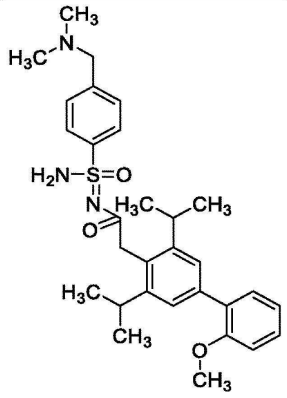
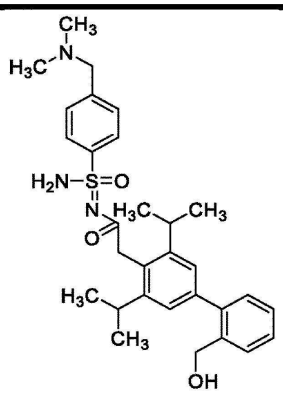
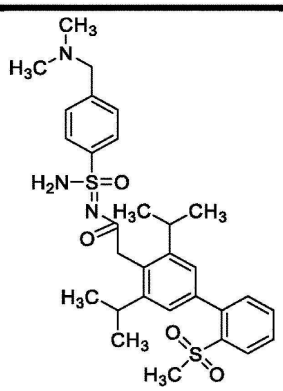
【表２７】

164	
165	
168	
169	

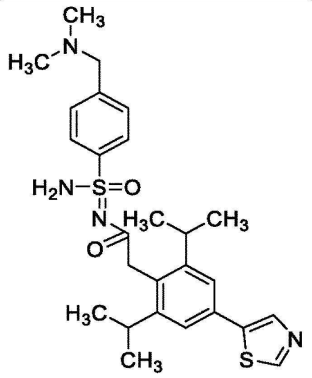
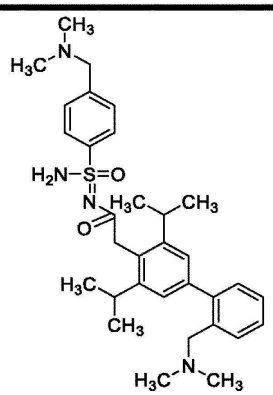
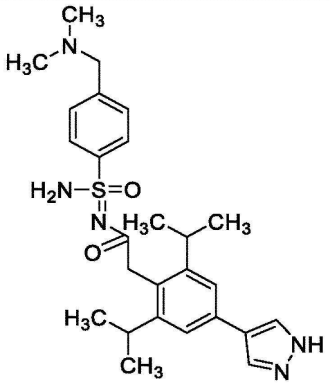
【表２８】

170	
171	
172	

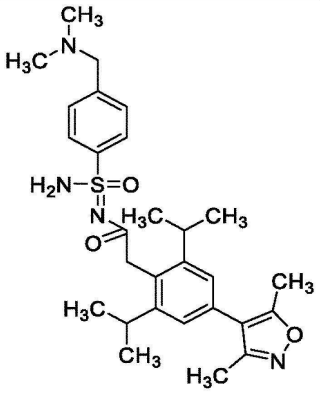
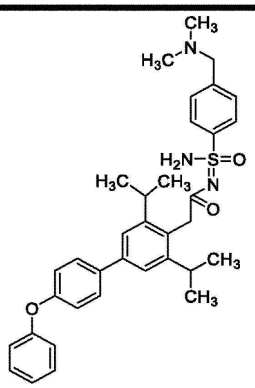
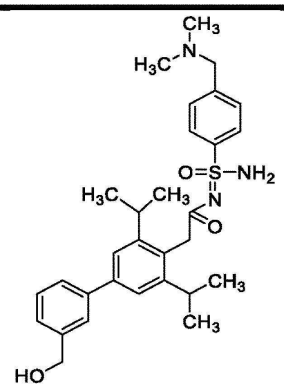
【表２９】

173	
176	
177	

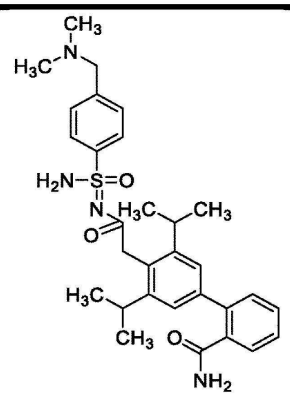
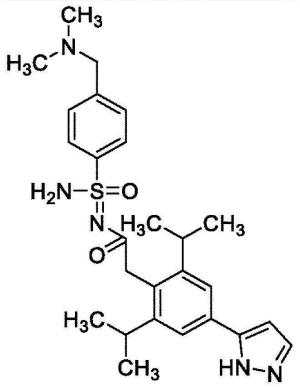
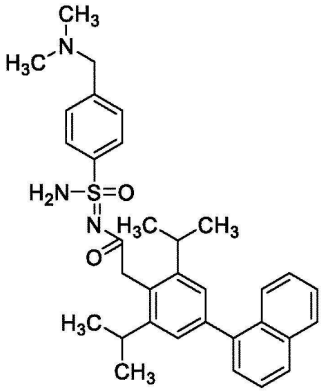
【表３０】

178	
180	
181	

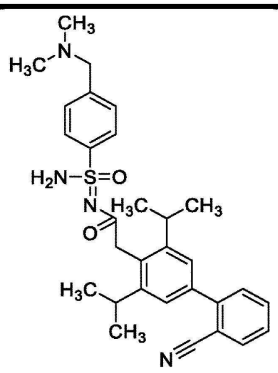
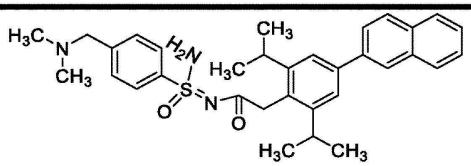
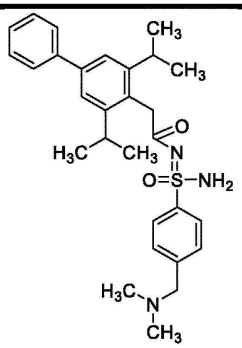
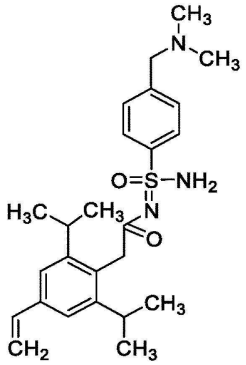
【表３１】

182	
183	
184	

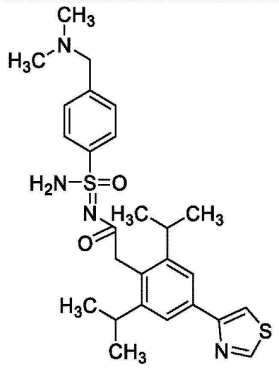
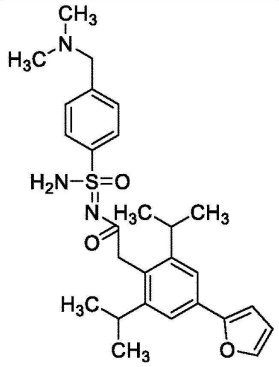
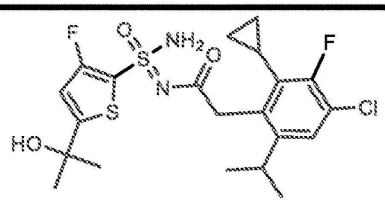
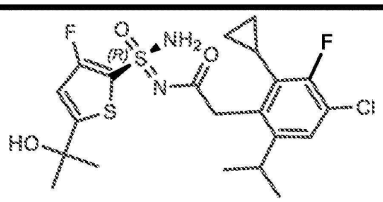
【表３２】

185	
186	
189	

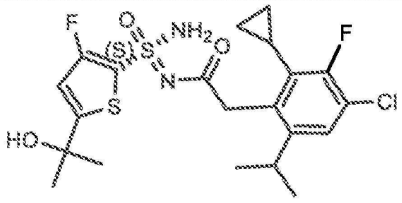
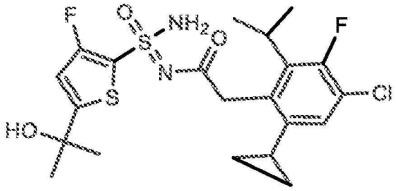
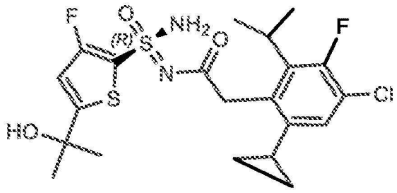
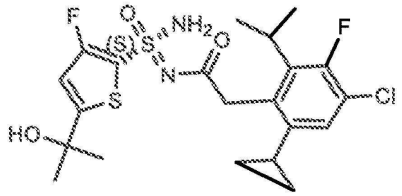
【表３３】

190	
191	
192	
194	

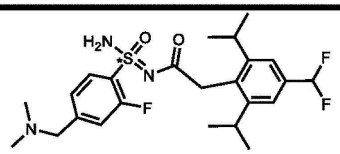
【表３４】

195	
196	
197	
197a	 (R)

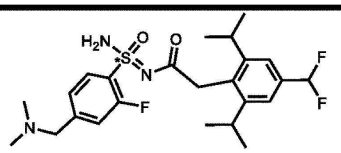
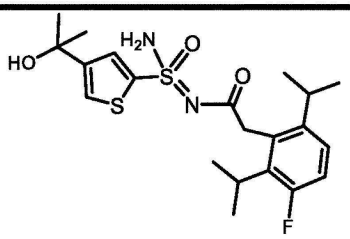
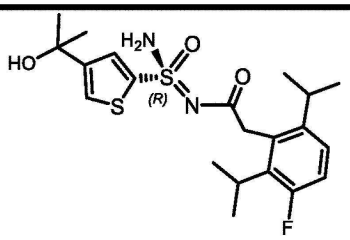
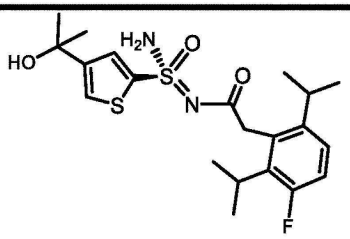
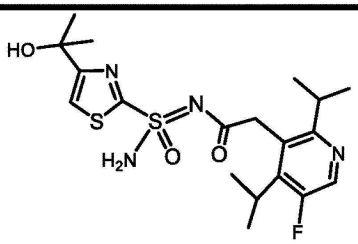
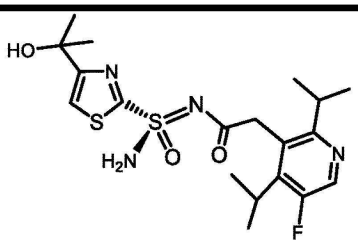
【表３５】

197b	 (S)
198	
198a	 (R)
198b	 (S)

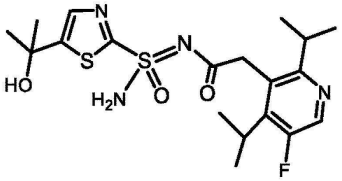
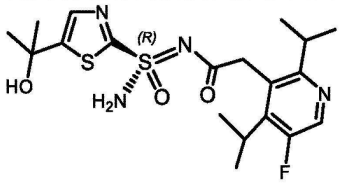
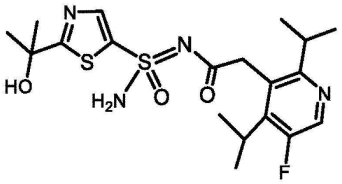
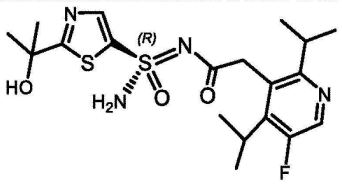
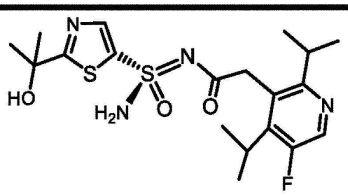
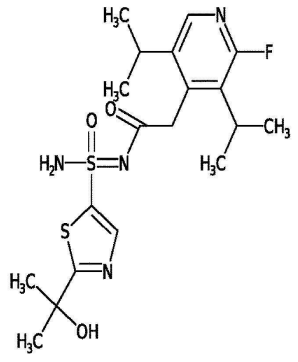
【表３６】

110a’	

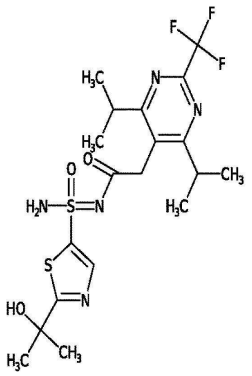
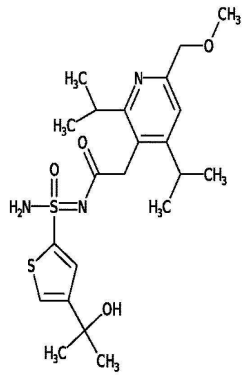
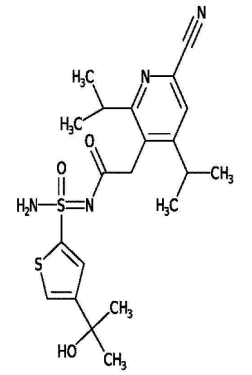
【表３７】

110b’	
201	
201b	
201a	
202	
202a	

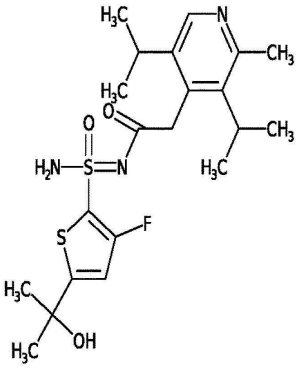
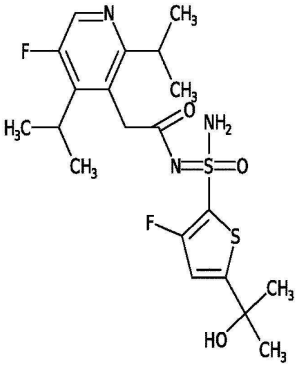
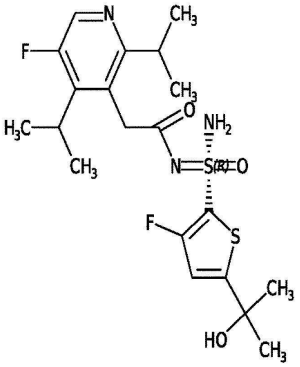
【表３８】

203	
203b	
204	
204b	
204a	
205	

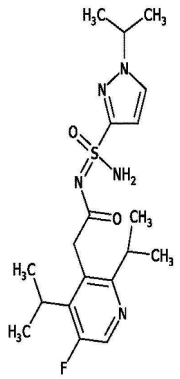
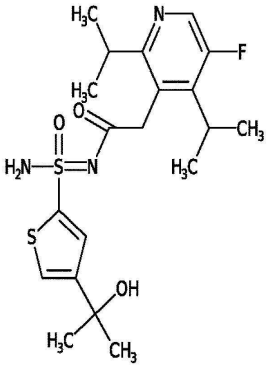
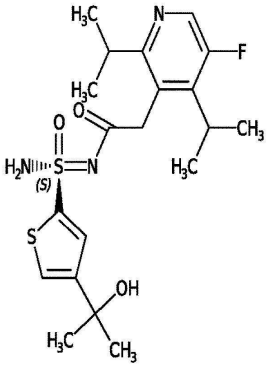
【表３９】

206	
207	
208	

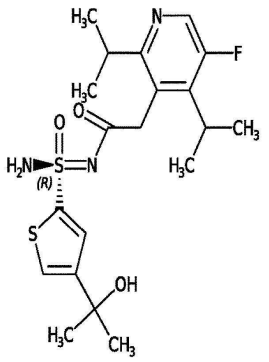
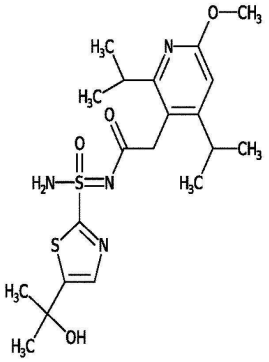
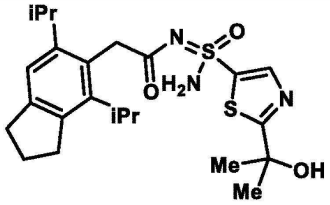
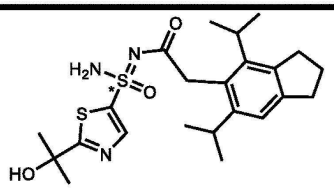
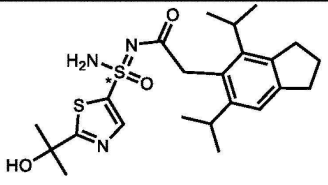
【表４０】

209	
210	
210b	

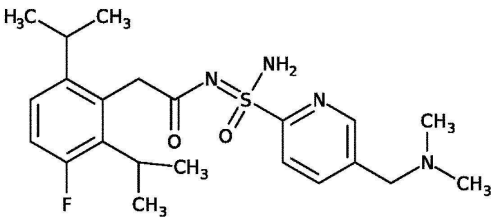
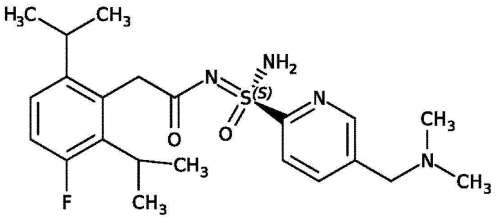
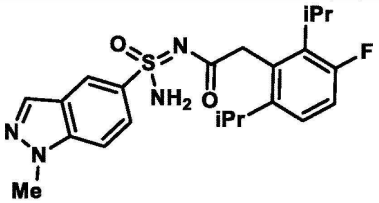
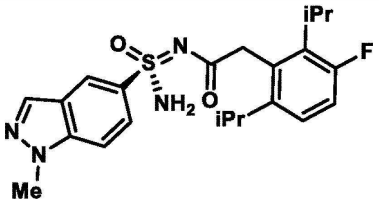
【表４１】

211	
213	
213a	

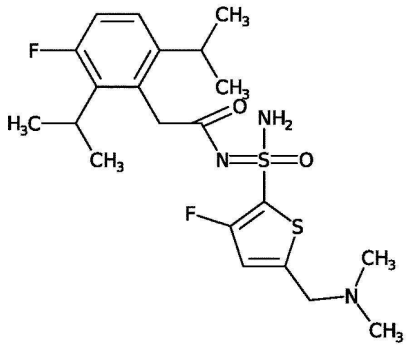
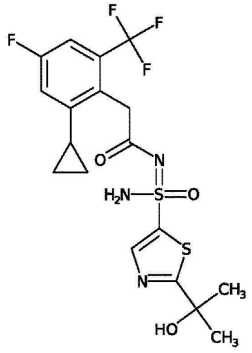
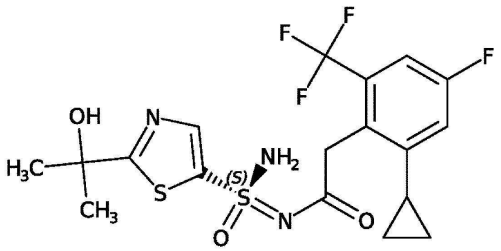
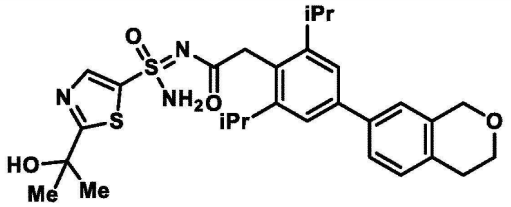
【表４２】

213b	
215	
216	
216a	
216b	

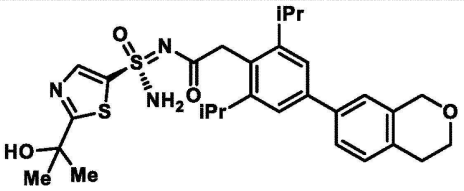
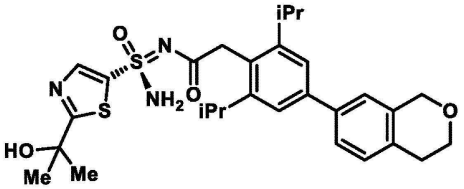
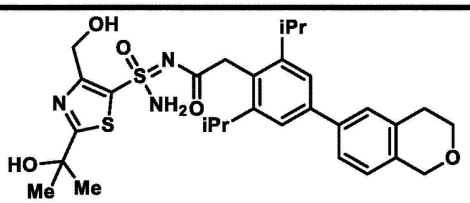
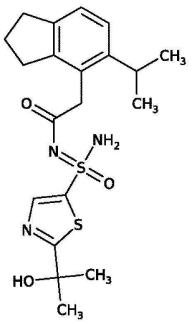
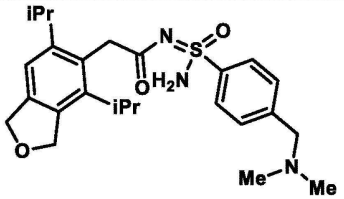
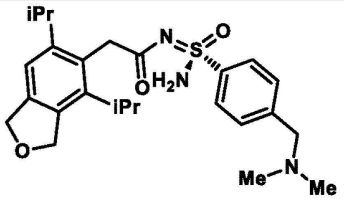
【表４３】

217	
217a	
218	
218a	

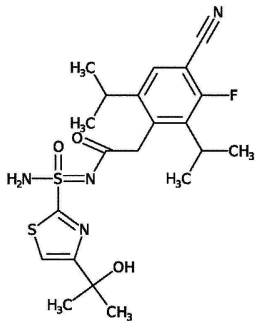
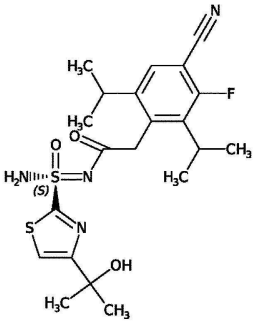
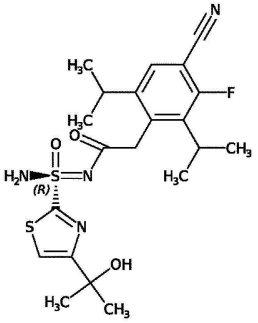
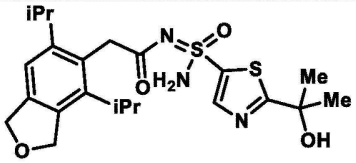
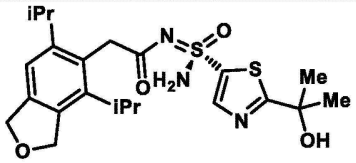
【表４４】

219	
220	
220a	
221	

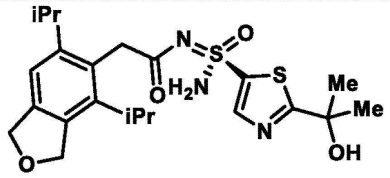
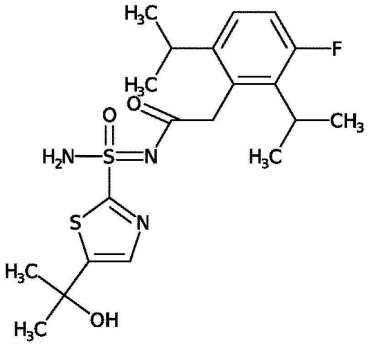
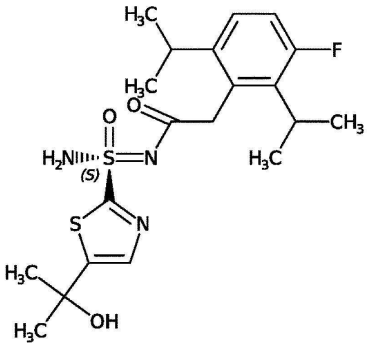
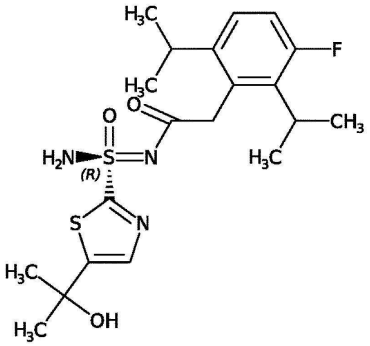
【表４５】

221a	
221b	
222	
224	
225	
225a	

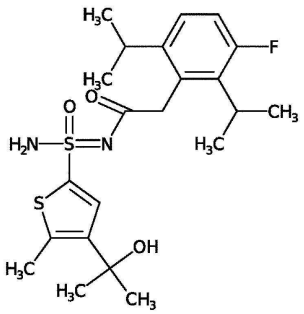
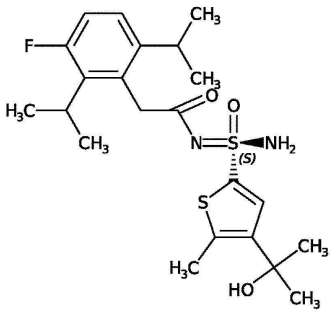
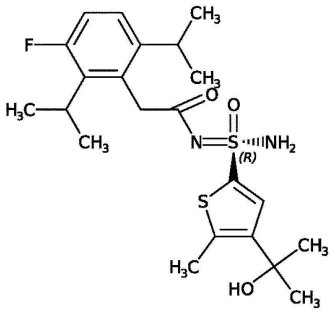
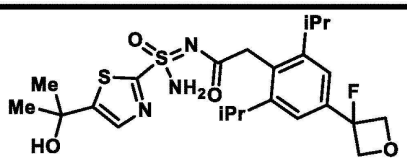
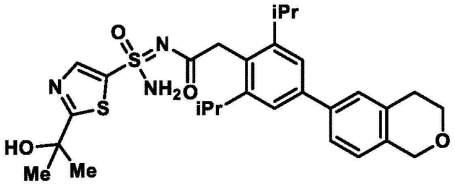
【表４６】

226	
226a	
226b	
227	
227a	

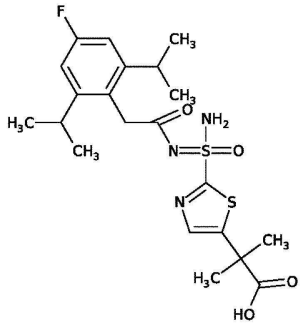
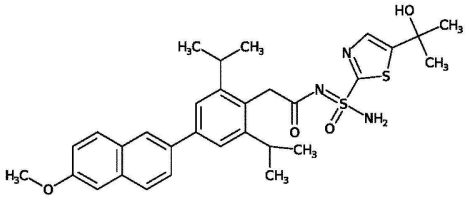
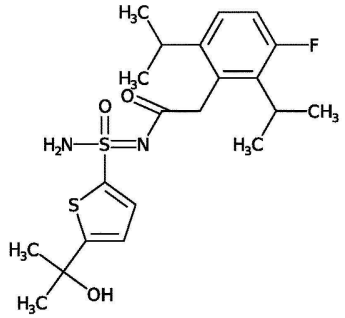
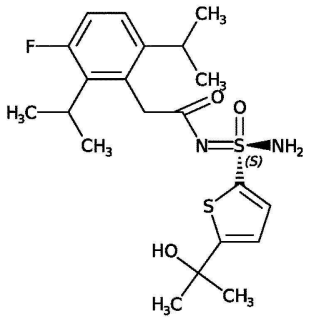
【表４７】

227b	
228	
228a	
228b	

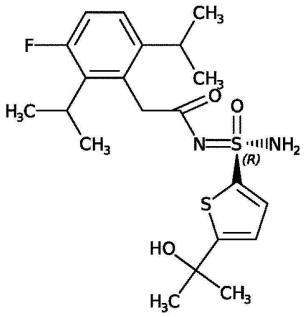
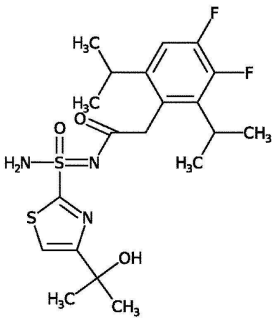
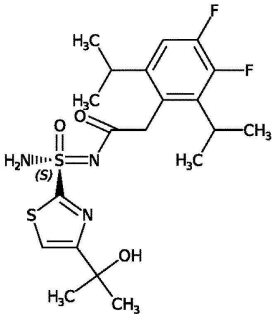
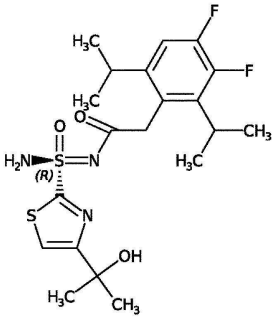
【表４８】

229	
229a	
229b	
230	
231	

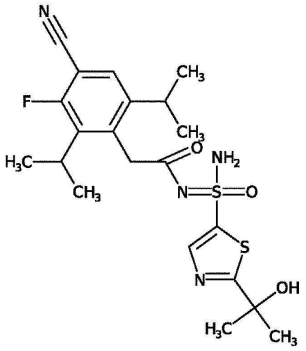
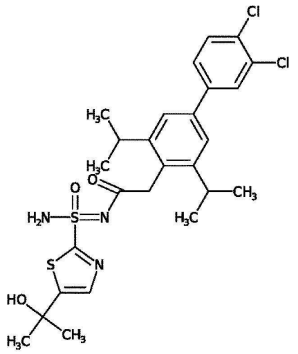
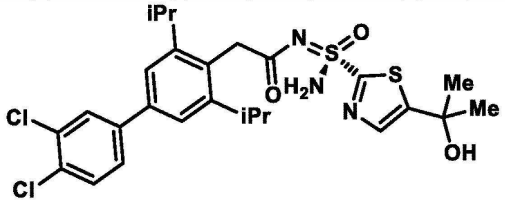
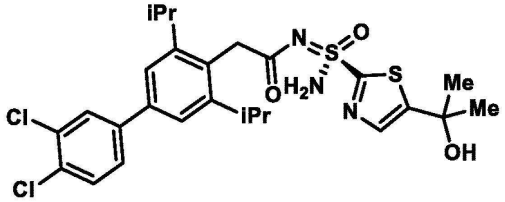
【表４９】

232	
233	
234	
234a	

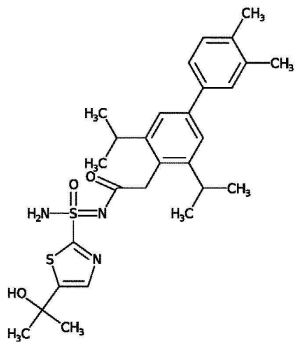
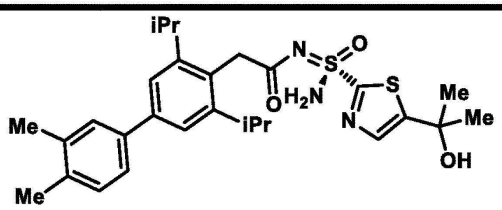
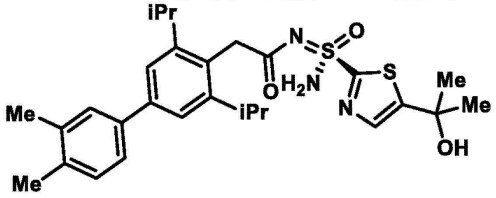
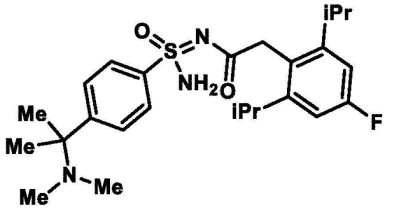
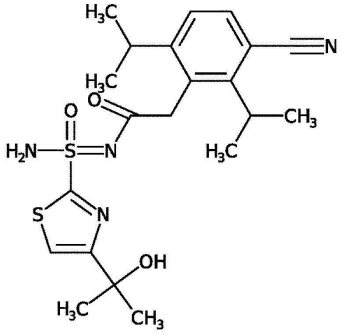
【表５０】

234b	
236	
236a	
236b	

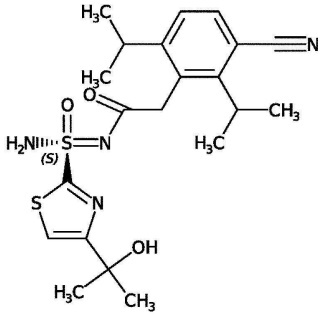
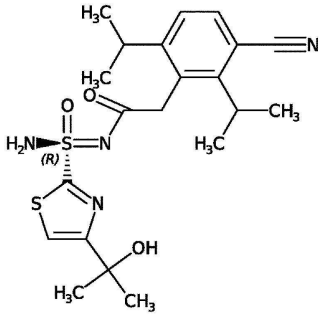
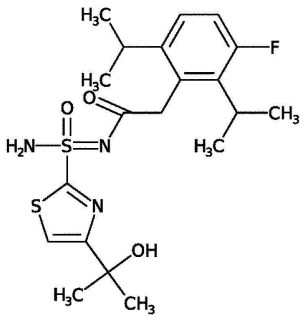
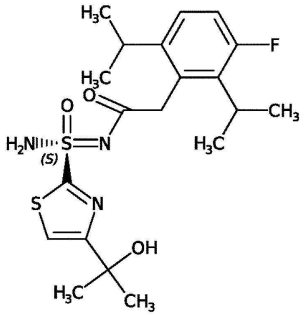
【表５１】

237	
238	
238a	
238b	

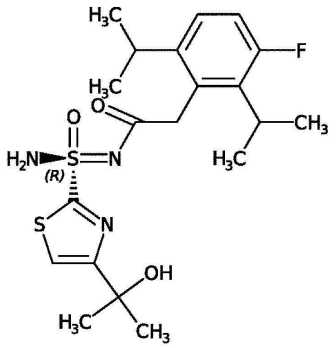
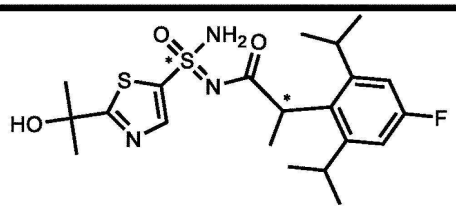
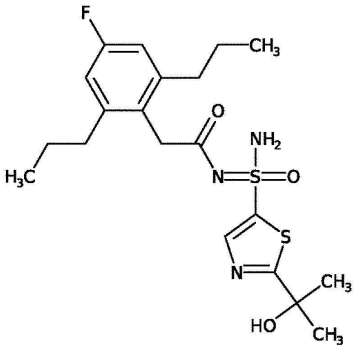
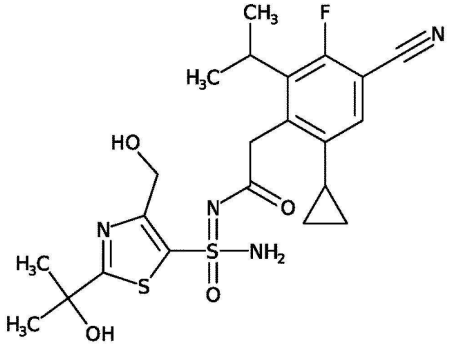
【表５２】

239	
239a	
239b	
241	
242	

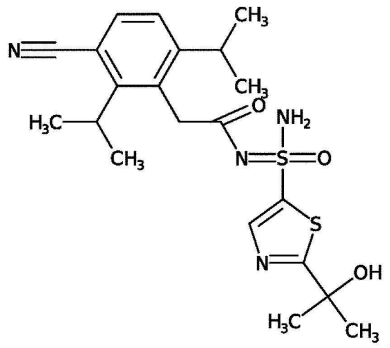
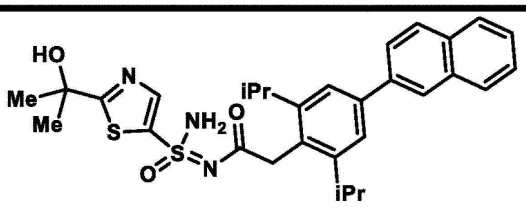
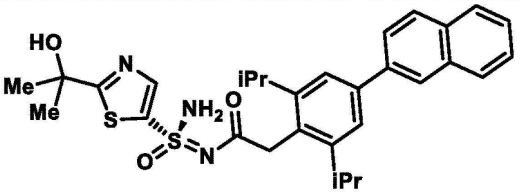
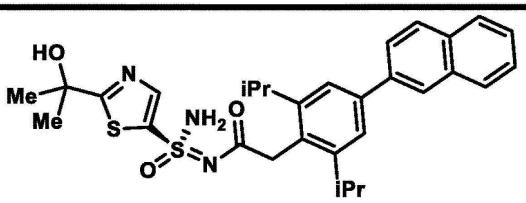
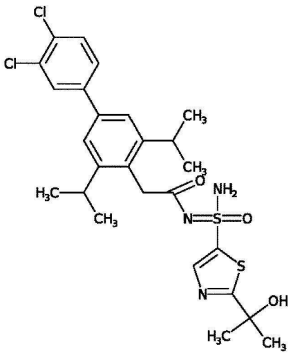
【表５３】

242a	
242b	
243	
243a	

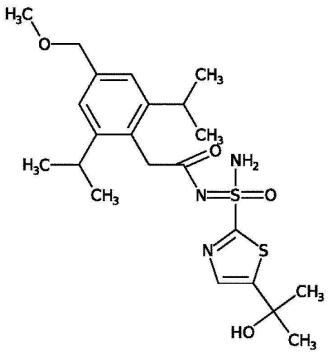
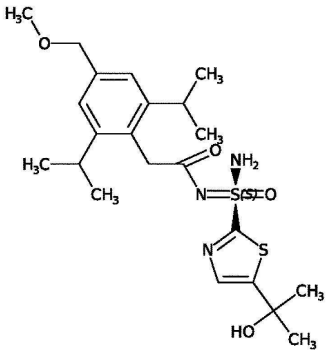
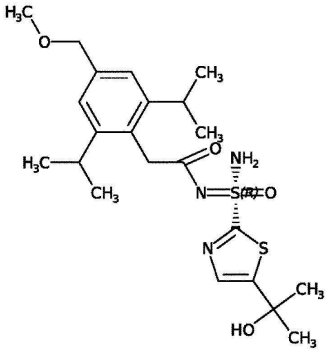
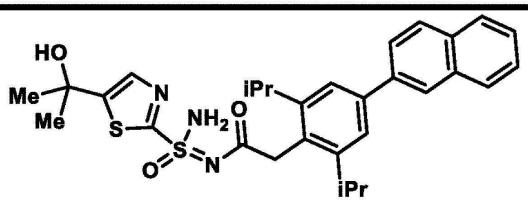
【表５４】

243b	
244ba	
245	
247	

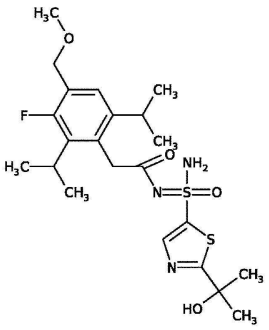
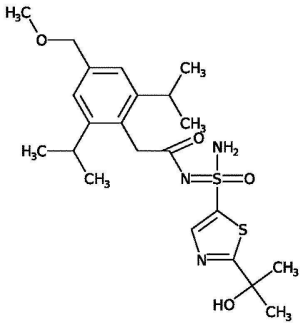
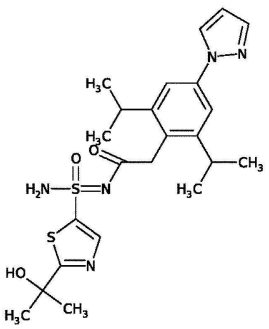
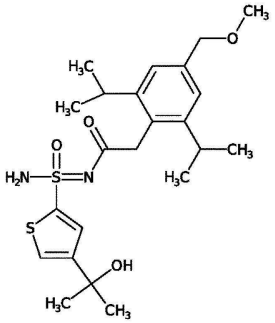
【表５５】

248	
249	
249a	
249b	
250	

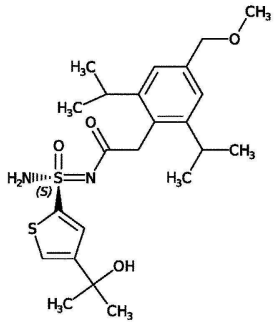
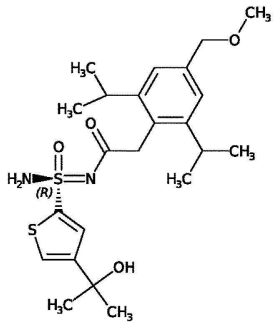
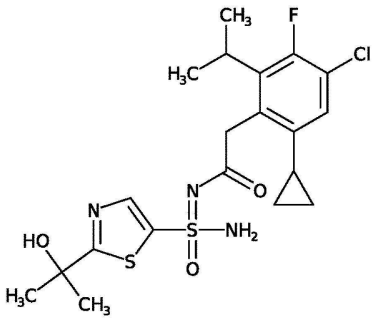
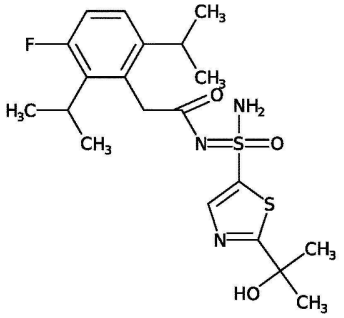
【表５６】

251	
251a	
251b	
252	

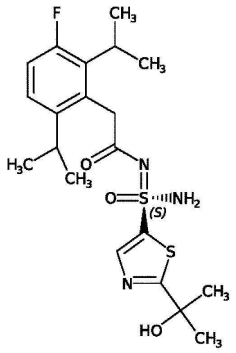
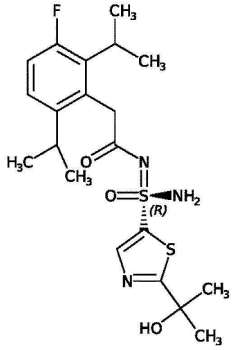
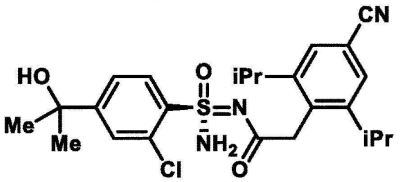
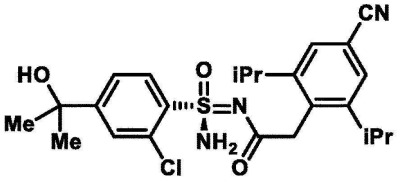
【表５７】

253	
254	
255	
256	

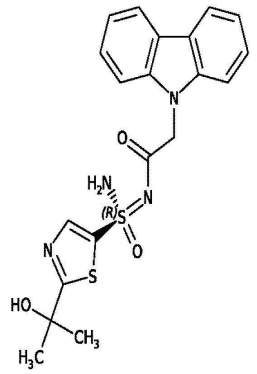
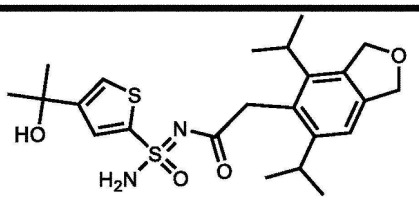
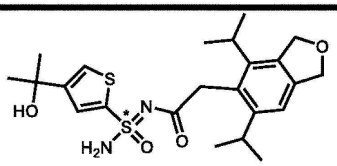
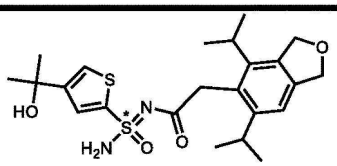
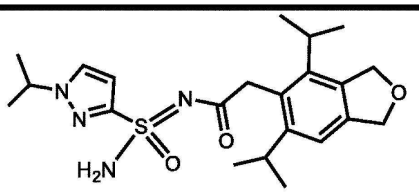
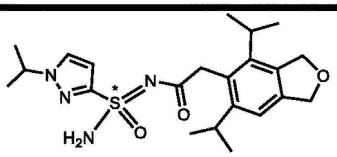
【表５８】

256a	
256b	
257	
258	

【表５９】

258a	
258b	
261a	
261b	

【表６０】

262b	
263	
263a	
263b	
264	
264a	

からなる群から選択される、化合物及びその薬学的に許容される塩。

【請求項１２】

前記部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ^{3}）＝Ｎ－中の硫黄は、（Ｓ）立体化学又は（Ｒ）立体化学を有する、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１３】

請求項１～１２のいずれか一項に記載の化合物又は塩と、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項１４】

代謝障害；中枢神経系の疾患；肺疾患；喘息、ＣＯＰＤ又は突発性肺線維症；肝疾患；膵疾患；腎疾患；腸疾患；皮膚疾患；筋骨格疾患；血管疾患；骨の疾患；眼疾患；ウイルス感染に起因する疾患；自己免疫疾患；癌又は老化のいずれか１つである、対象における

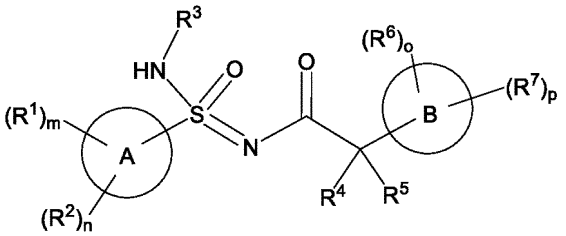
疾患、障害又は病態の治療のための、請求項１～１２のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物。
【請求項１５】
前記治療が抗ＴＮＦα剤を前記対象に投与する工程を含み；
前記組成物は、前記対象への前記抗ＴＮＦα剤の投与の前に、前記対象に投与され；又は
前記抗ＴＮＦα剤は、前記対象への前記組成物の投与の前に、前記対象に投与され；又は
前記組成物及び前記抗ＴＮＦα剤は、ほぼ同時に前記対象に投与される、請求項１４に記載の組成物。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
優先権主張
本出願は、２０１７年７月２４日に出願された米国仮特許出願第６２／５３６，３５２号；及び２０１７年１０月１８日に出願された米国仮特許出願第６２／５７３，９３５号の利益を主張するものであり；これらの仮特許出願は、両方とも、全体が参照により本明細書に援用される。
【０００２】
本開示は、例えば、ＮＬＲＰ３活性の減少又は増加（例えば、増加、例えば、ＮＬＲＰ３シグナル伝達に関連する病態、疾患又は障害）が、対象（例えば、ヒト）における病態、疾患又は障害の病変及び／又は症状及び／又は進行の一因である病態、疾患又は障害を治療するのに有用な化学物質（例えば、ＮＬＲＰ３を調節する（例えば、それに拮抗する）化合物、又はこの化合物の薬学的に許容される塩、及び／若しくは水和物、及び／若しくは共結晶、及び／若しくは複合薬）を特徴とする。本開示は、組成物並びにそれを使用及び作製する他の方法も特徴とする。
【背景技術】
【０００３】
ＮＬＲＰ３インフラマソームは、炎症過程の構成要素であり、その異常活性化は、クリオピリン関連周期性症候群（ＣＡＰＳ）などの遺伝性疾患を発病させる。遺伝性ＣＡＰＳマックル・ウェルズ症候群（ＭＷＳ）、家族性寒冷自己炎症症候群（ＦＣＡＳ）及び新生児期発症多臓器性炎症性疾患（ＮＯＭＩＤ）は、ＮＬＲＰ３の機能獲得型突然変異に関連することが報告された適応症の例である。
【０００４】
ＮＬＲＰ３は、複合体を形成し得、限定はされないが、２型糖尿病、アテローム性動脈硬化症、肥満及び痛風などの代謝障害、並びにアルツハイマー病及び多発性硬化症及び筋萎縮性側索硬化症及びパーキンソン病などの中枢神経系の疾患、喘息及びＣＯＰＤ及び突発性肺線維症などの肺疾患、ＮＡＳＨ症候群、ウイルス性肝炎及び肝硬変などの肝疾患、急性及び慢性膵炎などの膵疾患、急性及び慢性腎障害などの腎疾患、クローン病及び潰瘍性大腸炎などの腸疾患、乾癬などの皮膚疾患、強皮症などの筋骨格疾患、巨細胞性動脈炎などの血管疾患、変形性関節症、骨粗鬆症及び大理石骨病の障害などの骨の障害、緑内障及び黄斑変性症などの眼疾患、ＨＩＶ及びＡＩＤＳなどのウイルス感染に起因する疾患、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎などの自己免疫疾患、アジソン病、悪性貧血、癌及び老化を含む多くの複雑な疾患の発病に関与している。
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００５】
上記を考慮すると、ＮＬＲＰ３を調節する（例えば、それに拮抗する）化合物を提供することが望ましいであろう。
【課題を解決するための手段】
【０００６】
本開示は、例えば、ＮＬＲＰ３活性が減少又は増加する病態、疾患又は障害（例えば、

増加、例えば、ＮＬＲＰ３シグナル伝達に関連する病態、疾患又は障害）を治療するのに有用な化学物質（例えば、ＮＬＲＰ３を調節する（例えば、それに拮抗する）化合物、又はこの化合物の薬学的に許容される塩、及び／若しくは水和物、及び／若しくは共結晶、及び／若しくは複合薬）に関連することを特徴とする。

【０００７】

ある実施形態において、式ＡＡ

【化１】



式 AA

の化合物又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供され、式中、式ＡＡ中の変数は、本明細書のいずれかの箇所に定義されるとおりであり得る。

【０００８】

本開示は、組成物並びにそれを使用及び作製する他の方法も特徴とする。

【０００９】

ＮＬＲＰ３の「アンタゴニスト」は、ＮＬＲＰ３に直接結合することによって、又はＮＬＲＰ３の不活性化、不安定化、分布の変更若しくは他の方法によって、ＩＬ－１β及び／又はＩＬ－１８の生成を誘導するＮＬＲＰ３の能力を阻害する化合物を含む。

【００１０】

一態様において、本明細書に記載される化学物質（例えば、本明細書に一般的に若しくは具体的に記載される化合物又はその薬学的に許容される塩又はそれを含有する組成物）及び１つ以上の薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物を特徴とする。

【００１１】

一態様において、ＮＬＲＰ３活性を調節するための方法であって、ＮＬＲＰ３を、本明細書に記載される化学物質（例えば、本明細書に一般的に若しくは具体的に記載される化合物又はその薬学的に許容される塩又はそれを含有する組成物）と接触させる工程を含む方法を特徴とする。方法は、インビトロ方法、例えば、ＮＬＲＰ３を含む１つ以上の細胞を含む試料を接触させること、並びにインビボ方法を含む。

【００１２】

さらなる態様において、ＮＬＲＰ３シグナル伝達が疾患の病変及び／又は症状及び／又は進行の一因である疾患の治療の方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の本明細書に記載される化学物質（例えば、本明細書に一般的に若しくは具体的に記載される化合物又はその薬学的に許容される塩又はそれを含有する組成物）を投与する工程を含む方法を特徴とする。

【００１３】

さらなる態様において、本明細書に記載される化学物質（例えば、本明細書に一般的に若しくは具体的に記載される化合物又はその薬学的に許容される塩又はそれを含有する組成物）を対象に投与する工程であって、化学物質が、ＮＬＲＰ３シグナル伝達が疾患の病変及び／又は症状及び／又は進行の一因である疾患を治療するのに有効な量で投与され、それによって疾患を治療する工程を含む、治療方法を特徴とする。

【００１４】

実施形態は、以下の特徴の１つ以上を含み得る。

【００１５】

化学物質は、病態、疾患又は障害の治療に好適な１つ以上の薬剤による１つ以上のさら

なる治療と組み合わせて投与され得る。
【００１６】
本明細書に開示される化合物によって治療され得る適応症の例としては、限定はされないが、２型糖尿病、アテローム性動脈硬化症、肥満及び痛風などの代謝障害、並びにアルツハイマー病及び多発性硬化症及び筋萎縮性側索硬化症及びパーキンソン病などの中枢神経系の疾患、喘息及びＣＯＰＤ及び突発性肺線維症などの肺疾患、ＮＡＳＨ症候群、ウイルス性肝炎及び肝硬変などの肝疾患、急性及び慢性膵炎などの膵疾患、急性及び慢性腎障害などの腎疾患、クローン病及び潰瘍性大腸炎などの腸疾患、乾癬などの皮膚疾患、強皮症などの筋骨格疾患、巨細胞性動脈炎などの血管疾患、変形性関節症、骨粗鬆症及び大理石骨病の障害などの骨の障害、緑内障及び黄斑変性症などの眼疾患、ＨＩＶ及びＡＩＤＳなどのウイルス感染に起因する疾患、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎などの自己免疫疾患；アジソン病、悪性貧血、癌及び老化が挙げられる。
【００１７】
本方法は、対象を同定する工程をさらに含み得る。
【００１８】
他の実施形態は、詳細な説明及び／又は特許請求の範囲に記載されるものを含む。
【００１９】
さらなる定義
本明細書に記載される開示の理解を促進するために、いくつかのさらなる用語が、以下に定義される。一般に、本明細書において使用される命名法、並びに本明細書に記載される有機化学、医薬品化学、及び薬理学における実験手順は、当該技術分野において周知であり、一般的に用いられているものである。特に定義されない限り、本明細書において使用される全ての技術用語及び科学用語は、一般に、本開示が属する技術分野の当業者によって一般的に理解されるものと同じ意味を有する。本明細書全体を通して言及される特許、出願、公開出願、及び他の刊行物並びに添付の付属書のそれぞれは、全体が参照により本明細書に援用される。
【００２０】
本明細書において使用される際、「ＮＬＲＰ３」という用語は、限定はされないが、核酸、ポリヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、センス及びアンチセンスポリヌクレオチド鎖、相補配列、ペプチド、ポリペプチド、タンパク質、相同及び／又はオルソログＮＬＲＰ分子、アイソフォーム、前駆体、突然変異体、変異体、誘導体、スプライス変異、対立遺伝子、異なる種、並びにその活性断片を含むことが意図される。
【００２１】
本明細書において使用される際の、製剤、組成物又は成分に関する「許容される」という用語は、治療される対象の全体的な健康に対する持続的な有害作用を有さないことを意味する。
【００２２】
「ＡＰＩ」は、医薬品有効成分を指す。
【００２３】
本明細書において使用される際の「有効量」又は「治療有効量」という用語は、治療される疾患又は病態の症状の１つ以上をある程度軽減する、投与される化学物質（例えば、ＮＬＲＰ３の調節剤としての活性を示す化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶）の十分な量を指す。結果は、疾患の兆候、症状、若しくは原因の減少及び／若しくは軽減、又は生体系の任意の他の所望の改変を含む。例えば、治療用途のための「有効量」は、疾患症状の臨床的に有意な減少を提供するのに必要な本明細書に開示される化合物を含む組成物の量である。任意の個々の症例における適切な「有効」量は、用量漸増試験などの任意の好適な技術を用いて決定される。
【００２４】
「賦形剤」又は「薬学的に許容される賦形剤」という用語は、液体若しくは固体充填剤、希釈剤、担体、溶媒、又は封入材料などの、薬学的に許容される材料、組成物、又はビ

ヒクルを意味する。一実施形態において、各成分は、医薬製剤の他の成分と適合性であり、過剰な毒性、刺激、アレルギー反応、免疫原性、又は他の問題若しくは合併症なしにヒト及び動物の組織又は器官と接触させて使用するのに好適であり、妥当なベネフィット／リスク比に相応しているという意味で、「薬学的に許容される」。例えば、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ：Ｔｈｅ Ｓｃｉｅｎｃｅ ａｎｄ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｙ，２１ｓｔ ｅｄ．；Ｌｉｐｐｉｎｃｏｔｔ Ｗｉｌｌｉａｍｓ ＆ Ｗｉｌｋｉｎｓ：Ｐｈｉｌａｄｅｌｐｈｉａ，ＰＡ，２００５；Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｅｘｃｉｐｉｅｎｔｓ，６ｔｈ ｅｄ．；Ｒｏｗｅ ｅｔ ａｌ．，Ｅｄｓ．；Ｔｈｅ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｐｒｅｓｓ ａｎｄ ｔｈｅ Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ａｓｓｏｃｉａｔｉｏｎ：２００９；Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ａｄｄｉｔｉｖｅｓ，３ｒｄ ｅｄ．；Ａｓｈ ａｎｄ Ａｓｈ Ｅｄｓ．；Ｇｏｗｅｒ Ｐｕｂｌｉｓｈｉｎｇ Ｃｏｍｐａｎｙ：２００７；Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｐｒｅｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ ａｎｄ Ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ，２ｎｄ ｅｄ．；Ｇｉｂｓｏｎ Ｅｄ．；ＣＲＣ Ｐｒｅｓｓ ＬＬＣ：Ｂｏｃａ Ｒａｔｏｎ，ＦＬ，２００９を参照尾されたい。

【００２５】

「薬学的に許容される塩」という用語は、無機酸及び有機酸を含む薬学的に許容される非毒性の酸から調製される薬学的に許容される付加塩を指し得る。特定の場合、薬学的に許容される塩は、本明細書に記載される化合物を、塩酸、臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、サリチル酸などの酸と反応させることによって得られる。「薬学的に許容される塩」という用語は、酸性基を有する化合物を、アンモニウム塩、ナトリウム塩若しくはカリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩若しくはマグネシウム塩などのアルカリ土類金属塩、ジシクロヘキシルアミン、Ｎ－メチル－Ｄ－グルカミン、トリス（ヒドロキシメチル）メチルアミンなどの有機塩基の塩、及びアルギニン、リジンなどのアミノ酸との塩などの塩を形成するための塩基と反応させることによって、又は既に確定された他の方法によって調製される薬学的に許容される付加塩も指し得る。薬理学的に許容される塩は、薬剤中で使用可能である限り特に限定されない。本明細書に記載される化合物が塩基とともに形成する塩の例としては、以下：ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウム、及びアルミニウムなどの無機塩基とのその塩；メチルアミン、エチルアミン及びエタノールアミンなどの有機塩基とのその塩；リジン及びオルニチンなどの塩基性アミノ酸とのその塩；並びにアンモニウム塩が挙げられる。塩は、以下：塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、硝酸、及びリン酸などの鉱酸：ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、マロン酸、コハク酸、フマル酸、マレイン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、メタンスルホン酸、及びエタンスルホン酸などの有機酸；アスパラギン酸及びグルタミン酸などの酸性アミノ酸との酸付加塩によって具体的に例示される酸付加塩であり得る。

【００２６】

「医薬組成物」という用語は、本明細書に記載される化合物と、担体、安定剤、希釈剤、分散剤、懸濁化剤、及び／又は増粘剤などの他の化学成分（本明細書においてまとめて「賦形剤」と呼ばれる）との混合物を指す。医薬組成物は、生物への化合物の投与を促進する。限定はされないが：直腸、経口、静脈内、エアロゾル、非経口、眼内、肺内、及び局所投与を含む、化合物を投与する複数の技術が、当該技術分野において存在する。

【００２７】

「対象」という用語は、限定はされないが、霊長類（例えば、ヒト）、サル、ウシ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、イヌ、ネコ、ウサギ、ラット、又はマウスを含む動物を指す。「対象」及び「患者」という用語は、例えば、ヒトなどの哺乳動物対象に関して、本明細書において同義的に使用される。

【００２８】

疾患又は障害の治療の文脈における「治療する（ｔｒｅａｔ）」、「治療すること（ｔｒｅａｔｉｎｇ）」、及び「治療（ｔｒｅａｔｍｅｎｔ）」という用語は、障害、疾患、

若しくは病態、又は障害、疾患、若しくは病態の症状の１つ以上を軽減又は抑止すること；或いは疾患、障害若しくは病態又はその１つ以上の症状の進行、転移、又は悪化を遅らせることを含むことが意図される。

【００２９】

「水素」及び「Ｈ」という用語は、本明細書において同義的に使用される。

【００３０】

「ハロ」という用語は、フルオロ（Ｆ）、クロロ（Ｃｌ）、ブロモ（Ｂｒ）、又はヨード（Ｉ）を指す。

【００３１】

「アルキル」という用語は、示された数の炭素原子を含有する、直鎖又は分枝鎖、飽和又は不飽和であり得る炭化水素鎖を指す。例えば、$C_{1\sim10}$は、基が、１個以上１０個以下の炭素原子をその中に有し得ることを示す。非限定的な例としては、メチル、エチル、イソ－プロピル、ｔｅｒｔ－ブチル、ｎ－ヘキシルが挙げられる。

【００３２】

「ハロアルキル」という用語は、１つ以上の水素原子が独立して選択されるハロで置換されたアルキルを指す。

【００３３】

「アルコキシ」という用語は、－Ｏ－アルキル基（例えば、$-OCH_3$）を指す。

【００３４】

本明細書において使用される際の「炭素環」という用語は、３～１０個の炭素、例えば３～８個の炭素、例えば３～７個の炭素を有する、任意選択的に置換され得る芳香族又は非芳香族環状炭化水素基を含む。炭素環の例としては、５員、６員、及び７員炭素環が挙げられる。

【００３５】

「複素環」という用語は、単環式の場合は１～３個のヘテロ原子、二環式の場合は１～６個のヘテロ原子、又は三環式の場合は１～９個のヘテロ原子を有する、芳香族又は非芳香族の５～８員単環式、８～１２員二環式、又は１１～１４員三環式環系を指し、前記ヘテロ原子はＯ、Ｎ、又はＳから選択され（例えば、炭素原子、及び単環式、二環式、又は三環式の場合にそれぞれ、１～３個、１～６個、又は１～９個のＮ、Ｏ、又はＳのヘテロ原子）、各環の０、１、２、又は３個の原子は、置換基で置換され得る。複素環の例としては、５員、６員、及び７員複素環が挙げられる。

【００３６】

本明細書において使用される際の「シクロアルキル」という用語は、３～１０個の炭素、例えば３～８個の炭素、例えば３～７個の炭素を有する、非芳香族の環状、二環式、縮合、又はスピロ炭化水素基を含み、シクロアルキル基は、任意選択的に置換され得る。シクロアルキルの例としては、５員、６員、及び７員環が挙げられる。例としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニル、シクロヘプチル、及びシクロオクチルが挙げられる。

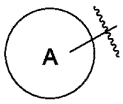
【００３７】

「ヘテロシクロアルキル」という用語は、単環式の場合は１～３個のヘテロ原子、二環式の場合は１～６個のヘテロ原子、又は三環式の場合は１～９個のヘテロ原子を有する、非芳香族の５～８員単環式、８～１２員二環式、又は１１～１４員三環式環、縮合、又はスピロ系基を指し、前記ヘテロ原子はＯ、Ｎ、又はＳから選択され（例えば、炭素原子、及び単環式、二環式、又は三環式の場合にそれぞれ、１～３個、１～６個、又は１～９個のＮ、Ｏ、又はＳのヘテロ原子）、各環の０、１、２、又は３個の原子は、置換基で置換され得る。ヘテロシクロアルキルの例としては、５員、６員、及び７員複素環が挙げられる。例としては、ピペラジニル、ピロリジニル、ジオキサニル、モルホリニル、テトラヒドロフラニルなどが挙げられる。

【００３８】

「アリール」という用語は、６～１０個の環炭素を含有する芳香環基を意味することが

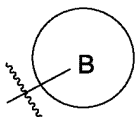
意図される。例としては、フェニル及びナフチルが挙げられる。
【００３９】
「ヘテロアリール」という用語は、単環、２つの縮合環又は３つの縮合環であり得る、５～１４個の芳香環原子を含有する芳香環系を意味することが意図され、ここで、少なくとも１つの芳香環原子は、限定はされないが、Ｏ、Ｓ及びＮからなる群から選択されるヘテロ原子である。例としては、フラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、トリアジニルなどが挙げられる。例としては、カルバゾリル、キノリジニル、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、トリアジニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、インドリジニル、プリニル、ナフチリジニル、プテリジニル、カルバゾリル、アクリジニル．フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、１Ｈ－ベンズイミダゾリル、イミダゾピリジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、イソベンゾフランなども挙げられる。
【００４０】
「ヒドロキシ」という用語は、ＯＨ基を指す。
【００４１】
「アミノ」という用語は、NH_2基を指す。
【００４２】
「オキソ」という用語は、Ｏを指す。例として、オキソによるCH_2基の置換により、Ｃ＝Ｏ基が得られる。
【００４３】
本明細書において使用される際、「環Ａ」又は「Ａ」という用語は、
【化２】



を示すために同義的に使用され、式ＡＡ中、波線
【化３】



によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡ中のＡをＳ（Ｏ）（NHR^3）＝Ｎ部分に連結する。
【００４４】
本明細書において使用される際、「環Ｂ」又は「Ｂ」という用語は、
【化４】

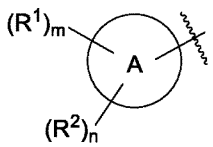


を示すために同義的に使用され、式ＡＡ中、波線
【化５】



によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡ中のＢをＣ（R^4R^5）基に連結

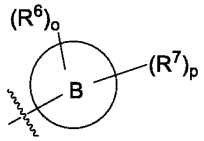
する。
【００４５】
本明細書において使用される際、「置換される環Ａ」という用語は、
【化６】



を示すのに使用され、式ＡＡ中、波線
【化７】



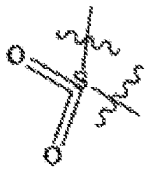
によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡ中のＡをＳ（Ｏ）（ＮＨＲ^{3}）＝Ｎ部分に連結する。
【００４６】
本明細書において使用される際、「置換される環Ｂ」という用語は、
【化８】



を示すのに使用され、式ＡＡ中、波線
【化９】



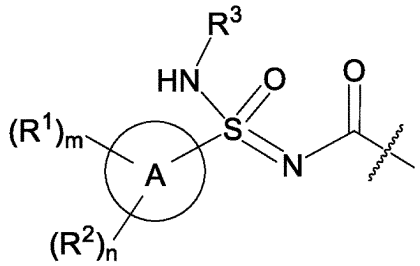
によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡ中のＢをＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する。
【００４７】
本明細書において使用される際、「Ｓ（Ｏ$_{2}$）」という表記は、単独で又はより大きい表記の一部として、基
【化１０】



を指す。
【００４８】
さらに、本実施形態の化合物を構成する原子は、このような原子の全ての同位体形態を含むことが意図される。本明細書において使用される際の同位体は、同じ原子数を有するが異なる質量数を有する原子を含む。一般例として且つ限定はされないが、水素の同位体としては、トリチウム及び重水素が挙げられ、炭素の同位体としては、^{13}Ｃ及び^{14}Ｃが挙げられる。
【００４９】

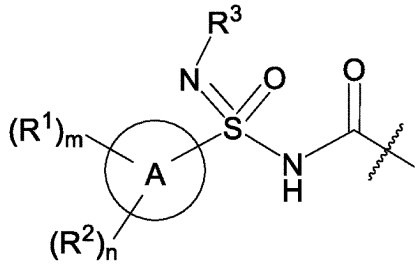
本明細書に開示される化合物の範囲は、化合物の互変異性体形態を含む。したがって、例として、部分

【化１１】



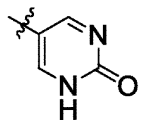
を含有するものとして表される化合物はまた、部分

【化１２】



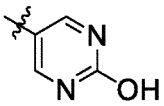
を含有する互変異性体形態を含むことが意図される。さらに、例として、部分

【化１３】



を含有するものとして表される化合物はまた、部分

【化１４】

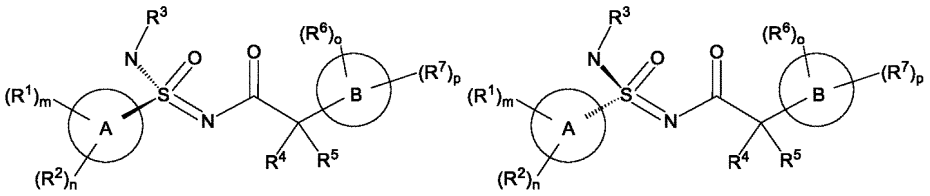


を含有する互変異性体形態を含むことが意図される。

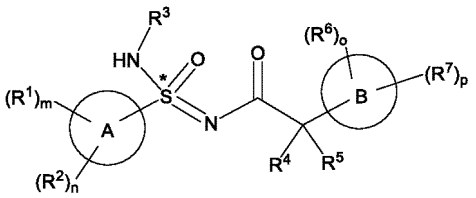
【００５０】

本明細書に記載される式の非限定的な例示される化合物は、立体中心（ｓｔｅｒｅｏｇｅｎｉｃ）硫黄原子及び任意選択的に１つ以上の立体中心炭素原子を含む。本開示は、立体異性体混合物（例えば、鏡像異性体のラセミ混合物；ジアステレオマーの混合物）の例を提供する。本開示は、前記立体異性体混合物の個々の成分を分離する（例えば、ラセミ混合物の鏡像異性体を分割する）ための方法も説明及び例示する。立体中心硫黄原子のみを含有する化合物の場合、分割された鏡像異性体は、２つの以下の形式の１つを用いて図示される：式Ａ／Ｂ（破線及び実線のくさび形の３次元表示）；及び式Ｃ（＊が表示された立体中心硫黄を有する平坦な構造）。

【化１５】



式Ａ　　式Ｂ



式Ｃ

【００５１】

ラセミ混合物の分割を示す反応スキームにおいて、式Ａ／Ｂ及びＣは、構成鏡像異性体がエナンチオピュアな形態（約９８％のｅｅ以上）で分割されたことを示すことのみが意図される。式Ａ／Ｂ形式を用いた分割生成物を示すスキームは、絶対配置と溶出順序との間の相関関係を開示又は示唆することは意図されていない。以下の表に示される化合物のいくつかが、式Ａ／Ｂ形式を用いて図示される。しかしながら、化合物１３２ａ及び１３２ｂを除いて、式Ａ／Ｂ形式において描かれる一覧にされた化合物のそれぞれについて示される図示される立体化学は、一時的な割り当てであり、類似性によって、化合物１３２ｂ（例えば、図１を参照）に割り当てられる絶対立体化学に基づいている。

【００５２】

本発明の１つ以上の実施形態の詳細が、添付の図面及び以下の明細書において記載される。本発明の他の特徴及び利点は、本明細書及び図面、並びに特許請求の範囲から明らかであろう。

【図面の簡単な説明】

【００５３】

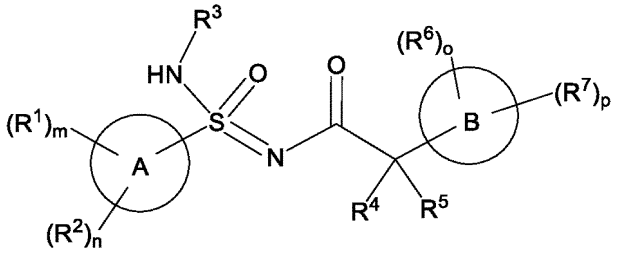
【図１】非対称単位における化合物１３２ａの２つの結晶学的に独立した分子の球棒表示を示す。

【発明を実施するための形態】

【００５４】

ある実施形態において、式ＡＡ

【化１６】



式ＡＡ

（式中、

ｍ＝０、１、又は２であり

ｎ＝０、１、又は２であり

ｏ＝１又は２であり
ｐ＝０、１、２、又は３であり
ここで、
Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルＳ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル、及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル置換基及び各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ

$_1$～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、ＮＨＣ$_1$～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、Ｒ^{6}又はＲ^{7}が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され、又はＲ^{6}又はＲ^{7}は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され、及び１つ以上のハロ、ＯＨ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びＯＣ$_1$～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、ＮＲ^{20}、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの４員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、$CH_2NR^8R^9$、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

Ｒ^{10}はC_1～C_6アルキルであり；

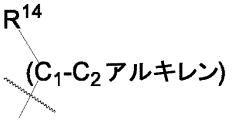
Ｒ^{8}及びＲ^{9}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、Ｓ（O_2）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{13}、CO_2R^{13}及びＣＯＮＲ^{11}Ｒ^{12}から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル、又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はＲ^{8}及びＲ^{9}は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

Ｒ^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

Ｒ^{11}及びＲ^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

Ｒ^{3}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、及び

【化１７】

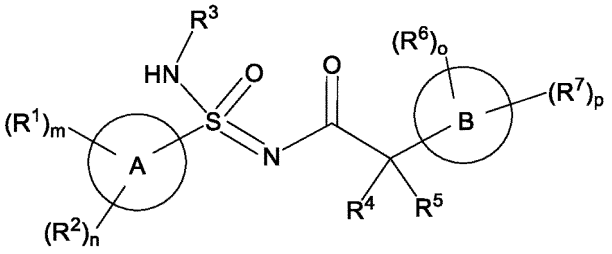


から選択され、ここで、Ｃ１～Ｃ２アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；
Ｒ１４は、水素、Ｃ１～Ｃ６アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ６～Ｃ１０単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ１～Ｃ６アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１、２、又は３つのＲ６で任意選択的に独立して置換される）
の化合物；
又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。

【００５５】

ある実施形態において、式ＡＡ

【化１８】



式ＡＡ

（式中、
ｍ＝０、１、又は２であり、
ｎ＝０、１、又は２であり、
ｏ＝１又は２であり、
ｐ＝０、１、２、又は３であり、
ここで、
Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ６～Ｃ１０単環式若しくは二環式アリールであり；
Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ６～Ｃ１０単環式若しくは二環式アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ６は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ４Ｒ５）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ１及びＲ２はそれぞれ、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ２、ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ－Ｃ６～Ｃ１０アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ２Ｃ３～Ｃ８シクロアルキル、ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ２、ＮＨＣ１～Ｃ６アルキル、Ｎ（Ｃ１～Ｃ６アルキル）２、ＮＨＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＮＨＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ２～Ｃ６アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ１～Ｃ６アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ１３）ＮＲ１１Ｒ１２、ＣＯＮＲ８Ｒ９、ＳＦ５、ＳＣ１～Ｃ６アルキル、Ｓ（Ｏ２）Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｓ（Ｏ２）ＮＲ１１Ｒ１２、Ｃ３～Ｃ１０シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ２～Ｃ

$_6$アルケニルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、R^1若しくはR^2　C_3～C_7シクロアルキル又はR^1若しくはR^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各C_1～C_6アルキル置換基及び各C_1～C_6アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、NR^8R^9、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、C_1～C_6アルキル及びC_1～C_6アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$で任意選択的に置換され；

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、R^6及びR^7はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、且つ１つ以上のハロ、ＯＨ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換される５員～７員炭素環又は複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロ

アリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；

Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択され；

Ｒ^{10}はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルであり；

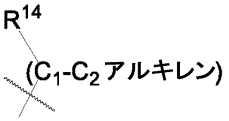
Ｒ^{8}及びＲ^{9}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{13}、ＣＯ$_2$Ｒ^{13}及びＣＯＮＲ^{11}Ｒ^{12}から選択され；ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はＲ^{8}及びＲ^{9}は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

Ｒ^{13}は、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

Ｒ^{11}及びＲ^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択され；

Ｒ^{3}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及び

【化１９】



から選択され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_2$アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；

Ｒ^{14}は、水素、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１、２、又は３つのＲ^{6}で任意選択的に独立して置換される）

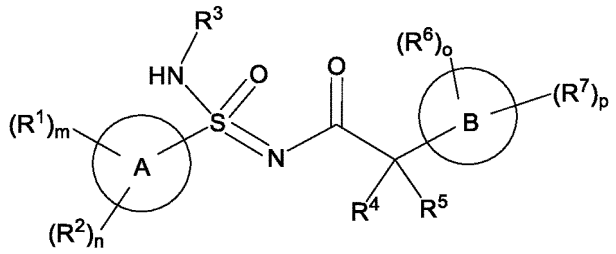
の化合物、

又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。

【００５６】

ある実施形態において、式ＡＡ

【化２０】



式ＡＡ

（式中、
ｍ＝０、１、又は２であり、
ｎ＝０、１、又は２であり、
ｏ＝１又は２であり、
ｐ＝０、１、２、又は３であり、
ここで、
Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^5）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、ＳＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｃ$_3$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_2$～Ｃ$_6$アルケニルから選択され、
ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^2　Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル置換基及び各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリールオキシ、及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、Ｒ^{6}又はＲ^{7}が置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され、又はＲ^{6}又はＲ^{7}は、酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、且つ１つ以上のハロ、ＯＨ、オキソ、又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に置換される５員～７員炭素環又は複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；

Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択され；

Ｒ^{10}はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルであり；

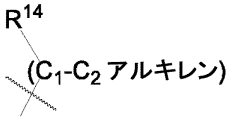
Ｒ^{8}及びＲ^{9}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{13}、ＣＯ$_{2}$Ｒ^{13}及びＣＯＮＲ^{11}Ｒ^{12}から選択され；ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はＲ^{8}及びＲ^{9}は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

Ｒ^{13}は、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

Ｒ^{11}及びＲ^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択され；

Ｒ^{3}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及び

【化２１】



から選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{2}$アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；

Ｒ^{14}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１、２、又は３つのＲ^{6}で任意選択的に独立して置換される）

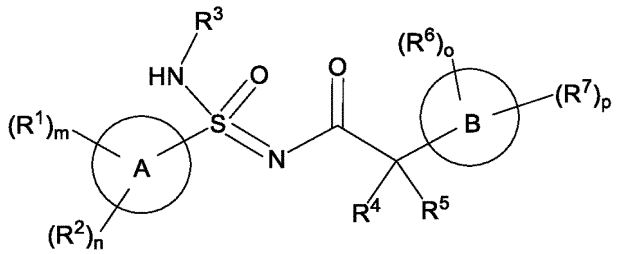
の化合物、

又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。

【００５７】

ある実施形態において、式ＡＡ

【化２２】



式 AA

（式中、

ｍ＝０、１又は２であり、

ｎ＝０、１又は２であり、

ｏ＝１又は２であり、

ｐ＝０、１、２又は３であり、

ここで、

Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；

Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；

ここで、

少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してオルトであり；

Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル置換基及び各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルから選択され、

ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮ

R^8R^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びS（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

R^4及びR^5のそれぞれは、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^{10}はC_1～C_6アルキルであり；

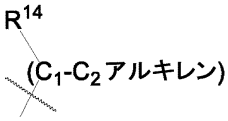
R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（$C=NR^{13}$）$NR^{11}R^{12}$、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

R^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^3は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、及び

【化２３】

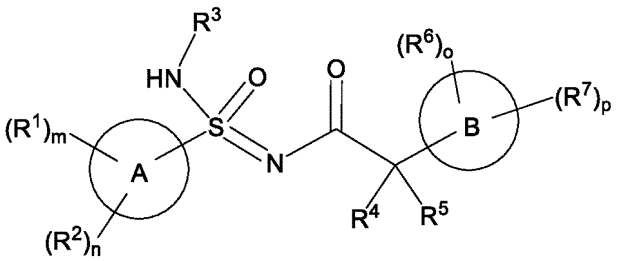


から選択され、ここで、C_1～C_2アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；

R^{14}は、水素、C_1～C_6アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各C_1～C_6アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのR^6で任意選択的に独立して置換される）の化合物、

又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。

【００５８】
ある実施形態において、式ＡＡ
【化２４】



式ＡＡ

（式中、
ｍ＝０、１、又は２であり；
ｎ＝０、１、又は２であり；
ｏ＝１又は２であり；
ｐ＝０、１、２、又は３であり；
ここで、
Ａは、５～１０員ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
Ｂは、５～１０員ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^5）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、ＳＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｃ$_3$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル、３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_2$～Ｃ$_6$アルケニルから選択され、
ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；；
ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^2　Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル置換基及び各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、R^1若しくはR^2　C_1～C_6アルキル、R^1若しくはR^2　C_1～C_6ハロアルキル、R^1若しくはR^2　C_1～C_6シクロアルキル、又はR^1若しくはR^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、C_1～C_6アルキル及びC_1～C_6アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$で任意選択的に置換され；

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、S（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、３員～７員ヘテロシクロアルキル、及びC_2～C_6アルケニルから選択され、

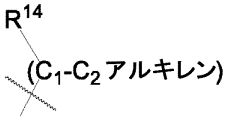
ここで、R^6及びR^7はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びS（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、ハロ、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員炭素環又は複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

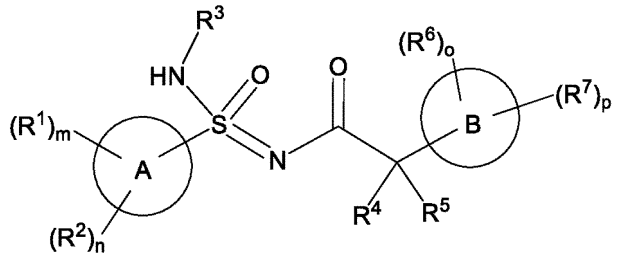
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

ここで、C_1～C_6アルキル及びC_1～C_6アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及びCONR

^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；
各Ｒ^{4}及びＲ^{5}は、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択され、
Ｒ^{10}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{8}及びＲ^{9}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{13}、ＣＯ$_{2}$Ｒ^{13}及びＣＯＮＲ^{11}Ｒ^{12}から選択され；ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はＲ^{8}及びＲ^{9}は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；
Ｒ^{13}は、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；
Ｒ^{11}及びＲ^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択され；
Ｒ^{3}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及び
【化２５】



から選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{2}$アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；
Ｒ^{14}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１、２、又は３つのＲ^{6}で任意選択的に独立して置換される）
の化合物；
又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。
【００５９】
ある実施形態において、式ＡＡ
【化２６】



式ＡＡ

（式中、
ｍ＝０、１、又は２であり；
ｎ＝０、１、又は２であり；
ｏ＝１又は２であり；
ｐ＝０、１、２、又は３であり；
ここで、
Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；

Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^5）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、ＳＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、Ｒ^{1}又はＲ^2　Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｒ^{1}又はＲ^2　Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｒ^{1}又はＲ^2　Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、又はＲ^{1}又はＲ^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_2$～Ｃ$_6$アルケニルから選択され、
ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキ

ル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

R^4及びR^5のそれぞれは、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^{10}はC_1～C_6アルキルであり；

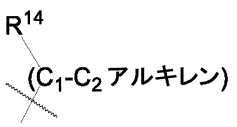
R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（Ｃ＝NR^{13}）$NR^{11}R^{12}$、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、Ｓ（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

R^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^3は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、及び

【化２７】



から選択され、ここで、C_1～C_2アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；

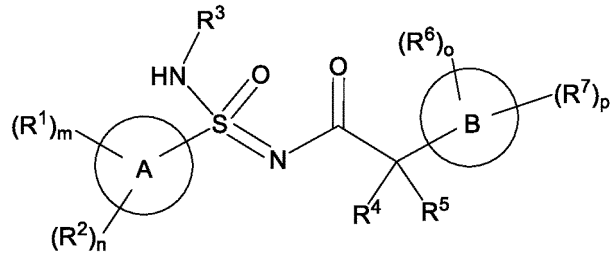
R^{14}は、水素、C_1～C_6アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各C_1～C_6アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのR^6で任意選択的に独立して置換される）の化合物；

又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。

【００６０】

式ＡＡ

【化２８】



式ＡＡ

（式中、

ｍ＝０、１、又は２であり；

ｎ＝０、１、又は２であり；

ｏ＝１又は２であり；

ｐ＝０、１、２、又は３であり；

ここで、

Ａは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；

Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_6$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；

ここで、

少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^5）基に連結する結合に対してオルトであり；

Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、ＳＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｓ（Ｏ$_2$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^2　Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル置換基及び各Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ置換基

は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、Ｒ^{1}又はＲ^{2}　Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｒ^{1}又はＲ^{2}　Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｒ^{1}又はＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、又はＲ^{1}又はＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルから選択され、

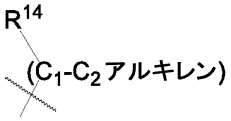
ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールオキシ、及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、Ｒ^{6}又はＲ^{7}が置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され、又はＲ^{6}又はＲ^{7}は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

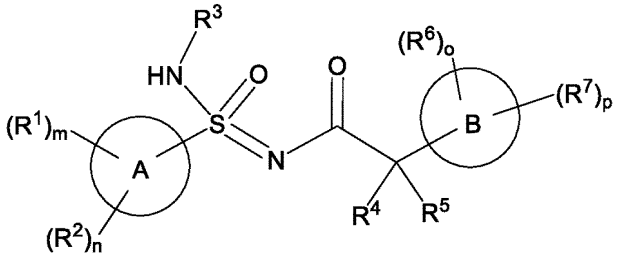
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＣＨ$_{2}$ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択され；

R^{10}はC_1～C_6アルキルであり；
R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（C＝NR^{13}）$NR^{11}R^{12}$、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；
R^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；
R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；
R^3は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、及び
【化２９】



から選択され、ここで、C_1～C_2アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；
R^{14}は、水素、C_1～C_6アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各C_1～C_6アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのR^6で任意選択的に独立して置換される）の化合物；
又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。
【００６１】
ある実施形態において、式ＡＡ
【化３０】



式AA

（式中、
ｍ＝０、１、又は２であり；
ｎ＝０、１、又は２であり；
ｏ＝１又は２であり；
ｐ＝０、１、２、又は３であり、
ここで、
Ａは、５員～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり；
Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール、又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり；

ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル置換基及び各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、R^6及びR^7はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

ここで、C_1～C_6アルキル及びC_1～C_6アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$で任意選択的に独立して置換され

R^4及びR^5のそれぞれは、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^{10}はC_1～C_6アルキルであり；

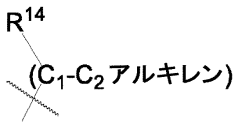
R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（Ｃ＝NR^{13}）$NR^{11}R^{12}$、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、Ｓ（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

R^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^3は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、及び

【化３１】



から選択され、ここで、C_1～C_2アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；

R^{14}は、水素、C_1～C_6アルキル、５員～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリー

ル又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各C_1～C_6アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ、２つは３つのR^6で任意選択的に独立して置換される）
の化合物；
又はその薬学的に許容される塩が本明細書において提供される。
【００６２】
ある実施形態において、本明細書の式に示される変数は、以下のとおりである。
【００６３】
変数m及びn
ある実施形態において、ｍ＝０、１、又は２である。
【００６４】
ある実施形態において、ｍ＝０又は１である。
【００６５】
ある実施形態において、ｍ＝１又は２である。
【００６６】
ある実施形態において、ｍ＝０又は２である。
【００６７】
ある実施形態において、ｍ＝０である。
【００６８】
ある実施形態において、ｍ＝１である。
【００６９】
ある実施形態において、ｍ＝２である。
【００７０】
ある実施形態において、ｎ＝０、１、又は２である。
【００７１】
ある実施形態において、ｎ＝０又は１である。
【００７２】
ある実施形態において、ｎ＝１又は２である。
【００７３】
ある実施形態において、ｎ＝０又は２である。
【００７４】
ある実施形態において、ｎ＝０である。
【００７５】
ある実施形態において、ｎ＝１である。
【００７６】
ある実施形態において、ｎ＝２である。
【００７７】
ある実施形態において、ｍ＝０及びｎ＝０である。
【００７８】
ある実施形態において、ｍ＝１及びｎ＝０である。
【００７９】
ある実施形態において、ｍ＝１及びｎ＝１である。
【００８０】
環Ａ及び環Ａ上の置換
ある実施形態において、Ａは、５員～１０員（例えば、５員～６員）単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリール、例えばフェニルである。
【００８１】
ある実施形態において、Ａは、５員～１０員（例えば、５員～６員）単環式又は二環式ヘテロアリールである。

【００８２】
ある実施形態において、Ａは、硫黄及び任意選択的に１つ以上の窒素を含有する５員ヘテロアリールである。
【００８３】
ある実施形態において、Ａは、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$（例えば、Ｃ$_{6}$）単環式又は二環式アリールである。
【００８４】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるフェニルである。
【００８５】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるフラニルである。
【００８６】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるチオフェニルである。
【００８７】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるオキサゾリルである。
【００８８】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるチアゾリルである。
【００８９】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるピラゾリルである。
【００９０】
ある実施形態において、Ａは、１つ又は２つのＲ^{1}で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるピリジルである。
【００９１】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるフェニルである。
【００９２】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるフラニルである。
【００９３】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるチオフェニルである。
【００９４】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるオキサゾリルである。
【００９５】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるチアゾリルである。
【００９６】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるピラゾリルである。
【００９７】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で任意選択的に置換されるピリジルである。
【００９８】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるフ

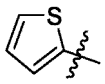
ェニルである。
【００９９】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるフラニルである。
【０１００】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるチオフェニルである。
【０１０１】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるオキサゾリルである。
【０１０２】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるチアゾリルである。
【０１０３】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるピラゾリルである。
【０１０４】
ある実施形態において、Ａは、１つのＲ^{1}で置換され、且つ１つのＲ^{2}で置換されるピリジルである。
【０１０５】
ある実施形態において、Ａはフェニルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１０６】
ある実施形態において、Ａはフラニルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１０７】
ある実施形態において、Ａはチオフェニルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１０８】
ある実施形態において、Ａはオキサゾリルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１０９】
ある実施形態において、Ａはチアゾリルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１１０】
ある実施形態において、Ａはピラゾリルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１１１】
ある実施形態において、Ａはピリジルであり、ｍは、０、１又は２であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１１２】
ある実施形態において、Ａはフェニルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１３】
ある実施形態において、Ａはフラニルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１４】
ある実施形態において、Ａはチオフェニルであり、ｍは１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１５】

ある実施形態において、Ａはオキサゾリルであり、ｍは１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１６】
ある実施形態において、Ａはチアゾリルであり、ｍは１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１７】
ある実施形態において、Ａはピラゾリルであり、ｍは１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１８】
ある実施形態において、Ａはピリジルであり、ｍは１であり、ｎは、０又は１である。
【０１１９】
ある実施形態において、Ａはフェニルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２０】
ある実施形態において、Ａはフラニルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２１】
ある実施形態において、Ａはチオフェニルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２２】
ある実施形態において、Ａはオキサゾリルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２３】
ある実施形態において、Ａはチアゾリルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２４】
ある実施形態において、Ａはピラゾリルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２５】
ある実施形態において、Ａはピリジルであり、ｍは１であり、ｎは１である。
【０１２６】
ある実施形態において、Ａはフェニルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１２７】
ある実施形態において、Ａはフラニルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１２８】
ある実施形態において、Ａはチオフェニルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１２９】
ある実施形態において、Ａはオキサゾリルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１３０】
ある実施形態において、Ａはチアゾリルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１３１】
ある実施形態において、Ａはピラゾリルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１３２】
ある実施形態において、Ａはピリジルであり、ｍは、０又は１であり、ｎは、０、１、又は２である。
【０１３３】
ある実施形態において、Ａはフェニルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１３４】
ある実施形態において、Ａはフラニルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１３５】
ある実施形態において、Ａはチオフェニルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。

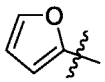
【０１３６】
ある実施形態において、Ａはオキサゾリルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１３７】
ある実施形態において、Ａはチアゾリルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１３８】
ある実施形態において、Ａはピラゾリルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１３９】
ある実施形態において、Ａはピリジルであり、ｍは０であり、ｎは、０又は１である。
【０１４０】
ある実施形態において、Ａは、本明細書において以下に開示されるように任意選択的に置換される、本明細書において以下に開示される環の１つであり、いずれの場合も、波線
【化３２】



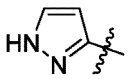
によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡのＡをＳ（Ｏ）（ＮＨＲ^{3}）＝Ｎ部分に連結する。
【０１４１】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３３】



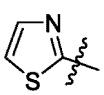
である。
【０１４２】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３４】



である。
【０１４３】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３５】

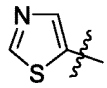


である。
【０１４４】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３６】

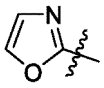


である。

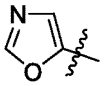
【０１４５】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３７】



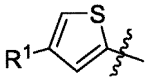
である。
【０１４６】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３８】



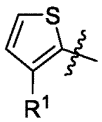
である。
【０１４７】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化３９】



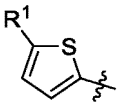
である。
【０１４８】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化４０】



である。
【０１４９】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化４１】



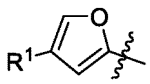
である。
【０１５０】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化４２】



である。
【０１５１】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４３】

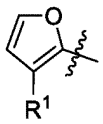


である。

【０１５２】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４４】

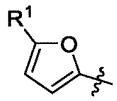


である。

【０１５３】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４５】

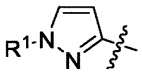


である。

【０１５４】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４６】

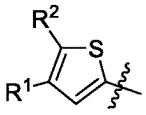


である。

【０１５５】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４７】

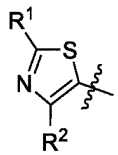


である。

【０１５６】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４８】

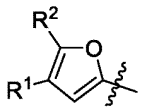


である。

【０１５７】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化４９】

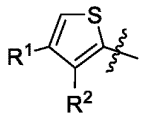


である。

【０１５８】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５０】

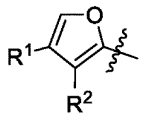


である。

【０１５９】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５１】

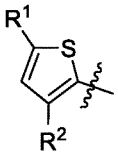


である。

【０１６０】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５２】

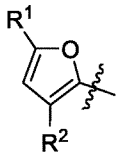


である。

【０１６１】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５３】

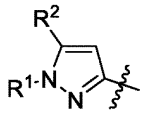


である。

【０１６２】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５４】

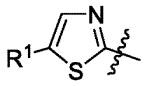


である。

【０１６３】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５５】

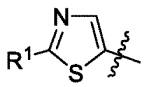


である。

【０１６４】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５６】

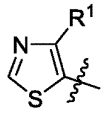


である。

【０１６５】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５７】

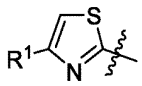


である。

【０１６６】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５８】

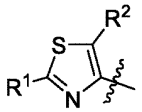


である。

【０１６７】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化５９】

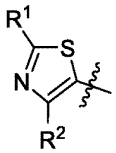


である。

【０１６８】

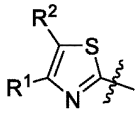
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化６０】

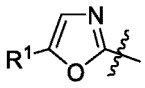


である。

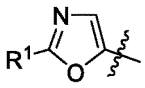
【０１６９】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６１】



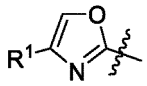
である。
【０１７０】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６２】



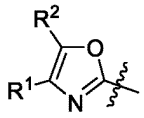
である。
【０１７１】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６３】



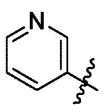
である。
【０１７２】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６４】



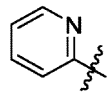
である。
【０１７３】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６５】



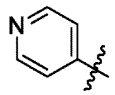
である。
【０１７４】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６６】



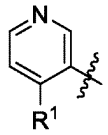
である。
【０１７５】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６７】



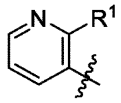
である。
【０１７６】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６８】



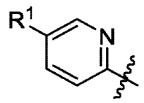
である。
【０１７７】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化６９】



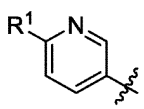
である。
【０１７８】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７０】



である。
【０１７９】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７１】

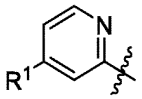


である。
【０１８０】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７２】

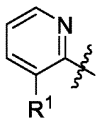


である。

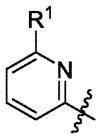
【０１８１】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７３】



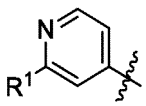
である。
【０１８２】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７４】



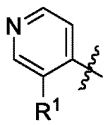
である。
【０１８３】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７５】



である。
【０１８４】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７６】

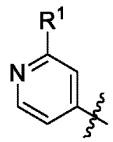


である。
【０１８５】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化７７】



である。
【０１８６】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化７８】

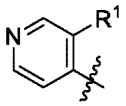


である。

【０１８７】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化７９】

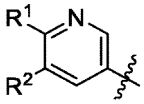


である。

【０１８８】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８０】

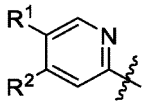


である。

【０１８９】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８１】

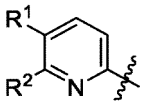


である。

【０１９０】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８２】

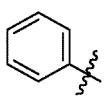


である。

【０１９１】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８３】

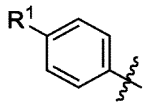


である。

【０１９２】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８４】

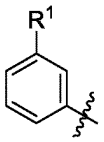


である。

【０１９３】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８５】

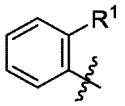


である。

【０１９４】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８６】

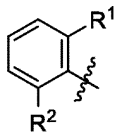


である。

【０１９５】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８７】

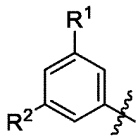


である。

【０１９６】

ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８８】

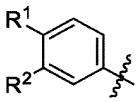


である。

【０１９７】

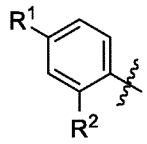
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化８９】

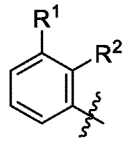


である。

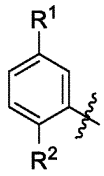
【０１９８】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化９０】



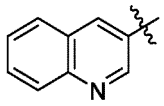
である。
【０１９９】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化９１】



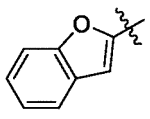
である。
【０２００】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化９２】



である。
【０２０１】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化９３】

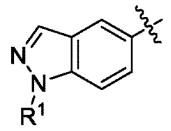


である。
【０２０２】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、
【化９４】



である。
【０２０３】
ある実施形態において、任意選択的に置換される環Ａは、

【化９５】



である。

【０２０４】

基Ｒ^{1}及びＲ^{2}

ある実施形態において、

Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、Ｒ^{1}若しくはＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又はＲ^{1}若しくはＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル置換基及び各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０２０５】

ある実施形態において、

Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ

$_6$～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、S（O）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、R^1若しくはR^2　C_3～C_7シクロアルキル又はR^1若しくはR^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各C_1～C_6アルキル置換基及び各C_1～C_6アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、NR^8R^9、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０２０６】

ある実施形態において、

R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、C（O）－C_6～C_{10}アリール、C（O）－５員～１０員ヘテロアリール、CO_2C_1～C_6アルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、S（O）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、R^1若しくはR^2　C_3～C_7シクロアルキル又はR^1若しくはR^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各C_1～C_6アルキル置換基及び各C_1～C_6アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、NR^8R^9、又はオキソでさらに任意選択的に独立し

て置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２０７】
ある実施形態において、
R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO－C_6～C_{10}アリール、CO－５員～１０員ヘテロアリール、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、S（O）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、R^1若しくはR^2　C_3～C_7シクロアルキル又はR^1若しくはR^2　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各C_1～C_6アルキル置換基及び各C_1～C_6アルコキシ置換基は、置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、置換され；
又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２０８】
ある実施形態において、
R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO－C_6～C_{10}アリール、CO－５員～１０員ヘテロアリール、CO_2C_1～

C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、S（O）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０２０９】

ある実施形態において、

R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、C（O）－C_6～C_{10}アリール、C（O）－５員～１０員ヘテロアリール、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、S（O）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ非置換であり；

又は隣接する原子上のR^1及びR^2の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

【０２１０】

ある実施形態において、

R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、CN、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、S（O）C_1～C_6アルキル、５員～１０員ヘテロアリール、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０２１１】

ある実施形態において、R^1及びR^2のそれぞれは、独立して、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルコキシ、又はNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6

アルキル、又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル（ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に置換される）；１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル（ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に置換される）；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}；Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルからなる群から選択される。

【０２１２】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}からなる群から選択される。

【０２１３】

ある実施形態において、Ｒ^{2}は、フルオロ、クロロ、シアノ、メチル；メトキシ；エトキシ；イソプロピル；１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＰｈ；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}からなる群から選択される。

【０２１４】

ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝０であり；

Ｒ^{1}は、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそ

れぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。
【０２１５】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝０であり；
各R^1及びR^2は、C_1～C_6アルキル、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｓ（Ｏ）C_1～C_6アルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから独立して選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。
【０２１６】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝０であり；
R^1は、C_1～C_6アルキル、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｓ（Ｏ）C_1～C_6アルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。
【０２１７】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、ＣＯ－C_6～C_{10}アリール、ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、SC_1～C_6アルキル、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、Ｓ（O_2）$NR^{11}R^{12}$、Ｓ（Ｏ）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。
【０２１８】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｓ（Ｏ）C_1～C_6アルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０２１９】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２２０】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２２１】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２２２】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。
【０２２３】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は非置換である。
【０２２４】
ある実施形態において、ｍ＝１であり；ｎ＝１であり；
R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は非置換である。
【０２２５】
ｍ＝１及びｎ＝０である特定の実施形態：
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２２６】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルである。
【０２２７】
ある実施形態において、R^1はC_1～C_6アルキルである。

【０２２８】
ある実施形態において、R^1はメチルである。
【０２２９】
ある実施形態において、R^1はイソプロピルである。
【０２３０】
ある実施形態において、R^1は、環Ａに直接連結される炭素においてヒドロキシで置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２３１】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルである。
【０２３２】
ある実施形態において、R^1はヒドロキシメチルである。
【０２３３】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシエチルである。
【０２３４】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシエチルである。
【０２３５】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルである。
【０２３６】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２３７】
ある実施形態において、R^1はC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２３８】
ある実施形態において、R^1は、環Ａに直接連結される炭素においてヒドロキシで置換されるC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２３９】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルである。
【０２４０】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルである。
【０２４１】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルである。
【０２４２】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルである。
【０２４３】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２４４】
ある実施形態において、R^1は３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２４５】
ある実施形態において、R^1はモルホリニル（例えば、４－モルホリニル）である。
【０２４６】
ある実施形態において、R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルである。
【０２４７】
ある実施形態において、R^1は、環Ａに直接連結される炭素においてヒドロキシで置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２４８】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２４９】
ある実施形態において、R^1は$COCH_3$である。

【０２５０】
ある実施形態において、R^1は$COCH_2CH_3$である。
【０２５１】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２５２】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２５３】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２５４】
ある実施形態において、R^1は２－メトキシ－２－プロピルである。
【０２５５】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２５６】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２５７】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２５８】
ある実施形態において、R^1は（ジメチルアミノ）メチルである。
【０２５９】
ある実施形態において、R^1は２－（ジメチルアミノ）プロパ－２－イルである。
【０２６０】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルである。
【０２６１】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルである。
【０２６２】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシ及び１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０２６３】
ある実施形態において、R^1は$C(Me)_2C(O)OH$である。
【０２６４】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6ハロアルキルである。
【０２６５】
ある実施形態において、R^1はC_1～C_6アルコキシである。
【０２６６】
ある実施形態において、R^1はC_1～C_6ハロアルコキシである。
【０２６７】
ある実施形態において、R^1はハロである。
【０２６８】
ある実施形態において、R^1はフルオロである。
【０２６９】
ある実施形態において、R^1はクロロである。

【０２７０】
ある実施形態において、R^1はＣＮである。
【０２７１】
ある実施形態において、R^1はNO_2である。
【０２７２】
ある実施形態において、R^1はCOC_1～C_6アルキルである。
【０２７３】
ある実施形態において、R^1はＣＯ－C_6～C_{10}アリールである。
【０２７４】
ある実施形態において、R^1はＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）である。
【０２７５】
ある実施形態において、R^1はCO_2C_1～C_6アルキルである。
【０２７６】
ある実施形態において、R^1はCO_2C_3～C_8シクロアルキルである。
【０２７７】
ある実施形態において、R^1は$OCOC_1$～C_6アルキルである。
【０２７８】
ある実施形態において、R^1は$OCOC_6$～C_{10}アリールである。
【０２７９】
ある実施形態において、R^1はＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）である。
【０２８０】
ある実施形態において、R^1はＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）である。
【０２８１】
ある実施形態において、R^1はC_6～C_{10}アリールである。
【０２８２】
ある実施形態において、R^1はフェニルである。
【０２８３】
ある実施形態において、R^1は５員～１０員ヘテロアリールである。
【０２８４】
ある実施形態において、R^1はピリジル（例えば、４－ピリジル）である。
【０２８５】
ある実施形態において、R^1はピラゾリル（例えば、１－ピラゾリル）である。
【０２８６】
ある実施形態において、R^1はNH_2である。
【０２８７】
ある実施形態において、R^1はＮＨC_1～C_6アルキルである。
【０２８８】
ある実施形態において、R^1はＮ（C_1～C_6アルキル）$_2$である。
【０２８９】
ある実施形態において、R^1はＣＯＮR^8 R^9である。
【０２９０】
ある実施形態において、R^1はSF_5である。
【０２９１】
ある実施形態において、R^1はＳC_1～C_6アルキルである。
【０２９２】
ある実施形態において、R^1はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルである。
【０２９３】
ある実施形態において、R^1はＳ（O_2）CH_3である。
【０２９４】
ある実施形態において、R^1はＳ（O_2）ＮR^{11} R^{12}である。

【０２９５】
ある実施形態において、R^1はＳ（O_2）Ｎ（CH_3）$_2$である。
【０２９６】
ある実施形態において、R^1はＳ（Ｏ）C_1～C_6アルキルである。
【０２９７】
ある実施形態において、R^1はＳ（Ｏ）CH_3である。
【０２９８】
ある実施形態において、R^1は、アリール環Ａの炭素に結合される。
【０２９９】
ある実施形態において、R^1は、ヘテロアリール環Ａの炭素に結合される。
【０３００】
ある実施形態において、R^1は、ヘテロアリール環Ａの窒素に結合される。
【０３０１】
ｍ＝１及びｎ＝１である特定の実施形態：
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。
【０３０２】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルである。
【０３０３】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルである。
【０３０４】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルである。
【０３０５】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルである。
【０３０６】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルである。
【０３０７】
ある実施形態において、R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルである。
【０３０８】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルである。
【０３０９】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルである。
【０３１０】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルである。
【０３１１】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールである。
【０３１２】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルである。
【０３１３】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールである。

【０３１４】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルである。
【０３１５】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピラゾリルである。
【０３１６】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5である。
【０３１７】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSC_1～C_6アルキルである。
【０３１８】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルである。
【０３１９】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は$S(O_2)CH_3$である。
【０３２０】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロである。
【０３２１】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はクロロである。
【０３２２】
ある実施形態において、R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフルオロである。
【０３２３】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルである。
【０３２４】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^2はメチルである。
【０３２５】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^2はメチルである。
【０３２６】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^2はメチルである。
【０３２７】
ある実施形態において、R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^2はメチルである。
【０３２８】
ある実施形態において、R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルである。
【０３２９】
ある実施形態において、R^1はモルホリニルであり、R^2はメチルである。
【０３３０】
ある実施形態において、R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はメチルである。

【０３３１】
ある実施形態において、R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロである。
【０３３２】
ある実施形態において、R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はフルオロである。
【０３３３】
ある実施形態において、R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はクロロである。
【０３３４】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルである。
【０３３５】
ある実施形態において、R^1は$COCH_3$であり、R^2はメチルである。
【０３３６】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルである。
【０３３７】
ある実施形態において、R^1は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルである。
【０３３８】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルである。
【０３３９】
ある実施形態において、R^1は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^2はメチルである。
【０３４０】
ある実施形態において、R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロである。
【０３４１】
ある実施形態において、R^1は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^2はフルオロである。
【０３４２】
ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^1はメチルである。
【０３４３】
ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルである。
【０３４４】
ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はイソプロピルである。
【０３４５】
ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1は１－ヒドロキシエチルである。
【０３４６】
ある実施形態において、R^2はヒドロキシメチルであり、R^1はメチルである。
【０３４７】
ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルである。
【０３４８】
ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルである。
【０３４９】

ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルである。

【０３５０】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールである。

【０３５１】

ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフェニルである。

【０３５２】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールである。

【０３５３】

ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピリジルである。

【０３５４】

ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピラゾリルである。

【０３５５】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5である。

【０３５６】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSC_1～C_6アルキルである。

【０３５７】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルである。

【０３５８】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)CH_3$である。

【０３５９】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。

【０３６０】

ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はクロロである。

【０３６１】

ある実施形態において、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフルオロである。

【０３６２】

ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルである。

【０３６３】

ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^1はメチルである。

【０３６４】

ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^1はメチルである。

【０３６５】

ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^1はメチルである。

【０３６６】
ある実施形態において、R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^1はメチルである。
【０３６７】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルである。
【０３６８】
ある実施形態において、R^2はモルホリニルであり、R^1はメチルである。
【０３６９】
ある実施形態において、R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はメチルである。
【０３７０】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロである。
【０３７１】
ある実施形態において、R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はフルオロである。
【０３７２】
ある実施形態において、R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はクロロである。
【０３７３】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルである。
【０３７４】
ある実施形態において、R^2は$COCH_3$であり、R^1はメチルである。
【０３７５】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルである。
【０３７６】
ある実施形態において、R^2は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルである。
【０３７７】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルである。
【０３７８】
ある実施形態において、R^2は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^1はメチルである。
【０３７９】
ある実施形態において、R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。
【０３８０】
ある実施形態において、R^2は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^1はフルオロである。
【０３８１】
ある実施形態において、R^1及びR^2はそれぞれ、アリール環Ａの炭素に結合される。
【０３８２】
ある実施形態において、R^1及びR^2はそれぞれ、ヘテロアリール環Ａの炭素に結合される。
【０３８３】
ある実施形態において、R^1は、炭素に結合され、R^2は、ヘテロアリール環Ａの窒素に結合される。

【０３８４】
ある実施形態において、R^2は、炭素に結合され、R^1は、ヘテロアリール環Ａの窒素に結合される。
【０３８５】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換されるC_5炭素環を形成する。
【０３８６】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成する。
【０３８７】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5飽和炭素環を形成する。
【０３８８】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6芳香族炭素環を形成する。
【０３８９】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換されるC_6炭素環を形成する。
【０３９０】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6脂肪族炭素環を形成する。
【０３９１】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6飽和炭素環を形成する。
【０３９２】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6芳香族炭素環を形成する。
【０３９３】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される５員複素環を形成する。
【０３９４】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員脂肪族複素環を形成する。
【０３９５】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員ヘテロ芳香環を形成する。
【０３９６】
ある実施形態において、R^1及びR^2は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子

と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される６員複素環を形成する。

【０３９７】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員脂肪族複素環を形成する。

【０３９８】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員ヘテロ芳香環を形成する。

【０３９９】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は異なる。

【０４００】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は異なり、Ｒ^{2}はカルボニル基を含む。

【０４０１】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は異なり、Ｒ^{2}は、１個又は２個（例えば、１個）の窒素原子を含む。

【０４０２】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は異なり、Ｒ^{2}は、１個又は２個（例えば、１個）の酸素原子を含む。

【０４０３】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は異なり、Ｒ^{2}は硫黄原子を含む。

【０４０４】

ある実施形態において、Ｒ^{2}及びＲ^{1}は異なり、Ｒ^{2}はカルボニル基を含む。

【０４０５】

ある実施形態において、Ｒ^{2}及びＲ^{1}は異なり、Ｒ^{2}は、１個又は２個（例えば、１個）の窒素原子を含む。

【０４０６】

ある実施形態において、Ｒ^{2}及びＲ^{1}は異なり、Ｒ^{2}は、１個又は２個（例えば、１個）の酸素原子を含む。

【０４０７】

ある実施形態において、Ｒ^{2}及びＲ^{1}は異なり、Ｒ^{2}は硫黄原子を含む。

【０４０８】

ある実施形態において、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は同じである。

【０４０９】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してパラ又はメタである。

【０４１０】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してパラ又はオルトである。

【０４１１】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してオルト又はメタである。

【０４１２】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してパラである。

【０４１３】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してメタである。

【０４１４】

ある実施形態において、Ｒ^{1}は、Ｒ^{2}に対してオルトである。

【０４１５】

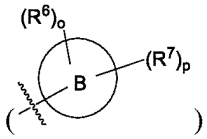
変数ｏ及びｐ
ある実施形態において、ｏ＝１又は２である。
【０４１６】
ある実施形態において、ｏ＝１である。
【０４１７】
ある実施形態において、ｏ＝２である。
【０４１８】
ある実施形態において、ｐ＝０、１、２、又は３である。
【０４１９】
ある実施形態において、ｐ＝０である。
【０４２０】
ある実施形態において、ｐ＝１である。
【０４２１】
ある実施形態において、ｐ＝２である。
【０４２２】
ある実施形態において、ｏ＝１及びｐ＝０である。
【０４２３】
ある実施形態において、ｏ＝２及びｐ＝０である。
【０４２４】
ある実施形態において、ｏ＝１及びｐ＝１である。
【０４２５】
ある実施形態において、ｏ＝１及びｐ＝２である。
【０４２６】
ある実施形態において、ｏ＝２及びｐ＝１である。
【０４２７】
ある実施形態において、ｏ＝２及びｐ＝２である。
【０４２８】
ある実施形態において、ｏ＝２及びｐ＝３である。
【０４２９】
環Ｂ及び環Ｂ上の置換
ある実施形態において、Ｂは、５員～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリール、例えばフェニルである。
【０４３０】
ある実施形態において、Ｂは、５員～６員単環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$単環式アリールである。
【０４３１】
ある実施形態において、Ｂは、５員～１０員単環式又は二環式ヘテロアリールである。
【０４３２】
ある実施形態において、Ｂは、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式又は二環式アリールである。
【０４３３】
ある実施形態において、Ｂは、５員単環式又は二環式ヘテロアリールである。
【０４３４】
ある実施形態において、Ｂは、７～１０員単環式又は二環式ヘテロアリールである。
【０４３５】
ある実施形態において、Ｂは６員二環式ヘテロアリールである。
【０４３６】
ある実施形態において、Ｂは、２個以上のＮ原子を含有する６員単環式ヘテロアリールである。
【０４３７】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、

２、又は３である。
【０４３８】
ある実施形態において、Ｂはピリジルであり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４３９】
ある実施形態において、Ｂは３－ピリジルであり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４０】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは、１、又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４１】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４２】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは１であり、ｐは、１、２、又は３である。
【０４４３】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは２であり、ｐは、１、２、又は３である。
【０４４４】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは１であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４５】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４６】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４７】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは、１又は２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４８】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは１であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４４９】
ある実施形態において、Ｂはフェニルであり、ｏは２であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４５０】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは１であり、ｐは、０、１、２、又は３である。
【０４５１】
ある実施形態において、Ｂはピリジル（例えば、３－ピリジル）であり、ｏは２であり、ｐは、０、１、又は２である。
【０４５２】
ある実施形態において、Ｂはピリミジニル（例えば、ピリミジン－５－イル）であり、ｏは１であり、ｐは、０、１、又は２である。
【０４５３】
ある実施形態において、Ｂはピリミジニル（例えば、ピリミジン－５－イル）であり、ｏは２であり、ｐは、０又は１である。
【０４５４】

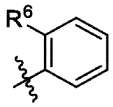
ある実施形態において、本明細書において以下に開示されるように置換される、本明細書において以下に開示される環の１つであり、いずれの場合も、波線
【化９６】



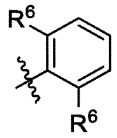
によって破断されていることが示される結合は、式ＡＡのＢをＮＨ（ＣＯ）基に連結する。
【０４５５】
ある実施形態において、置換される環Ｂ
【化９７】



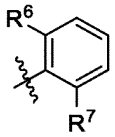
は、
【化９８】



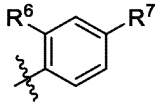
である。
【０４５６】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化９９】



である。
【０４５７】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１００】

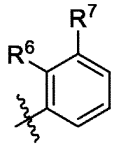


である。
【０４５８】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０１】

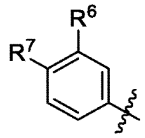


である。

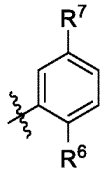
【０４５９】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０２】



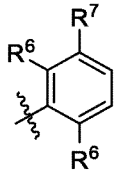
である。
【０４６０】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０３】



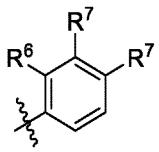
である。
【０４６１】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０４】



である。
【０４６２】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０５】

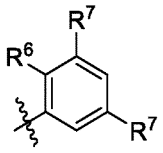


である。
【０４６３】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１０６】



である。
【０４６４】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１０７】

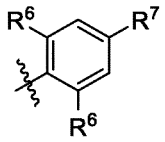


である。

【０４６５】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１０８】

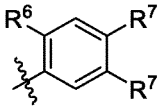


である。

【０４６６】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１０９】

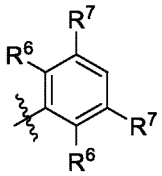


である。

【０４６７】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１０】

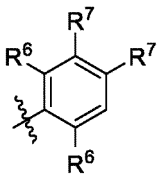


である。

【０４６８】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１１】

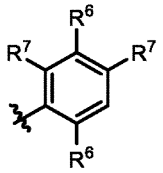


である。

【０４６９】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１２】

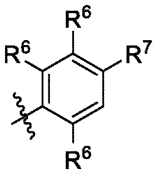


である。

【０４７０】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１３】

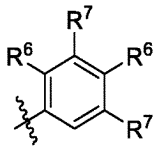


である。

【０４７１】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１４】

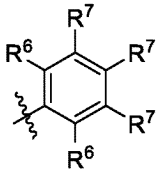


である。

【０４７２】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１５】

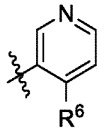


である。

【０４７３】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１６】

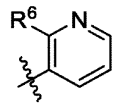


である。

【０４７４】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１７】

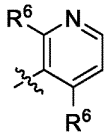


である。

【０４７５】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１８】

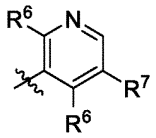


である。

【０４７６】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１１９】

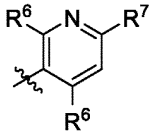


である。

【０４７７】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２０】

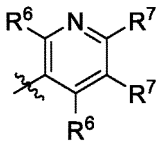


である。

【０４７８】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２１】

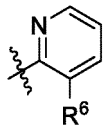


である。

【０４７９】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２２】

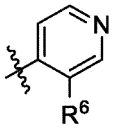


である。

【０４８０】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２３】

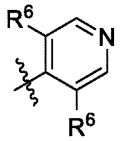


である。

【０４８１】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２４】

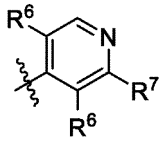


である。

【０４８２】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２５】

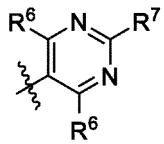


である。

【０４８３】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１２６】



である。

【０４８４】

基Ｒ^{6}及びＲ^{7}

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ

（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリールオキシ、及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、Ｒ^{6}又はＲ^{7}が置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され、又はＲ^{6}又はＲ^{7}は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及びＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４８５】

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_{10}$シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びＣ$_2$～Ｃ$_6$アルケニルから選択され、

ここで、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリールオキシ、及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、Ｒ^{6}又はＲ^{7}が置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル又

はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール又はＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され、又はＲ^{6}又はＲ^{7}は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_6$脂肪族炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～６員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、ＣＨ$_2$ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４８６】

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_5$～Ｃ$_8$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、ＣＨ$_2$ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４８７】

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$

～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４８８】

ある実施形態において、

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立し

て形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４８９】

ある実施形態において、

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、R^6及びR^7はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換されるC_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、ハロ、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、C_1～C_6アルキル及びC_1～C_6アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$で任意選択的に置換される。

【０４９０】

ある実施形態において、

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９１】

ある実施形態において、

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９２】

ある実施形態において、
R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（5員～10員ヘテロアリール）、OCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、S（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び3員～7員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、及び3員～7員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、3員～7員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（5員～10員ヘテロアリール）、OCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（5員～10員ヘテロアリール）、NHCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、3員～7員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（5員～10員ヘテロアリール）及びNHCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも1つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも1つのC_5～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される1個又は2個のヘテロ原子を含有する少なくとも1つの5員～8員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される1つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【0493】

ある実施形態において、
R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、ハロ、CN、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（5員～10員ヘテロアリール）、OCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、S（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び3員～7員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、及び3員～7員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、3員～7員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（5員～10員ヘテロアリール）、OCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（5員～10員ヘテロアリール）、NHCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される1つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、3員～7員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、5員～10員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（5員～10員ヘテロアリール）及びNHCO（3員～7員ヘテロシクロアルキル）は、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6

アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{5}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＣＨ$_{2}$ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９４】

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は非置換であり；
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{5}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＣＨ$_{2}$ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９５】

ある実施形態において、

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルはそれぞれ、非置換であり；
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と

一緒になって、少なくとも１つのＣ５～Ｃ８炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、ＣＨ２ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９６】

ある実施形態において、

Ｒ６は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ１～Ｃ６アルキル；ＣＯＮＲ８Ｒ９、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯＮＲ８Ｒ９、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＮＨＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ２～Ｃ６アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ３～Ｃ６シクロアルキル、ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ８Ｒ９、ＳＦ５、Ｓ（Ｏ２）Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ１～Ｃ６アルキルは、１～２つのＣ１～Ｃ６アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ６及びＲ７は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ４～Ｃ７炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０４９７】

ある実施形態において、

Ｒ６及びＲ７はそれぞれ、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ２、ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ８Ｒ９、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ１～Ｃ６アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、

又は隣接する原子上のＲ６及びＲ７の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ５～Ｃ８炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。

【０４９８】

ある実施形態において、

Ｒ６及びＲ７はそれぞれ、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ２、ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリ

ール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０４９９】
ある実施形態において、
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５００】
ある実施形態において、
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０１】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０２】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０３】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{5}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０４】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{6}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。

【０５０５】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～６員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０６】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０７】
ある実施形態において、
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの６員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。
【０５０８】
ある実施形態において、
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に独立して置換される。
【０５０９】
ある実施形態において、
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に独立して置換される。
【０５１０】
ある実施形態において、
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され.
又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と

一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_8$炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１１】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_6$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１２】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１３】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_5$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１４】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_6$脂肪族炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１５】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～６員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１６】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１７】

ある実施形態において、

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの６員複素環を独立して形成し、ここで、複素環は、１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に独立して置換される。

【０５１８】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝０であり；

Ｒ^{6}は、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び

３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０５１９】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；

Ｒ^{6}は、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_5$～Ｃ$_8$炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。

【０５２０】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_2$、ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、及びＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０５２１】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、Ｃ$_1$－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及

び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又はR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５２２】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル；$CONR^8R^9$、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_7（例えば、C_4～C_6）炭素環（例えば、脂肪族炭素環）又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有

する少なくとも１つの５員～７員（例えば、５員～６員）複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５２３】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され、

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_5～C_8炭素環を独立して形成し、ここで、炭素環は、１つ以上のヒドロキシ又はオキソで任意選択的に独立して置換される。

【０５２４】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

R^6及びR^7はそれぞれ、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ハロ、ＣＮ、NO_2、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、C_1～C_6アルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０５２５】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５２６】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５２７】

ある実施形態において、ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、ここで、炭素環又は複素環は非置換である。

【０５２８】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複

素環を独立して形成し、ここで、各炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５２９】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのＲ６及び１つのＲ７のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ６及び１つのＲ７の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ６炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０５３０】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのＲ６及び１つのＲ７のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ６及び１つのＲ７の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ５～Ｃ８炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は非置換である。

【０５３１】

ｏ＝１であり；ｐ＝０である特定の実施形態：

ある実施形態において、Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルである。

【０５３２】

ある実施形態において、Ｒ６はイソプロピルである。

【０５３３】

ある実施形態において、Ｒ６はエチルである。

【０５３４】

ある実施形態において、Ｒ６はメチルである。

【０５３５】

ある実施形態において、Ｒ６は、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルキルである。

【０５３６】

ある実施形態において、Ｒ６は、１つ以上（例えば、１つ）のＣ１～Ｃ６アルコキシ（例えば、メトキシ）で置換されるＣ１～Ｃ６アルキル（例えば、メチル）である。ある実施形態において、Ｒ６はメトキシメチルである。

【０５３７】

ある実施形態において、Ｒ６はトリフルオロメチルである。

【０５３８】

ある実施形態において、Ｒ６はトリフルオロメトキシである。

【０５３９】

ある実施形態において、Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルである。

【０５４０】

ある実施形態において、Ｒ６はシクロプロピルである。

【０５４１】

ある実施形態において、Ｒ６はハロである。

【０５４２】

ある実施形態において、Ｒ６はクロロである。

【０５４３】

ある実施形態において、Ｒ６はフルオロである。

【０５４４】

ある実施形態において、R^6はシアノである。

【０５４５】

ある実施形態において、R^6は、アリール環Ｂの炭素に結合される。

【０５４６】

ある実施形態において、R^6は、ヘテロアリール環Ｂの炭素に結合される。

【０５４７】

ある実施形態において、R^6は、ヘテロアリール環Ｂの窒素に結合される。

【０５４８】

ｏ＝１又は２であり；ｐ＝１、２、又は３である特定の実施形態：

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルである。

【０５４９】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7はハロである。

【０５５０】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7はC_1～C_6アルキルである。

【０５５１】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はメチルである。

【０５５２】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はイソプロピルである。

【０５５３】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^6はイソプロピルであり；R^7はイソプロピルである。

【０５５４】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルである。

【０５５５】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はトリフルオロメチルである。

【０５５６】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7はC_3～C_7シクロアルキルである。

【０５５７】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はシクロプロピルである。

【０５５８】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^6はイソプロピルであり；R^7はシクロプロピルである。

【０５５９】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；R^6はイソプロピルであり；一方のR^7がシクロプロピルであり；他方のR^7がフルオロである。

【０５６０】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；一方のR^6がイソプロピルであり；一方のR^7がシクロプロピルであり；他方のR^6がシアノであり；他方のR^7がフルオロである。

【０５６１】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも

１つのＲ^{7}はハロである。
【０５６２】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はハロである。
【０５６３】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はクロロである。
【０５６４】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はフルオロである。
【０５６５】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロである。
【０５６６】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロである。
【０５６７】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５６８】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５６９】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；各Ｒ^{6}はイソプロピルであり、Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５７０】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５７１】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５７２】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、１つのＲ^{7}はフルオロであり、１つのＲ^{7}は、トリフルオロメチルで置換される（例えば、メタ位においてトリフルオロメチルで置換される）フェニルである。
【０５７３】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５７４】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；一方のＲ^{7}がフルオロであり；他方のＲ^{7}がシアノである。
【０５７５】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝３であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；２つのＲ^{7}はフルオロであり；１つのＲ^{7}はクロロである。
【０５７６】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５７７】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも一方のＲ^{6}はイソプロピルであり；他方のＲ^{6}はトリフルオロメチルであり；Ｒ^{7}はクロロである。

【０５７８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はシアノである。
【０５７９】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はシアノである。
【０５８０】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノである。
【０５８１】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノである。
【０５８２】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルである。
【０５８３】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はシクロプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はシクロプロピルである。
【０５８４】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はハロである。
【０５８５】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はシクロプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はハロである。
【０５８６】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はシクロプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はクロロである。
【０５８７】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はシクロプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はフルオロである。
【０５８８】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロである。
【０５８９】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロである。
【０５９０】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシである。
【０５９１】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシである。
【０５９２】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はメトキシである。
【０５９３】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり、Ｒ^{7}はメトキシである。
【０５９４】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{6}はイソプ

ロピルであり、R^7はメトキシである。

【０５９５】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシである。

【０５９６】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はトリフルオロメトキシである。

【０５９７】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はジフルオロメトキシである。

【０５９８】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7は、１つ以上（例えば、１つ）のC_1～C_6アルコキシ（例えば、メトキシ）で置換されるC_1～C_6アルキル（例えば、メチル）である。

【０５９９】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はメトキシメチルである。

【０６００】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各R^6はイソプロピルであり、R^7はメトキシメチルである。

【０６０１】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はハロであり、少なくとも１つのR^7は、ヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6ハロアルキルである。

【０６０２】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^6はクロロであり、R^7はトリフルオロメチルである。

【０６０３】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はハロであり、少なくとも１つのR^7はC_1～C_6ハロアルコキシである。

【０６０４】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はクロロであり、少なくとも１つのR^7はトリフルオロメトキシである。

【０６０５】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^6はクロロであり、R^7はトリフルオロメトキシである。

【０６０６】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルコキシであり；少なくとも１つのR^7はハロである。

【０６０７】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；R^6はC_1～C_6アルコキシであり；少なくとも１つのR^7はクロロである。

【０６０８】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_3～C_7シクロアルキルであり；少なくとも１つのR^7は、ヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6ハロアルキルである。

【０６０９】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はシクロプロピルであり；少なくとも１つのR^7はトリフルオロメチルである。

【０６１０】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；R^6はシクロプロピルであり；

一方のR^7がトリフルオロメチルであり；他方のR^7がフルオロである。

【０６１１】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7はC_6～C_{10}アリールであり、ここで、C_6～C_{10}アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。

【０６１２】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はC_6～C_{10}アリールであり、ここで、C_6～C_{10}アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される。

【０６１３】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はジクロロフェニル（例えば、３，４－ジクロロフェニル）である。

【０６１４】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はジメチルフェニル（例えば、３，４－ジメチルフェニル）である。

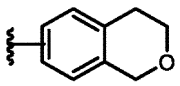
【０６１５】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はナフチル（例えば、１つのメトキシで置換されるナフチル）である。

【０６１６】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^7はC_6～C_{10}アリールであり、ここで、C_6～C_{10}アリールは、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合される（例えば、R^7は、

【化１２７】



である）。

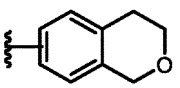
【０６１７】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各R^6はイソプロピルであり；R^7はC_6～C_{10}アリールであり、ここで、C_6～C_{10}アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される（例えば、R^7はジメチルフェニルであり；又はR^7はジクロロフェニルであり；又はR^7はナフチルである）。

【０６１８】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各R^6はイソプロピルであり；R^7はC_6～C_{10}アリールであり、ここで、C_6～C_{10}アリールは、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合される（例えば、R^7は、

【化１２８】



である）。

【０６１９】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^7は３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキルは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。

【０６２０】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}は３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキルは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される。
【０６２１】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はテトラヒドロフラニルである。
【０６２２】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}は、
【化１２９】



である。
【０６２３】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}は５員～１０員ヘテロアリールであり、ここで、５員～１０員ヘテロアリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。
【０６２４】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、及び少なくとも１つのＲ^{7}は５員～１０員ヘテロアリールであり、ここで、５員～１０員ヘテロアリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。
【０６２５】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はピラゾリルである。
【０６２６】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。
【０６２７】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はメチルである。
【０６２８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。
【０６２９】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はトリフルオロメチルである。
【０６３０】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルである。
【０６３１】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はシクロプロピルである。
【０６３２】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルである。

【０６３３】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；一方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；他方のＲ^{6}がフルオロである。
【０６３４】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；一方のＲ^{7}がイソプロピルであり；一方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；他方のＲ^{7}がシアノであり；他方のＲ^{6}がフルオロである。
【０６３５】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はハロである。
【０６３６】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はハロである。
【０６３７】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はクロロである。
【０６３８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はフルオロである。
【０６３９】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロである。
【０６４０】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり；少なくとも１つのＲ^{6}はクロロである。
【０６４１】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロである。
【０６４２】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；少なくとも１つのＲ^{6}はフルオロである。
【０６４３】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり、Ｒ^{6}はフルオロである。
【０６４４】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり；少なくとも１つのＲ^{6}はフルオロである。
【０６４５】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり；一方のＲ^{6}がフルオロであり；他方のＲ^{6}がシアノである。
【０６４６】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はエチルであり；少なくとも１つのＲ^{6}はフルオロである。
【０６４７】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；一方のＲ^{7}がイソプロピルであり；他方のＲ^{7}がトリフルオロメチルであり；Ｒ^{6}はクロロである。
【０６４８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はシアノである。
【０６４９】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^6はシアノである。

【０６５０】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^7はイソプロピルであり；R^6はシアノである。

【０６５１】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；R^7はイソプロピルであり；少なくとも１つのR^6はシアノである。

【０６５２】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、少なくとも１つのR^6はC_3～C_7シクロアルキルである。

【０６５３】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はシクロプロピルであり、少なくとも１つのR^6はシクロプロピルである。

【０６５４】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、少なくとも１つのR^6はハロである。

【０６５５】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はシクロプロピルであり、少なくとも１つのR^6はハロである。

【０６５６】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はシクロプロピルであり、少なくとも１つのR^6はクロロである。

【０６５７】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はシクロプロピルであり、少なくとも１つのR^6はフルオロである。

【０６５８】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^7はシクロプロピルであり；R^6はクロロである。

【０６５９】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^7はシクロプロピルであり；R^6はフルオロである。

【０６６０】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^6は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシである。

【０６６１】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^6はC_1～C_6アルコキシである。

【０６６２】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^6はメトキシである。

【０６６３】

ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；R^7はイソプロピルであり、R^6はメトキシである。

【０６６４】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；R^7はイソプロピルであり、少なくとも１つのR^6はメトキシである。

【０６６５】

ある実施形態において、少なくとも１つのR^7はC_1～C_6アルキルであり、少なくとも１つのR^6は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシである。

【０６６６】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はトリフルオロメトキシである。
【０６６７】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は、１つ以上（例えば、１つ）のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ（例えば、メトキシ）で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、メチル）である。
【０６６８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はメトキシメチルである。
【０６６９】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各Ｒ^{7}はイソプロピルであり、Ｒ^{6}はメトキシメチルである。
【０６７０】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はハロであり、少なくとも１つのＲ^{6}は、ヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルである。
【０６７１】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はクロロであり、Ｒ^{6}はトリフルオロメチルである。
【０６７２】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はハロであり、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシである。
【０６７３】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はクロロであり、少なくとも１つのＲ^{6}はトリフルオロメトキシである。
【０６７４】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はクロロであり、Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。
【０６７５】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；少なくとも１つのＲ^{6}はハロである。
【０６７６】
ある実施形態において、ｏ＝１であり；ｐ＝２であり；少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロである。
【０６７７】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；少なくとも１つのＲ^{6}は、ヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルである。
【０６７８】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はシクロプロピルであり；少なくとも１つのＲ^{6}はトリフルオロメチルである。
【０６７９】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；一方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；他方がＲ^{6}がフルオロである。
【０６８０】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり、ここで、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。
【０６８１】
ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つ

のＲ^{7}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり、ここで、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される。

【０６８２】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はジクロロフェニル（例えば、３，４－ジクロロフェニル）である。

【０６８３】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はジメチルフェニル（例えば、３，４－ジメチルフェニル）である。

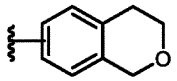
【０６８４】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{6}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{7}はナフチル（例えば、１つのメトキシで置換されるナフチル）である。

【０６８５】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり、ここで、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールは、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合される（例えば、Ｒ^{7}は、

【化１３０】



である）。

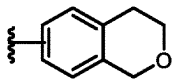
【０６８６】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり、ここで、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される（例えば、Ｒ^{6}はジメチルフェニルであり；又はＲ^{6}はジクロロフェニルであり；又はＲ^{6}はナフチルである）。

【０６８７】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝１であり、各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり、ここで、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールは、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合される（例えば、Ｒ^{7}は、

【化１３１】



である）。

【０６８８】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキルは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。

【０６８９】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、ここで、３員～７員ヘテロシクロアルキルは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換される。

【０６９０】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はテトラヒドロフラニルである。

【０６９１】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は、

【化１３２】



である。

【０６９２】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は５員～１０員ヘテロアリールであり、ここで、５員～１０員ヘテロアリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。

【０６９３】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}は５員～１０員ヘテロアリールであり、ここで、５員～１０員ヘテロアリールは、本明細書の他の箇所に記載されるように任意選択的に置換されるか又は任意選択的に縮合される。

【０６９４】

ある実施形態において、少なくとも１つのＲ^{7}はイソプロピルであり、少なくとも１つのＲ^{6}はピラゾリルである。

【０６９５】

ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、アリール環Ｂの炭素に結合される。

【０６９６】

ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヘテロアリール環Ｂの炭素に結合される。

【０６９７】

ある実施形態において、Ｒ^{6}は、炭素に結合され、Ｒ^{7}は、ヘテロアリール環Ｂの窒素に結合される。

【０６９８】

ある実施形態において、Ｒ^{7}は、炭素に結合され、Ｒ^{6}は、ヘテロアリール環Ｂの窒素に結合される。

【０６９９】

ある実施形態において、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換されるＣ$_{5}$炭素環を形成する。

【０７００】

ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成する。

【０７０１】

ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換されるＣ$_{6}$炭素環を形成する。

【０７０２】

ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成する。

【０７０３】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_6芳香族炭素環を形成する。
【０７０４】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される５員複素環を形成する。
【０７０５】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員脂肪族複素環を形成する。
【０７０６】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員ヘテロ芳香環を形成する。
【０７０７】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される６員複素環を形成する。
【０７０８】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員脂肪族複素環を形成する。
【０７０９】
ある実施形態において、R^6及びR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員ヘテロ芳香環を形成する。
【０７１０】
ある実施形態において、１つのR^6及び１つのR^7は隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、
ここで、環は、Ｂ環をＣ（R^4R^5）基に連結する結合に対するオルト位及びメタ位においてＢ環に縮合される。
【０７１１】
ある実施形態において、
１つのR^6及び１つのR^7の１つは、隣接する原子上にあり、それらを連結する原子と一緒になって、C_5～C_8炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を形成し、
ここで、環は、Ｂ環をＣ（R^4R^5）基に連結する結合に対するメタ位及びパラ位においてＢ環に縮合される。
【０７１２】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オ

キソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換されるC_5炭素環を形成する。

【０７１３】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成する。

【０７１４】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換されるC_6炭素環を形成する。

【０７１５】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_6脂肪族炭素環を形成する。

【０７１６】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_6芳香族炭素環を形成する。

【０７１７】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される５員複素環を形成する。

【０７１８】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員脂肪族複素環を形成する。

【０７１９】

ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員ヘテロ芳香環を形成する。

【０７２０】

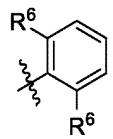
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；

１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換

基で任意選択的に置換される６員複素環を形成する。
【０７２１】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員脂肪族複素環を形成する。
【０７２２】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する６員ヘテロ芳香環を形成する。
【０７２３】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２又は３であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～８員複素環を独立して形成し、
ここで、２つの環の一方が、Ｂ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対する２位及び３位においてＢ環に縮合され、２つの環の他方が、Ｂ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対する５位及び６位においてＢ環に縮合される。
【０７２４】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝２であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成する。
【０７２５】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝３であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はハロ（例えば、Ｃｌ又はＦ）である。
【０７２６】
ある実施形態において、ｏ＝２であり；ｐ＝３であり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はＣＮである。
【０７２７】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はピラゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７２８】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は３－ピラゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７２９】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は４－ピラゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３０】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は５－ピラゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３１】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はチアゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。

【０７３２】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は４－チアゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３３】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は５－チアゾリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３４】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はフリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３５】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は２－フリルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３６】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はチオフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３７】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は２－チオフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３８】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７３９】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はナフチル（例えば、非置換ナフチル又はメトキシナフチル）であり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４０】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はイソクロマニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４１】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}はシクロアルケニル（例えば、シクロペンテニル、例えば、１－シクロペンテニル）であり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４２】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のヒドロキシル、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}（例えば、ジメチルアミノ）、又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール（例えば、フェニル、ナフチル、若しくはメチレンジオキシフェニルで任意選択的に置換される１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、メチル又はプロピル、例えば、２－プロピル）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４３】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のヒドロキシル、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}（例えば、ジメチルアミノ）、又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール（例えば、フェニル、ナフチル、若しくはメチレンジオキシフェニルで任意選択的に置換される１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ（例えば、メトキシ）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４４】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールオキシ（例えば、フェノキシ）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４５】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＣＮで任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。

【０７４６】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のハロ（例えば、Ｆ、Ｃｌ）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４７】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、ＣＯ$_{2}$ｔ－Ｂｕ）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４８】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、Ｓ（Ｏ$_{2}$）メチル）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７４９】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上の３員～７員ヘテロシクロアルキル（例えば、モルホリニル）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７５０】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}（例えば、非置換アミド）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７５１】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、メチル又はプロピル、例えば、２－プロピル）及び１つ以上のハロ（例えば、Ｆ、Ｃｌ）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７５２】
ある実施形態において、１つのＲ^{7}は、１つ以上（例えば、１つ）のハロ（例えば、フルオロ）で任意選択的に置換される１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル（例えば、メチル又はプロピル、例えば、２－プロピル）で任意選択的に置換されるフェニルであり、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してパラである。
【０７５３】
ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、アリール環Ｂの炭素に結合される。
【０７５４】
ある実施形態において、Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、ヘテロアリール環Ｂの炭素に結合される。
【０７５５】
ある実施形態において、Ｒ^{6}は、炭素に結合され、Ｒ^{7}は、ヘテロアリール環Ｂの窒素に結合される。
【０７５６】
ある実施形態において、Ｒ^{7}は、炭素に結合され、Ｒ^{6}は、ヘテロアリール環Ｂの窒素に結合される。
【０７５７】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１３３】



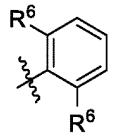
であり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ

$_6$ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯC_1～C_6アルキル、ＮＨＣＯC_6～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯC_2～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０７５８】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３４】

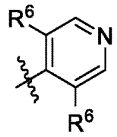


であり、各Ｒ^{6}は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシからなる群から選択され、ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、及びC_3～C_7シクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０７５９】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３５】

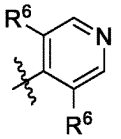


であり、各Ｒ^{6}は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯC_1～C_6アルキル、ＮＨＣＯC_6～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯC_2～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０７６０】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３６】

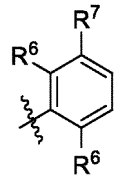


であり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシからなる群から選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、及びＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、又はオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される。

【０７６１】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３７】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

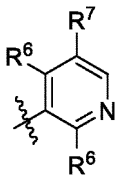
ここで、Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～２つのＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$～Ｃ$_{7}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６２】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３８】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～２つのＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$～Ｃ$_{7}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６３】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１３９】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ

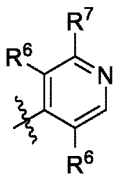
ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～２つのＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換される。

【０７６４】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４０】



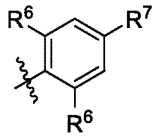
であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

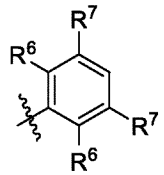
ここで、Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～２つのＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$～Ｃ$_{7}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６５】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１４１】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルは、１～２つのＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換される。
【０７６６】
ある実施形態において、置換される環Ｂは、
【化１４２】



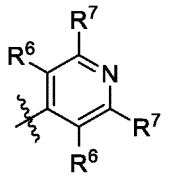
であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそ

れぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６７】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４３】



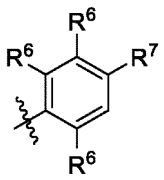
であり、式中、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキ

ル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６８】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４４】



であり、式中、各Ｒ６は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ１～Ｃ６アルキル、ＣＯＮＲ８Ｒ９、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯＮＲ８Ｒ９、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＮＨＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ２～Ｃ６アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

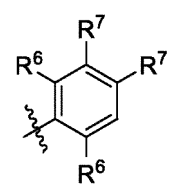
ここで、Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル、ＣＯ２Ｃ３～Ｃ６シクロアルキル、ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル、ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ６～Ｃ１０アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ８Ｒ９、ＳＦ５、Ｓ（Ｏ２）Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ１～Ｃ６アルキルは、１～２つのＣ１～Ｃ６アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ６及びＲ７は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ４～Ｃ７炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、ＮＲ８Ｒ９、＝ＮＲ１０、ＣＯＯＣ１～Ｃ６アルキル、Ｃ６～Ｃ１０アリール、及びＣＯＮＲ８Ｒ９から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７６９】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４５】



であり、式中、各Ｒ６は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキル、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル、Ｃ１～Ｃ６アルコキシ、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、

Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

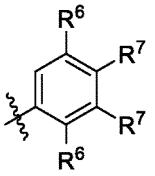
ここで、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルは、１～２つのＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで任意選択的に置換され；

又はＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_4$～Ｃ$_7$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７７０】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４６】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣ

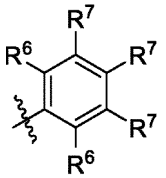
ＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルは、１～２つのＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_7$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、ＣＨ$_2$ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７７１】

ある実施形態において、置換される環Ｂは、

【化１４７】



であり、式中、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルは、１～２つのＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_7$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、ＣＨ$_2$ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される。

【０７７２】

基Ｒ^{4}及びＲ^{5}

ある実施形態において、Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは、独立して、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。

【０７７３】

ある実施形態において、Ｒ^{4}は水素である。

【０７７４】

ある実施形態において、Ｒ^{5}は水素である。

【０７７５】

ある実施形態において、Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれは水素である。

【０７７６】

ある実施形態において、Ｒ^{4}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。

【０７７７】

ある実施形態において、Ｒ^{5}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。

【０７７８】

ある実施形態において、Ｒ^{4}及びＲ^{5}のそれぞれはＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。

【０７７９】

ある実施形態において、Ｒ^{4}は水素であり、Ｒ^{5}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。

【０７８０】

ある実施形態において、Ｒ^{4}は水素であり；Ｒ^{5}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；Ｒ^{4}及びＲ^{5}に結合される炭素は、（Ｓ）立体化学を有する。

【０７８１】

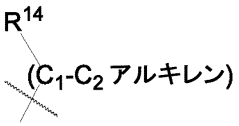
ある実施形態において、Ｒ^{4}は水素であり；Ｒ^{5}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；Ｒ^{4}及びＲ^{5}に結合される炭素は、（Ｒ）立体化学を有する。

【０７８２】

基Ｒ^{3}

ある実施形態において、Ｒ^{3}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及び

【化１４８】



から選択され、式中、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{2}$アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換される。

【０７８３】

ある実施形態において、Ｒ^{3}は水素である。

【０７８４】

ある実施形態において、Ｒ^{3}はシアノである。

【０７８５】

ある実施形態において、Ｒ^{3}はヒドロキシである。

【０７８６】

ある実施形態において、Ｒ^{3}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシである。

【０７８７】

ある実施形態において、Ｒ^{3}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。

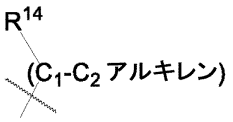
【０７８８】

ある実施形態において、Ｒ^{3}はメチルである。

【０７８９】

ある実施形態において、Ｒ^{3}は、

【化１４９】



であり、式中、Ｃ１～Ｃ２アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換される。

【０７９０】

ある実施形態において、Ｒ３は－ＣＨ２Ｒ１４である。

【０７９１】

ある実施形態において、Ｒ３は－Ｃ（Ｏ）Ｒ１４である。

【０７９２】

ある実施形態において、Ｒ３は－ＣＨ２ＣＨ２Ｒ１４である。

【０７９３】

ある実施形態において、Ｒ３は－ＣＨＲ１４ＣＨ３である。

【０７９４】

ある実施形態において、Ｒ３は－ＣＨ２Ｃ（Ｏ）Ｒ１４である。

【０７９５】

ある実施形態において、Ｒ３は－Ｃ（Ｏ）ＣＨ２Ｒ１４である。

【０７９６】

基Ｒ１４

ある実施形態において、Ｒ１４は、水素、Ｃ１～Ｃ６アルキル、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ６～Ｃ１０単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ１～Ｃ６アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのＲ６で任意選択的に独立して置換される。

【０７９７】

ある実施形態において、Ｒ１４は、水素又はＣ１～Ｃ６アルキルである。

【０７９８】

ある実施形態において、Ｒ１４は、水素、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ６～Ｃ１０単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各Ｃ１～Ｃ６アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのＲ６で任意選択的に独立して置換される。

【０７９９】

ある実施形態において、Ｒ１４は水素である。

【０８００】

ある実施形態において、Ｒ１４はＣ１～Ｃ６アルキルである。

【０８０１】

ある実施形態において、Ｒ１４はメチルである。

【０８０２】

ある実施形態において、Ｒ１４は、１つ又は２つのＲ６で任意選択的に独立して置換される５員～１０員単環式又は二環式ヘテロアリールである。

【０８０３】

ある実施形態において、Ｒ１４は、１つ又は２つのＲ６で任意選択的に独立して置換されるＣ６～Ｃ１０単環式又は二環式アリールである。

【０８０４】

部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ３）＝Ｎ－

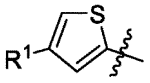
ある実施形態において、部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ３）＝Ｎ－中の硫黄は、（Ｓ）立体化学を有する。

【０８０５】

ある実施形態において、部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ３）＝Ｎ－中の硫黄は、（Ｒ）立体化

学を有する。
【０８０６】
基R^{10}
ある実施形態において、R^{10}はC_1～C_6アルキルである。
【０８０７】
ある実施形態において、R^{10}はメチルである。
【０８０８】
ある実施形態において、R^{10}はエチルである。
【０８０９】
基R^8及びR^9
ある実施形態において、R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（C＝NR^{13}）$NR^{11}R^{12}$、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成する。
【０８１０】
ある実施形態において、R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、水素である。
【０８１１】
ある実施形態において、各R^8は、出現するごとに、水素であり、各R^9は、出現するごとに、C_1～C_6アルキルである。
【０８１２】
ある実施形態において、各R^8は、出現するごとに、水素であり、各R^9は、出現するごとに、メチルである。
【０８１３】
ある実施形態において、各R^8は、出現するごとに、水素であり、各R^9は、出現するごとに、エチルである。
【０８１４】
ある実施形態において、R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、メチルである。
【０８１５】
ある実施形態において、R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、エチルである。
【０８１６】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、３員環を形成する。
【０８１７】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、４員環を形成する。
【０８１８】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、５員環を形成する。
【０８１９】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上の酸素原子を任意選択的に含有する６員環を形成する。
【０８２０】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上の窒素原子を任意選択的に含有する６員環を形成する。

【０８２１】
ある実施形態において、R^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、７員環を形成する。
【０８２２】
基R^{13}
ある実施形態において、R^{13}はC_1～C_6アルキルである。
【０８２３】
ある実施形態において、R^{13}はメチルである。
【０８２４】
ある実施形態において、R^{13}はエチルである。
【０８２５】
ある実施形態において、R^{13}はC_6～C_{10}アリールである。
【０８２６】
ある実施形態において、R^{13}はフェニルである。
【０８２７】
ある実施形態において、R^{13}は５員～１０員ヘテロアリールである。
【０８２８】
基R^{11}及びR^{12}
ある実施形態において、R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択される。
【０８２９】
ある実施形態において、R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、水素である。
【０８３０】
ある実施形態において、各R^{11}は、出現するごとに、水素であり、各R^{12}は、出現するごとに、C_1～C_6アルキルである。
【０８３１】
ある実施形態において、各R^{11}は、出現するごとに、水素であり、各R^{12}は、出現するごとに、メチルである。
【０８３２】
ある実施形態において、各R^{11}は、出現するごとに、水素であり、各R^{12}は、出現するごとに、エチルである。
【０８３３】
ある実施形態において、R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、メチルである。
【０８３４】
ある実施形態において、R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、エチルである。
【０８３５】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１５０】



であり；
R^1は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ

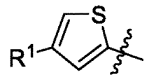
１～Ｃ６アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ３～Ｃ７シクロアルキル；１つ以上のＣ１～Ｃ６アルコキシで置換されるＣ１～Ｃ６アルキル；１つ以上のＣ１～Ｃ６アルコキシで置換されるＣ３～Ｃ７シクロアルキル；１つ以上のＮＲ８Ｒ９で置換されるＣ１～Ｃ６ハロアルキル；１つ以上のＮＲ８Ｒ９で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルＣ１～Ｃ６ハロアルキル；Ｃ１～Ｃ６アルコキシ；Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ２；ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル；ＣＯ－Ｃ６～Ｃ１０アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル；ＣＯ２Ｃ３～Ｃ８シクロアルキル；ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル；ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ６～Ｃ１０アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ２；ＮＨＣ１～Ｃ６アルキル；Ｎ（Ｃ１～Ｃ６アルキル）２；ＣＯＮＲ８Ｒ９；ＳＦ５；及びＳ（Ｏ２）Ｃ１～Ｃ６アルキルから選択される。

【０８３６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５１】



であり；

Ｒ１は、

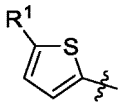
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ３；ＣＯＣＨ２ＣＨ３；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ２）ＣＨ３から選択される。

【０８３７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５２】



であり；

Ｒ１は、

１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ３～Ｃ７シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ１～Ｃ６アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ３～Ｃ７シクロアルキル；１つ以上のＣ１～Ｃ６アルコキシで置換されるＣ１～Ｃ６アルキル；１つ以上のＣ１～Ｃ６アルコキシで置換されるＣ３～Ｃ７シクロアルキル；１つ以上のＮＲ８Ｒ９で置換されるＣ１～Ｃ６アルキル；１つ以上のＮＲ８Ｒ９で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ１～Ｃ６ハロアルキル；Ｃ１～Ｃ６アルコキシ；Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ２；ＣＯＣ１～Ｃ６アルキル；ＣＯ－Ｃ６～Ｃ１０アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ２Ｃ１～Ｃ６アルキル；ＣＯ２Ｃ３～Ｃ８シクロアルキル；ＯＣＯＣ１～Ｃ６アルキル；ＯＣＯＣ６～Ｃ１０アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３

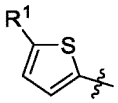
員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８３８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５３】



であり；

Ｒ^{1}は、

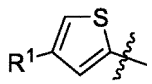
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８３９】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５４】



であり；

Ｒ^{1}は、

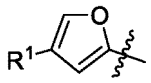
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８４０】

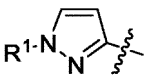
式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

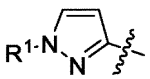
【化１５５】



であり；
　Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。
【０８４１】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ａは、
【化１５６】



であり；
　Ｒ^{1}は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。
【０８４２】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ａは、
【化１５７】



であり；
　Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキ

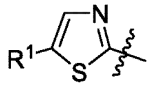
シ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；$COCH_3$；$COCH_2CH_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（O_2）CH_3から選択される。

【０８４３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５８】



であり；

R^1は、

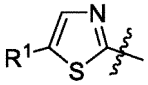
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のオキソで置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のC_1～C_6アルコキシで置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のC_1～C_6アルコキシで置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のNR^8R^9で置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のNR^8R^9で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；C_1～C_6ハロアルキル；C_1～C_6アルコキシ；C_1～C_6ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；NO_2；OC_1～C_6アルキル；ＣＯ－C_6～C_{10}アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；CO_2C_1～C_6アルキル；CO_2C_3～C_8シクロアルキル；$OCOC_1$～C_6アルキル；$OCOC_6$～C_{10}アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；C_6～C_{10}アリール；５員～１０員ヘテロアリール；NH_2；NHC_1～C_6アルキル；Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$；$CONR^8R^9$；SF_5；及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから選択される。

【０８４４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１５９】



であり；

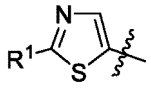
R^1は、

１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；$COCH_3$；$COCH_2CH_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（O_2）CH_3から選択される。

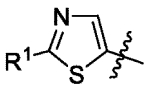
【０８４５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

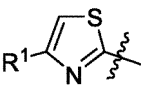
置換される環Ａは、
【化１６０】



であり；
Ｒ^{1}は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。
【０８４６】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１６１】



であり；
Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。
【０８４７】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１６２】



であり；
Ｒ^{1}は、

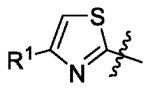
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８４８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１６３】



であり；

Ｒ^{1}は、

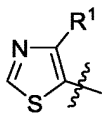
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８４９】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１６４】



であり；

Ｒ^{1}は、

１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；

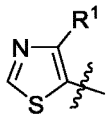
ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８５０】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１６５】



であり；

Ｒ^{1}は、

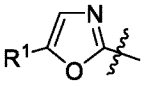
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８５１】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１６６】



であり；

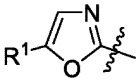
Ｒ^{1}は、

１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

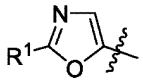
【０８５２】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

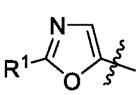
置換される環Ａは、
【化１６７】



であり；
Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。
【０８５３】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１６８】



であり；
Ｒ^{1}は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。
【０８５４】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１６９】



であり；
Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ

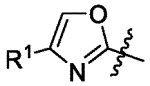
－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８５５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７０】



であり；

Ｒ^{1}は、

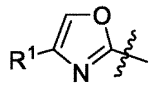
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８５６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７１】



であり；

Ｒ^{1}は、

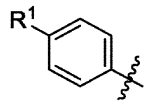
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８５７】

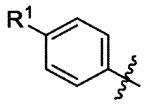
式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

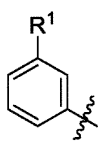
【化１７２】



であり；
　Ｒ^{1}は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。
【０８５８】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ａは、
【化１７３】



であり；
　Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。
【０８５９】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ａは、
【化１７４】



であり；
　Ｒ^{1}は、

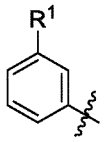
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８６０】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７５】



であり；

Ｒ^{1}は、

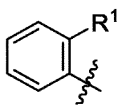
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８６１】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７６】



であり；

Ｒ^{1}は、

１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$ア

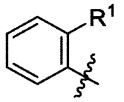
ルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。

【０８６２】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７７】



であり；

Ｒ^{1}は、

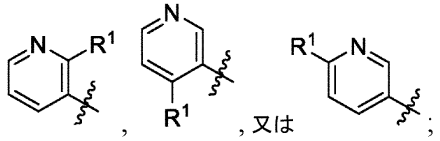
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。

【０８６３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７８】



であり；

Ｒ^{1}は、

１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；

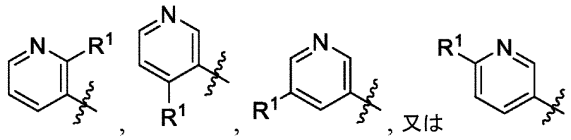
ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８６４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１７９】



であり；

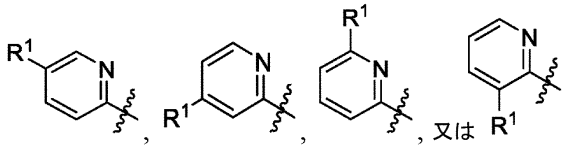
Ｒ^{1}は、

１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_3$；ＣＯＣＨ$_2$ＣＨ$_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$から選択される。

【０８６５】

置換される環Ａは、

【化１８０】



であり；

Ｒ^{1}は、

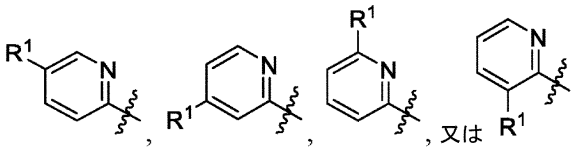
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで置換されるＣ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ；Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_2$；ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_8$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_2$；ＮＨＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；Ｎ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）$_2$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9；ＳＦ$_5$；及びＳ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルから選択される。

【０８６６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１８１】



であり；

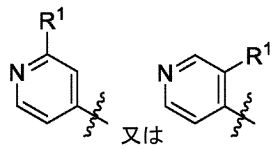
Ｒ^{1}は、

１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。

【０８６７】

Ａは、

【化１８２】



であり；

Ｒ^{1}は、

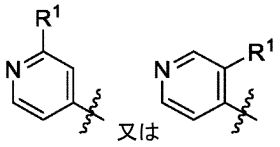
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。

【０８６８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

Ａは、

【化１８３】

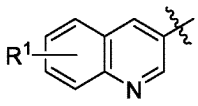


であり；

R^1は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；$COCH_3$；$COCH_2CH_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（O_2）CH_3から選択される。

【０８６９】

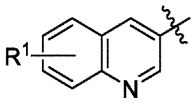
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
Ａは、
【化１８４】



であり；
R^1は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のオキソで置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のC_1～C_6アルコキシで置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のC_1～C_6アルコキシで置換されるC_3～C_7シクロアルキル；１つ以上のNR^8R^9で置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のNR^8R^9で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；C_1～C_6ハロアルキル；C_1～C_6アルコキシ；C_1～C_6ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；NO_2；OC_1～C_6アルキル；ＣＯ－C_6～C_{10}アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；CO_2C_1～C_6アルキル；CO_2C_3～C_8シクロアルキル；$OCOC_1$～C_6アルキル；$OCOC_6$～C_{10}アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；C_6～C_{10}アリール；５員～１０員ヘテロアリール；NH_2；NHC_1～C_6アルキル；Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$；$CONR^8R^9$；SF_5；及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルから選択される。

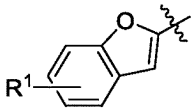
【０８７０】

Ａは、
【化１８５】

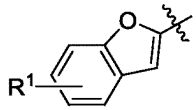


であり；
R^1は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；$COCH_3$；$COCH_2CH_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（O_2）CH_3から選択される。

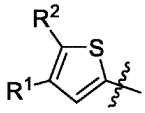
【０８７１】
Ａは、
【化１８６】



であり；
Ｒ^{1}は、
１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のオキソで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ；Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＮＯ$_{2}$；ＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）；Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；５員～１０員ヘテロアリール；ＮＨ$_{2}$；ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル；Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}；ＳＦ$_{5}$；及びＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから選択される。
【０８７２】
Ａは、
【化１８７】

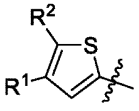


であり；
Ｒ^{1}は、
１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；ＣＯＣＨ$_{3}$；ＣＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；及びＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$から選択される。
【０８７３】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
Ａは、
【化１８８】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｉｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；
（ｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はS（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5である。
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はS（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；

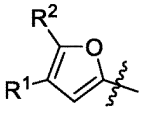
又は
（ｘｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロである。
【０８７４】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１８９】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；
（ｉＶ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（Ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；
（Ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（Ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（Ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；

（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチル、及びＲ^{1}はメチルである。

【０８７５】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１９０】



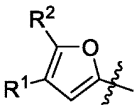
であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであ

り、R^2はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。

【０８７６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化１９１】



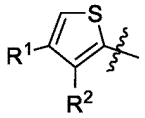
であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルであり；
（ｘｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルであり；
（ｘｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフルオロであり；
（ｘｖｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘ）R^1はモルホリニルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）R^1は$COCH_3$であり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｖ）R^1は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）R^1は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）R^2は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）R^2はヒドロキシメチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）R^2は１－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）R^2は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アル

キルであり、R^1はＳ（O_2）CH_3であり；
（ｘｌ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はクロロであり；
（ｘｌｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）R^2はモルホリニルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はフルオロであり；
（ｌ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はクロロであり；
（ｌｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉ）R^2は$COCH_3$であり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）R^2は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）R^2は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^1はメチルである。

【０８７７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

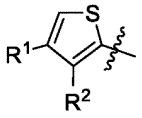
【化１９２】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｉｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；
（ｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6

アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5である。
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。

【０８７８】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１９３】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；

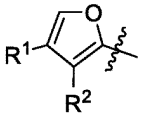
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；

（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８７９】

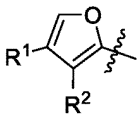
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化１９４】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル

であり、R^1はSF_5である。
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。
【０８８０】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１９５】



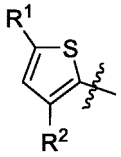
であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルであり；
（ｘｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルであり；
（ｘｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフルオロであり；

（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}は$COCH_3$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、Ｒ^{1}は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}は$COCH_3$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８８１】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、
【化１９６】



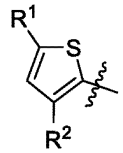
であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳＦ$_{5}$である。
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

（ｘｘｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロである。

【０８８２】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化１９７】

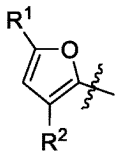


であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；

（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８８３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化１９８】



であり；

R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｉｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；
（ｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｖ）又は

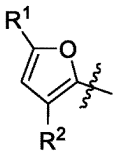
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロである。

【０８８４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ａは、

【化１９９】



であり；

Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：

（ｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；

（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；

（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；

（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；

（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；

（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；

（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；

（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；

（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；

（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；

（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；

（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；

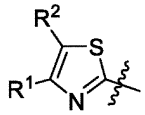
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；

（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；

（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチル

であり；
（ｘｘｉ）R^2はヒドロキシメチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は１－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシエチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｖ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフェニルであり；
（ｘｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｖｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピリジルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピラゾリルであり；
（ｘｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はＳ（O_2）CH_3であり；
（ｘｌ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はクロロであり；
（ｘｌｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）R^2はモルホリニルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はフルオロであり；
（ｌ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はクロロであり；
（ｌｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉ）R^2は$COCH_3$であり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）R^2は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）R^2は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^1はメチルである。

【０８８５】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２００】



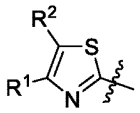
であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｉｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；

（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロである。

【０８８６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

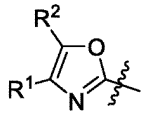
【化２０１】



であり；
　Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
　（ｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；
　（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
　（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；
　（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
　（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
　（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
　（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
　（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
　（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
　（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
　（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
　（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
　（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
　（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
　（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
　（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
　（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アル

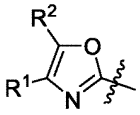
キルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｌ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はクロロであり；
（ｘｌｉ）R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^1はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）R^2は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）R^2はモルホリニルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はフルオロであり；
（ｌ）R^2は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^1はクロロであり；
（ｌｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉ）R^2は$COCH_3$であり、R^1はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）R^2は２－メトキシ－２－プロピルであり、R^1はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）R^2は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^1はメチルである。

【０８８７】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０２】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｉｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；
（ｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロ

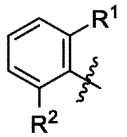
シクロアルキルであり、R^2はC1～C6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC1～C6アルコキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^2はC1～C6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^2はC1～C6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はC6～C10アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はS（O_2）C1～C6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC3～C7シクロアルキルであり、R^1はC1～C6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC1～C6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC1～C6アルコキシで任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はC1～C6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はC1～C6アルキルであり；又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC1～C6アルキルであり、R^1はハロである。
【０８８８】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０３】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；

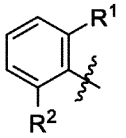
（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであ

り；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。
【０８８９】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０４】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキ

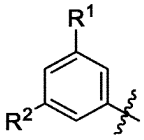
ルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。
【０８９０】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０５】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルであり；
（ｘｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルであり；

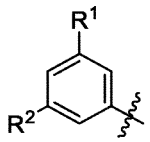
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；

（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。
【０８９１】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０６】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アル

キルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；又は
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。
【０８９２】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０７】



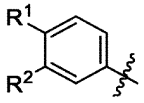
であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルであり；
（ｘｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルであり；
（ｘｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフルオロであり；
（ｘｖｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^2はメチルであり；

（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８９３】

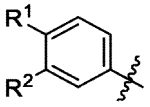
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２０８】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで

あり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。
【０８９４】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、
【化２０９】



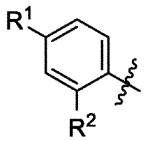
であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はイソプロピルであり；
（ｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）R^1はヒドロキシメチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシエチルであり、R^2はメチルであり；
（ｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフェニルであり；
（ｘｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピリジルであり；
（ｘｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2は$S(O_2)CH_3$であり；
（ｘｉｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｖ）R^1は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、R^2はフルオロであり；
（ｘｖｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉｘ）R^1は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘ）R^1はモルホリニルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^1は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、R^2はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）R^1は$COCH_3$であり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）R^1は（ジメチルアミノ）メチルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）R^2は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^1はメチルであり；

（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８９５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

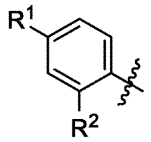
【化２１０】



であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル

であり、R^2は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はSF_5であり；
（ｖ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｖｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｖｉｉ）R^1は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は$S(O_2)C_1$～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルである。
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
【０８９６】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２１１】



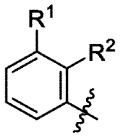
であり；
Ｒ１及びＲ２は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｉｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｉｉｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はイソプロピルであり；
（ｉｖ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）Ｒ１はヒドロキシメチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｖｉｉ）Ｒ１は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はＳ（Ｏ$_2$）ＣＨ$_3$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ１は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ１は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ１はモルホリニルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ１は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ１は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ２はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ１は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ２はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ１はＣＯＣＨ$_3$であり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ１は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ１は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ２はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ２は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ２は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ２は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ１はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ２は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ１は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ２はヒドロキシメチルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ２は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ２は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ２は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ１はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ２は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ１はフェニルであり；

（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８９７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２１２】



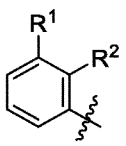
であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロア

ルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｉｘ）R^1は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘ）R^1は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はメチルであり；
（ｘｉ）R^1は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）R^1は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^2はハロであり；
（ｘｉｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_6～C_{10}アリールであり；
（ｘｖ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はSF_5であり；
（ｘｖｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はＳ（O_2）C_1～C_6アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロであり；
（ｉｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉ）R^2は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、R^1はハロであり；
（ｘｘｉｉ）R^2は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）R^2は、１つ以上のC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はC_1～C_6アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）R^2は、１つ以上のNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり、R^1はハロである。

【０８９８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２１３】



であり；
R^1及びR^2は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）R^1は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、R^2はメチルで

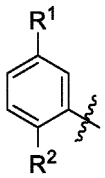
あり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；

（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０８９９】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２１４】



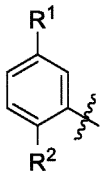
であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｖ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；

（ｘｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{2}はハロであり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリールであり；
（ｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳＦ$_{5}$であり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキルであり、Ｒ^{1}はハロであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
又は
（ｘｘｖ）Ｒ^{2}は、１つ以上のＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はハロである。

【０９００】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ａは、

【化２１５】



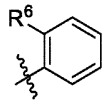
であり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、以下の組合せのうちの１つである：
（ｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はイソプロピルであり；
（ｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり；
（ｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであ

り；
（ｖｉ）Ｒ^{1}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフェニルであり；
（ｘｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピリジルであり；
（ｘｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はピラゾリルであり；
（ｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｉｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｖ）Ｒ^{1}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｖｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｖｉｉｉ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｉｘ）Ｒ^{1}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘ）Ｒ^{1}はモルホリニルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はフルオロであり；
（ｘｘｉｉｉ）Ｒ^{1}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{2}はクロロであり；
（ｘｘｉｖ）Ｒ^{1}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖ）Ｒ^{1}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉ）Ｒ^{1}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{2}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はイソプロピルであり；
（ｘｘｘ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}は１－ヒドロキシエチルであり；
（ｘｘｘｉ）Ｒ^{2}はヒドロキシメチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシエチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｘｘｖ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフェニルであり；
（ｘｘｘｖｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}は５員～１０員ヘテロアリールであり；
（ｘｘｘｖｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピリジルであり；
（ｘｘｘｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はピラゾリルであり；
（ｘｘｘｉｘ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はＳ（Ｏ$_{2}$）ＣＨ$_{3}$であり；
（ｘｌ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｘｌｉ）Ｒ^{2}は２－ヒドロキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｘｌｉｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のヒドロキシで任意選択的に置換されるＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
（ｘｌｉｉｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロプロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロブチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロペンチルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；

（ｘｌｖｉ）Ｒ^{2}は１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉ）Ｒ^{2}はモルホリニルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｖｉｉｉ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｘｌｉｘ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はフルオロであり；
（ｌ）Ｒ^{2}は１，３－ジオキソラン－２－イルであり、Ｒ^{1}はクロロであり；
（ｌｉ）Ｒ^{2}は、１つ以上のオキソで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}はＣＯＣＨ$_{3}$であり、Ｒ^{1}はメチルであり；又は
（ｌｉｉ）Ｒ^{2}は２－メトキシ－２－プロピルであり、Ｒ^{1}はメチルであり；
又は
（ｌｉｖ）Ｒ^{2}は（ジメチルアミノ）メチルであり、Ｒ^{1}はメチルである。

【０９０１】

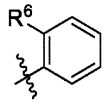
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２１６】



であり；
Ｒ^{6}は、
Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、ハロ、及びシアノから選択される。

【０９０２】

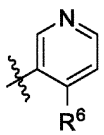
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２１７】



であり；
Ｒ^{6}は、
イソプロピル、エチル、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロ、クロロ、及びフルオロから選択される。

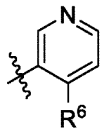
【０９０３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２１８】

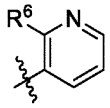


であり；
Ｒ^{6}は、
Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、ハロ、及びシアノから選択される。

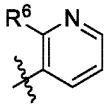
【０９０４】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２１９】



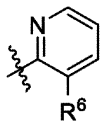
であり；
Ｒ^{6}は、
イソプロピル、エチル、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロ、クロロ、及びフルオロから選択される。
【０９０５】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２０】



であり；
Ｒ^{6}は、
Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、ハロ、及びシアノから選択される。
【０９０６】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２１】

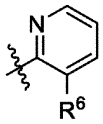


であり；
Ｒ^{6}は、
イソプロピル、エチル、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロ、クロロ、及びフルオロから選択される。
【０９０７】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２２】

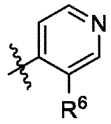


であり；

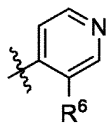
Ｒ^{6}は、
Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、ハロ、及びシアノから選択される。
【０９０８】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２３】



であり；
Ｒ^{6}は、
イソプロピル、エチル、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロ、クロロ、及びフルオロから選択される。
【０９０９】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２４】

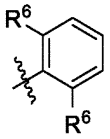


であり；
Ｒ^{6}は、
Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、ハロ、及びシアノから選択される。
【０９１０】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２５】



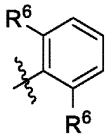
であり；
Ｒ^{6}は、
イソプロピル、エチル、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シクロプロピル、ハロ、クロロ、及びフルオロから選択される。
【０９１１】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２２６】



であり；
２つのＲ^{6}は、以下の組合せのうちの１つである：
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}が、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}が、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}がハロであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}がシアノであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、他方のＲ^{6}がハロであり；
一方のＲ^{6}がシクロプロピルであり、他方のＲ^{6}がハロであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}が、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、他方のＲ^{6}が、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
一方のＲ^{6}がハロであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
一方のＲ^{6}がハロであり、他方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；他方のＲ^{6}がハロであり；
一方のＲ^{6}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；他方のＲ^{6}がクロロである。

【０９１２】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２２７】



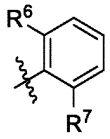
であり；
２つのＲ^{6}は、以下の組合せのうちの１つである：
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がメチルであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がｎ－プロピルであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がイソプロピルであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がクロロであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がフルオロであり；
一方のＲ^{6}がエチルであり；他方のＲ^{6}がフルオロであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がシアノであり；

一方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；他方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；
一方のＲ^{6}がシクロプロピルであり；他方のＲ^{6}がクロロであり；
一方のＲ^{6}はシクロプロピルであり；他方のＲ^{6}がフルオロであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がメトキシであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメトキシである。

【０９１３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２２８】



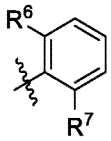
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロである。

【０９１４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２２９】

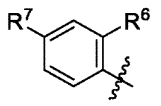


であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメトキシであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。

【０９１５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

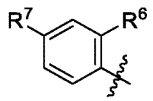
【化２３０】



であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
　Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
　Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はシアノであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
　Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はハロであり；
　Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロである。

【０９１６】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ｂは、

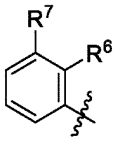
【化２３１】



であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメトキシであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。

【０９１７】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２３２】



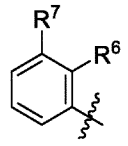
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アル

キルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7はハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7はシアノであり；
R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり；
R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はハロであり；
R^6はシクロプロピルであり、R^7はハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7はC_1～C_6アルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^6はハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルキルであり；
R^6はハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルコキシであり；R^7はハロであり；
R^6はC_1～C_6アルコキシであり；R^7はクロロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はシアノであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はハロであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はC_1～C_6アルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^7はハロであり、R^6はC_1～C_6ハロアルキルであり；
R^7はハロであり、R^6はC_1～C_6ハロアルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルコキシであり；R^6はハロであり；
R^7はC_1～C_6アルコキシであり；R^6はクロロであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換されるC_4～C_6脂肪族炭素環を形成し；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換される。

【０９１８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

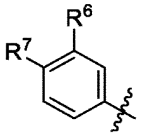
【化２３３】



であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメトキシであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
　Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
　Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
　Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
　Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$脂肪族炭素環を形成し；
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；又は
　隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成する。

【０９１９】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２３４】



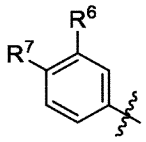
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロであり；

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に置換されるＣ$_{4}$～Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；又は
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に置換される。

【０９２０】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２３５】



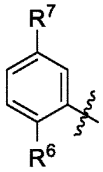
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメトキシであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$脂肪族炭素環を形成し；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；

隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；又は
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成する。

【０９２１】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

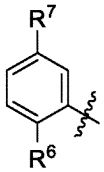
【化２３６】



であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{6}はハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；

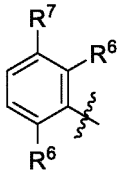
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{7}はハロであり、Ｒ^{6}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロである。

【０９２２】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２３７】



であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はエチルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメトキシであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。

【０９２３】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２３８】



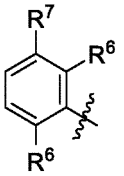
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

R^7はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシであり；
R^7はハロであり、各R^6は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキルであり；
R^7はハロであり、各R^6は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシであり；
R^7はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシであり；各R^6はクロロであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に置換されるＣ$_4$～Ｃ$_6$脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、ハロ又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に置換され；１つのR^6は、ハロ又はシアノである。

【０９２４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２３９】



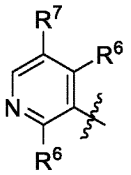
であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
各R^6はイソプロピルであり；R^7はメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はイソプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はエチルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はシアノであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；

Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{4}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{6}は、クロロ、フルオロ、又はシアノである。

【０９２５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２４０】



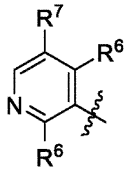
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}はシアノであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
Ｒ^{7}はハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
Ｒ^{7}はハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に置換されるＣ$_{4}$～Ｃ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{6}は、ハロ又はシアノであり；又は
隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルで任意選択的に置換され；１つのＲ^{6}は、ハロ又はシアノである。

【０９２６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２４１】



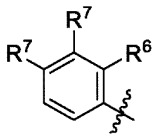
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はフルオロであり；

各R^6はエチルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はシアノであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
一方のR^6がイソプロピルであり；他方のR^6がトリフルオロメチルであり；R^7はクロロであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_6脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノである。

【０９２７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２４２】



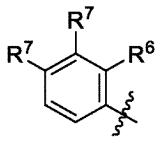
であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に

置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、ハロであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７はシアノであり；
Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり、各Ｒ７は、独立して、ハロであり；
Ｒ６はシクロプロピルであり、各Ｒ７は、独立して、ハロであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はハロであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキルであり、
Ｒ６はハロであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；各Ｒ７は、独立して、ハロであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；各Ｒ７はクロロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はシアノであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、ハロであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６ハロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、ハロであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６ハロアルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；Ｒ６はクロロである。

【０９２８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

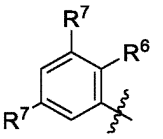
【化２４３】



であり；
　Ｒ６及びＲ７は、以下の組合せのうちの１つである：
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はメチルであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はイソプロピルであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はシクロプロピルであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はクロロであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はフルオロであり；
　各Ｒ７はエチルであり；Ｒ６はフルオロであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はシアノであり；
　各Ｒ７はシクロプロピルであり；Ｒ６はシクロプロピルであり；
　各Ｒ７はシクロプロピルであり；Ｒ６はクロロであり；
　各Ｒ７はシクロプロピルであり；Ｒ６はフルオロであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はメトキシであり；
　各Ｒ７はイソプロピルであり；Ｒ６はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ７はクロロであり；Ｒ６はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ７はクロロであり；Ｒ６はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はメチルであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はシクロプロピルであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はクロロであり；
　Ｒ７はエチルであり；各Ｒ６はフルオロであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はシアノであり；
　Ｒ７はシクロプロピルであり；各Ｒ６はシクロプロピルであり；
　Ｒ７はシクロプロピルであり；各Ｒ６はクロロであり；
　Ｒ７はシクロプロピルであり；各Ｒ６はフルオロであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はメトキシであり；
　Ｒ７はイソプロピルであり；各Ｒ６はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ７はクロロであり；各Ｒ６はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ７はクロロであり；各Ｒ６はトリフルオロメトキシである。

【０９２９】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ｂは、

【化２４４】



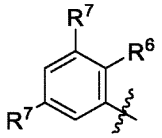
であり；
　Ｒ６及びＲ７は、以下の組合せのうちの１つである：
　Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
　Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり；

R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7はシアノであり；
R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はシクロプロピルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^6はハロであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり、
R^6はハロであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
R^6はC_1～C_6アルコキシであり；各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はC_1～C_6アルコキシであり；各R^7はクロロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6はハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6はハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6はシアノであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はハロであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^6はハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6はC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^6は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、R^6はC_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、R^6はC_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^6はハロであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^6はクロロである。

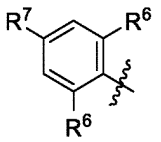
【０９３０】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２４５】



であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメチルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はエチルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；Ｒ^{7}はシアノであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
　Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
　Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
　各Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。
【０９３１】
　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ｂは、
【化２４６】



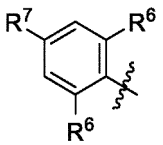
であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}は、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はハロであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；

各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はハロであり；
各R^6は、独立して、シクロプロピルであり、R^7はハロであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はC_1～C_6アルコキシであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^6は、独立して、ハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^6は、独立して、ハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^7はハロであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^7はクロロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6はシアノであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
R^7はハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
R^7はハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
R^7はC_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
R^7はC_1～C_6アルコキシであり；各R^6はクロロである。

【０９３２】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２４７】



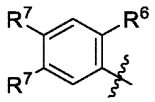
であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
各R^6はイソプロピルであり；R^7はメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はイソプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はシクロプロピルであり；

各R^6はイソプロピルであり；R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はエチルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はシアノであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；R^7はトリフルオロメトキシであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；
R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
（R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
一方のR^6がイソプロピルであり；他方のR^6がトリフルオロメチルであり；R^7はクロロである。

【０９３３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

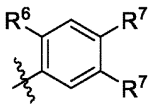
【化２４８】



であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7はシアノであり；
R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
（R^6はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はシクロプロピルであり、各R^7は、独立して、ハロであり；
R^6はC_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に

置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルキルであり、各Ｒ７は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
Ｒ６はハロであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６ハロアルキルであり；
Ｒ６はハロであり、各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６ハロアルコキシであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；各Ｒ７は、独立して、ハロであり；
Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；各Ｒ７はクロロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はシアノであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はＣ３～Ｃ７シクロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ３～Ｃ７シクロアルキルであり、Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルキルであり、Ｒ６は、１つ以上のハロで置換されるＣ１～Ｃ６アルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、ハロであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６ハロアルキルであり；
各Ｒ７は、独立して、ハロであり、Ｒ６はＣ１～Ｃ６ハロアルコキシであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；Ｒ６はハロであり；
各Ｒ７は、独立して、Ｃ１～Ｃ６アルコキシであり；Ｒ６はクロロである。

【０９３４】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２４９】



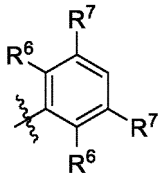
であり；
Ｒ６及びＲ７は、以下の組合せのうちの１つである：
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はメチルであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はイソプロピルであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はトリフルオロメチルであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はシクロプロピルであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はクロロであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はフルオロであり；
Ｒ６はエチルであり；各Ｒ７はフルオロであり；
Ｒ６はイソプロピルであり；各Ｒ７はシアノであり；
Ｒ６はシクロプロピルであり；各Ｒ７はシクロプロピルであり；

Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はエチルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はシアノであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシである。

【０９３５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５０】



であり；

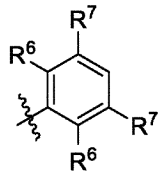
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^7は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^6は、独立して、ハロであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^6は、独立して、ハロであり、各R^7は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^7は、独立して、ハロであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^7はクロロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6はシアノであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6はクロロであり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_8脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換されるC_4～C_6脂肪族炭素環を形成し；又は
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換される。

【０９３６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５１】



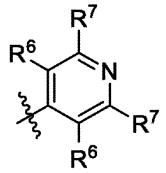
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はエチルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はエチルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシアノであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；一方のＲ^{7}がフルオロであり；他方のＲ^{7}がシアノであり；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{4}$脂肪族炭素環を形成し；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；

１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換され；又は
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換される。

【０９３７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５２】

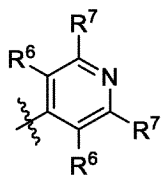


であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり、
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；

各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6はシアノであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり、
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6はクロロであり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_8脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換されるC_4～C_6脂肪族炭素環を形成し；又は
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換される。

【０９３８】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２５３】



であり；

R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はイソプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はエチルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシアノであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
一方のR^6がイソプロピルであり；他方のR^6がトリフルオロメチルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；一方のR^7がフルオロであり；他方のR^7がシアノであり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるC_4脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるC_5脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるC_6脂肪族炭素環を形成し；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換され；又は
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6

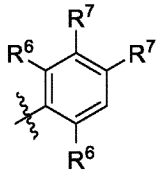
及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換される。

【０９３９】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、

置換される環Ｂは、

【化２５４】



であり；

Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}はシアノであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；

各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；

各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；

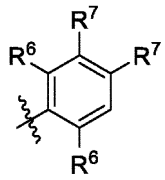
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；

各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}はシアノであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{6}はクロロである。

【０９４０】

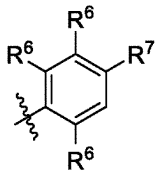
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２５５】



であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はエチルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；

各Ｒ^{7}はエチルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシアノであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；一方のＲ^{7}がフルオロであり；他方のＲ^{7}がシアノである。

【０９４１】
式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２５６】



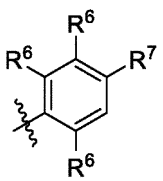
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^7は、独立して、ハロであり；
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^7はクロロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6はシアノであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6はクロロであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換されるC_4～C_6脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、ハロ又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換され；１つのR^6は、ハロ又はシアノである。

【０９４２】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５７】



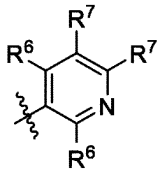
であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はイソプロピルであり；

各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はエチルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシアノであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
一方のR^6がイソプロピルであり；他方のR^6がトリフルオロメチルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；一方のR^7がフルオロであり；他方のR^7がシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_6脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノである。

【０９４３】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５８】



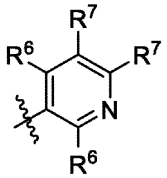
であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{7}はシアノであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{7}はクロロであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、Ｒ^{6}はシアノであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
　各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであ

り；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；Ｒ^{6}はクロロである。

【０９４４】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２５９】



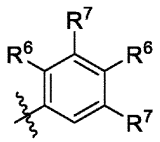
であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はエチルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はエチルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシアノであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメトキシであり；

各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
一方のＲ^{6}がイソプロピルであり；他方のＲ^{6}がトリフルオロメチルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；一方のＲ^{7}がフルオロであり；他方がＲ^{7}がシアノである。

【０９４５】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２６０】

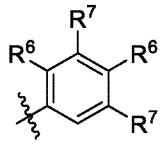


であり；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}はシアノであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、シクロプロピルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{7}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、ハロであり、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}は、独立して、ハロであり；
各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、１つ以上のハロで置換されるＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり；
各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シク

ロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6はシアノであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
各R^7は、独立して、ハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
各R^7は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_8脂肪族炭素環を形成し；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換されるC_4～C_6脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、ハロ又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換され；１つのR^6は、ハロ又はシアノである。

【０９４６】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、
【化２６１】



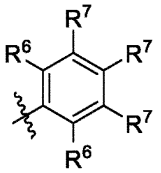
であり；
R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はイソプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はエチルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はシアノであり；

各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はシクロプロピルであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はシクロプロピルであり；各R^7はフルオロであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はメトキシであり；
各R^6はイソプロピルであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメチルであり；
各R^6はクロロであり；各R^7はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はエチルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はシアノであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はシクロプロピルであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はクロロであり；
各R^7はシクロプロピルであり；各R^6はフルオロであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はメトキシであり；
各R^7はイソプロピルであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメチルであり；
各R^7はクロロであり；各R^6はトリフルオロメトキシであり；
一方のR^6がイソプロピルであり；他方のR^6がトリフルオロメチルであり；各R^7はクロロであり；
各R^6はイソプロピルであり；一方のR^7がフルオロであり；他方のR^7がシアノであり；
１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_6脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノであり；又は
隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する原子と一緒になって、C_5脂肪族炭素環を形成し；１つのR^6は、クロロ、フルオロ、又はシアノである。

【０９４７】

式ＡＡの化合物のある実施形態において、
置換される環Ｂは、

【化２６２】



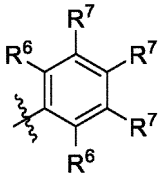
であり；
　R^6及びR^7は、以下の組合せのうちの１つである：
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、各R^7は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はC_1～C_6アルキルであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はハロであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はシアノであり；
　各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり；
　各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり、R^7はハロであり；
　各R^6は、独立して、シクロプロピルであり、R^7はハロであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7はC_1～C_6アルコキシであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキルであり、R^7は、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
　各R^6は、独立して、ハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルキルであり；
　各R^6は、独立して、ハロであり、R^7はC_1～C_6ハロアルコキシであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^7はハロであり；
　各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；R^7はクロロであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキルであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルキルであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、R^6はシアノであり；
　R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、C_3～C_7シクロアルキルであり；
　R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
　R^7はC_3～C_7シクロアルキルであり、各R^6は、独立して、ハロであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで任意選択的に置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6アルコキシであり；
　R^7はC_1～C_6アルキルであり、各R^6は、独立して、１つ以上のハロで置換されるC_1～C_6アルコキシであり；
　R^7はハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルキルであり；
　R^7はハロであり、各R^6は、独立して、C_1～C_6ハロアルコキシであり；
　R^7はC_1～C_6アルコキシであり；各R^6は、独立して、ハロであり；
　R^7はC_1～C_6アルコキシであり；R^6はクロロであり；
　１つのR^6及び１つのR^7のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、C_4～C_8脂肪族炭素環を形成し；１つのR^7はハロであり、１つのR^6及び１つのR^7の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はC_1～C_6アルキルで任意

選択的に置換されるＣ$_4$～Ｃ$_6$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}は、ハロ又はシアノであり；又は
　１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員～６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルで任意選択的に置換され；１つのＲ^{7}は、ハロ又はシアノである。

【０９４８】

　式ＡＡの化合物のある実施形態において、
　置換される環Ｂは、

【化２６３】



であり；
　Ｒ^{6}及びＲ^{7}は、以下の組合せのうちの１つである：
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメチルであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　各Ｒ^{6}はエチルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はシアノであり；
　各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はクロロであり；
　各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{7}はフルオロであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はメトキシであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{6}はクロロであり；各Ｒ^{7}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメチルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
　各Ｒ^{7}はエチルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はシアノであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はシクロプロピルであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はクロロであり；
　各Ｒ^{7}はシクロプロピルであり；各Ｒ^{6}はフルオロであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はイソプロピルであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメチルであり；
　各Ｒ^{7}はクロロであり；各Ｒ^{6}はトリフルオロメトキシであり；
　各Ｒ^{6}はイソプロピルであり；２つのＲ^{7}はフルオロであり；１つのＲ^{7}はクロロであり；
　１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^6

及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｃ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はクロロであり；
（ｉ）１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{4}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はフルオロ又はクロロであり；
（ｉｉ）１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{5}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はフルオロ又はクロロであり；
（ｉｉｉ）１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換されるＣ$_{6}$脂肪族炭素環を形成し；１つのＲ^{7}はフルオロ又はクロロであり；
（ｉｖ）１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する５員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換され；１つのＲ^{7}はフルオロ又はクロロであり、又は
１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}のそれぞれの２つの対は、隣接する原子上にあり、１つのＲ^{6}及び１つのＲ^{7}の各対は、それらを連結する原子と一緒になって、Ｏ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個のヘテロ原子を含有する６員複素環を形成し、ここで、複素環は、１つ以上のヒドロキシ、オキソ、又はメチルで任意選択的に置換され；１つのＲ^{7}はフルオロ又はクロロである。

【０９４９】

特に示されない限り、開示される化合物が、立体化学を指定せずにある構造によって命名されるか又は示され、１つ以上のキラル中心を有する場合、化合物の全ての可能な立体異性体を表すことが理解される。

【０９５０】

本明細書の式中の変数の組合せは、化合物が安定性であるようなものであることが理解される。

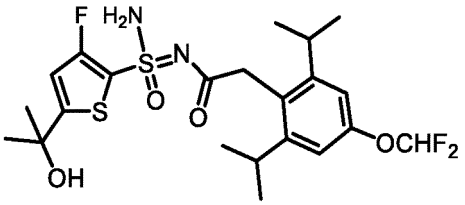
【０９５１】

ある実施形態において、表１中の化合物からなる群から選択される化合物及びその薬学的に許容される塩が、本明細書において提供される。

【０９５２】

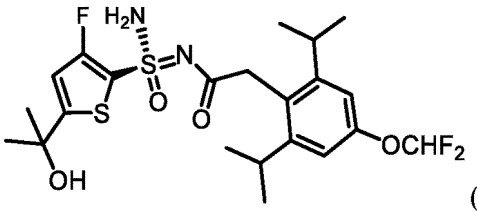
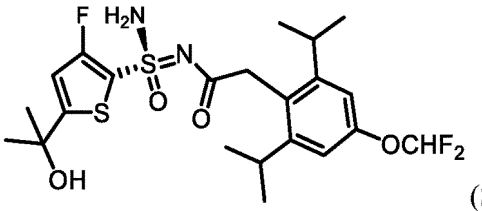
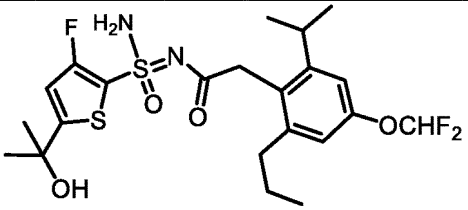
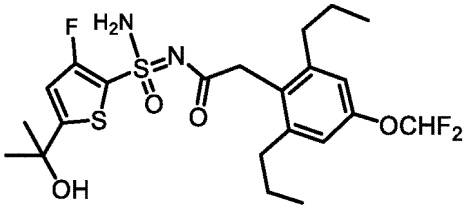
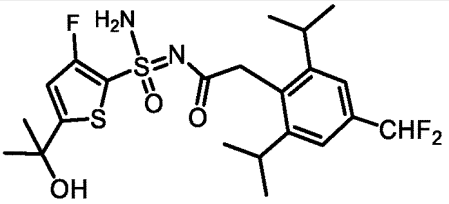
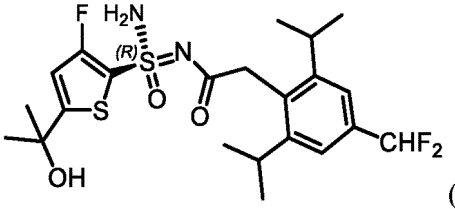
【表１】

表1

化合物	構造
101	

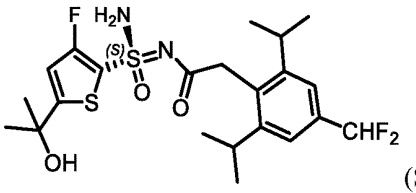
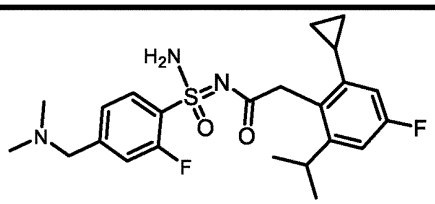
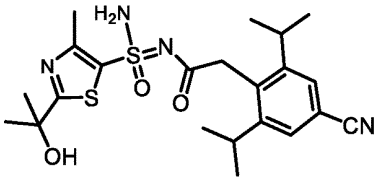
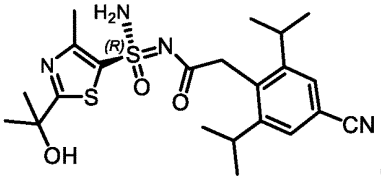
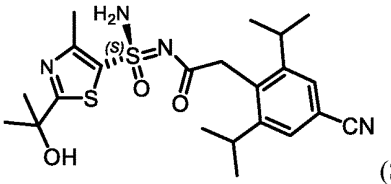
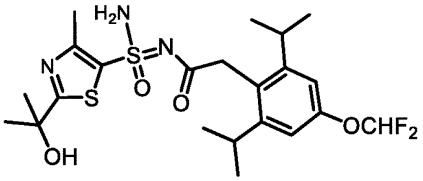
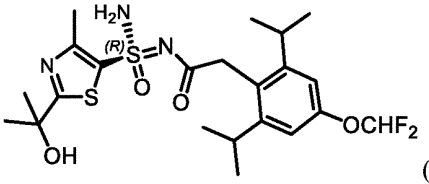
【０９５３】

【表２】

101a	 (R)
101b	 (S)
102	
103	
104	
104a	 (R)

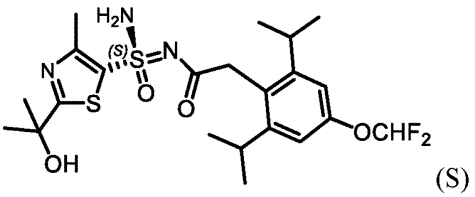
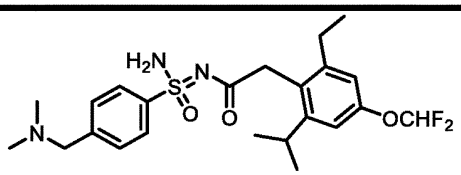
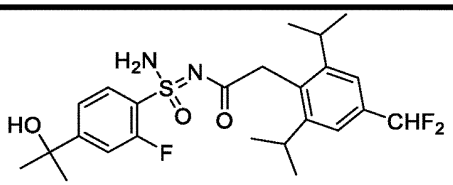
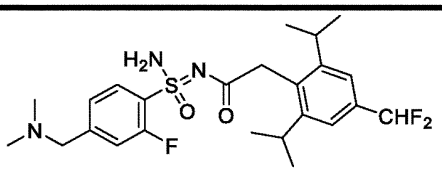
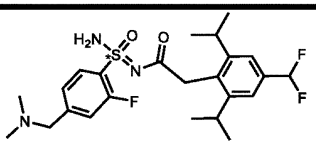
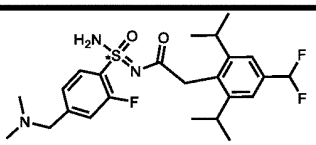
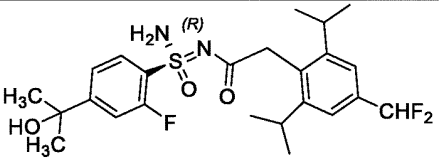
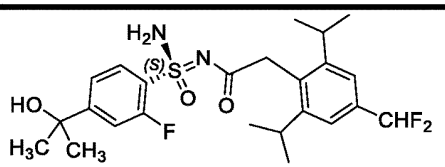
【０９５４】

【表３】

104b	 (S)
105	
106	
106a	 (R)
106b	 (S)
107	
107a	 (R)

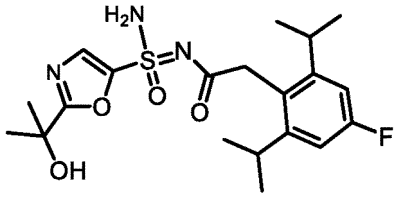
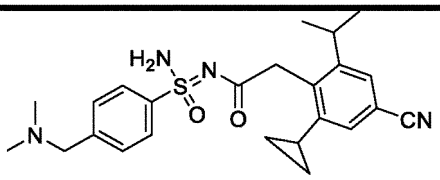
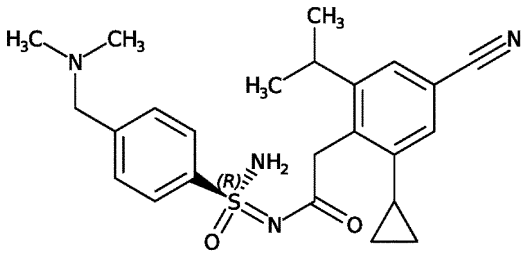
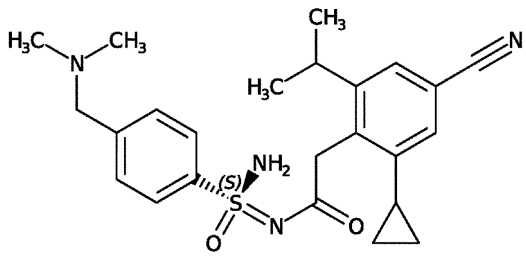
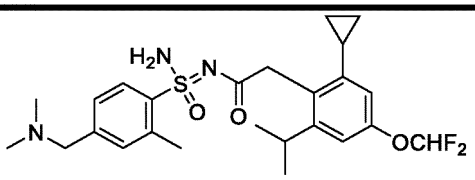
【０９５５】

【表４】

107b	 (S)
108	
109	
110	
110a’	
110b’	
110a	
110b	

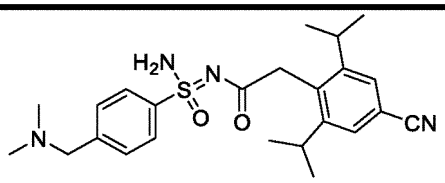
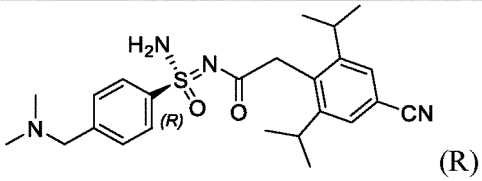
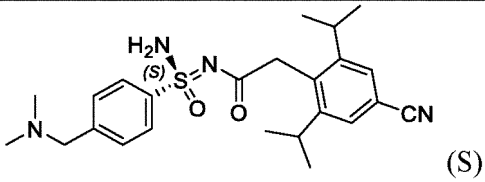
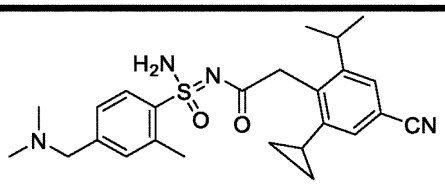
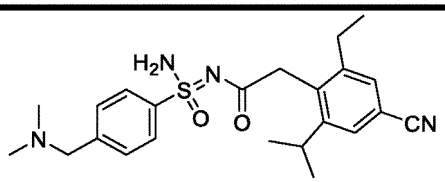
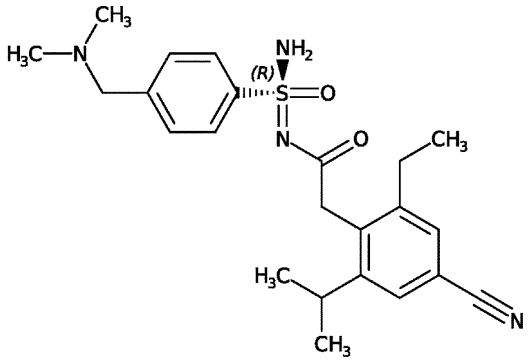
【０９５６】

【表５】

111	
112	
112a	 (R)
112b	 (S)
113	

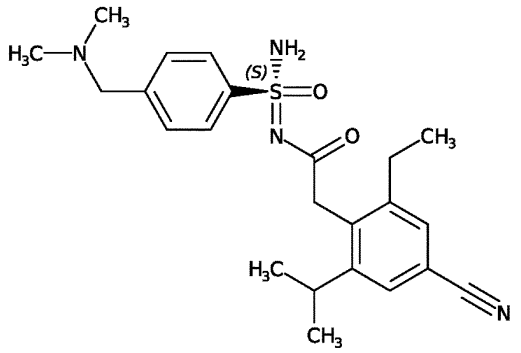
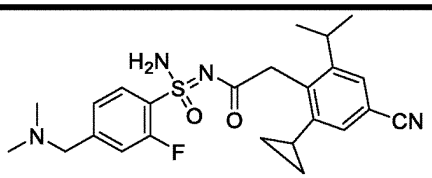
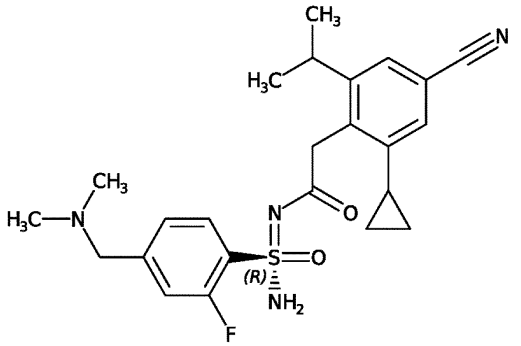
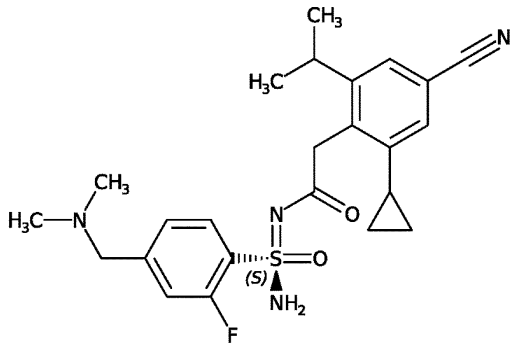
【０９５７】

【表６】

114	
114a	 (R)
114b	 (S)
115	
116	
116a	 (R)

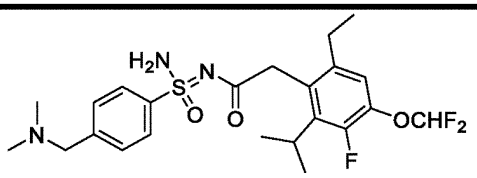
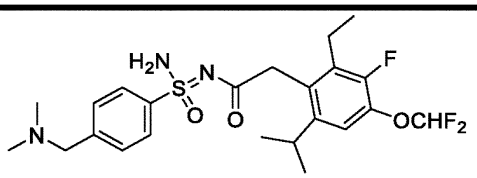
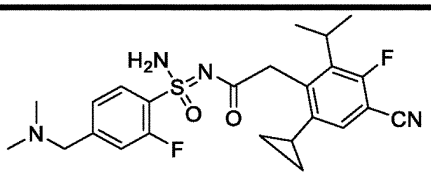
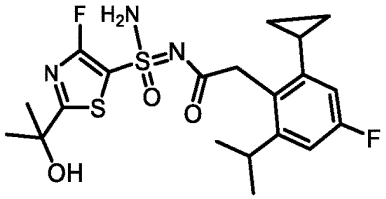
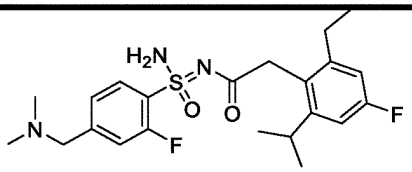
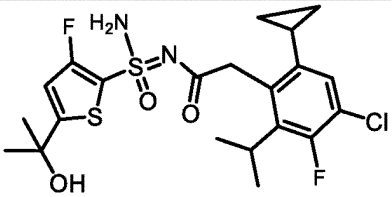
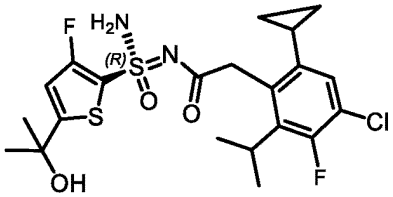
【０９５８】

【表７】

116b	 (S)
117	
117a	 (R)
117b	 (S)

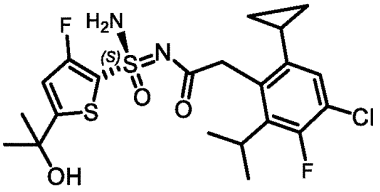
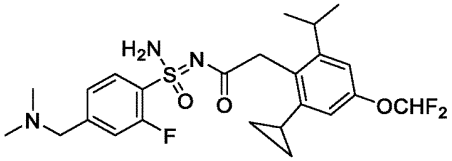
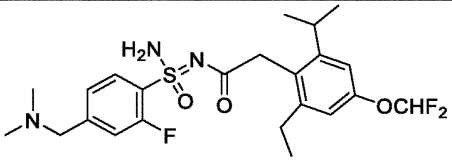
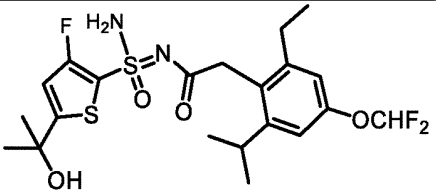
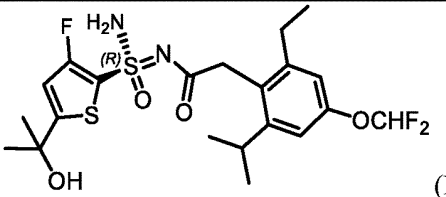
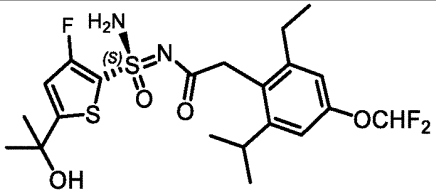
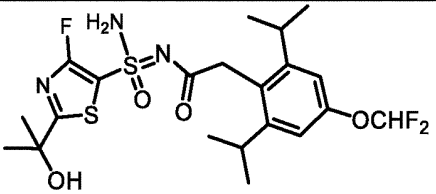
【０９５９】

【表８】

118	
119	
120	
121	
122	
123	
123a	 (R)

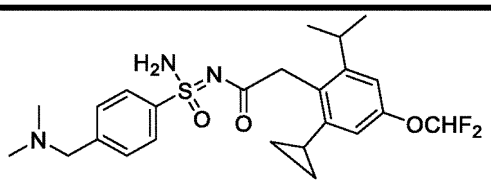
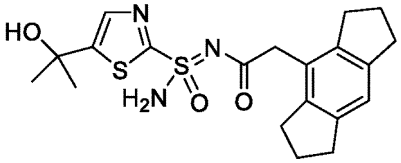
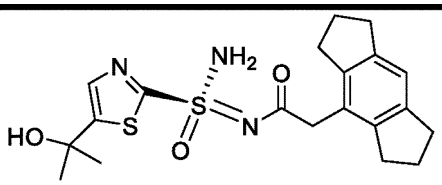
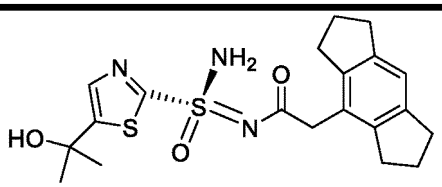
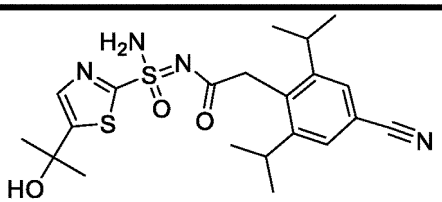
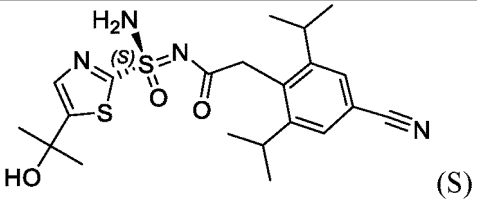
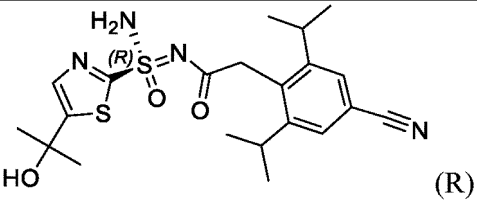
【０９６０】

【表９】

123b	 (S)
124	
125	
126	
126a	 (R)
126b	 (S)
127	

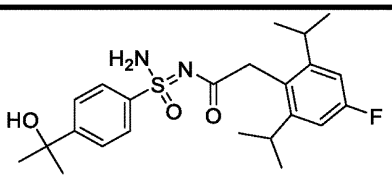
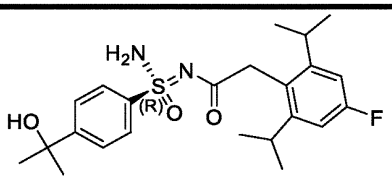
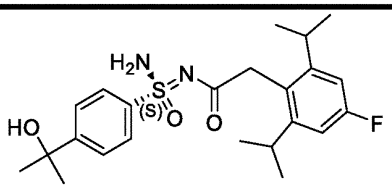
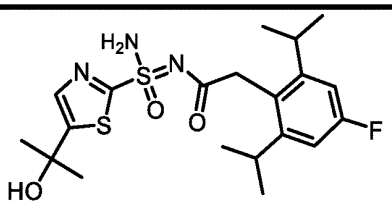
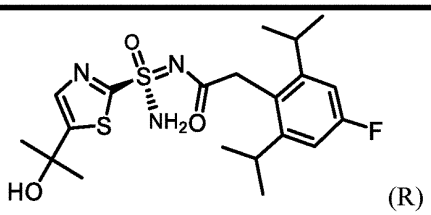
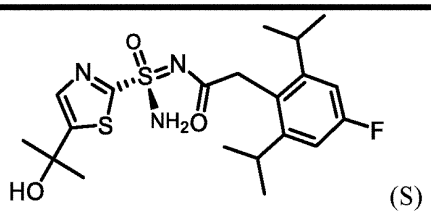
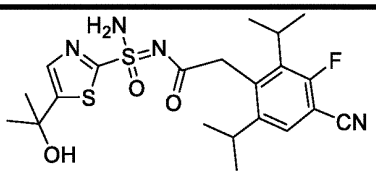
【０９６１】

【表１０】

128	
129	
129a	
129b	
130	
130a	 (S)
130b	 (R)

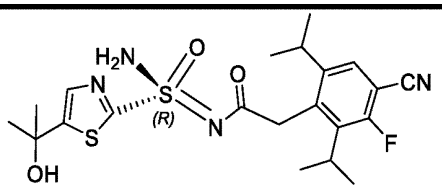
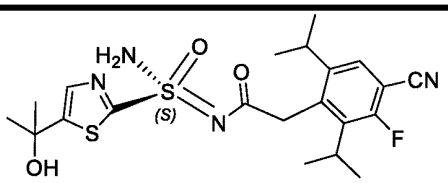
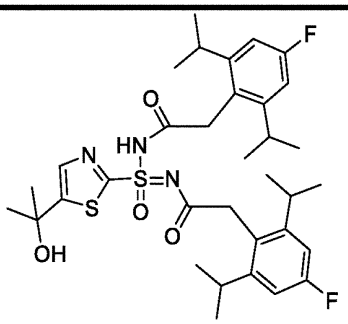
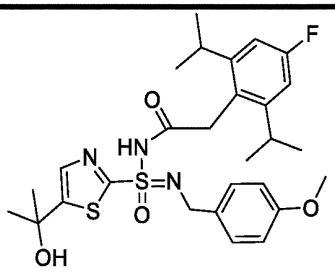
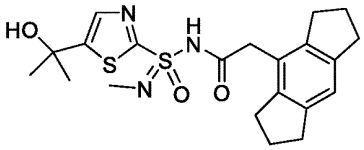
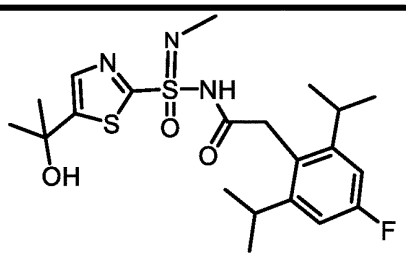
【０９６２】

【表１１】

131	
131a	
131b	
132	
132a	 (R)
132b	 (S)
133	

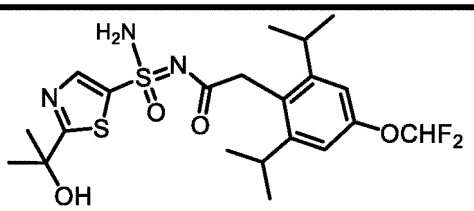
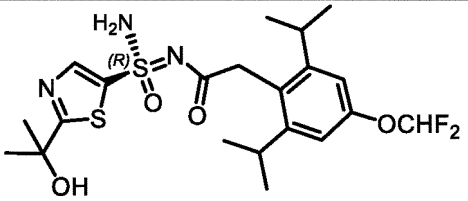
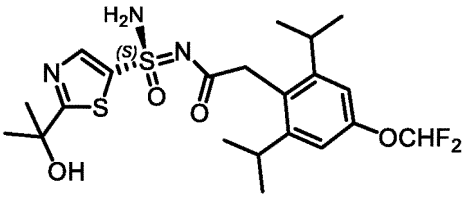
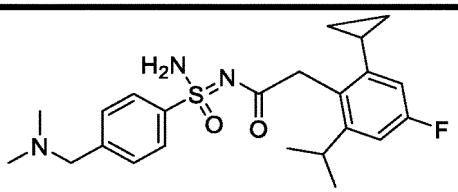
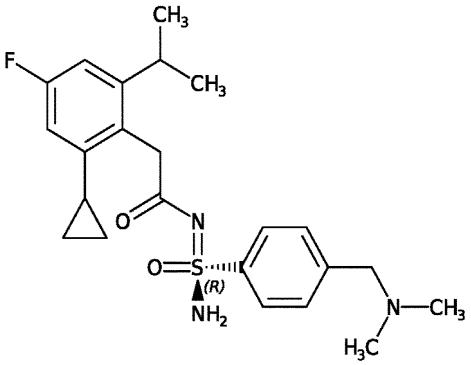
【０９６３】

【表１２】

133a	
133b	
134	
135	
136	
137	

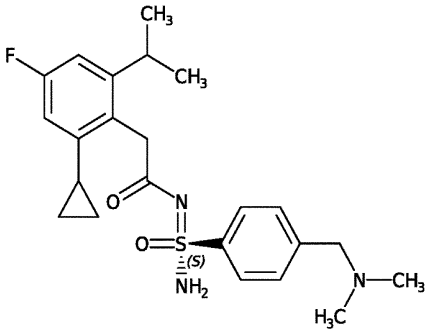
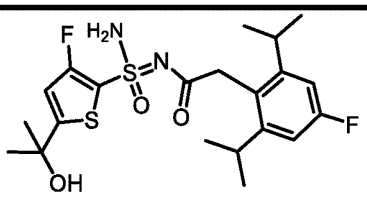
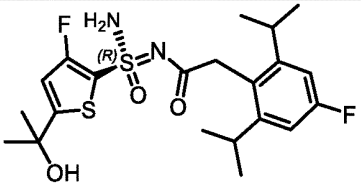
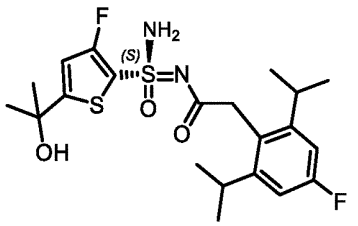
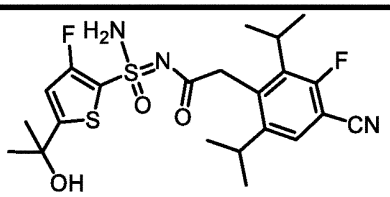
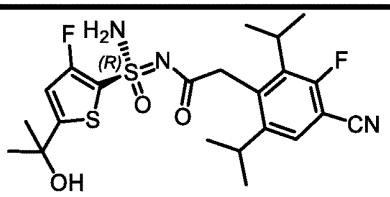
【０９６４】

【表１３】

138	
138a	
138b	
139	
139a	

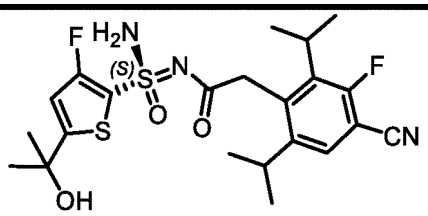
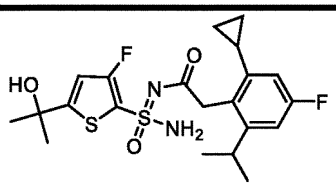
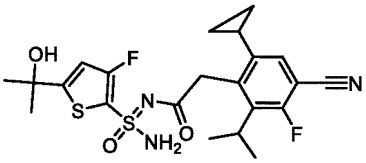
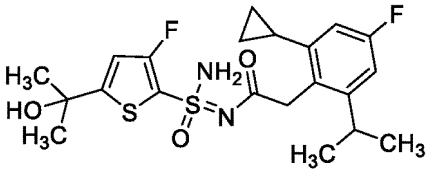
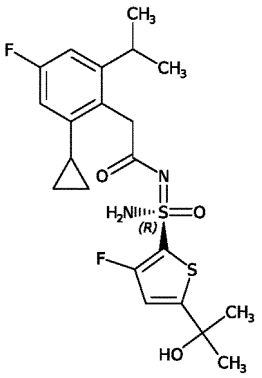
【０９６５】

【表１４】

139b	
140	
140a	
140b	
141	
141a	

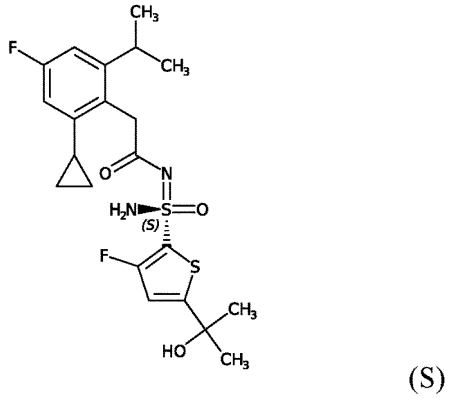
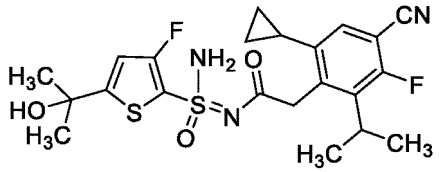
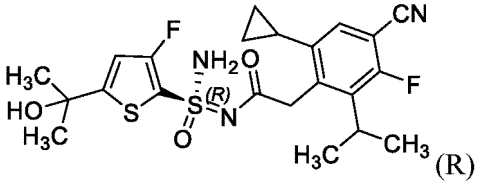
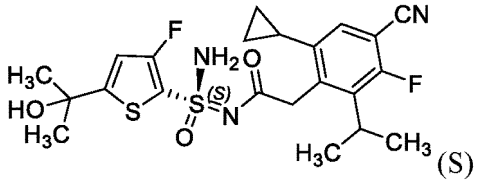
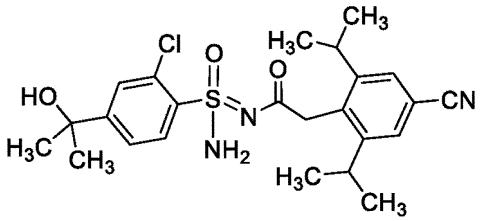
【０９６６】

【表１５】

141b	
142	
143	
144	
144a	 (R)

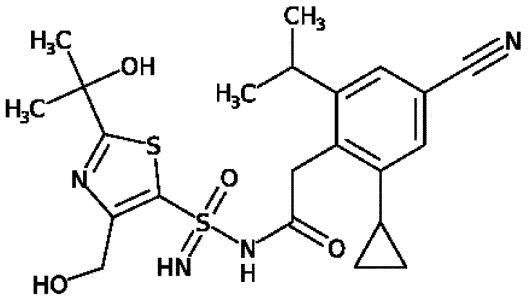
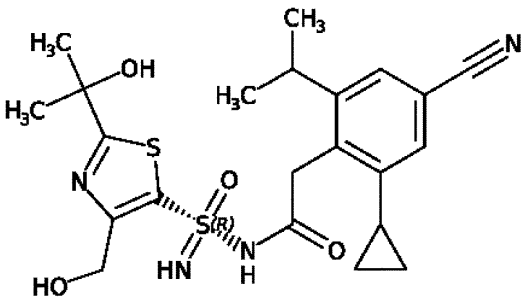
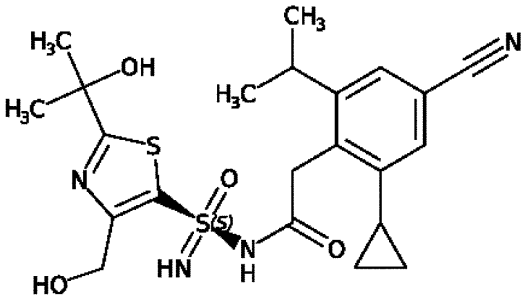
【０９６７】

【表１６】

144b	 (S)
145	
145a	 (R)
145b	 (S)
146	

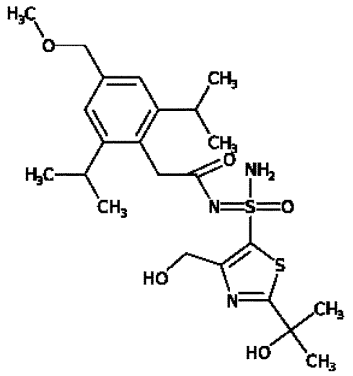
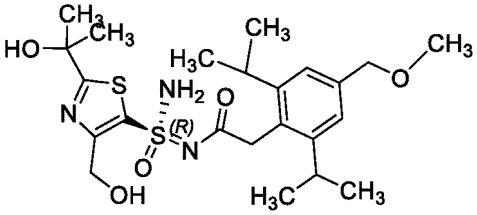
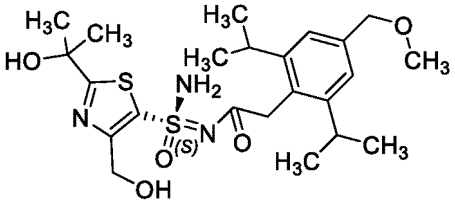
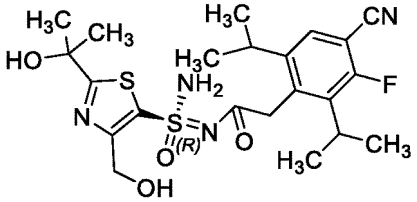
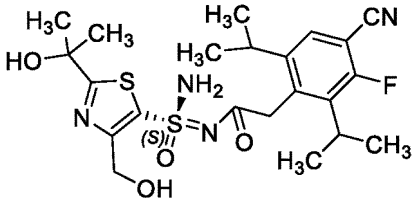
【０９６８】

【表１７】

147	
147a	
147b	

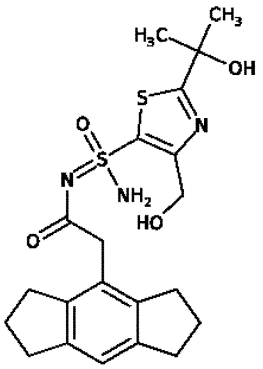
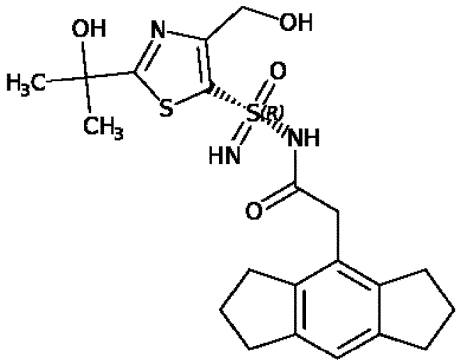
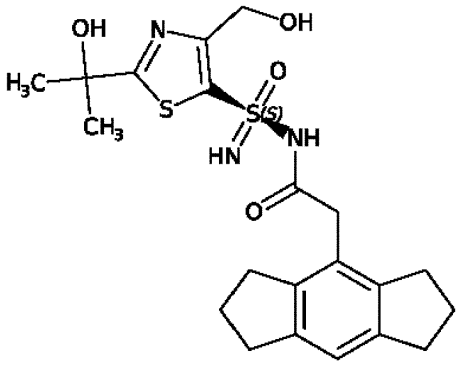
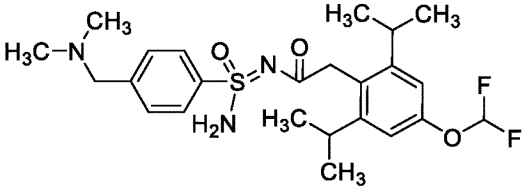
【０９６９】

【表１８】

148	
148a	
148b	
149a	
149b	

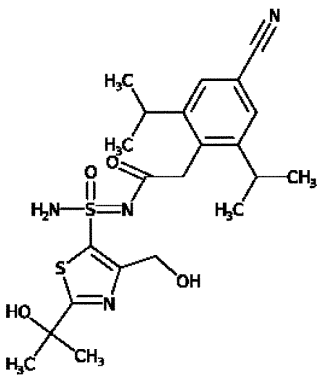
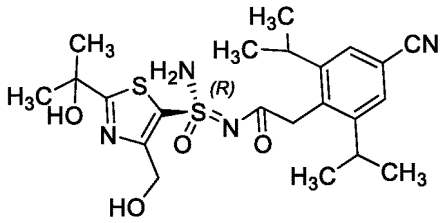
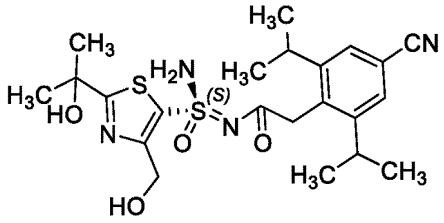
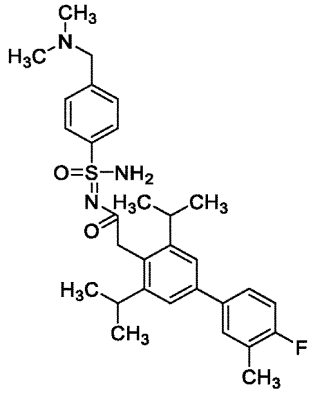
【０９７０】

【表１９】

150	
150a	
150b	
151	

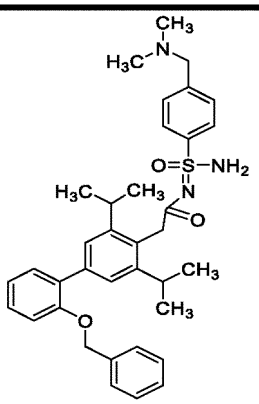
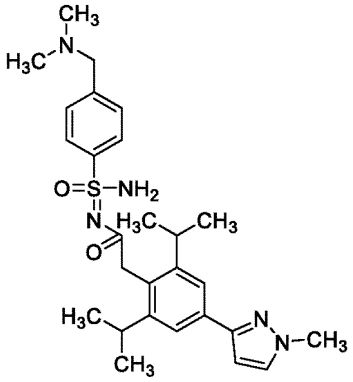
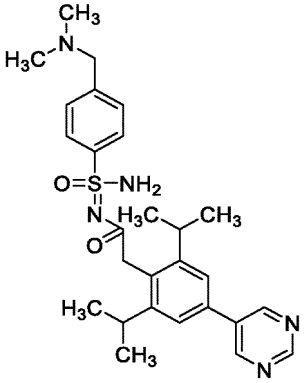
【０９７１】

【表２０】

152	
152a	
152b	
153	

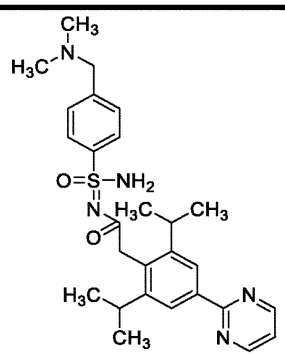
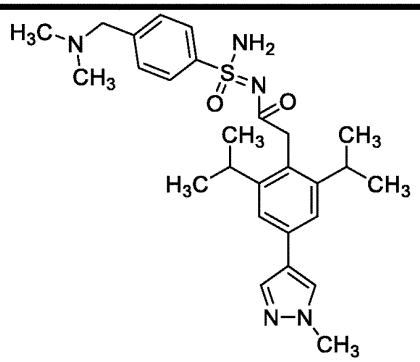
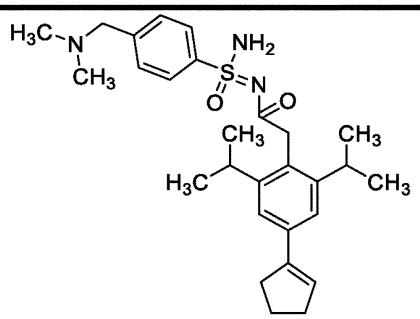
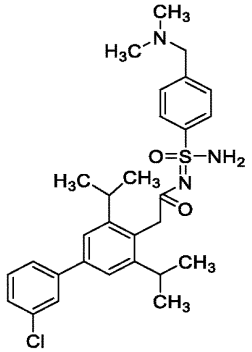
【０９７２】

【表２１】

154	
155	
156	

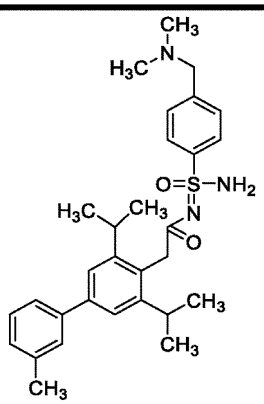
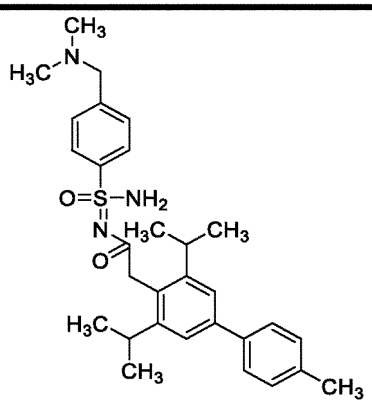
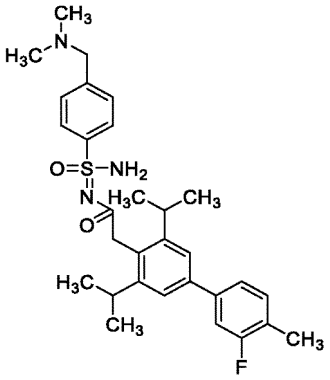
【０９７３】

【表２２】

157	
158	
159	
160	

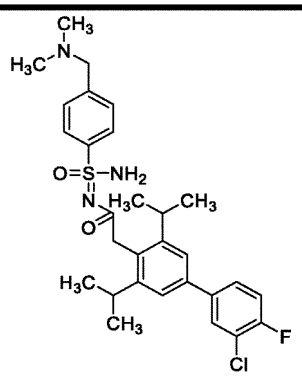
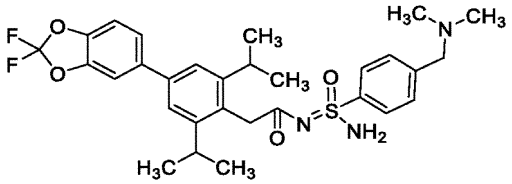
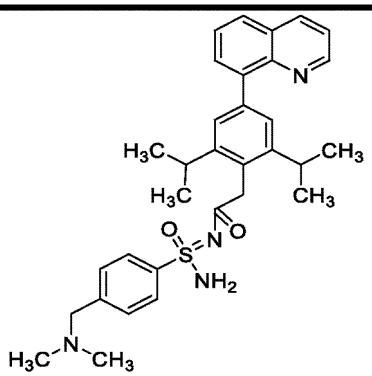
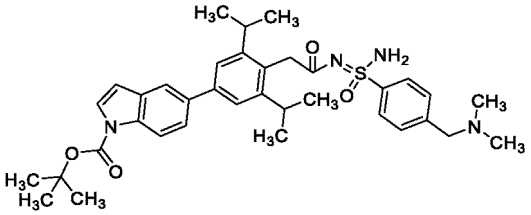
【０９７４】

【表２３】

161	
162	
163	

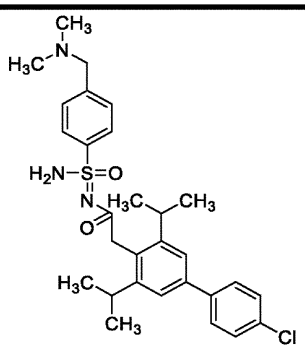
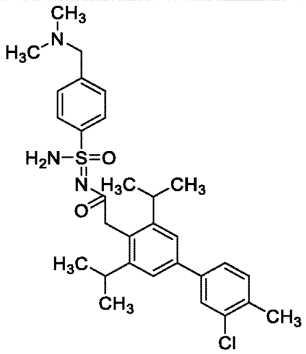
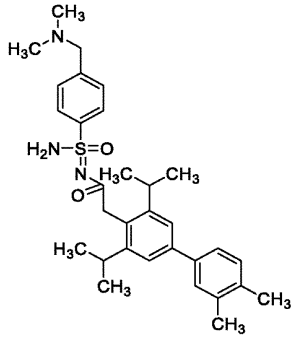
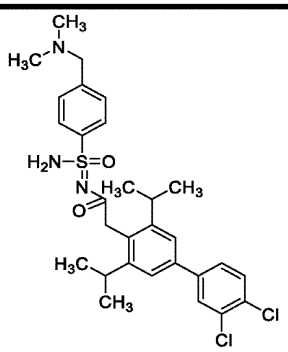
【０９７５】

【表２４】

164	
165	
166	
167	

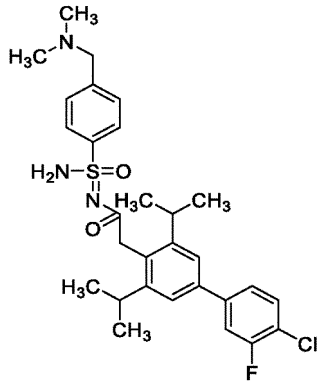
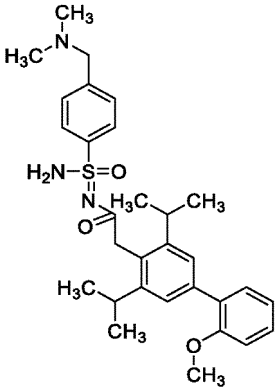
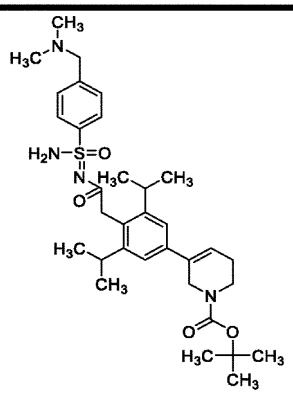
【０９７６】

【表２５】

168	
169	
170	
171	

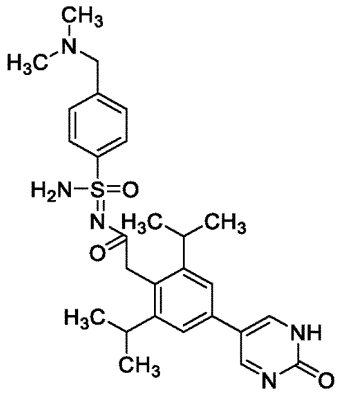
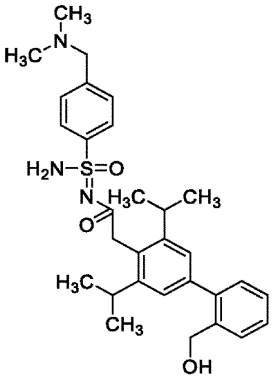
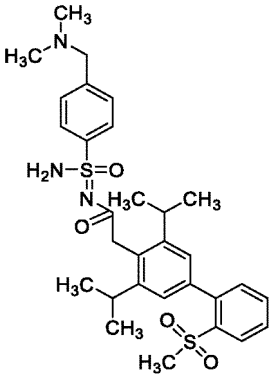
【０９７７】

【表２６】

172	
173	
174	

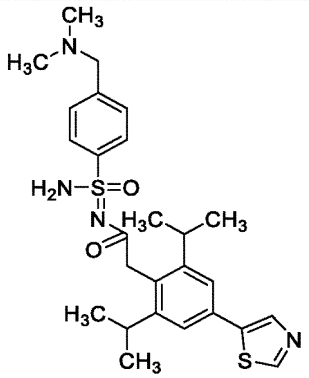
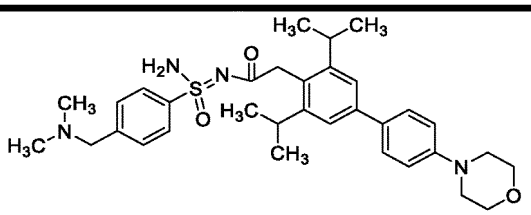
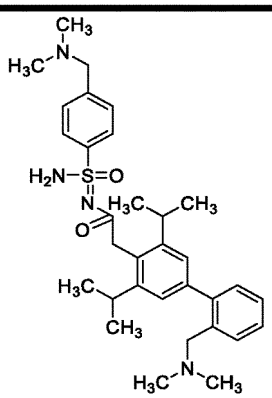
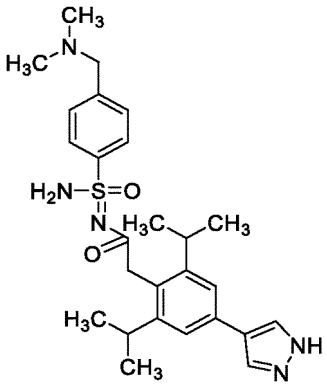
【０９７８】

【表２７】

175	
176	
177	

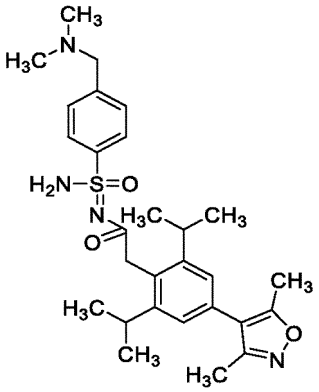
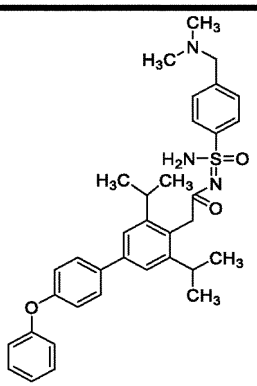
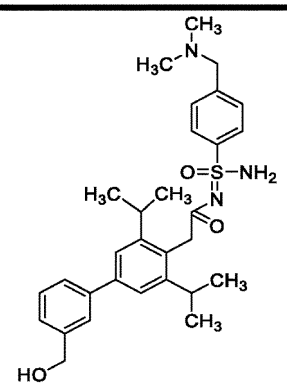
【０９７９】

【表２８】

178	
179	
180	
181	

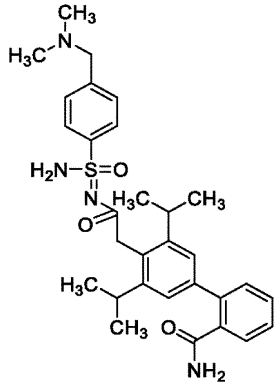
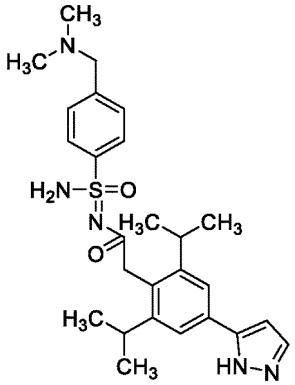
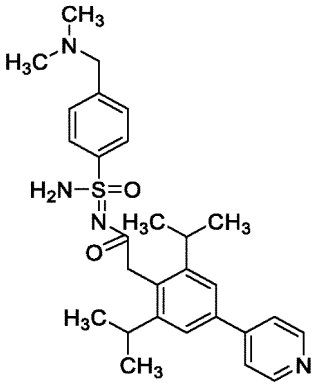
【０９８０】

【表２９】

182	
183	
184	

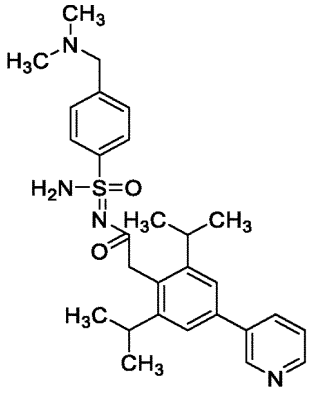
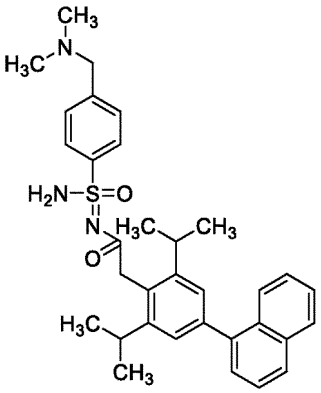
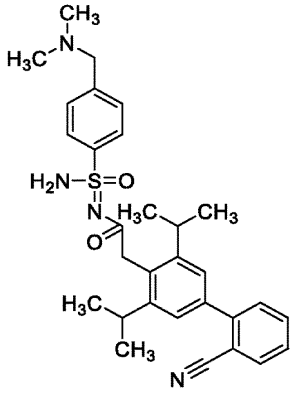
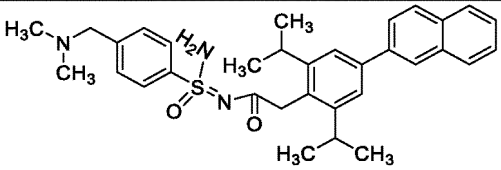
【０９８１】

【表３０】

185	
186	
187	

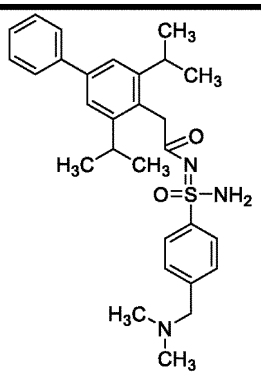
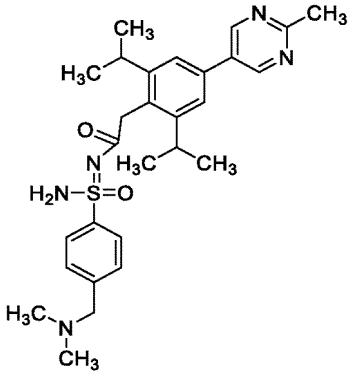
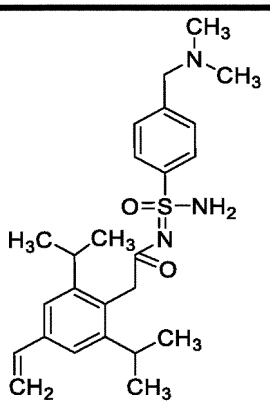
【０９８２】

【表３１】

188	
189	
190	
191	

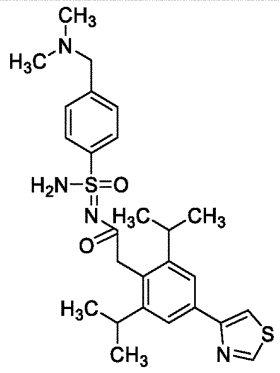
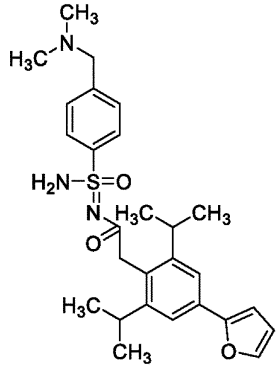
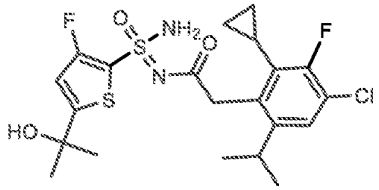
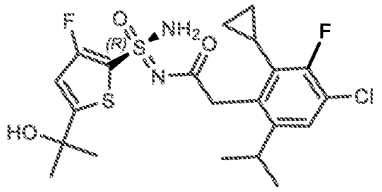
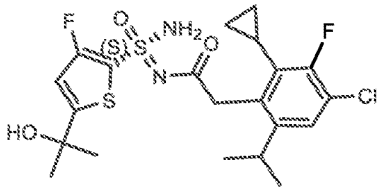
【０９８３】

【表３２】

192	
193	
194	

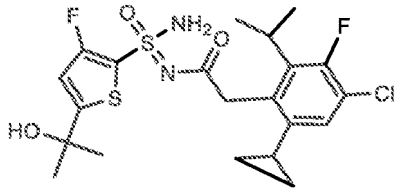
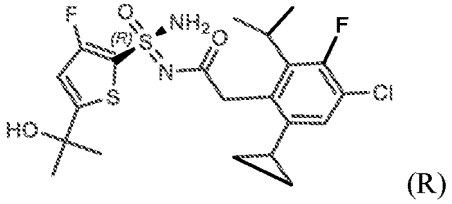
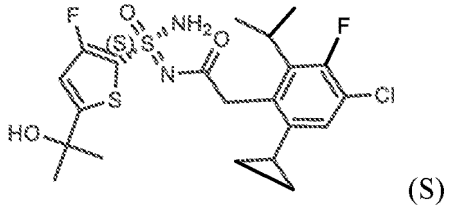
【０９８４】

【表３３】

195	
196	
197	
197a	 (R)
197b	 (S)

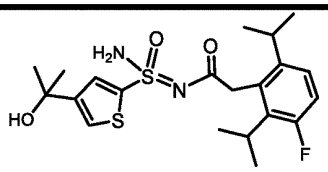
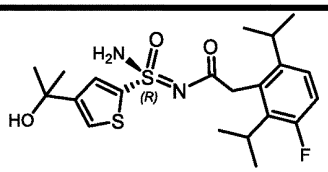
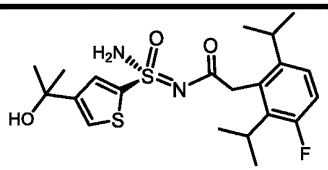
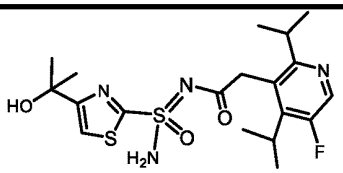
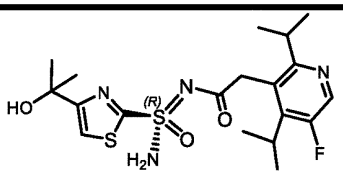
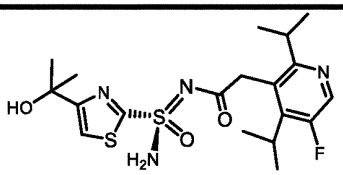
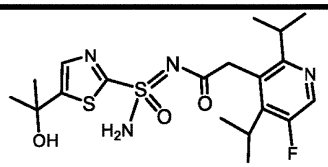
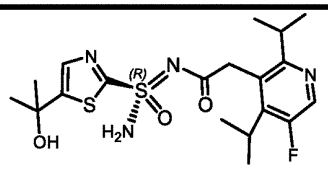
【０９８５】

【表３４】

198	
198a	 (R)
198b	 (S)

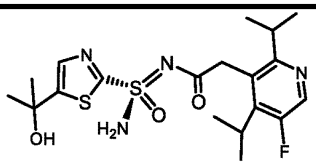
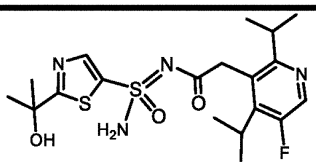
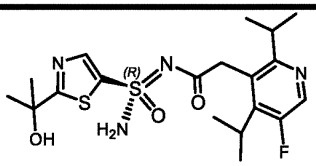
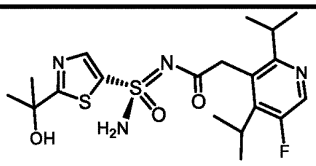
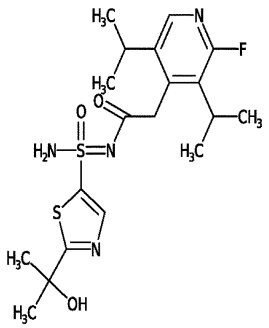
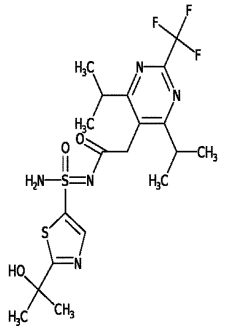
【０９８６】

【表３５】

201	
201b	
201a	
202	
202b	
202a	
203	
203b	

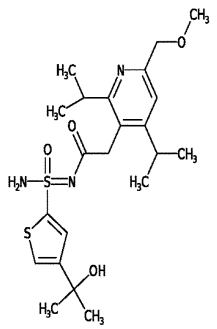
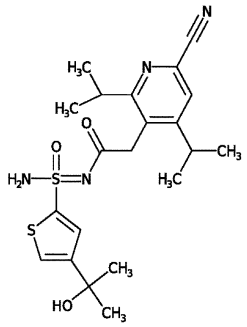
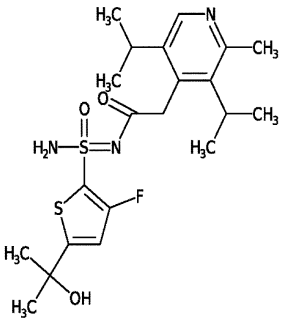
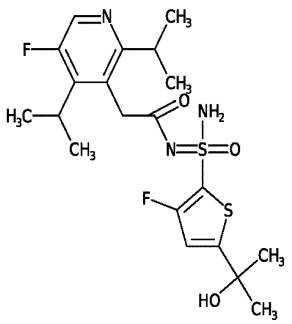
【０９８７】

【表３６】

203a	
204	
204b	
204a	
205	
206	

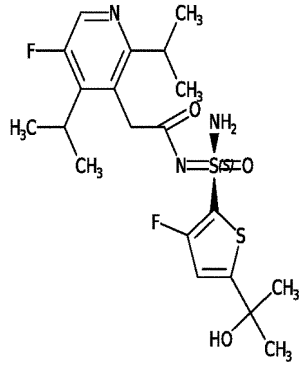
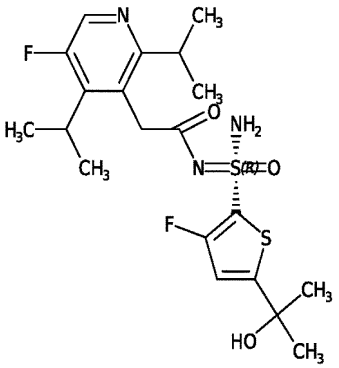
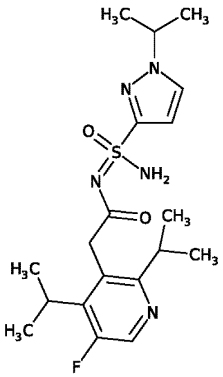
【０９８８】

【表３７】

207	
208	
209	
210	

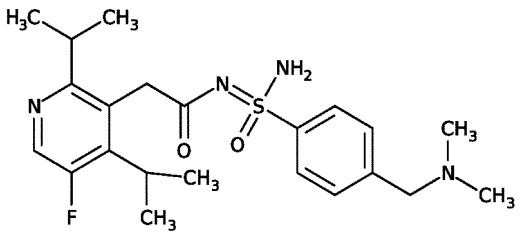
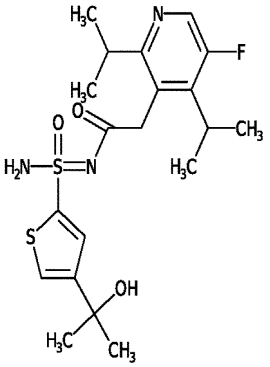
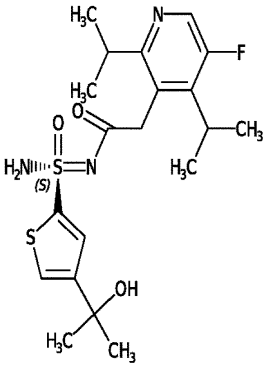
【０９８９】

【表３８】

210a	
210b	
211	

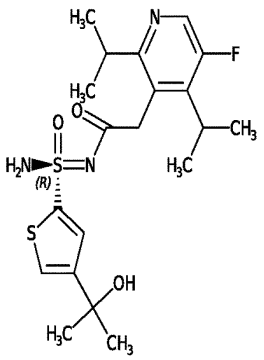
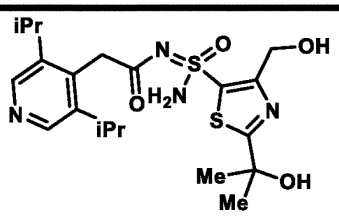
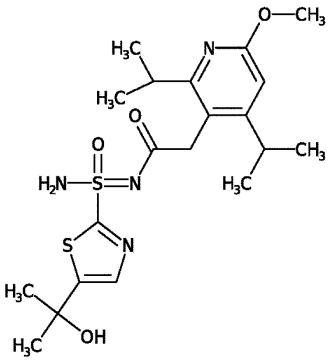
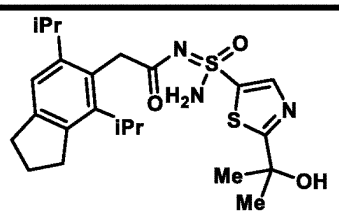
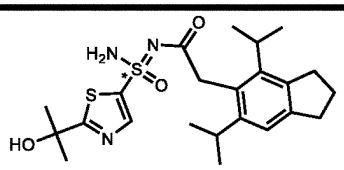
【０９９０】

【表３９】

212	
213	
213a	

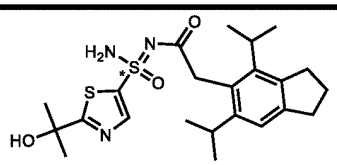
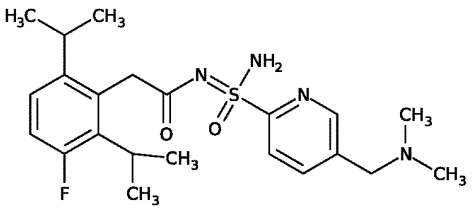
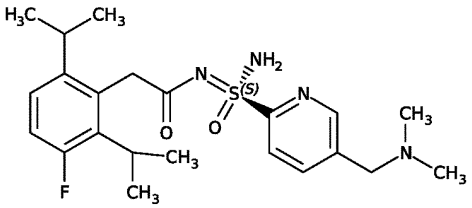
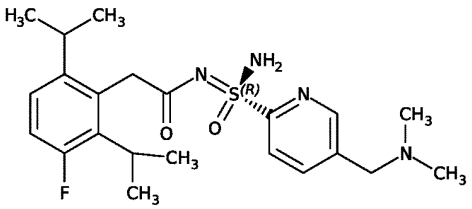
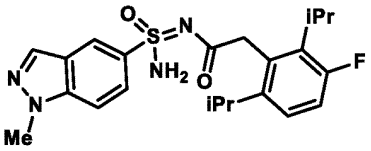
【０９９１】

【表４０】

213b	
214	
215	
216	
216a	

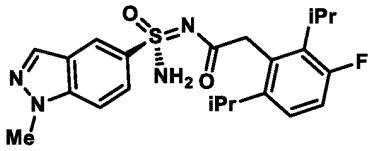
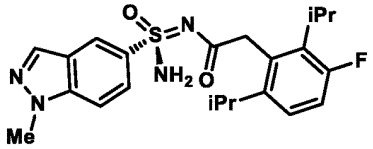
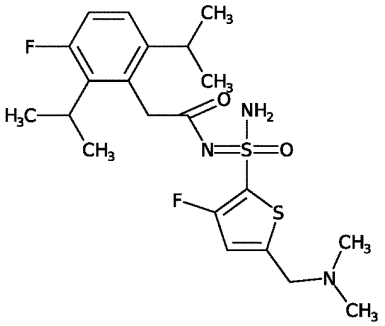
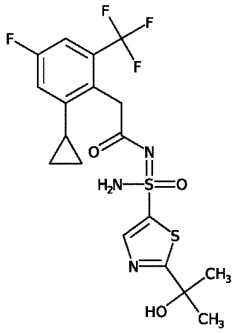
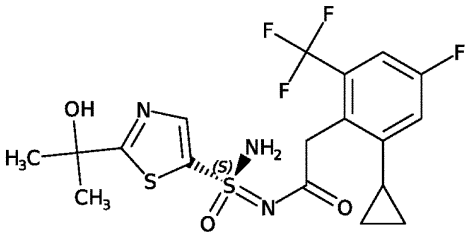
【０９９２】

【表４１】

216b	
217	
217a	
217b	
218	

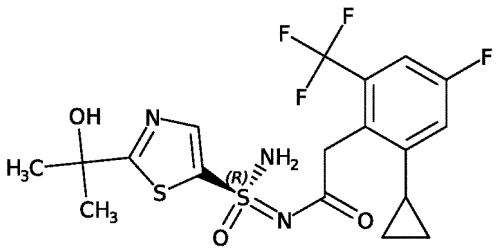
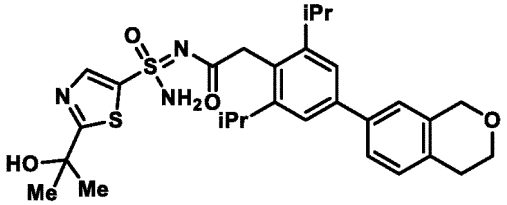
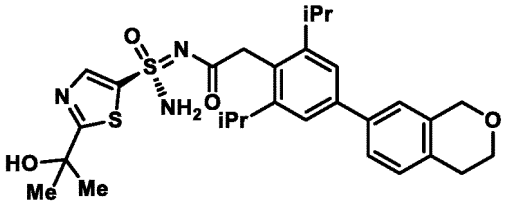
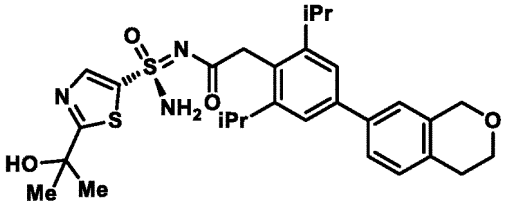
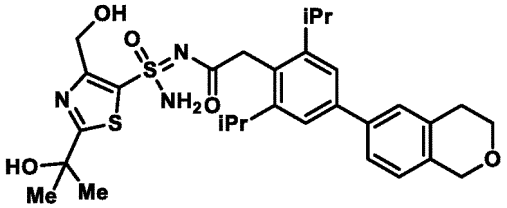
【０９９３】

【表４２】

218a	
218b	
219	
220	
220a	

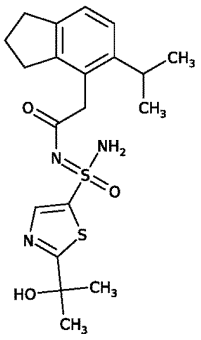
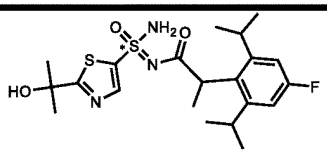
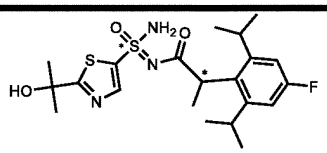
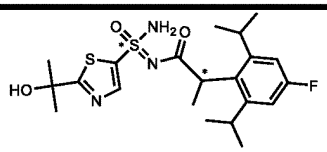
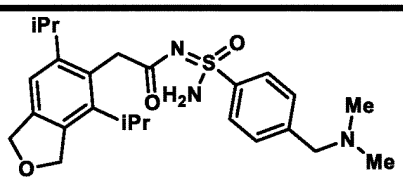
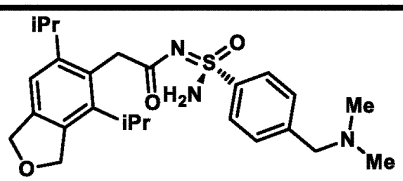
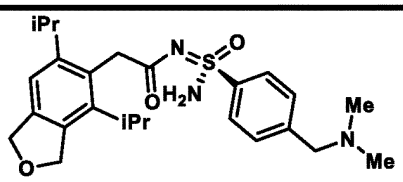
【０９９４】

【表４３】

220b	
221	
221a	
221b	
222	

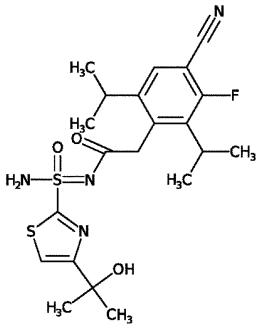
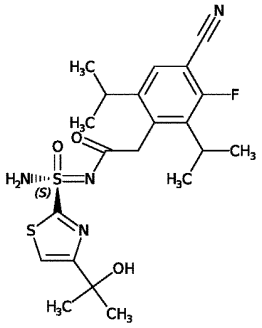
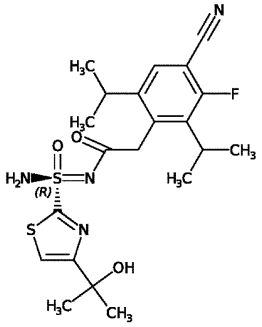
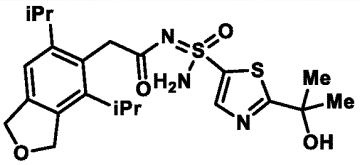
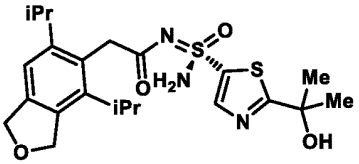
【０９９５】

【表４４】

224	
224b	
224ba	
224aa	
225	
225a	
225b	

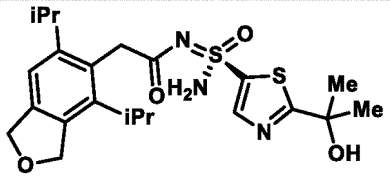
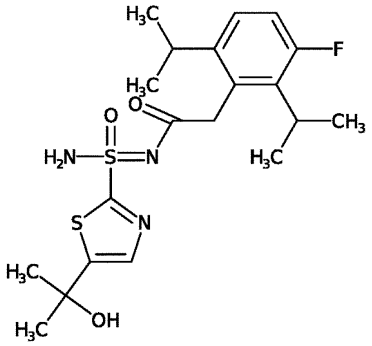
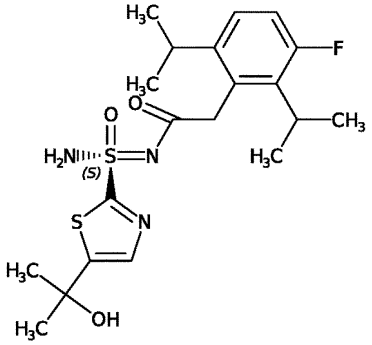
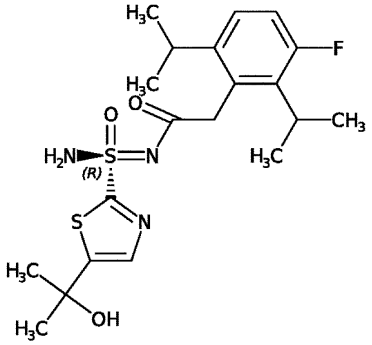
【０９９６】

【表４５】

226	
226a	
226b	
227	
227a	

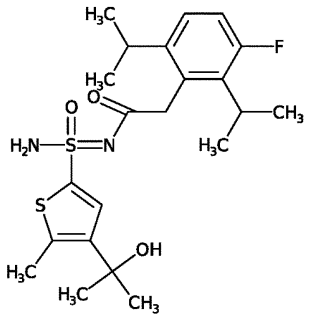
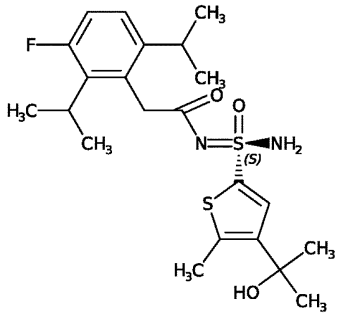
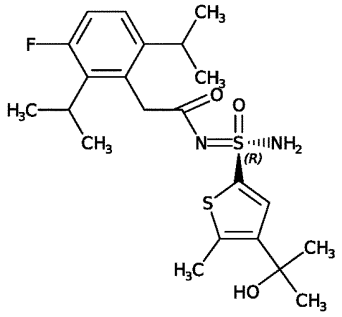
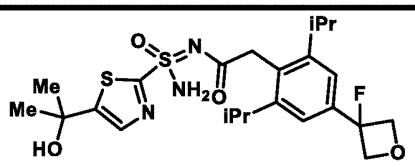
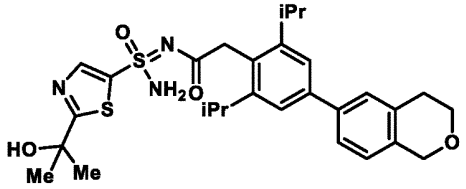
【０９９７】

【表４６】

227b	
228	
228a	
228b	

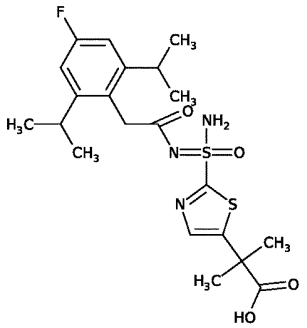
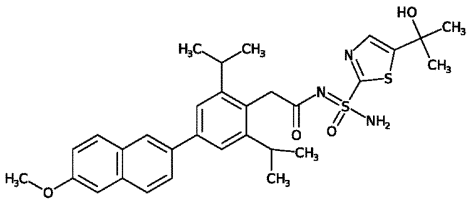
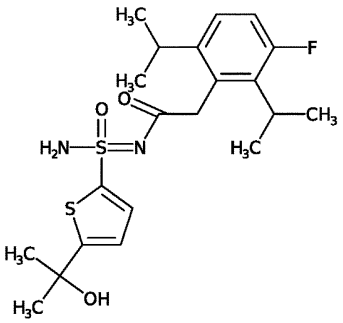
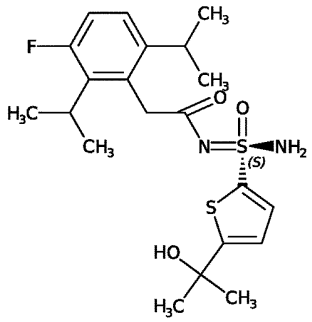
【０９９８】

【表４７】

229	
229a	
229b	
230	
231	

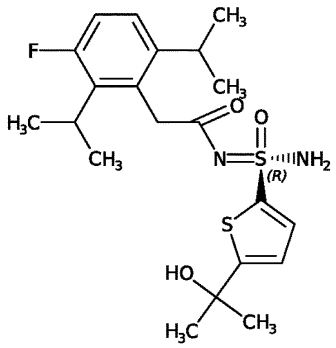
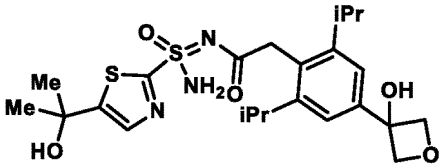
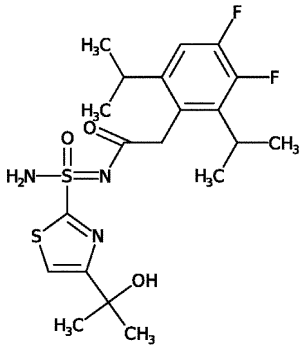
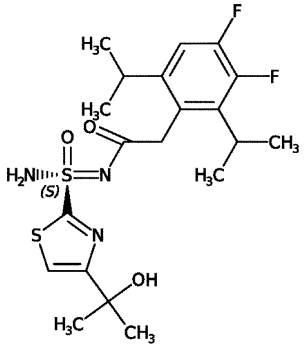
【０９９９】

【表４８】

232	
233	
234	
234a	

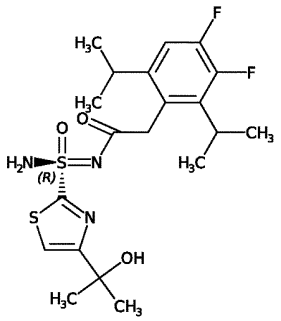
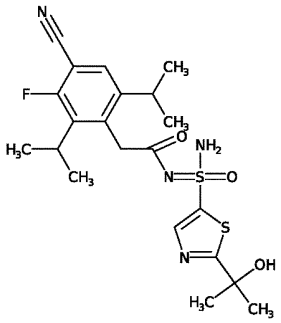
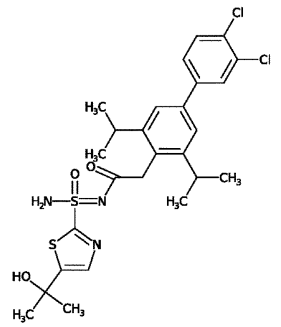
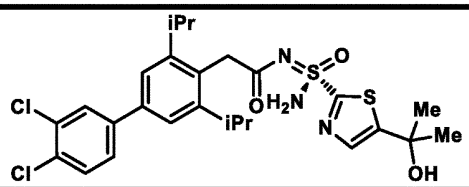
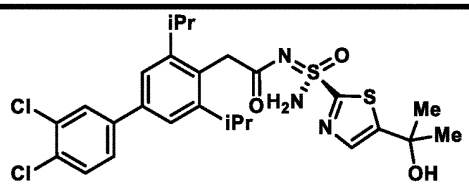
【１０００】

【表４９】

234b	
235	
236	
236a	

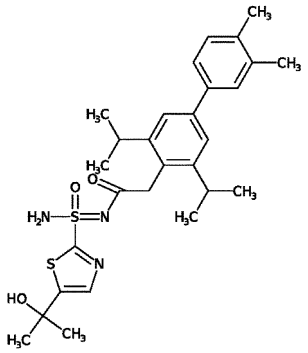
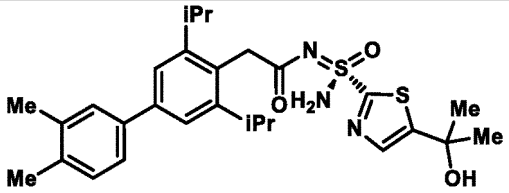
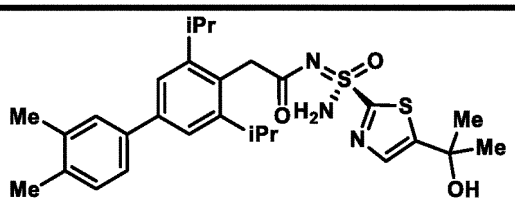
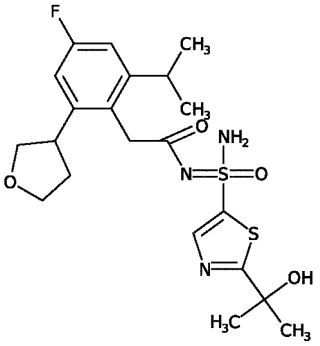
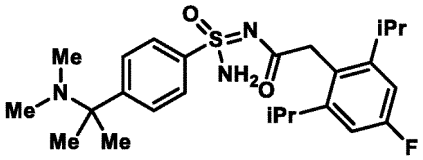
【１００１】

【表５０】

236b	
237	
238	
238a	
238b	

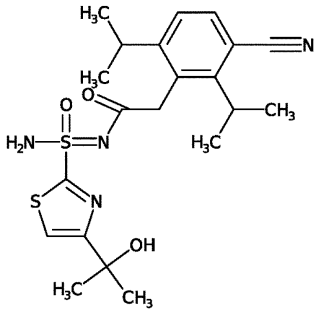
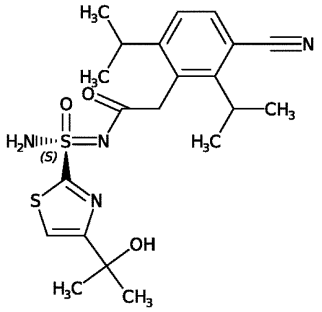
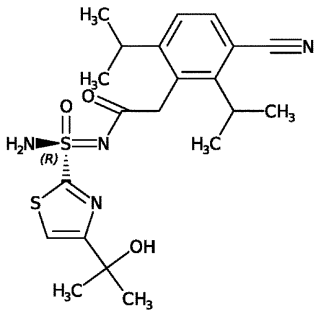
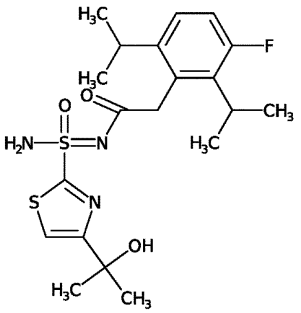
【１００２】

【表５１】

239	
239a	
239b	
240	
241	

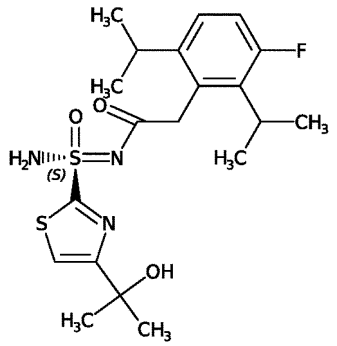
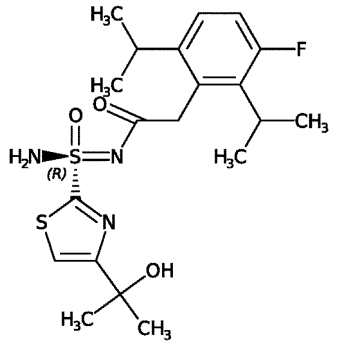
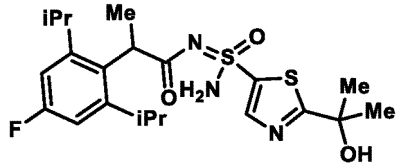
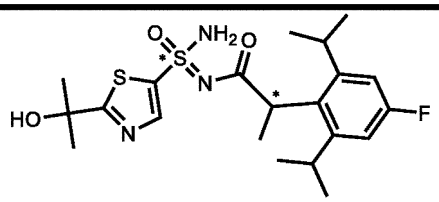
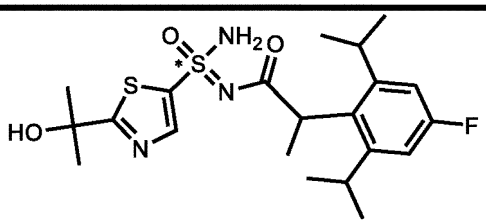
【１００３】

【表５２】

242	
242a	
242b	
243	

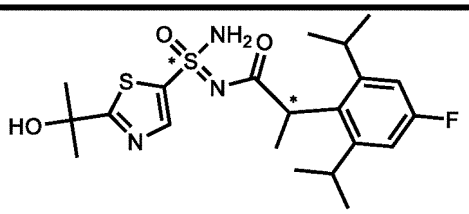
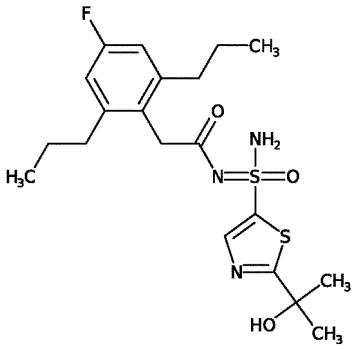
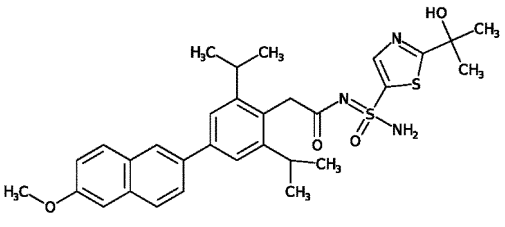
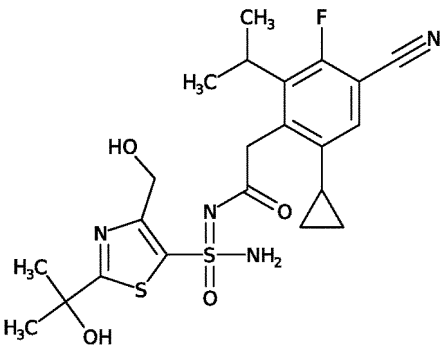
【１００４】

【表５３】

243a	
243b	
244	
244aa	
244b	

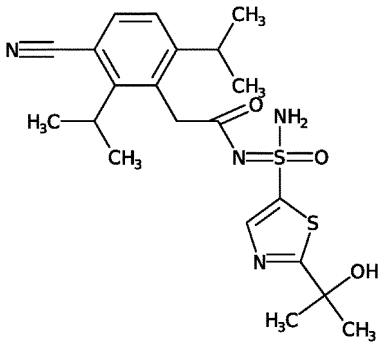
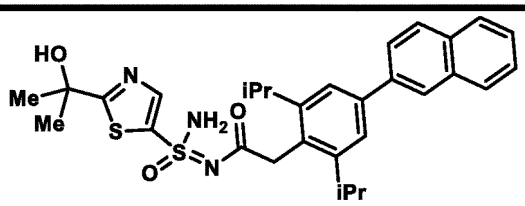
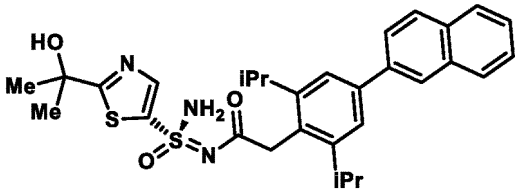
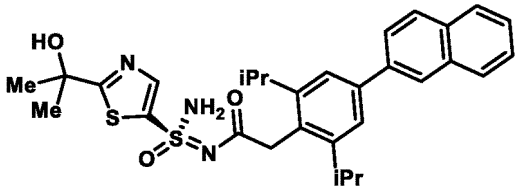
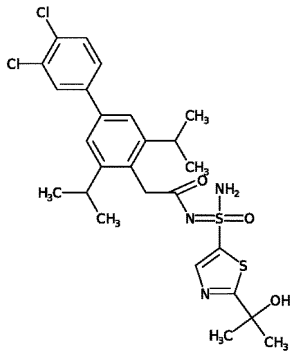
【１００５】

【表５４】

244ba	
245	
246	
247	

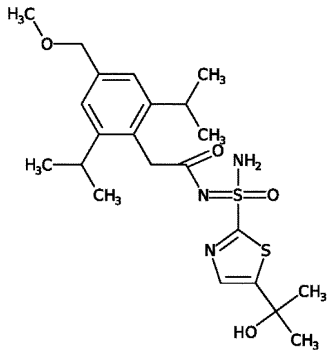
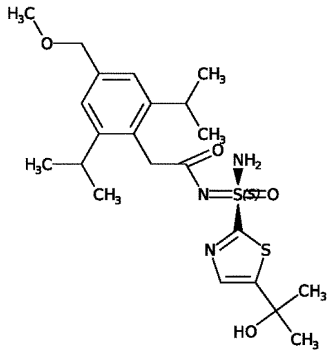
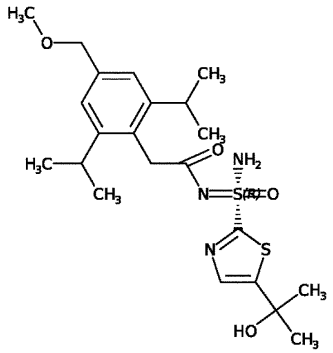
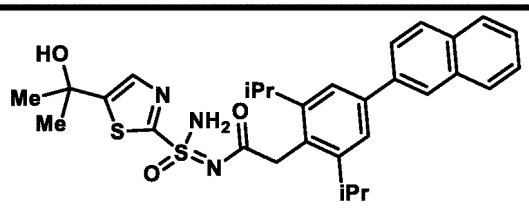
【１００６】

【表５５】

248	
249	
249a	
249b	
250	

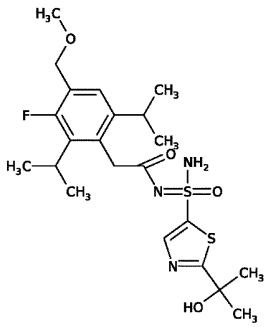
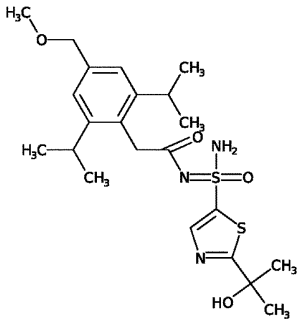
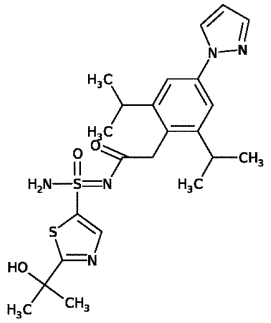
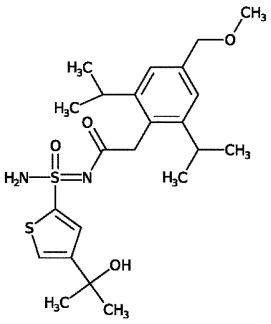
【１００７】

【表５６】

251	
251a	
251b	
252	

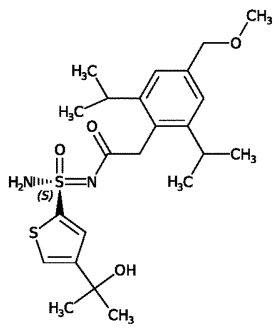
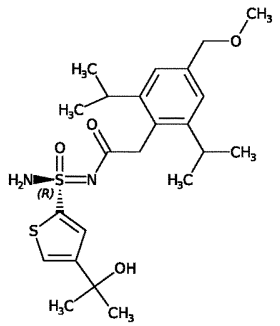
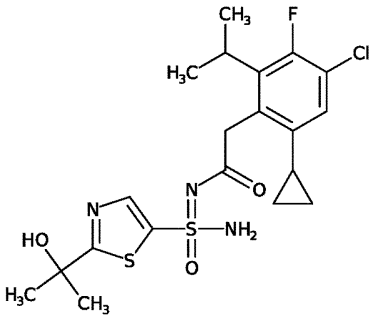
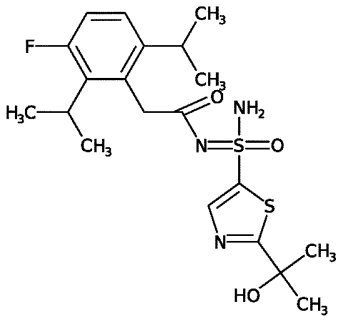
【１００８】

【表５７】

253	
254	
255	
256	

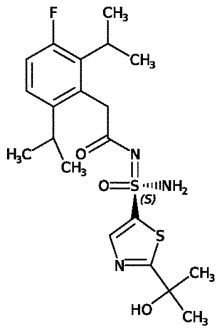
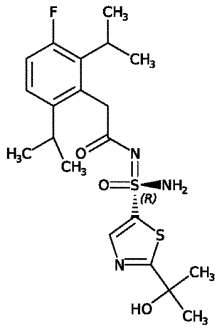
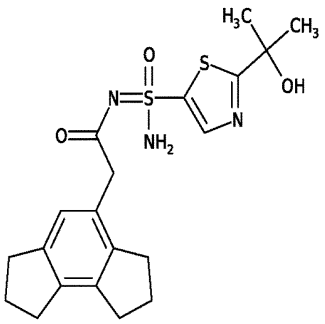
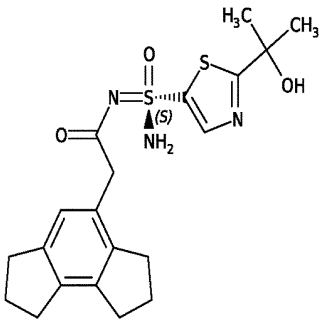
【１００９】

【表５８】

256a	
256b	
257	
258	

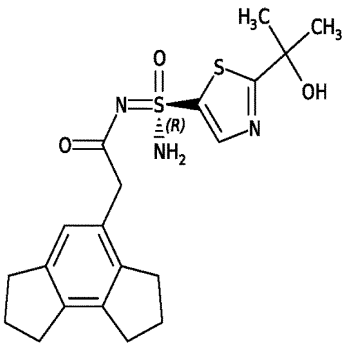
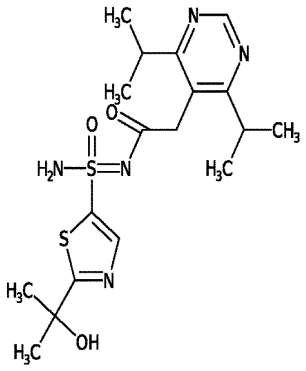
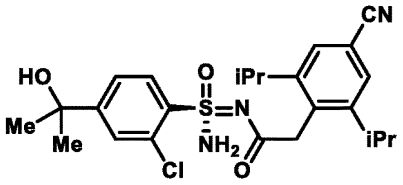
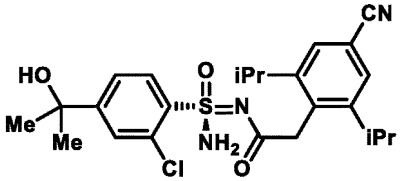
【１０１０】

【表５９】

258a	
258b	
259	
259a	

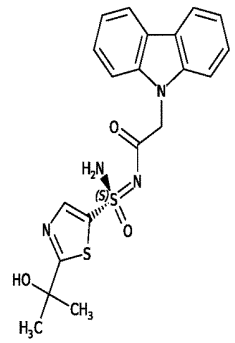
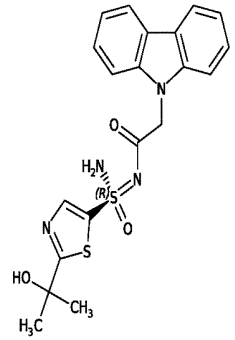
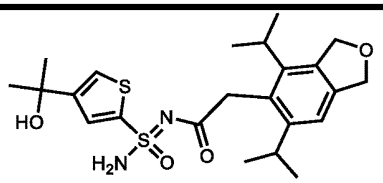
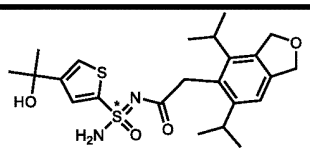
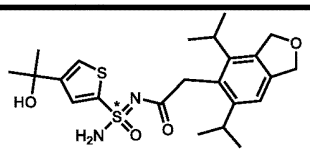
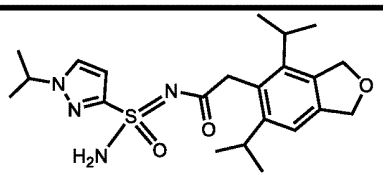
【１０１１】

【表６０】

259b	
260	
261a	
261b	

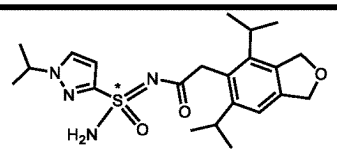
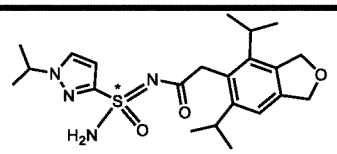
【１０１２】

【表６１】

262a	
262b	
263	
263a	
263b	
264	

【１０１３】

【表６２】

264a	
264b	

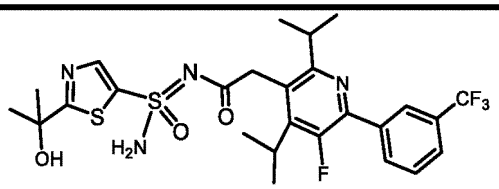
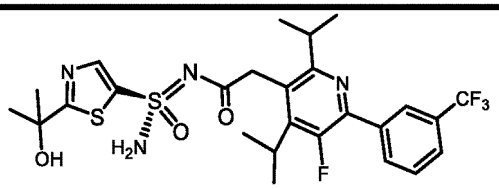
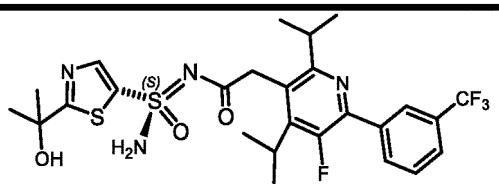
【１０１４】

ある実施形態において、表１～３中の化合物からなる群から選択される化合物又はその薬学的に許容される塩が、本明細書において提供される。

【１０１５】

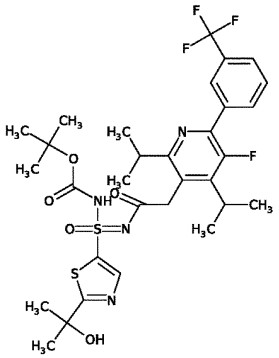
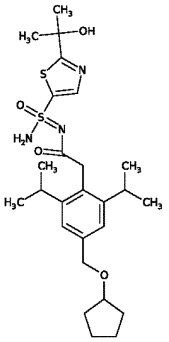
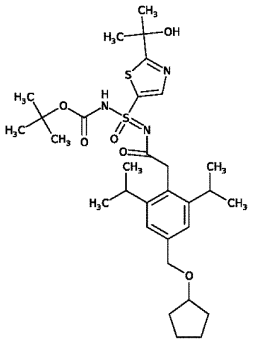
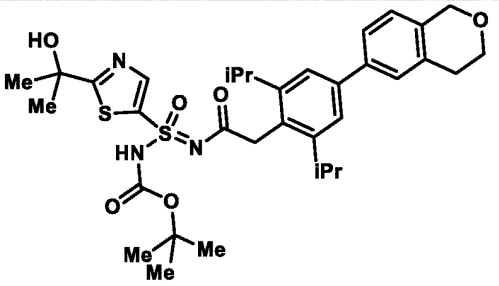
【表６３】

表 1-3

301	
302	
303	

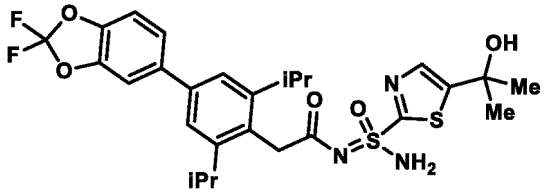
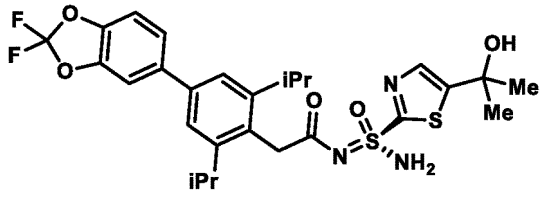
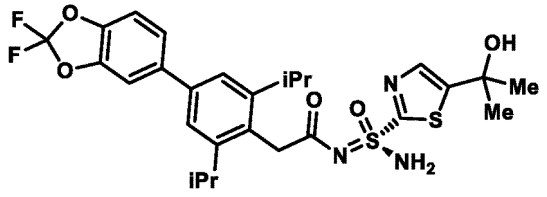
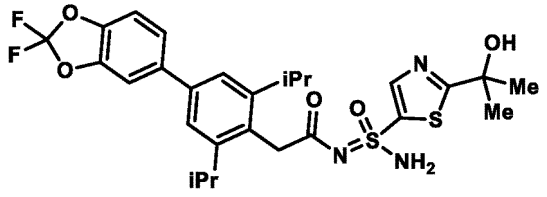
【１０１６】

【表６４】

304	
305	
306	
307	

【１０１７】

【表６５】

309	
309a	
309b	
310	

【１０１８】

医薬組成物及び投与

概略

ある実施形態において、化学物質（例えば、ＮＬＲＰ３を調節する（例えば、それに拮抗する）化合物、又はその薬学的に許容される塩、及び／若しくは水和物、及び／若しくは共結晶、及び／若しくは複合薬）は、化学物質及び１つ以上の薬学的に許容される賦形剤と、任意選択的に、本明細書に記載される１つ以上のさらなる治療剤とを含む医薬組成物として投与される。

【１０１９】

ある実施形態において、化学物質は、１つ以上の従来の医薬品賦形剤と組み合わせて投与され得る。薬学的に許容される賦形剤としては、限定はされないが、イオン交換体、アルミナ、ステアリン酸アルミニウム、レシチン、ｄ－α－トコフェロールポリエチレングリコール１０００スクシネートなどの自己乳化薬剤送達システム（ＳＥＤＤＳ）、Ｔｗｅｅｎｓ、ポロキサマー若しくは他の同様のポリマー送達マトリックスなどの医薬品において使用される界面活性剤、ヒト血清アルブミンなどの血清タンパク質、ホスフェート、トリスなどの緩衝物質、グリシン、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム、飽和植物性脂肪酸などの部分グリセリド混合物、水、硫酸プロタミン、リン酸水素二ナトリウム、リン酸水素カリウム、塩化ナトリウム、亜鉛塩などの塩若しくは電解質、コロイドシリカ、三ケイ酸マグネシウム、ポリビニルピロリドン、セルロース系物質、ポリエチレングリコール、ナトリウムカルボキシメチルセルロース、ポリアクリレート、ワックス、ポリエチレン－ポリオキシプロピレン－ブロックポリマー、及び羊毛脂が挙げられる。α－、β、及びγ－シクロデキストリンなどのシクロデキストリン、又は２－及び３－ヒドロキシプロピル－β－シクロデキストリンを含むヒドロキシアルキルシクロデキストリン、若しくは他の可溶化誘導体などの化学修飾誘導体も、本明細書に記載される化合物の送達を向上させるの

に使用され得る。０．００５％～１００％の範囲の本明細書に記載される化学物質を含有し、残りが非毒性賦形剤から構成される剤形又は組成物が調製され得る。想定される組成物は、０．００１％～１００％、一実施形態において０．１～９５％、別の実施形態において７５～８５％、さらなる実施形態において２０～８０％の本明細書において提供される化学物質を含有する。このような剤形を調製する実際の方法は、当業者に公知であり、又は当業者に明らかであり；例えば、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ：Ｔｈｅ Ｓｃｉｅｎｃｅ ａｎｄ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｙ，２２ｎｄ Ｅｄｉｔｉｏｎ（Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｐｒｅｓｓ，Ｌｏｎｄｏｎ，ＵＫ．２０１２）を参照されたい。

【１０２０】

投与経路及び組成物成分

ある実施形態において、本明細書に記載される化学物質又はその医薬組成物は、それを必要とする対象に、任意の許容される投与経路によって投与され得る。許容される投与経路としては、限定はされないが、口腔、皮膚、子宮頸管内、洞内（ｅｎｄｏｓｉｎｕｓｉａｌ）、気管内、腸内、硬膜外、間質内、腹腔内、動脈内、気管支内、滑液包内（ｉｎｔｒａｂｕｒｓａｌ）、脳内、嚢内、冠動脈内、皮内、管内、十二指腸内、硬膜内、表皮内、食道内、胃内、歯肉内、回腸内、リンパ内、髄内、髄膜内、筋肉内、卵巣内、腹腔内、前立腺内、肺内、副鼻腔内（ｉｎｔｒａｓｉｎａｌ）、髄腔内、滑液嚢内、精巣内、くも膜下内、管内、腫瘍内、子宮内、血管内、静脈内、経鼻、経鼻胃、経口、非経口、経皮、硬膜外、直腸、呼吸器（吸入）、皮下、舌下、粘膜下、局所、経皮、経粘膜、経気管、尿管、尿道、及び膣内が挙げられる。特定の実施形態において、好ましい投与経路は、非経口（例えば、腫瘍内）である。

【１０２１】

組成物は、非経口投与用に製剤化され得、例えば、静脈内、筋肉内、皮下、又はさらには腹腔内経路を介した注射用に製剤化され得る。典型的に、このような組成物は、液体溶液又は懸濁液のいずれかとしての注射剤として調製され得；注射前に液体の添加により溶液又は懸濁液を調製するための使用に好適な固体形態がまた、調製され得；製剤はまた、乳化され得る。このような製剤の調製は、本開示を考慮して当業者に公知である。

【１０２２】

注射用途に好適な医薬品形態としては、滅菌水溶液又は分散液；ゴマ油、ピーナッツ油、又は水性プロピレングリコールを含み製剤；及び滅菌注射用溶液又は分散液の即時調製用の滅菌散剤が挙げられる。いずれの場合も、形態は滅菌されていなければならず、容易に注射され得る程度に流動的でなければならない。また、形態は、製造及び貯蔵の条件下で安定しているべきであり、細菌及び真菌などの微生物の汚染作用から保護されなければならない。

【１０２３】

担体はまた、例えば、水、エタノール、ポリオール（例えば、グリセロール、プロピレングリコール、及び液体ポリエチレングリコールなど）、その好適な混合物、及び植物油を含有する溶媒又は分散媒であり得る。適切な流動性は、例えば、レシチンなどのコーティングの使用、分散液の場合、必要な粒度の維持、及び界面活性剤の使用によって維持され得る。微生物の作用の防止は、様々な抗菌剤及び抗真菌剤、例えば、パラベン、クロロブタノール、フェノール、ソルビン酸、チメロサールなどによってもたらされ得る。多くの場合、等張剤、例えば、糖又は塩化ナトリウムを含むことが好ましい。注射用組成物の持続的吸収は、組成物中の、吸収を遅延させる剤、例えば、モノステアリン酸アルミニウム及びゼラチンの使用によってもたらされ得る。

【１０２４】

滅菌注射用溶液は、所要量の活性化合物を、必要に応じて上に列挙される様々な他の成分とともに適切な溶媒中に組み込んだ後、ろ過滅菌を行うことによって調製される。一般に、分散液は、様々な滅菌有効成分を、塩基性分散媒及び上に列挙されるものからの必要な他の成分を含有する滅菌ビヒクルに組み込むことによって調製される。滅菌注射用溶液の調製用の滅菌散剤の場合、好ましい調製方法は、既に滅菌ろ過されたその溶液から、有

効成分、及び任意のさらなる所望の成分を生じさせる真空乾燥及び凍結乾燥技術である。
【１０２５】
腫瘍内注射剤は、例えば、Ｌａｍｍｅｒｓ，ｅｔ ａｌ．，“Ｅｆｆｅｃｔ ｏｆ Ｉｎｔｒａｔｕｍｏｒａｌ Ｉｎｊｅｃｔｉｏｎ ｏｎ ｔｈｅ Ｂｉｏｄｉｓｔｒｉｂｕｔｉｏｎ ａｎｄ ｔｈｅ Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃ Ｐｏｔｅｎｔｉａｌ ｏｆ ＨＰＭＡ Ｃｏｐｏｌｙｍｅｒ－Ｂａｓｅｄ Ｄｒｕｇ Ｄｅｌｉｖｅｒｙ Ｓｙｓｔｅｍｓ”Ｎｅｏｐｌａｓｉａ．２００６，１０，７８８－７９５において説明されている。
【１０２６】
特定の実施形態において、本明細書に記載される化学物質又はその医薬組成物は、局所、消化管又は胃腸管への局所投与、例えば、直腸投与に好適である。直腸用組成物としては、限定はされないが、かん腸剤、直腸用ゲル、直腸用フォーム、直腸用エアロゾル、坐薬、ゼリー状坐薬、及びかん腸剤（例えば、停留かん腸剤）が挙げられる。
【１０２７】
ゲル、クリーム、かん腸剤、又は肛門坐薬として直腸用組成物中で使用可能な薬理学的に許容される賦形剤としては、限定はされないが、カカオ脂グリセリド、ポリビニルピロリドン、ＰＥＧ（ＰＥＧ軟膏のような）などの合成ポリマー、グリセロール、グリセロールゼラチン、硬化植物油、ポロキサマー、様々な分子量のポリエチレングリコールの混合物及びポリエチレングリコールの脂肪酸エステル、ワセリン、無水ラノリン、サメ肝油、サッカリン酸ナトリウム、メントール、スイートアーモンド油、ソルビトール、安息香酸ナトリウム、ａｎｏｘｉｄ ＳＢＮ、バニラ精油、エアロゾル、フェノキシエタノール中のパラベン、ｐ－オキシ安息香酸メチルナトリウム、ｐ－オキシ安息香酸プロピルナトリウム、ジエチルアミン、カルボマー、ｃａｒｂｏｐｏｌ、オキシ安息香酸メチル、マクロゴールセトステアリルエーテル、ココイルカプリロカプレート、イソプロピルアルコール、プロピレングリコール、流動パラフィン、キサンタンガム、カルボキシ－メタ重亜硫酸塩、エデト酸ナトリウム、安息香酸ナトリウム、メタ重亜硫酸カリウム、グレープフルーツ種子抽出物、メチルスルホニルメタン（ＭＳＭ）、乳酸、グリシン、ビタミン、例えばビタミンＡ及びＥなどのビタミン、並びに酢酸カリウムのうちのいずれか１つ以上が挙げられる。
【１０２８】
特定の実施形態において、坐薬は、本明細書に記載される化学物質を、周囲温度で固体であるが体温で液体であり、したがって直腸内で溶解し、活性化合物を放出する、カカオ脂、ポリエチレングリコール又は坐薬ワックスなどの好適な非刺激性の賦形剤又は担体と混合することによって調製され得る。他の実施形態において、直腸投与用組成物は、かん腸剤の形態である。
【１０２９】
他の実施形態において、本明細書に記載される化合物又はその医薬組成物は、経口投与（例えば、固体又は液体剤形）による消化管又は胃腸管への局所送達に好適である。
【１０３０】
経口投与用の固体剤形としては、カプセル剤、錠剤、丸剤、散剤、及び顆粒剤が挙げられる。このような固体剤形において、化学物質は、クエン酸ナトリウム若しくはリン酸二カルシウムなどの１つ以上の薬学的に許容される賦形剤及び／又は：ａ）デンプン、ラクトース、スクロース、グルコース、マンニトール、及びケイ酸などの充填剤又は増量剤、ｂ）例えば、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸塩、ゼラチン、ポリビニルピロリジノン、スクロース、及びアカシアなどの結合剤、ｃ）グリセロールなどの保湿剤、ｄ）寒天、炭酸カルシウム、ジャガイモ若しくはタピオカデンプン、アルギン酸、特定のケイ酸塩、及び炭酸ナトリウムなどの崩壊剤、ｅ）パラフィンなどの溶解遅延剤、ｆ）第四級アンモニウム化合物などの吸収促進剤、ｇ）例えば、セチルアルコール及びモノステアリン酸グリセロールなどの湿潤剤、ｈ）カオリン及びベントナイト粘土などの吸収剤、及びｉ）タルク、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、固体ポリエチレングリコール、ラウリル硫酸ナトリウム、及びそれらの混合物などの潤滑剤と混合される。カ

プセル剤、錠剤及び丸剤の場合、剤形は、緩衝剤も含み得る。同様のタイプの固体組成物はまた、ラクトース又は乳糖並びに高分子量ポリエチレングリコールなどの賦形剤を用いる軟ゼラチンカプセル及び硬ゼラチンカプセル中の充填剤として用いられ得る。

【１０３１】

一実施形態において、組成物は、丸剤又は錠剤などの単位剤形の形態を取り、したがって組成物は、本明細書において提供される化学物質とともに、ラクトース、スクロース、リン酸二カルシウムなどの希釈剤；ステアリン酸マグネシウムなどの潤滑剤；及びデンプン、アカシアゴム、ポリビニルピロリジン、ゼラチン、セルロース、セルロース誘導体などの結合剤を含有し得る。別の固体剤形において、散剤、マルメ（ｍａｒｕｍｅ）、溶液又は懸濁液（例えば、炭酸プロピレン、植物油、ＰＥＧ、ポロキサマー１２４又はトリグリセリド中の）が、カプセル剤（ゼラチン又はセルロース系カプセル）に封入される。本明細書において提供される１つ以上の化学物質又はさらなる活性薬剤が物理的に分離された単位剤形；例えば、各薬剤の顆粒（又はカプセル中の錠剤）；２層錠剤；２区画ゲルカプセルなども想定される。腸溶コーティング又は遅延放出経口剤形も想定される。

【１０３２】

他の生理学的に許容される化合物としては、湿潤剤、乳化剤、分散剤又は微生物の増殖又は作用を防止するのに特に有用な保存料が挙げられる。様々な保存料が周知であり、例えば、フェノール及びアスコルビン酸が挙げられる。

【１０３３】

特定の実施形態において、賦形剤は滅菌であり、一般に、望ましくない物質を含まない。これらの組成物は、従来の周知の滅菌技術によって滅菌され得る。錠剤及びカプセル剤などの様々な経口剤形賦形剤には、無菌性は必要でない。ＵＳＰ／ＮＦ標準で通常は十分である。

【１０３４】

特定の実施形態において、固体経口剤形は、胃又は下部消化管；例えば、上行結腸及び／又は横行結腸及び／又は遠位結腸及び／又は小腸への化学物質の送達に組成物を化学的に及び／又は構造的に適応させる１つ以上の成分をさらに含み得る。例示的な製剤化技術は、例えば、Ｆｉｌｉｐｓｋｉ，Ｋ．Ｊ．，ｅｔ ａｌ．，Ｃｕｒｒｅｎｔ Ｔｏｐｉｃｓ ｉｎ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ，２０１３，１３，７７６－８０２に記載されており、その全体が参照により本明細書に援用される。

【１０３５】

例としては、上部消化管を標的とする技術、例えば、Ａｃｃｏｒｄｉｏｎ Ｐｉｌｌ（Ｉｎｔｅｃ Ｐｈａｒｍａ）、浮遊カプセル、及び粘膜壁に付着可能な材料が挙げられる。

【１０３６】

他の例としては、下部消化管を標的とする技術が挙げられる。腸管内の様々な領域を標的とするために、いくつかの腸溶／ｐＨ応答性コーティング及び賦形剤が利用可能である。これらの材料は、典型的に、薬剤放出が望まれる消化管領域に基づいて選択される特定のｐＨ範囲で溶解又は浸食されるように設計されたポリマーである。これらの材料はまた、酸不安定性薬剤を胃液から保護するため、又は有効成分が上部消化管に対して刺激性でありうる場合に曝露を制限するために機能する（例えば、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレートシリーズ、Ｃｏａｔｅｒｉｃ（ポリビニルアセテートフタレート）、酢酸セルロースフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート、Ｅｕｄｒａｇｉｔシリーズ（メタクリル酸－メチルメタクリレートコポリマー）、及びＭａｒｃｏａｔ）。他の技術としては、胃腸管内の局部細菌叢に応答する剤形、圧力制御型結腸送達カプセル、及びＰｕｌｓｉｎｃａｐが挙げられる。

【１０３７】

点眼用組成物は、限定はされないが、以下のうちのいずれかの１つ以上を含み得る：ビスコゲン（ｖｉｓｃｏｇｅｎ）（例えば、カルボキシメチルセルロース、グリセロール、ポリビニルピロリドン、ポリエチレングリコール）；安定剤（例えば、Ｐｌｕｒｏｎｉｃ（トリブロックコポリマー）、シクロデキストリン）；保存料（例えば、塩化ベンザルコ

ニウム、ＥＴＤＡ、ＳｏｆＺｉａ（ホウ酸、プロピレングリコール、ソルビトール、及び塩化亜鉛；Ａｌｃｏｎ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｉｅｓ，Ｉｎｃ．）、Ｐｕｒｉｔｅ（安定化オキシクロロ複合体；Ａｌｌｅｒｇａｎ，Ｉｎｃ．））。

【１０３８】

局所用組成物としては、軟膏及びクリームが挙げられる。軟膏は、典型的にワセリン又は他の石油誘導体をベースとする半固体製剤である。選択された活性薬剤を含有するクリームは、典型的に、多くの場合水中油型又は油中水型のいずれかである粘性液体又は半固体乳剤である。クリーム基剤は、典型的に、水で洗浄可能であり、油相、乳化剤及び水性相を含有する。「内」相と呼ばれることもある油相は、一般に、ワセリン及びセチル又はステアリルアルコールなどの脂肪アルコールから構成され；水性相は、通常、必ずしもではないが、体積が油相を上回り、一般に、湿潤剤を含有する。クリーム製剤中の乳化剤は、一般に、非イオン性、アニオン性、カチオン性、又は両性界面活性剤である。他の担体又はビヒクルと同様に、軟膏基剤は、不活性、安定性、非刺激性、及び非感作性であるべきである。

【１０３９】

上記の実施形態のいずれかにおいて、本明細書に記載される医薬組成物は、以下のうちの１つ以上を含み得る：脂質、二重層間架橋多重膜ベシクル、生分解性ポリ（Ｄ，Ｌ－乳酸－コ－グリコール酸）［ＰＬＧＡ］系又はポリ無水物系ナノ粒子又は微粒子、及びナノ多孔性粒子担持脂質二重層。

【１０４０】

かん腸製剤

ある実施形態において、本明細書に記載される化学物質を含有するかん腸製剤は、「調製済み（ｒｅａｄｙ－ｔｏ－ｕｓｅ）」形態で提供される。

【１０４１】

ある実施形態において、本明細書に記載される化学物質を含有するかん腸製剤は、１つ以上のキット又はパック中で提供される。特定の実施形態において、キット又はパックは、２つ以上の別々に含まれる／包装される成分、例えば２つの成分を含み、これは、一緒に混合されると、所望の製剤（例えば、懸濁液として）を提供する。これらの実施形態のいくつかにおいて、２成分系は、第１の成分及び第２の成分を含み、ここで、（ｉ）第１の成分（例えば、小袋に含まれる）は、化学物質（本明細書のいずれかの箇所に記載される）及び任意選択的に１つ以上の薬学的に許容される賦形剤（例えば、固体製剤として一緒に製剤化される、例えば、湿潤粒状固体製剤として一緒に製剤化される）を含み；（ｉｉ）第２の成分（例えば、バイアル又はボトルに含まれる）は、一緒に液体担体を形成する、１つ以上の液体及び任意選択的に１つ以上の他の薬学的に許容される賦形剤を含む。使用前（例えば、使用の直前）に、（ｉ）及び（ｉｉ）の内容物が組み合わされて、例えば、懸濁液としての所望のかん腸製剤が形成される。他の実施形態において、成分（ｉ）及び（ｉｉ）のそれぞれは、それ自体の別個のキット又はパック中で提供される。

【１０４２】

ある実施形態において、１つ以上の液体のそれぞれは、水、又は生理学的に許容される溶媒、又は水と１つ以上の生理学的に許容される溶媒との混合物である。典型的なこのような溶媒としては、限定はされないが、グリセロール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール及びポリプロピレングリコールが挙げられる。特定の実施形態において、１つ以上の液体のそれぞれは、水である。他の実施形態において、１つ以上の液体のそれぞれは、医薬品製剤中で一般的に使用される油、例えば天然及び／又は合成油である。

【１０４３】

本明細書に記載される医薬品に使用され得るさらなる医薬品賦形剤及び担体は、様々な参考書（例えば、Ｄ．Ｅ．Ｂｕｇａｙ　ａｎｄ　Ｗ．Ｐ．Ｆｉｎｄｌａｙ（Ｅｄｓ）Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　ｅｘｃｉｐｉｅｎｔｓ（Ｍａｒｃｅｌ　Ｄｅｋｋｅｒ，Ｎｅｗ　Ｙｏｒｋ，１９９９）、Ｅ－Ｍ　Ｈｏｅｐｆｎｅｒ，Ａ．Ｒｅｎｇ　ａｎｄ　Ｐ．Ｃ．Ｓｃ

hmidt（Eds）Fiedler Encyclopedia of Excipients for Pharmaceuticals, Cosmetics and Related Areas（Edition Cantor, Munich, 2002）及びH.P.Fielder（Ed）Lexikon der Hilfsstoffe fuer Pharmazie, Kosmetik and angrenzende Gebiete（Edition Cantor Aulendorf, 1989））に列挙されている。

【１０４４】

ある実施形態において、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤のそれぞれは、独立して、増粘剤、粘度増強剤、増量剤、粘膜付着剤（ｍｕｃｏａｄｈｅｓｉｖｅ ａｇｅｎｔ）、透過促進剤、緩衝液、保存料、希釈剤、結合剤、潤滑剤、滑剤、崩壊剤、充填剤、可溶化剤、ｐＨ調節剤、保存料、安定剤、酸化防止剤、湿潤剤又は乳化剤、懸濁化剤、顔料、着色剤、等張剤、キレート剤、乳化剤、及び診断用薬から選択され得る。

【１０４５】

特定の実施形態において、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤のそれぞれは、独立して、増粘剤、粘度増強剤、粘膜付着剤、緩衝液、保存料、希釈剤、結合剤、潤滑剤、滑剤、崩壊剤、及び充填剤から選択され得る。

【１０４６】

特定の実施形態において、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤のそれぞれは、独立して、増粘剤、粘度増強剤、増量剤、粘膜付着剤、緩衝液、保存料、及び充填剤から選択され得る。

【１０４７】

特定の実施形態において、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤のそれぞれは、独立して、希釈剤、結合剤、潤滑剤、滑剤、及び崩壊剤から選択され得る。

【１０４８】

増粘剤、粘度増強剤、及び粘膜付着剤の例としては、限定はされないが：ガム、例えばキサンタンガム、グアーガム、ローカストビーンガム、トラガカントガム、カラヤガム、ガティガム、チョヤガム（ｃｈｏｌｌａ ｇｕｍ）、オオバコ種子ガム及びアラビアガム；ポリ（カルボン酸含有）系ポリマー、例えば、強い水素結合基を有するポリ酸（アクリル酸、マレイン酸、イタコン酸、シトラコン酸、ヒドロキシエチルメタクリル酸又はメタクリル酸）、又は塩及びエステルなどのその誘導体；セルロース誘導体、例えばメチルセルロース、エチルセルロース、メチルエチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルエチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース又はセルロースエステル若しくはエーテル又はその誘導体若しくは塩；モンモリロナイト粘土、例えばＶｅｅｇｕｎ、アタパルジャイト粘土などの粘土；デキストラン、ペクチン、アミロペクチン、寒天、マンナン若しくはポリガラクツロン酸又はデンプン、例えばヒドロキシプロピルデンプン若しくはカルボキシメチルデンプンなどの多糖類；カゼイン、グルテン、ゼラチン、フィブリン糊などのポリペプチド；キトサン、例えばラクテート若しくはグルタメート又はカルボキシメチルキチン；ヒアルロン酸などのグリコサミノグリカン；金属又はアルギン酸の水溶性塩、例えばアルギン酸ナトリウム若しくはアルギン酸マグネシウム；スクレログルカン；酸化ビスマス又は酸化アルミニウムを含有する接着剤；アテロコラーゲン；カルボキシビニルポリマーなどのポリビニルポリマー；ポリビニルピロリドン（ポビドン）；ポリビニルアルコール；ポリ酢酸ビニル、ポリビニルメチルエーテル、ポリ塩化ビニル、ポリビニリデンなど；上述されるポリアクリル酸などのポリカルボキシル化ビニルポリマー；ポリシロキサン；ポリエーテル；ポリエチレンオキシド及びグリコール；ポリアルコキシ及びポリアクリルアミド並びにその誘導体及び塩が挙げられる。好ましい例は、セルロース誘導体、例えばメチルセルロース、エチルセルロース、メチルエチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルエチルセルロース、カルボキシメチルセルロ

ース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース又はセルロースエステル若しくはエーテル又はその誘導体若しくは塩（例えば、メチルセルロース）；及びポリビニルピロリドン（ポビドン）などのポリビニルポリマーを含み得る。

【１０４９】

保存料の例としては、限定はされないが：塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゾキソニウム、塩化ベンゼトニウム、セトリミド、塩化セパゾニウム、塩化セチルピリジニウム、臭化ドミフェン（Ｂｒａｄｏｓｏｌ（登録商標））、チオメルサール、硝酸フェニル水銀、酢酸フェニル水銀、ホウ酸フェニル水銀、メチルパラベン、プロピルパラベン、クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコール、クロルヘキシジン、ポリヘキサメチレンビグアナイド、過ホウ酸ナトリウム、イミダゾリジニル尿素、ソルビン酸、Ｐｕｒｉｔｅ（登録商標））、Ｐｏｌｙｑｕａｒｔ（登録商標））、及び過ホウ酸ナトリウム四水和物などが挙げられる。

【１０５０】

特定の実施形態において、保存料は、パラベン、又はその薬学的に許容される塩である。ある実施形態において、パラベンは、アルキル置換４－ヒドロキシベンゾエート、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステルである。特定の実施形態において、アルキルは、Ｃ１～Ｃ４アルキルである。特定の実施形態において、保存料は、４－ヒドロキシ安息香酸メチル（メチルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、４－ヒドロキシ安息香酸プロピル（プロピルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、又はそれらの組合せである。

【１０５１】

緩衝液の例としては、限定はされないが：リン酸緩衝系（無水リン酸二水素ナトリウム、リン酸二ナトリウム十二水和物、二塩基性リン酸ナトリウム、無水第一リン酸ナトリウム）、重炭酸緩衝系、及び重硫酸緩衝系が挙げられる。

【１０５２】

崩壊剤の例としては、限定はされないが：カルメロースカルシウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース（Ｌ－ＨＰＣ）、カルメロース、クロスカルメロースナトリウム、部分アルファー化デンプン、乾燥デンプン、カルボキシメチルデンプンナトリウム、クロスポビドン、ポリソルベート８０（ポリオキシエチレンソルビタンオレエート）、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロースアルファデンプン、粘土、セルロース、アルギニン、ガム又は架橋ポリマー、例えば架橋ＰＶＰ（Ｐｏｌｙｐｌａｓｄｏｎｅ　ＸＬ　ｆｒｏｍ　ＧＡＦ　Ｃｈｅｍｉｃａｌ　Ｃｏｒｐ）が挙げられる。特定の実施形態において、崩壊剤は、クロスポビドンである。

【１０５３】

滑剤及び潤滑剤（凝集阻害剤）の例としては、限定はされないが：タルク、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、コロイドシリカ、ステアリン酸、二酸化ケイ素水溶液、合成ケイ酸マグネシウム、微粒子状酸化ケイ素、デンプン、ラウリル硫酸ナトリウム、ホウ酸、酸化マグネシウム、ワックス、硬化油、ポリエチレングリコール、安息香酸ナトリウム、ステアリン酸、ベヘン酸グリセロール、ポリエチレングリコール、及び鉱油が挙げられる。特定の実施形態において、流動促進剤／潤滑剤は、ステアリン酸マグネシウム、タルク、及び／又はコロイドシリカ；例えば、ステアリン酸マグネシウム及び／又はタルクである。

【１０５４】

「充填剤」又は「増量剤」とも呼ばれる希釈剤の例としては、限定はされないが：リン酸二カルシウム二水和物、硫酸カルシウム、ラクトース（例えば、ラクトース一水和物）、スクロース、マンニトール、ソルビトール、セルロース、微結晶性セルロース、カオリン、塩化ナトリウム、乾燥デンプン、加水分解デンプン、アルファデンプン、二酸化シリコーン、酸化チタン、ケイ酸アルミニウムマグネシウム及び粉糖が挙げられる。特定の実施形態において、希釈剤は、ラクトース（例えば、ラクトース一水和物）である。

【１０５５】

結合剤の例としては、限定はされないが：デンプン、アルファデンプン、ゼラチン、糖（スクロース、グルコース、デキストロース、ラクトース及びソルビトールを含む）、ポリエチレングリコール、ワックス、天然及び合成ゴム、例えばアカシアトラガカント、アルギン酸ナトリウムセルロース（ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロースを含む）、及びビーガム（ｖｅｅｇｕｍ）、及び合成ポリマー、例えばアクリル酸及びメタクリル酸コポリマー、メタクリル酸コポリマー、メチルメタクリレートコポリマー、アミノアルキルメタクリレートコポリマー、ポリアクリル酸／ポリメタクリル酸及びポリビニルピロリドン（ポビドン）が挙げられる。特定の実施形態において、結合剤は、ポリビニルピロリドン（ポビドン）である。

【１０５６】

ある実施形態において、本明細書に記載される化学物質を含有するかん腸製剤は、水及び以下の賦形剤のうちの１つ以上（例えば、全て）：

・１つ以上（例えば、１つ、２つ、又は３つ）の増粘剤、粘度増強剤、結合剤、及び／又は粘膜付着剤（例えば、セルロース又はセルロースエステル若しくはエーテル又はその誘導体若しくは塩（例えば、メチルセルロース）；及びポリビニルポリマー、例えばポリビニルピロリドン（ポビドン）などの；

・１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、２つ）の保存料、例えばパラベン、例えば、４－ヒドロキシ安息香酸メチル（メチルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、４－ヒドロキシ安息香酸プロピル（プロピルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、又はそれらの組合せ；

・１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、２つ）の緩衝液、例えばリン酸緩衝系（例えば、無水リン酸二水素ナトリウム、リン酸二ナトリウム十二水和物）；

・１つ以上（例えば、１つ又は２つ、例えば、２つ）の滑剤及び／又は潤滑剤、例えばステアリン酸マグネシウム及び／又はタルク；

・１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、１つ）の崩壊剤、例えばクロスポビドン；及び

・１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、１つ）の希釈剤、例えばラクトース（例えば、ラクトース一水和物）を含む。

【１０５７】

これらの実施形態のいくつかにおいて、化学物質は、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶である。

【１０５８】

特定の実施形態において、本明細書に記載される化学物質を含有するかん腸製剤は、水、メチルセルロース、ポビドン、メチルパラベン、プロピルパラベン、無水リン酸二水素ナトリウム、リン酸二ナトリウム十二水和物、クロスポビドン、ラクトース一水和物、ステアリン酸マグネシウム、及びタルクを含む。これらの実施形態のいくつかにおいて、化学物質は、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶である。

【１０５９】

特定の実施形態において、本明細書に記載される化学物質を含有するかん腸製剤は、１つ以上のキット又はパック中で提供される。特定の実施形態において、キット又はパックは、２つの別々に含まれる／包装される成分を含み、これは、一緒に混合されると、所望の製剤（例えば、懸濁液として）を提供する。これらの実施形態のいくつかにおいて、２成分系は、第１の成分及び第２の成分を含み、ここで、（ｉ）第１の成分（例えば、小袋に含まれる）は、化学物質（本明細書のいずれかの箇所に記載される）及び１つ以上の薬学的に許容される賦形剤（例えば、固体製剤として一緒に製剤化される、例えば、湿潤粒状固体製剤として一緒に製剤化される）を含み；（ｉｉ）第２の成分（例えば、バイアル又はボトルに含まれる）は、液体担体を一緒に形成する、１つ以上の液体及び１つ以上の他の薬学的に許容される賦形剤を含む。他の実施形態において、成分（ｉ）及び（ｉｉ）のそれぞれは、それ自体の別個のキット又はパック中で提供される。

【１０６０】
これらの実施形態のいくつかにおいて、成分（ｉ）は、化学物質（例えば、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶；例えば、式ＡＡの化合物）及び以下の賦形剤のうちの１つ以上（例えば、全て）：
（ａ）１つ以上（例えば、１つ）の結合剤（例えば、ポリビニルポリマー、例えばポリビニルピロリドン（ポビドン）；
（ｂ）１つ以上（例えば、１つ又は２つ、例えば、２つ）の滑剤及び／又は潤滑剤、例えばステアリン酸マグネシウム及び／又はタルク；
（ｃ）１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、１つ）の崩壊剤、例えばクロスポビドン；及び
（ｄ）１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、１つ）の希釈剤、例えばラクトース（例えば、ラクトース一水和物）を含む。
【１０６１】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、約４０重量パーセント～約８０重量パーセント（例えば、約５０重量パーセント～約７０重量パーセント、約５５重量パーセント～約７０重量パーセント；約６０重量パーセント～約６５重量パーセント；例えば、約６２．１重量パーセント）の化学物質（例えば、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶）を含む。
【１０６２】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、約０．５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約１．５重量パーセント～約４．５重量パーセント、約２重量パーセント～約３．５重量パーセント；例えば、約２．７６重量パーセント）の結合剤（例えば、ポビドン）を含む。
【１０６３】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、約０．５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約０．５重量パーセント～約３重量パーセント、約１重量パーセント～約３重量パーセント；約２重量パーセント、例えば、約１．９重量パーセント）の崩壊剤（例えば、クロスポビドン）を含む。
【１０６４】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、約１０重量パーセント～約５０重量パーセント（例えば、約２０重量パーセント～約４０重量パーセント、約２５重量パーセント～約３５重量パーセント；例えば、約３１．０３重量パーセント）の希釈剤（例えば、ラクトース、例えば、ラクトース一水和物）を含む。
【１０６５】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、約０．０５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約３重量パーセント）の滑剤及び／又は潤滑剤を含む。
【１０６６】
特定の実施形態（例えば、成分（ｉ）が、ステアリン酸マグネシウムなどの１つ以上の潤滑剤を含む場合）において、成分（ｉ）は、約０．０５重量パーセント～約１重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約１重量パーセント；約０．１重量パーセント～約１重量パーセント；約０．１重量パーセント～約０．５重量パーセント；例えば、約０．２７重量パーセント）の潤滑剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム）を含む。
【１０６７】
特定の実施形態（成分（ｉ）が、タルクなどの１つ以上の潤滑剤を含む場合）において、成分（ｉ）は、約０．５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約０．５重量パーセント～約３重量パーセント、約１重量パーセント～約３重量パーセント；約１．５重量パーセント～約２．５重量パーセント；約１．８重量パーセント～約２．２重量パーセント；約１．９３重量パーセント）の潤滑剤（例えば、タルク）を含む。
【１０６８】

これらの実施形態のいくつかにおいて、上記の（ａ）、（ｂ）、（ｃ）、及び（ｄ）のそれぞれが存在する。

【１０６９】

特定の実施形態において、成分（ｉ）は、表Ａに示されるような成分及び量を含む。

【１０７０】

【表６６】

表Ａ

成分	重量パーセント
式 AA の化合物	40 重量パーセント～約 80 重量パーセント (例えば、約 50 重量パーセント～約 70 重量パーセント、約 55 重量パーセント～約 70 重量パーセント; 約 60 重量パーセント～約 65 重量パーセント; 例えば、約 62.1 重量パーセント)
クロスポビドン(Kollidon CL)	0.5 重量パーセント～約 5 重量パーセント (例えば、約 0.5 重量パーセント～約 3 重量パーセント、約 1 重量パーセント～約 3 重量パーセント; 約 1.93 重量パーセント
ラクトース一水和物(Pharmatose 200M)	約 10 重量パーセント～約 50 重量パーセント (例えば、約 20 重量パーセント～約 40 重量パーセント、約 25 重量パーセント～約 35 重量パーセント; 例えば、約 31.03 重量パーセント
ポビドン(Kollidon K30)	約 0.5 重量パーセント～約 5 重量パーセント (例えば、約 1.5 重量パーセント～約 4.5 重量パーセント、約 2 重量パーセント～約 3.5 重量パーセント; 例えば、約 2.76 重量パーセント
タルク	0.5 重量パーセント～約 5 重量パーセント (例えば、約 0.5 重量パーセント～約 3 重量パーセント、約 1 重量パーセント～約 3 重量パーセント; 約 1.5 重量パーセント～約 2.5 重量パーセント; 約 1.8 重量パーセント～約 2.2 重量パーセント; 例えば、約 1.93 重量パーセント
ステアリン酸マグネシウム	約 0.05 重量パーセント～約 1 重量パーセント (例えば、約 0.05 重量パーセント～約 1 重量パーセント; 約 0.1 重量パーセント～約 1 重量パーセント; 約 0.1 重量パーセント～約 0.5 重量パーセント; 例えば、約 0.27 重量パーセント

【１０７１】

特定の実施形態において、成分（ｉ）は、表Ｂに示されるような成分及び量を含む。

【１０７２】

【表６７】

表B

成分	重量パーセント
式 AA の化合物	約 62.1 重量パーセント)
クロスポビドン(Kollidon CL)	約 1.93 重量パーセント
ラクトース一水和物(Pharmatose 200M)	約 31.03 重量パーセント
ポビドン(Kollidon K30)	約 2.76 重量パーセント
タルク	約 1.93 重量パーセント
ステアリン酸マグネシウム	約 0.27 重量パーセント

【１０７３】
特定の実施形態において、成分（ｉ）は、湿潤粒状固体製剤として製剤化される。これらの実施形態のいくつかにおいて、成分（化学物質、崩壊剤、及び希釈剤）の内相が組み合わされて、高せん断造粒機中で混合される。結合剤（例えば、ポビドン）は、水に溶解されて、顆粒化溶液が形成される。この溶液が、内相混合物に加えられて、顆粒を発生させる。理論に制約されるのを望むものではないが、顆粒発生は、ポリマー結合剤と、内相の材料との相互作用によって促進されるものと考えられる。顆粒が形成され、乾燥されると、外相（例えば、１つ以上の潤滑剤－乾燥された顆粒の固有成分ではない）が、乾燥顆粒に加えられる。顆粒の潤滑が、特に包装のための、顆粒の流動性にとって重要であるものと考えられる。
【１０７４】
上記の実施形態のいくつかにおいて、成分（ｉｉ）は、水及び以下の賦形剤のうちの１つ以上（例えば、全て）：
（ａ’）１つ以上（例えば、１つ、２つ；例えば、２つ）の増粘剤、粘度増強剤、結合剤、及び／又は粘膜付着剤（例えば、セルロース又はセルロースエステル若しくはエーテル又はその誘導体若しくは塩（例えば、メチルセルロース）；及びポリビニルポリマー、例えばポリビニルピロリドン（ポビドン）；
（ｂ’）１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、２つ）の保存料、例えばパラベン、例えば、４－ヒドロキシ安息香酸メチル（メチルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、４－ヒドロキシ安息香酸プロピル（プロピルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、又はそれらの組合せ；及び
（ｃ’）１つ以上（例えば、１つ又は２つ；例えば、２つ）の緩衝液、例えばリン酸緩衝系（例えば、リン酸二水素ナトリウム二水和物、リン酸二ナトリウム十二水和物）を含み；
上記の実施形態のいくつかにおいて、成分（ｉｉ）は、水及び以下の賦形剤のうちの１つ以上（例えば、全て）：
（ａ’’）第１の増粘剤、粘度増強剤、結合剤、及び／又は粘膜付着剤（例えば、セルロース又はセルロースエステル若しくはエーテル又はその誘導体若しくは塩（例えば、メチルセルロース））；
（ａ’’’）第２の増粘剤、粘度増強剤、結合剤、及び／又は粘膜付着剤（例えば、ポリビニルポリマー、例えばポリビニルピロリドン（ポビドン））；
（ｂ’’）第１の保存料、例えばパラベン、例えば、４－ヒドロキシ安息香酸プロピル（プロピルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル；
（ｂ’’）第２の保存料、例えばパラベン、例えば、４－ヒドロキシ安息香酸メチル（メチルパラベン）、又はその薬学的に許容される塩若しくはエステル、
（ｃ’’）第１の緩衝液、例えばリン酸緩衝系（例えば、リン酸二ナトリウム十二水和物

）；
（ｃ’’’）第２の緩衝液、例えばリン酸緩衝系（例えば、無水リン酸二水素ナトリウム）を含み、
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．０５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約３重量パーセント、約０．１重量パーセント～約３重量パーセント；例えば、約１．４重量パーセント）の（ａ’’）を含む。
【１０７５】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．０５重量パーセント～約５重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約３重量パーセント、約０．１重量パーセント～約２重量パーセント；例えば、約１．０重量パーセント）の（ａ’’’）を含む。
【１０７６】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．００５重量パーセント～約０．１重量パーセント（例えば、約０．００５重量パーセント～約０．０５重量パーセント；例えば、約０．０２重量パーセント）の（ｂ’’）を含む。
【１０７７】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．０５重量パーセント～約１重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約０．５重量パーセント；例えば、約０．２０重量パーセント）の（ｂ’’’）を含む。
【１０７８】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．０５重量パーセント～約１重量パーセント（例えば、約０．０５重量パーセント～約０．５重量パーセント；例えば、約０．１５重量パーセント）の（ｃ’’）を含む。
【１０７９】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、約０．００５重量パーセント～約０．５重量パーセント（例えば、約０．００５重量パーセント～約０．３重量パーセント；例えば、約０．１５重量パーセント）の（ｃ’’’）を含む。
【１０８０】
これらの実施形態のいくつかにおいて、（ａ’’）～（ｃ’’’）のそれぞれが存在する。
【１０８１】
特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、水（最大で１００％）並びに表Ｃに示されるような成分及び量を含む。
【１０８２】

【表６８】

表C

成分	重量パーセント
メチルセルロース (Methocel A15C premium)	0.05 重量パーセント～約 5 重量パーセント (例えば、約 0.05 重量パーセント～約 3 重量パーセント、約 0.1 重量パーセント～約 3 重量パーセント; 例えば、約 1.4 重量パーセント
ポビドン(Kollidon K30)	0.05 重量パーセント～約 5 重量パーセント (例えば、約 0.05 重量パーセント～約 3 重量パーセント、約 0.1 重量パーセント～約 2 重量パーセント; 例えば、約 1.0 重量パーセント
4-ヒドロキシ安息香酸プロピル	約 0.005 重量パーセント～約 0.1 重量パーセント(例えば、約 0.005 重量パーセント～約 0.05 重量パーセント; 例えば、約 0.02 重量パーセント)
4-ヒドロキシ安息香酸メチル	約 0.05 重量パーセント～約 1 重量パーセント (例えば、約 0.05 重量パーセント～約 0.5 重量パーセント; 例えば、約 0.20 重量パーセント)
リン酸二ナトリウム十二水和物	約 0.05 重量パーセント～約 1 重量パーセント (例えば、約 0.05 重量パーセント～約 0.5 重量パーセント; 例えば、約 0.15 重量パーセント)
リン酸二水素ナトリウム二水和物	約 0.005 重量パーセント～約 0.5 重量パーセント(例えば、約 0.005 重量パーセント～約 0.3 重量パーセント; 例えば、約 0.15 重量パーセント)

【１０８３】

特定の実施形態において、成分（ｉｉ）は、水（最大で１００％）並びに表Ｄに示されるような成分及び量を含む。

【１０８４】

【表６９】

表 D

成分	重量パーセント
メチルセルロース (Methocel A15C premium)	約 1.4 重量パーセント
ポビドン(Kollidon K30)	約 1.0 重量パーセント
4-ヒドロキシ安息香酸プロピル	約 0.02 重量パーセント
4-ヒドロキシ安息香酸メチル	約 0.20 重量パーセント
リン酸二ナトリウム十二水和物	約 0.15 重量パーセント
リン酸二水素ナトリウム二水和物	約 0.15 重量パーセント

【１０８５】
調製済みかん腸剤は、一般に、プラスチック又はガラスの「シングルユース（ｓｉｎｇｌｅ－ｕｓｅ）」の密閉使い捨て容器中で提供される。ポリマー材料で形成されるものは、好ましくは、患者単独による使用の容易さのために十分な可撓性を有する。典型的なプラスチック容器は、ポリエチレンで作製され得る。これらの容器は、直腸への直接の導入のための先端を備え得る。このような容器は、容器と先端との間にチューブも備え得る。先端には、好ましくは、使用前に取り外される保護遮蔽体が設けられる。任意選択的に、先端は、患者のコンプライアンスを向上させるために潤滑剤を有する。
【１０８６】
ある実施形態において、かん腸製剤（例えば、懸濁液）は、それが別個の容器中で調製された後、送達のためにボトルに注がれる。特定の実施形態において、ボトルは、プラスチックボトル（例えば、ボトルを押しつぶすことによって送達を可能にするように可撓性である）であり、これは、ポリエチレンボトル（例えば、白色の）であり得る。ある実施形態において、ボトルは、懸濁液又は溶液を含む単一チャンバボトルである。他の実施形態において、ボトルは、マルチチャンバボトルであり、ここで、各チャンバが、別個の混合物又は溶液を含む。さらに他の実施形態において、ボトルは、直腸への直接の導入のための先端又は直腸カニューレをさらに含み得る。ある実施形態において、かん腸製剤は、図３Ａ～３Ｃに示されるデバイス中で送達され得、このデバイスは、プラスチックボトル、易破壊性カプセル、及び直腸カニューレ及び単一フローパックを含む。
【１０８７】
投与量
投与量は、患者の所要量、治療される病態の重症度及び用いられる特定の化合物に応じて変動し得る。特定の状況のための適切な投与量の決定は、医療分野の当業者によって決定され得る。総一日投与量が、分割され、１日を通して数回に分けて、又は連続送達を提供する手段によって投与され得る。
【１０８８】
ある実施形態において、本明細書に記載される化合物は、約０．００１ｍｇ／Ｋｇ～約５００ｍｇ／Ｋｇ（例えば、約０．００１ｍｇ／Ｋｇ～約２００ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約２００ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約１５０ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約１００ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約５０ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約１０ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約５ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約１ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約０．５ｍｇ／Ｋｇ；約０．０１ｍｇ／Ｋｇ～約０．１ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約２００ｍｇ／Ｋｇ；約０

．１ｍｇ／Ｋｇ～約１５０ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約１００ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約５０ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約１０ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約５ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約１ｍｇ／Ｋｇ；約０．１ｍｇ／Ｋｇ～約０．５ｍｇ／Ｋｇ）の投与量で投与される。

【１０８９】

ある実施形態において、かん腸製剤は、約１ｍＬ～約３０００ｍＬ（例えば、約１ｍＬ～約２０００ｍＬ、約１ｍＬ～約１０００ｍＬ、約１ｍＬ～約５００ｍＬ、約１ｍＬ～約２５０ｍＬ、約１ｍＬ～約１００ｍＬ、約１０ｍＬ～約１０００ｍＬ、約１０ｍＬ～約５００ｍＬ、約１０ｍＬ～約２５０ｍＬ、約１０ｍＬ～約１００ｍＬ、約３０ｍＬ～約９０ｍＬ、約４０ｍＬ～約８０ｍＬ；約５０ｍＬ～約７０ｍＬ；例えば、約１ｍＬ、約５ｍＬ、約１０ｍＬ、約１５ｍＬ、約２０ｍＬ、約２５ｍＬ、約３０ｍＬ、約３５ｍＬ、約４０ｍＬ、約４５ｍＬ、約５０ｍＬ、約５５ｍＬ、約６０ｍＬ、約６５ｍＬ、約７０ｍＬ、約７５ｍＬ、約１００ｍＬ、約２５０ｍＬ、又は約５００ｍＬ、又は約１０００ｍＬ、又は約２０００ｍＬ、又は約３０００ｍＬ；例えば、６０ｍＬ）の液体担体中の、約０．５ｍｇ～約２５００ｍｇ（例えば、約０．５ｍｇ～約２０００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約１０００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約７５０ｍｇ、約０．５ｍｇ～約６００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約５００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約４００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約３００ｍｇ、約０．５ｍｇ～約２００ｍｇ；例えば、約５ｍｇ～約２５００ｍｇ、約５ｍｇ～約２０００ｍｇ、約５ｍｇ～約１０００ｍｇ；約５ｍｇ～約７５０ｍｇ；約５ｍｇ～約６００ｍｇ；約５ｍｇ～約５００ｍｇ；約５ｍｇ～約４００ｍｇ；約５ｍｇ～約３００ｍｇ；約５ｍｇ～約２００ｍｇ；例えば、約５０ｍｇ～約２０００ｍｇ、約５０ｍｇ～約１０００ｍｇ、約５０ｍｇ～約７５０ｍｇ、約５０ｍｇ～約６００ｍｇ、約５０ｍｇ～約５００ｍｇ、約５０ｍｇ～約４００ｍｇ、約５０ｍｇ～約３００ｍｇ、約５０ｍｇ～約２００ｍｇ；例えば、約１００ｍｇ～約２５００ｍｇ、約１００ｍｇ～約２０００ｍｇ、約１００ｍｇ～約１０００ｍｇ、約１００ｍｇ～約７５０ｍｇ、約１００ｍｇ～約７００ｍｇ、約１００ｍｇ～約６００ｍｇ、約１００ｍｇ～約５００ｍｇ、約１００ｍｇ～約４００ｍｇ、約１００ｍｇ～約３００ｍｇ、約１００ｍｇ～約２００ｍｇ；例えば、約１５０ｍｇ～約２５００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約２０００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約１０００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約７５０ｍｇ、約１５０ｍｇ～約７００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約６００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約５００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約４００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約３００ｍｇ、約１５０ｍｇ～約２００ｍｇ；例えば、約１５０ｍｇ～約５００ｍｇ；例えば、約３００ｍｇ～約２５００ｍｇ、約３００ｍｇ～約２０００ｍｇ、約３００ｍｇ～約１０００ｍｇ、約３００ｍｇ～約７５０ｍｇ、約３００ｍｇ～約７００ｍｇ、約３００ｍｇ～約６００ｍｇ；例えば、約４００ｍｇ～約２５００ｍｇ、約４００ｍｇ～約２０００ｍｇ、約４００ｍｇ～約１０００ｍｇ、約４００ｍｇ～約７５０ｍｇ、約４００ｍｇ～約７００ｍｇ、約４００ｍｇ～約６００　約４００ｍｇ～約５００ｍｇ；例えば、１５０ｍｇ又は４５０ｍｇ）の化学物質を含む。

【１０９０】

特定の実施形態において、かん腸製剤は、約１０ｍＬ～約１００ｍＬ（例えば、約２０ｍＬ～約１００ｍＬ、約３０ｍＬ～約９０ｍＬ、約４０ｍＬ～約８０ｍＬ；約５０ｍＬ～約７０ｍＬ）の液体担体中の、約５０ｍｇ～約２５０ｍｇ（例えば、約１００ｍｇ～約２００；例えば、約１５０ｍｇ）の化学物質を含む。特定の実施形態において、かん腸製剤は、約６０ｍＬの液体担体中の約１５０ｍｇの化学物質を含む。これらの実施形態のいくつかにおいて、化学物質は、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶である。例えば、かん腸製剤は、約６０ｍＬの液体担体中の約１５０ｍｇの式ＡＡの化合物を含み得る。

【１０９１】

特定の実施形態において、かん腸製剤は、約１０ｍＬ～約１００ｍＬ（例えば、約２０ｍＬ～約１００ｍＬ、約３０ｍＬ～約９０ｍＬ、約４０ｍＬ～約８０ｍＬ；約５０ｍＬ～約７０ｍＬ）の液体担体中の、約３５０ｍｇ～約５５０ｍｇ（例えば、約４００ｍｇ～約

５００；例えば、約４５０ｍｇ）の化学物質を含む。特定の実施形態において、かん腸製剤は、約６０ｍＬの液体担体中の約４５０ｍｇの化学物質を含む。これらの実施形態のいくつかにおいて、化学物質は、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶である。例えば、かん腸製剤は、約６０ｍＬの液体担体中の約４５０ｍｇの式ＡＡの化合物を含み得る。

【１０９２】

ある実施形態において、かん腸製剤は、液体担体中の、約０．０１ｍｇ／ｍＬ～約５０ｍｇ／ｍＬ（例えば、約０．０１ｍｇ／ｍＬ～約２５ｍｇ／ｍＬ；約０．０１ｍｇ／ｍＬ～約１０ｍｇ／ｍＬ；約０．０１ｍｇ／ｍＬ～約５ｍｇ／ｍＬ；約０．１ｍｇ／ｍＬ～約５０ｍｇ／ｍＬ；約０．０１ｍｇ／ｍＬ～約２５ｍｇ／ｍＬ；約０．１ｍｇ／ｍＬ～約１０ｍｇ／ｍＬ；約０．１ｍｇ／ｍＬ～約５ｍｇ／ｍＬ；約１ｍｇ／ｍＬ～約１０ｍｇ／ｍＬ；約１ｍｇ／ｍＬ～約５ｍｇ／ｍＬ；約５ｍｇ／ｍＬ～約１０ｍｇ／ｍＬ；例えば、約２．５ｍｇ／ｍＬ又は約７．５ｍｇ／ｍＬ）の化学物質を含む。これらの実施形態のいくつかにおいて、化学物質は、式ＡＡの化合物、又はその薬学的に許容される塩及び／若しくは水和物及び／若しくは共結晶である。例えば、かん腸製剤は、液体担体中の約２．５ｍｇ／ｍＬ又は約７．５ｍｇ／ｍＬの式ＡＡの化合物を含み得る。

【１０９３】

レジメン

上記の投与量は、毎日（例えば、単回投与若しくは２回以上の分割投与として）又は毎日ではなく（例えば、隔日、２日毎、３日毎、週１回、数週間に２回、２週間に１回、月１回）投与され得る。

【１０９４】

ある実施形態において、本明細書に記載される化合物の投与期間は、１日、２日間、３日間、４日間、５日間、６日間、７日間、８日間、９日間、１０日間、１１日間、１２日間、１３日間、１４日間、３週間、４週間、５週間、６週間、７週間、８週間、９週間、１０週間、１１週間、１２週間、４ヶ月間、５ヶ月間、６ヶ月間、７ヶ月間、８ヶ月間、９ヶ月間、１０ヶ月間、１１ヶ月間、１２ヶ月間、又はそれ以上である。さらなる実施形態において、投与が停止される期間は、１日、２日間、３日間、４日間、５日間、６日間、７日間、８日間、９日間、１０日間、１１日間、１２日間、１３日間、１４日間、３週間、４週間、５週間、６週間、７週間、８週間、９週間、１０週間、１１週間、１２週間、４ヶ月間、５ヶ月間、６ヶ月間、７ヶ月間、８ヶ月間、９ヶ月間、１０ヶ月間、１１ヶ月間、１２ヶ月間、又はそれ以上である。一実施形態において、治療用化合物が、ある期間、続いて別の期間にわたって個体に投与される。別の実施形態において、治療用化合物が、第１の期間及び第１の期間の後の第２の期間にわたって投与され、第２の期間中に投与が停止され、続いて第３の期間に治療用化合物の投与が開始され、次に第３の期間の後の第４の期間に投与が停止される。この実施形態の一態様において、治療用化合物の投与期間と、それに続く投与が停止される期間が、所定の又は不確定の期間にわたって繰り返される。さらなる実施形態において、投与期間は、１日、２日間、３日間、４日間、５日間、６日間、７日間、８日間、９日間、１０日間、１１日間、１２日間、１３日間、１４日間、３週間、４週間、５週間、６週間、７週間、８週間、９週間、１０週間、１１週間、１２週間、４ヶ月間、５ヶ月間、６ヶ月間、７ヶ月間、８ヶ月間、９ヶ月間、１０ヶ月間、１１ヶ月間、１２ヶ月間又はそれ以上である。さらなる実施形態において、投与が停止される期間は、１日、２日間、３日間、４日間、５日間、６日間、７日間、８日間、９日間、１０日間、１１日間、１２日間、１３日間、１４日間、３週間、４週間、５週間、６週間、７週間、８週間、９週間、１０週間、１１週間、１２週間、４ヶ月間、５ヶ月間、６ヶ月間、７ヶ月間、８ヶ月間、９ヶ月間、１０ヶ月間、１１ヶ月間、１２ヶ月間又はそれ以上である。

【１０９５】

治療方法

ある実施形態において、ＮＬＲＰ３活性の減少又は増加（例えば、増加、例えば、ＮＬ

ＲＰ３シグナル伝達）が病態、疾患又は障害の病変及び／又は症状及び／又は進行の一因である病態、疾患又は障害に罹患した対象を治療するための方法であって、有効量の本明細書に記載される化学物質（例えば、本明細書に一般的に若しくは具体的に記載される化合物又はその薬学的に許容される塩又はそれを含有する組成物）を対象に投与する工程を含む方法が提供される。

【１０９６】

適応症

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、活動性感染が任意の身体部位に存在する感染症に対する不適切な宿主応答、例えば敗血症性ショック、播種性血管内凝固症候群、及び／又は成人呼吸窮迫症候群；抗原、抗体及び／又は補体の沈着に起因する急性若しくは慢性炎症；関節炎、胆管炎、大腸炎、脳炎、心内膜炎、糸球体腎炎、肝炎、心筋炎、膵炎、心膜炎、再かん流傷害及び脈管炎を含む炎症性疾患、急性及び遅延型過敏症、移植片拒絶反応、及び移植片対宿主病などの免疫系疾患；１型糖尿病及び多発性硬化症を含む自己免疫疾患から選択される。例えば、病態、疾患又は障害は、関節リウマチ、変形性関節症、敗血症性ショック、ＣＯＰＤ及び歯周病などの炎症性疾患であり得る。

【１０９７】

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、自己免疫疾患である。非限定的な例としては、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、多遺伝子感受性を伴う慢性炎症性疾患である、クローン病（ＣＤ）及び潰瘍性大腸炎（ＵＣ）を含む炎症性腸疾患（ＩＢＤ）が挙げられる。特定の実施形態において、病態は炎症性腸疾患である。特定の実施形態において、病態は、クローン病、自己免疫性大腸炎、医原性自己免疫性大腸炎、潰瘍性大腸炎、１つ以上の化学療法剤によって誘導される大腸炎、養子細胞療法による処置によって誘導される大腸炎、１つ以上の同種免疫疾患（移植片対宿主病、例えば、急性移植片対宿主病及び慢性移植片対宿主病など）、放射線腸炎、膠原線維性大腸炎、リンパ球性大腸炎、顕微鏡的大腸炎、及び放射線腸炎に関連する大腸炎である。これらの実施形態のいくつかにおいて、病態は、同種免疫疾患（移植片対宿主病、例えば、急性移植片対宿主病及び慢性移植片対宿主病など）、セリアック病、過敏性腸症候群、関節リウマチ、ループス、強皮症、乾癬、皮膚Ｔ細胞リンパ腫、ブドウ膜炎、及び粘膜炎（例えば、口腔粘膜炎、食道粘膜炎又は腸粘膜炎）である。

【１０９８】

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、以前の心臓発作及び炎症性アテローム性動脈硬化症を有する患者における心血管系死亡、非致死性心筋梗塞及び非致死性脳卒中などの主要有害心血管イベント（例えば、ＮＣＴ０１３２７８４６を参照）から選択される。

【１０９９】

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、２型糖尿病、アテローム性動脈硬化症、肥満及び痛風などの代謝障害、並びにアルツハイマー病及び多発性硬化症及び筋萎縮性側索硬化症及びパーキンソン病などの中枢神経系の疾患、喘息及びＣＯＰＤ及び突発性肺線維症などの肺疾患、ＮＡＳＨ症候群、ウイルス性肝炎及び肝硬変などの肝疾患、急性及び慢性膵炎などの膵疾患、急性及び慢性腎障害などの腎疾患、クローン病及び潰瘍性大腸炎などの腸疾患、乾癬などの皮膚疾患、強皮症などの筋骨格疾患、巨細胞性動脈炎などの血管疾患、変形性関節症、骨粗鬆症及び大理石骨病の障害などの骨の障害、緑内障及び黄斑変性症などの眼疾患、ＨＩＶ及びＡＩＤＳなどのウイルス感染に起因する疾患、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎などの自己免疫疾患、アジソン病、悪性貧血、癌及び老化から選択される。

【１１００】

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、心血管適応症である。ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、心筋梗塞である。ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、脳卒中である。

【１１０１】

ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、肥満である。
【１１０２】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、２型糖尿病である。
【１１０３】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、ＮＡＳＨである。
【１１０４】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、アルツハイマー病である。
【１１０５】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、痛風である。
【１１０６】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、ＳＬＥである。
【１１０７】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、関節リウマチである。
【１１０８】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、ＩＢＤである。
【１１０９】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、多発性硬化症である。
【１１１０】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、ＣＯＰＤである。
【１１１１】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、喘息である。
【１１１２】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、強皮症である。
【１１１３】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、肺線維症である。
【１１１４】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、加齢黄斑変性症（ＡＭＤ）である。
【１１１５】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、嚢胞性線維症である。
【１１１６】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、マックル・ウェルズ症候群である。
【１１１７】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、家族性寒冷自己炎症症候群（ＦＣＡＳ）である。
【１１１８】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、慢性神経皮膚関節症候群である。
【１１１９】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、骨髄異形成症候群（ＭＤＳ）；非小細胞肺癌、例えばＮＬＲＰ３の突然変異又は過剰発現を有する患者の非小細胞肺癌；急性リンパ芽球性白血病（ＡＬＬ）、例えば糖質コルチコイド治療に対して耐性がある患者のＡＬＬ；ランゲルハンス細胞組織球症（ＬＣＨ）；多発性骨髄腫；前骨髄球性白血病；急性骨髄性白血病（ＡＭＬ）慢性骨髄性白血病（ＣＭＬ）；胃癌；及び肺癌転移から選択される。
【１１２０】
ある実施形態において、病態、疾患又は障害は、骨髄異形成症候群（ＭＤＳ）；非小細胞肺癌、例えばＮＬＲＰ３の突然変異又は過剰発現を有する患者の非小細胞肺癌；急性リンパ芽球性白血病（ＡＬＬ）、例えば糖質コルチコイド治療に対して耐性がある患者のＡＬＬ；ランゲルハンス細胞組織球症（ＬＣＨ）；多発性骨髄腫；前骨髄球性白血病；胃癌；及び肺癌転移から選択される。
【１１２１】

ある実施形態において、適応症はＭＤＳである。
【１１２２】
ある実施形態において、適応症は、ＮＬＲＰ３の突然変異又は過剰発現を有する患者の非小細胞肺癌である。
【１１２３】
ある実施形態において、適応症は、糖質コルチコイド治療に対して耐性がある患者のＡＬＬである。
【１１２４】
ある実施形態において、適応症はＬＣＨである。
【１１２５】
ある実施形態において、適応症は多発性骨髄腫である。
【１１２６】
ある実施形態において、適応症は前骨髄球性白血病である。
【１１２７】
ある実施形態において、適応症は胃癌である。
【１１２８】
ある実施形態において、適応症は肺癌転移である。
【１１２９】
併用療法
本開示は、単剤療法レジメン並びに併用療法レジメンの両方を想定する。
【１１３０】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、本明細書に記載される化合物の投与と組み合わせて、１つ以上のさらなる治療（例えば、１つ以上のさらなる治療剤及び／又は１つ以上の治療レジメン）を投与する工程をさらに含み得る。
【１１３１】
特定の実施形態において、第２の治療剤又はレジメンは、化学物質と接触させるか又はそれを投与する前（例えば、約１時間前、又は約６時間前、又は約１２時間前、又は約２４時間前、又は約４８時間前、又は約１週間前、又は約１ヶ月前）に対象に投与される。
【１１３２】
他の実施形態において、第２の治療剤又はレジメンは、化学物質と接触させるか又はそれを投与するのとほぼ同時に対象に投与される。例として、第２の治療剤又はレジメン及び化学物質は、同じ剤形中で同時に対象に与えられる。別の例として、第２の治療剤又はレジメン及び化学物質は、別個の剤形中で同時に対象に与えられる。
【１１３３】
さらに他の実施形態において、第２の治療剤又はレジメンは、化学物質と接触させるか又はそれを投与した後（例えば、約１時間後、又は約６時間後、又は約１２時間後、又は約２４時間後、又は約４８時間後、又は約１週間後、又は約１ヶ月後）に対象に投与される。
【１１３４】
患者の選択
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症、例えばＮＬＲＰ３遺伝子多型に関連する適応症の治療を必要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１３５】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症、例えば遺伝子多型が機能獲得であるＮＬＲＰ３に関連する適応症の治療を必要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１３６】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症、例えばＣＡＰＳ症候群に見られるＮＬＲＰ３遺伝子多型に関連する適応症の治療を必

要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１３７】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症、例えば遺伝子多型がＶＡＲ＿０１４１０４（Ｒ２６２Ｗ）であるＮＬＲＰ３遺伝子多型に関連する適応症の治療を必要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１３８】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症の、例えば遺伝子多型がｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ｕｎｉｐｒｏｔ．ｏｒｇ／ｕｎｉｐｒｏｔ／Ｑ９６Ｐ２０に報告されている天然変異体であるＮＬＲＰ３遺伝子多型に関連する適応症の治療を必要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１３９】
ある実施形態において、本明細書に記載される方法は、ＮＬＲＰ３活性に関連する適応症、例えばＮＬＲＰ３シグナル伝達の点突然変異に関連する適応症の治療を必要とする対象（例えば、患者）を同定する工程をさらに含む。
【１１４０】
抗ＴＮＦα剤
「抗ＴＮＦα剤」という用語は、ＴＮＦα活性及び／又は発現を直接又は間接的に阻止し、下方制御し、低下させ、阻害し、低下させ、又は低減する薬剤を指す。ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、抗体又はその抗原結合断片、融合タンパク質、可溶性ＴＮＦα受容体（可溶性腫瘍壊死因子受容体スーパーファミリーメンバー１Ａ（ＴＮＦＲ１）又は可溶性腫瘍壊死因子受容体スーパーファミリー１Ｂ（ＴＮＦＲ２））、阻害性核酸、又は小分子ＴＮＦαアンタゴニストである。ある実施形態において、阻害性核酸は、リボザイム、低分子ヘアピン型ＲＮＡ、低分子干渉ＲＮＡ、アンチセンス核酸、又はアプタマーである。
【１１４１】
ＴＮＦα活性及び／又は発現を直接阻止し、下方制御し、低下させ、阻害し、又は低減する例示的な抗ＴＮＦα剤は、例えば、細胞（例えば、対象から採取した細胞、哺乳動物細胞）内のＴＮＦα又はＴＮＦαの受容体（ＴＮＦＲ１若しくはＴＮＦＲ２）の発現レベルを阻害するか若しくは、又はＴＮＦαの、その受容体（ＴＮＦＲ１及び／又はＴＮＦＲ２）への結合を阻害若しくは低減し得る及び／又は。ＴＮＦα活性及び／又は発現を直接阻止し、下方制御し、低下させ、阻害し、又は低減する抗ＴＮＦα剤の非限定的な例は、抗体又はその断片、融合タンパク質、可溶性ＴＮＦα受容体（例えば、可溶性ＴＮＦＲ１又は可溶性ＴＮＦＲ２）、阻害性核酸（例えば、本明細書に記載される阻害性核酸の例のいずれか）、及び小分子ＴＮＦαアンタゴニストを含む。
【１１４２】
ＴＮＦα活性及び／又は発現を間接的に阻止し、下方制御し、低下させ、阻害し、低減し得る例示的な抗ＴＮＦα剤は、例えば、哺乳動物細胞内のＴＮＦα受容体（例えば、ＴＮＦＲ１又はＴＮＦＲ２）の下流のシグナル伝達のレベルを阻害又は低減し得（例えば、細胞内の、以下のシグナル伝達タンパク質のうちの１つ以上のレベル及び／又は活性を低減する：ＡＰ－１、分裂促進因子活性化プロテインキナーゼキナーゼキナーゼ５（ＡＳＫ１）、核内因子κＢの阻害剤（ＩＫＫ）、分裂促進因子活性化プロテインキナーゼ８（ＪＮＫ）、分裂促進因子活性化プロテインキナーゼ（ＭＡＰＫ）、ＭＥＫＫ　１／４、ＭＥＫＫ　４／７、ＭＥＫＫ　３／６、核内因子κＢ（ＮＦ－κＢ）、分裂促進因子活性化プロテインキナーゼキナーゼキナーゼ１４（ＮＩＫ）、受容体共役セリン／トレオニンキナーゼ１（ＲＩＰ）、ＴＮＦＲＳＦ１Ａ関連デスドメイン（ＴＲＡＤＤ）、及びＴＮＦ受容体関連因子２（ＴＲＡＦ２））、及び／又は哺乳動物細胞内のＴＮＦα誘導性遺伝子発現のレベルを低減し得る（例えば、活性化転写因子２（ＡＴＦ２）、ｃ－Ｊｕｎ、及びＮＦ－κＢの群から例えば選択される１つ以上の転写因子によって調節される遺伝子の転写を低減する）。ＴＮＦα受容体の下流のシグナル伝達の説明は、Ｗａｊａｎｔ　ｅｔ　ａｌ．，

Ｃｅｌｌ Ｄｅａｔｈ Ｄｉｆｆｅｒｅｎｔｉａｔｉｏｎ １０：４５－６５，２００３（参照により本明細書に援用される）において提供されている。例えば、このような間接的な抗ＴＮＦα剤は、ＴＮＦα誘導性遺伝子（例えば、当該技術分野において公知の任意のＴＮＦα誘導性遺伝子）の下流のシグナル伝達成分、ＴＮＦα受容体（例えば、本明細書に記載されるか若しくは当該技術分野において公知のＴＮＦα受容体の下流のシグナル伝達成分のいずれか１つ以上）、又はＮＦ－κＢ、ｃ－Ｊｕｎ、及びＡＴＦ２の群から選択される転写因子を標的とする（発現を低減する）阻害性核酸であり得る。

【１１４３】

他の例において、このような間接的な抗ＴＮＦα剤は、ＴＮＦα誘導性遺伝子によってコードされるタンパク質（例えば、当該技術分野において公知のＴＮＦα誘導性遺伝子によってコードされる任意のタンパク質）の小分子阻害剤、ＴＮＦα受容体の下流のシグナル伝達成分（例えば、本明細書に記載されるか若しくは当該技術分野において公知のＴＮＦα受容体の下流のシグナル伝達成分のいずれか）の小分子阻害剤、並びにＡＴＦ２、ｃ－Ｊｕｎ、及びＮＦ－κＢの群から選択される転写因子の小分子阻害剤であり得る。

【１１４４】

他の実施形態において、ＴＮＦα ｍＲＮＡ転写、ＴＮＦα ｍＲＮＡ安定化、及びＴＮＦα ｍＲＮＡ翻訳をもたらすシグナル伝達経路に関与する細胞（例えば、対象から取得した細胞、哺乳動物細胞）内の１つ以上の成分（例えば、ＣＤ１４、ｃ－Ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩＫＫ、ＩκＢ、インターロイキン１受容体関連キナーゼ１（ＩＲＡＫ）、ＪＮＫ、リポ多糖結合タンパク質（ＬＢＰ）、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫ３／６、ＭＥＫ４／７、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ＰＫＲ、ｐ３８、ＡＫＴセリン／トレオニンキナーゼ１（ｒａｃ）、ｒａｆキナーゼ（ｒａｆ）、ｒａｓ、ＴＲＡＦ６、ＴＴＰの群から選択される１つ以上の成分）を間接的に阻止し、下方制御し、低下させ、又は低減し得る抗ＴＮＦα剤。例えば、このような間接的な抗ＴＮＦα剤は、ＴＮＦα ｍＲＮＡ転写、ＴＮＦα ｍＲＮＡ安定化、及びＴＮＦα ｍＲＮＡ翻訳をもたらすシグナル伝達経路に関与する哺乳動物細胞内の成分（例えば、ＣＤ１４、ｃ－Ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩＫＫ、ＩκＢ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫ３／６、ＭＥＫ４／７、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ＩＲＡＫ、リポ多糖結合タンパク質（ＬＢＰ）、ＰＫＲ、ｐ３８、ｒａｃ、ｒａｆ、ｒａｓ、ＴＲＡＦ６、ＴＴＰの群から選択される成分）を標的とする（発現を低減する）阻害性核酸であり得る。他の例において、間接的な抗ＴＮＦα剤は、ＴＮＦα ｍＲＮＡ転写、ＴＮＦα ｍＲＮＡ安定化、及びＴＮＦα ｍＲＮＡ翻訳をもたらすシグナル伝達経路に関与する哺乳動物細胞内の成分（例えば、ＣＤ１４、ｃ－Ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩＫＫ、ＩκＢ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、リポ多糖結合タンパク質（ＬＢＰ）、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫ３／６、ＭＥＫ４／７、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ＩＲＡＫ、リポ多糖結合タンパク質（ＬＢＰ）、ＰＫＲ、ｐ３８、ｒａｃ、ｒａｆ、ｒａｓ、ＴＲＡＦ６、ＴＴＰの群から選択される成分）の小分子阻害剤である。

【１１４５】

抗体

ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、抗体又はその抗原結合断片（例えば、Ｆａｂ又はｓｃＦｖ）である。ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗体の抗原結合断片は、ＴＮＦαに特異的に結合し得る。ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗原結合断片は、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、又はＴＮＦＲ２のいずれか１つに特異的に結合する。ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗体の抗原結合断片は、ＴＮＦα受容体（ＴＮＦＲ１又はＴＮＦＲ２）に特異的に結合し得る。

【１１４６】

ある実施形態において、抗体は、ヒト化抗体、キメラ抗体、多価抗体、又はその断片であり得る。ある実施形態において、抗体は、ｓｃＦｖ－Ｆｃ、ＶＨＨドメイン、ＶＮＡＲドメイン、（ｓｃＦｖ）２、ミニボディ（ｍｉｎｉｂｏｄｙ）、又はＢｉＴＥであり得る。

【１１４７】

ある実施形態において、抗体は、クロスマブ（ｃｒｏｓｓｍａｂ）、ダイアボディ（ｄｉａｂｏｄｙ）、ｓｃダイアボディ、ｓｃダイアボディ－ＣＨ３、ダイアボディ－ＣＨ３、ＤｕｔａＭａｂ、ＤＴ－ＩｇＧ、ダイアボディ－Ｆｃ、ｓｃダイアボディ－ＨＡＳ、電荷対（ｃｈａｒｇｅ　ｐａｉｒ）抗体、Ｆａｂ－アーム交換抗体、ＳＥＥＤボディ、トリオマブ（Ｔｒｉｏｍａｂ）、ＬＵＺ－Ｙ、Ｆｃａｂ、ｋλ－ボディ、直交Ｆａｂ、ＤＶＤ－ＩｇＧ、ＩｇＧ（Ｈ）－ｓｃＦｖ、ｓｃＦｖ－（Ｈ）ＩｇＧ、ＩｇＧ（Ｌ）－ｓｃＦｖ、ｓｃＦｖ－（Ｌ）－ＩｇＧ、ＩｇＧ（Ｌ，Ｈ）－Ｆｃ、ＩｇＧ（Ｈ）－Ｖ、Ｖ（Ｈ）－ＩｇＧ、ＩｇＧ（Ｌ）－Ｖ、Ｖ（Ｌ）－ＩｇＧ、ＫＩＨ　ＩｇＧ－ｓｃＦａｂ、２ｓｃＦｖ－ＩｇＧ、ＩｇＧ－２ｓｃＦｖ、ｓｃＦｖ４－Ｉｇ、Ｚｙボディ、ＤＶＩ－ＩｇＧ、ナノボディ、ナノボディ－ＨＳＡ、ＤＶＤ－Ｉｇ、二重親和性標的転換（ｄｕａｌ－ａｆｆｉｎｉｔｙ　ｒｅ－ｔａｒｇｅｔｉｎｇ）抗体（ＤＡＲＴ）、トリオマブ、共通ＬＣを有するｋｉｈ　ＩｇＧ、オルト－Ｆａｂ　ＩｇＧ、２－イン－１－ＩｇＧ（２－ｉｎ－１－ＩｇＧ）、ＩｇＧ－ＳｃＦｖ、ｓｃＦｖ２－Ｆｃ、ビーナノボディ、タンデム抗体、ＤＡＲＴ－Ｆｃ、ｓｃＦｖ－ＨＡＳ－ｓｃＦｖ、ＤＡＦ（ツー－イン－ワン（ｔｗｏ－ｉｎ－ｏｎｅ）又はフォー－イン－ワン（ｆｏｕｒ－ｉｎ－ｏｎｅ））、ＤＮＬ－Ｆａｂ３、ノブ－イン－ホール（ｋｎｏｂｓ－ｉｎ－ｈｏｌｅｓ）共通ＬＣ、ノブ－イン－ホールアセンブリ、ＴａｎｄＡｂ、トリプルボディ（Ｔｒｉｐｌｅ　Ｂｏｄｙ）、ミニ抗体、ミニボディ、ＴｒｉＢｉミニボディ、ｓｃＦｖ－ＣＨ３　ＫＩＨ、Ｆａｂ－ｓｃＦｖ、ｓｃＦｖ－ＣＨ－ＣＬ－ｓｃＦｖ、Ｆ（ａｂ’）２－ｓｃＦＶ２、ｓｃＦｖ－ＫＩＨ、Ｆａｂ－ｓｃＦｖ－Ｆｃ、四価ＨＣＡｂ、ｓｃダイアボディ－Ｆｃ、タンデムｓｃＦｖ－Ｆｃ、細胞内抗体、ドック・ロック（ｄｏｃｋ　ａｎｄ　ｌｏｃｋ）二重特異性抗体、ＩｍｍＴＡＣ、ＨＳＡボディ、タンデムｓｃＦｖ、ＩｇＧ－ＩｇＧ、Ｃｏｖ－Ｘ－Ｂｏｄｙ、及びｓｃＦｖ１－ＰＥＧ－ｓｃＦｖ２であり得る。

【１１４８】

抗体の抗原結合断片の非限定的な例としては、Ｆｖ断片、Ｆａｂ断片、Ｆ（ａｂ’）２断片、及びＦａｂ’断片が挙げられる。抗体の抗原結合断片のさらなる例は、ＩｇＡの抗原結合断片の抗原結合断片（例えば、ＩｇＡ１又はＩｇＡ２の抗原結合断片）（例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＡ、例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＡ１又はＩｇＡ２の抗原結合断片）；ＩｇＤの抗原結合断片（例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＤの抗原結合断片）；ＩｇＥの抗原結合断片（例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＥの抗原結合断片）；ＩｇＧ（例えば、ＩｇＧ１、ＩｇＧ２、ＩｇＧ３、若しくはＩｇＧ４の抗原結合断片）（例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＧ、例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＧ１、ＩｇＧ２、ＩｇＧ３、若しくはＩｇＧ４の抗原結合断片）；又はＩｇＭの抗原結合断片（例えば、ヒト若しくはヒト化ＩｇＭの抗原結合断片）である。

【１１４９】

ＴＮＦαに特異的に結合する抗体である抗ＴＮＦα剤の非限定的な例は、Ｂｅｎ－Ｈｏｒｉｎ　ｅｔ　ａｌ．，Ａｕｔｏｉｍｍｕｎｉｔｙ　Ｒｅｖ．１３（１）：２４－３０，２０１４；Ｂｏｎｇａｒｔｚ　ｅｔ　ａｌ．，ＪＡＭＡ　２９５（１９）：２２７５－２２８５，２００６；Ｂｕｔｌｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，Ｅｕｒ．Ｃｙｔｏｋｉｎｅ　Ｎｅｔｗｏｒｋ　６（４）：２２５－２３０，１９９４；Ｃｏｈｅｎ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃａｎａｄｉａｎ　Ｊ．Ｇａｓｔｒｏｅｎｔｅｒｏｌ．Ｈｅｐａｔｏｌ．１５（６）：３７６－３８４，２００１；Ｅｌｌｉｏｔｔ　ｅｔ　ａｌ．，Ｌａｎｃｅｔ　１９９４；３４４：１１２５－１１２７，１９９４；Ｆｅｌｄｍａｎｎ　ｅｔ　ａｌ．，Ａｎｎ．Ｒｅｖ．Ｉｍｍｕｎｏｌ．１９（１）：１６３－１９６，２００１；Ｒａｎｋｉｎ　ｅｔ　ａｌ．，Ｂｒ．Ｊ．Ｒｈｅｕｍａｔｏｌ．２：３３４－３４２，１９９５；Ｋｎｉｇｈｔ　ｅｔ　ａｌ．，Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　Ｉｍｍｕｎｏｌ．３０（１６）：１４４３－１４５３，１９９３；Ｌｏｒｅｎｚ　ｅｔ　ａｌ．，Ｊ．Ｉｍｍｕｎｏｌ．１５６（４）：１６４６－１６５３，１９９６；Ｈｉｎｓｈａｗ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃｉｒｃｕｌａｔｏｒｙ　Ｓｈｏｃｋ　３０（３）：２７９－２９２，１９９０；Ｏｒｄａｓ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃｌｉｎ．Ｐｈａｒｍａｃｏｌ．Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃｓ　９１（４）：６３５－６４６，２０１２；Ｆｅｌｄｍａｎ，Ｎａｔｕ

ｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｉｍｍｕｎｏｌ．２（５）：３６４－３７１，２００２；Ｔａｙｌｏｒ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｒｈｅｕｍａｔｏｌ．５（１０）：５７８－５８２，２００９；Ｇａｒｃｅｓ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎａｌｓ Ｒｈｅｕｍａｔｉｃ Ｄｉｓ．７２（１２）：１９４７－１９５５，２０１３；Ｐａｌｌａｄｉｎｏ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖ．Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ ２（９）：７３６－７４６，２００３；Ｓａｎｄｂｏｒｎ ｅｔ ａｌ．，Ｉｎｆｌａｍｍａｔｏｒｙ Ｂｏｗｅｌ Ｄｉｓｅａｓｅｓ ５（２）：１１９－１３３，１９９９；Ａｔｚｅｎｉ ｅｔ ａｌ．，Ａｕｔｏｉｍｍｕｎｉｔｙ Ｒｅｖｉｅｗｓ １２（７）：７０３－７０８，２０１３；Ｍａｉｎｉ ｅｔ ａｌ．，Ｉｍｍｕｎｏｌ．Ｒｅｖ．１４４（１）：１９５－２２３，１９９５；Ｗａｎｎｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｓｈｏｃｋ １１（６）：３９１－３９５，１９９９；及び米国特許第６，０９０，３８２号明細書；同第６，２５８，５６２号明細書；及び同第６，５０９，０１５号明細書）に記載されている。

【１１５０】

特定の実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、ゴリムマブ（ゴリムマブ（商標））、アダリムマブ（Ｈｕｍｉｒａ（商標））、インフリキシマブ（Ｒｅｍｉｃａｄｅ（商標））、ＣＤＰ５７１、ＣＤＰ ８７０、又はセルトリズマブペゴル（Ｃｉｍｚｉａ（商標））を含み得るか又はそれである。特定の実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、ＴＮＦα阻害剤バイオシミラーであり得る。承認された及び後期フェーズの（ｌａｔｅ－ｐｈａｓｅ）ＴＮＦα阻害剤バイオシミラーの例としては、限定はされないが、インフリキシマブバイオシミラー、例えば、Ｓａｍｓｕｎｇ Ｂｉｏｅｐｉｓ製のＦｌｉｘａｂｉ（商標）（ＳＢ２）、Ｃｅｌｌｔｒｉｏｎ／Ｐｆｉｚｅｒ製のＩｎｆｌｅｃｔｒａ（登録商標）（ＣＴ－Ｐ１３）、Ａｐｒｏｇｅｎ製のＧＳ０７１、Ｒｅｍｓｉｍａ（商標）、Ｐｆｉｚｅｒ／Ｓａｎｄｏｚ製のＰＦ－０６４３８１７９、Ｎｉｃｈｉ－Ｉｋｏ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｃｏ．製のＮＩ－０７１、及びＡｍｇｅｎ製のＡＢＰ ７１０；アダリムマブバイオシミラー、例えば、Ａｍｇｅｎ製のＡｍｇｅｖｉｔａ（登録商標）（ＡＢＰ ５０１）及びＺｙｄｕｓ Ｃａｄｉｌａ製のＥｘｅｍｐｔｉａ（商標）、Ｂｉｏｃｏｎ／Ｍｙｌａｎ製のＢＭＯ－２又はＭＹＬ－１４０１－Ａ、Ｃｏｈｅｒｕｓ製のＣＨＳ－１４２０、Ｋｙｏｗａ Ｋｉｒｉｎ製のＦＫＢ３２７、及びＢｏｅｈｒｉｎｇｅｒ Ｉｎｇｅｌｈｅｉｍ製のＢＩ ６９５５０１；Ｓｏｌｙｍｂｉｃ（登録商標）、Ｓａｍｓｕｎｇ Ｂｉｏｅｐｉｓ製のＳＢ５、Ｓａｎｄｏｚ製のＧＰ－２０１７、Ｏｎｃｏｂｉｏｌｏｇｉｃｓ製のＯＮＳ－３０１０、Ｍｏｍｅｎｔａ製のＭ９２３、Ｐｆｉｚｅｒ製のＰＦ－０６４１０２９３、並びにエタネルセプトバイオシミラー、例えば、Ｓａｎｄｏｚ／Ｎｏｖａｒｔｉｓ製のＥｒｅｌｚｉ（商標）、Ｓａｍｓｕｎｇ Ｂｉｏｅｐｉｓ製のＢｒｅｎｚｙｓ（商標）（ＳＢ４）、Ｓａｎｄｏｚ製のＧＰ２０１５、Ｍｙｃｅｎａｘ製のＴｕＮＥＸ（登録商標）、ＬＧ Ｌｉｆｅ製のＬＢＥＣ０１０１、及びＣｏｈｅｒｕｓ製のＣＨＳ－０２１４が挙げられる。

【１１５１】

本明細書に記載される方法のいずれかのある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、アダリムマブ、セルトリズマブ、エタネルセプト、ゴリムマブ、インフリキシマブ、ＣＤＰ５７１、及びＣＤＰ ８７０からなる群から選択される。

【１１５２】

ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗原結合断片のいずれかは、例えば、表面プラズモン共鳴（ＳＰＲ）を用いてリン酸緩衝生理食塩水中で測定した際に、1×10^{-5}Ｍ未満（例えば、0.5×10^{-5}Ｍ未満、1×10^{-6}Ｍ未満、0.5×10^{-6}Ｍ未満、1×10^{-7}Ｍ未満、0.5×10^{-7}Ｍ未満、1×10^{-8}Ｍ未満、0.5×10^{-8}Ｍ未満、1×10^{-9}Ｍ未満、0.5×10^{-9}Ｍ未満、1×10^{-10}Ｍ未満、0.5×10^{-10}Ｍ未満、1×10^{-11}Ｍ未満、0.5×10^{-11}Ｍ未満、又は1×10^{-12}Ｍ未満）の解離定数（K_D）を有する。

【１１５３】

ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗原結合断片のいずれかは、例

えば、表面プラズモン共鳴（ＳＰＲ）を用いてリン酸緩衝生理食塩水中で測定した際に、約１×１０$^{-12}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、約０．５×１０$^{-8}$Ｍ、約１×１０$^{-9}$Ｍ、約０．５×１０$^{-9}$Ｍ、約１×１０$^{-10}$Ｍ、約０．５×１０$^{-10}$Ｍ、約１×１０$^{-11}$Ｍ、又は約０．５×１０$^{-11}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-11}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、約０．５×１０$^{-8}$Ｍ、約１×１０$^{-9}$Ｍ、約０．５×１０$^{-9}$Ｍ、約１×１０$^{-10}$Ｍ、約０．５×１０$^{-10}$Ｍ、又は約１×１０$^{-11}$Ｍ（端値を含む）；約１×１０$^{-11}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、約０．５×１０$^{-8}$Ｍ、約１×１０$^{-9}$Ｍ、約０．５×１０$^{-9}$Ｍ、又は約１×１０$^{-10}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-10}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、約０．５×１０$^{-8}$Ｍ、約１×１０$^{-9}$Ｍ、又は約０．５×１０$^{-9}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-9}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、約０．５×１０$^{-8}$Ｍ、又は約１×１０$^{-9}$Ｍ（端値を含む）；約１×１０$^{-9}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、約０．５×１０$^{-7}$Ｍ、約１×１０$^{-8}$Ｍ、又は約０．５×１０$^{-8}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-8}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、約１×１０$^{-7}$Ｍ、又は約０．５×１０$^{-7}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-7}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、約０．５×１０$^{-6}$Ｍ、又は約１×１０$^{-7}$Ｍ（端値を含む）；約１×１０$^{-7}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、約１×１０$^{-6}$Ｍ、又は約０．５×１０$^{-6}$Ｍ（端値を含む）；約０．５×１０$^{-6}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ、約０．５×１０$^{-5}$Ｍ、又は約１×１０$^{-6}$Ｍ（端値を含む）；約１×１０$^{-6}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ又は約０．５×１０$^{-5}$Ｍ（端値を含む）；又は約０．５×１０$^{-5}$Ｍ～約１×１０$^{-5}$Ｍ（端値を含む）のK_Dを有する。

【１１５４】

ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗原結合断片のいずれかは、例えば、表面プラズモン共鳴（ＳＰＲ）を用いてリン酸緩衝生理食塩水中で測定した際に、約１×１０$^{-6}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約１×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$、約１×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約０．５×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約１×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$、又は約１×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約１×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約１×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約０．５×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、又は約１×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約１×１０$^{-4}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；又は約０．５×１０$^{-5}$ｓ$^{-1}$～約１×１０$^{-3}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）のK_{off}を有する。

【１１５５】

ある実施形態において、本明細書に記載される抗体又は抗原結合断片のいずれかは、例えば、表面プラズモン共鳴（ＳＰＲ）を用いてリン酸緩衝生理食塩水中で測定した際に、

約１×１０^{2}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{3}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０^{3}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約０．５×１０^{3}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約１×１０^{3}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約１×１０^{3}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約０．５×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約１×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約１×１０^{4}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約０．５×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；約１×１０^{5}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$、又は約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）；又は約０．５×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$～約１×１０^{6}Ｍ$^{-1}$ｓ$^{-1}$（端値を含む）のＫ$_{on}$を有する。

【１１５６】

融合タンパク質

ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、融合タンパク質（例えば、パートナーペプチドに縮合されたＴＮＦＲの細胞外ドメイン、例えば、免疫グロブリン、例えば、ヒトＩｇＧのＦｃ領域）（例えば、Ｄｅｅｇ ｅｔ ａｌ．，Ｌｅｕｋｅｍｉａ１６（２）：１６２，２００２；Ｐｅｐｐｅｌ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｅｘｐ．Ｍｅｄ．１７４（６）：１４８３－１４８９，１９９１を参照）又はＴＮＦαに特異的に結合する可溶性ＴＮＦＲ（例えば、ＴＮＦＲ１若しくはＴＮＦＲ２）である。ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、可溶性ＴＮＦα受容体を含むか又は可溶性ＴＮＦα受容体である（例えば、Ｂｊｏｒｎｂｅｒｇ ｅｔ ａｌ．，Ｌｙｍｐｈｏｋｉｎｅ Ｃｙｔｏｋｉｎｅ Ｒｅｓ．１３（３）：２０３－２１１，１９９４；Ｋｏｚａｋ ｅｔ ａｌ．，Ａｍ．Ｊ．Ｐｈｙｓｉｏｌ．Ｒｅｇ．Ｉｎｔｅｇｒａｔｉｖｅ Ｃｏｍｐａｒａｔｉｖｅ Ｐｈｙｓｉｏｌ．２６９（１）：Ｒ２３－Ｒ２９，１９９５；Ｔｓａｏ ｅｔ ａｌ．，Ｅｕｒ Ｒｅｓｐｉｒ Ｊ．１４（３）：４９０－４９５，１９９９；Ｗａｔｔ ｅｔ ａｌ．，Ｊ Ｌｅｕｋｏｃ Ｂｉｏｌ．６６（６）：１００５－１０１３，１９９９；Ｍｏｈｌｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｉｍｍｕｎｏｌ．１５１（３）：１５４８－１５６１，１９９３；Ｎｏｐｈａｒ ｅｔ ａｌ．，ＥＭＢＯ Ｊ．９（１０）：３２６９，１９９０；Ｐｉｇｕｅｔ ｅｔ ａｌ．，Ｅｕｒ．Ｒｅｓｐｉｒａｔｏｒｙ Ｊ．７（３）：５１５－５１８，１９９４；及びＧｒａｙ ｅｔ ａｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．Ｕ．Ｓ．Ａ．８７（１９）：７３８０－７３８４，１９９０）。ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は、エタネルセプトを含むか又はエタネルセプトである（Ｅｎｂｒｅｌ（商標））（例えば、参照により本明細書に援用される国際公開第９１／０３５５３号パンフレット及び国際公開第０９／４０６，４７６号パンフレットを参照）。ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤阻害剤は、ｒ－ＴＢＰ－Ｉを含むか又はｒ－ＴＢＰ－Ｉである（例えば、Ｇｒａｄｓｔｅｉｎ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ａｃｑｕｉｒ．Ｉｍｍｕｎｅ Ｄｅｆｉｃ．Ｓｙｎｄｒ．２６（２）：１１１－１１７，２００１）。

【１１５７】

阻害性核酸

哺乳動物細胞内のＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡ発現の発現を低減し得る阻害性核酸

は、アンチセンス核酸分子、すなわち、ヌクレオチド配列が、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ　３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ　ｍＲＮＡの全て又は一部に相補的である（例えば、配列番号１～３７のいずれか１つの全て又は一部に相補的である）核酸分子を含む。

【１１５８】

ヒトＴＮＦα　ＣＤＳ（配列番号１）

【化２６４】

ATGAGCACTGAAAGCATGATCCGGGACGTGGAGCTGGCCGAGGAGGCGCTCCCCAA
GAAGACAGGGGGGCCCCAGGGCTCCAGGCGGTGCTTGTTCCTCAGCCTCTTCTCCTT
CCTGATCGTGGCAGGCGCCACCACGCTCTTCTGCCTGCTGCACTTTGGAGTGATCGG
CCCCCAGAGGGAAGAGTTCCCCAGGGACCTCTCTCTAATCAGCCCTCTGGCCCAGGC
AGTCAGATCATCTTCTCGAACCCCGAGTGACAAGCCTGTAGCCCATGTTGTAGCAAA
CCCTCAAGCTGAGGGGCAGCTCCAGTGGCTGAACCGCCGGGCCAATGCCCTCCTGG
CCAATGGCGTGGAGCTGAGAGATAACCAGCTGGTGGTGCCATCAGAGGGCCTGTAC
CTCATCTACTCCCAGGTCCTCTTCAAGGGCCAAGGCTGCCCCTCCACCCATGTGCTC
CTCACCCACACCATCAGCCGCATCGCCGTCTCCTACCAGACCAAGGTCAACCTCCTC
TCTGCCATCAAGAGCCCCTGCCAGAGGGAGACCCCAGAGGGGGCTGAGGCCAAGCC
CTGGTATGAGCCCATCTATCTGGGAGGGGTCTTCCAGCTGGAGAAGGGTGACCGACT
CAGCGCTGAGATCAATCGGCCCGACTATCTCGACTTTGCCGAGTCTGGGCAGGTCTA
CTTTGGGATCATTGCCCTGTGA

【１１５９】

ヒトＴＮＦＲ１　ＣＤＳ（配列番号２）

【化２６５】

ATGGGCCTCTCCACCGTGCCTGACCTGCTGCTGCCACTGGTGCTCCTGGAGCTGTTG
GTGGGAATATACCCCTCAGGGGTTATTGGACTGGTCCCTCACCTAGGGGACAGGGA
GAAGAGAGATAGTGTGTGTCCCCAAGGAAAATATATCCACCCTCAAAATAATTCGA
TTTGCTGTACCAAGTGCCACAAAGGAACCTACTTGTACAATGACTGTCCAGGCCCGG
GGCAGGATACGGACTGCAGGGAGTGTGAGAGCGGCTCCTTCACCGCTTCAGAAAAC
CACCTCAGACACTGCCTCAGCTGCTCCAAATGCCGAAAGGAAATGGGTCAGGTGGA
GATCTCTTCTTGCACAGTGGACCGGGACACCGTGTGTGGCTGCAGGAAGAACCAGT
ACCGGCATTATTGGAGTGAAAACCTTTTCCAGTGCTTCAATTGCAGCCTCTGCCTCA
ATGGGACCGTGCACCTCTCCTGCCAGGAGAAACAGAACACCGTGTGCACCTGCCAT
GCAGGTTTCTTTCTAAGAGAAAACGAGTGTGTCTCCTGTAGTAACTGTAAGAAAAGC
CTGGAGTGCACGAAGTTGTGCCTACCCCAGATTGAGAATGTTAAGGGCACTGAGGA
CTCAGGCACCACAGTGCTGTTGCCCCTGGTCATTTTCTTTGGTCTTTGCCTTTTATCCC
TCCTCTTCATTGGTTTAATGTATCGCTACCAACGGTGGAAGTCCAAGCTCTACTCCAT
TGTTTGTGGGAAATCGACACCTGAAAAAGAGGGGGAGCTTGAAGGAACTACTACTA
AGCCCCTGGCCCCAAACCCAAGCTTCAGTCCCACTCCAGGCTTCACCCCCACCCTGG
GCTTCAGTCCCGTGCCCAGTTCCACCTTCACCTCCAGCTCCACCTATACCCCCGGTGA
CTGTCCCAACTTTGCGGCTCCCCGCAGAGAGGTGGCACCACCCTATCAGGGGGCTGA
CCCCATCCTTGCGACAGCCCTCGCCTCCGACCCCATCCCCAACCCCCTTCAGAAGTG
GGAGGACAGCGCCCACAAGCCACAGAGCCTAGACACTGATGACCCCGCGACGCTGT
ACGCCGTGGTGGAGAACGTGCCCCCGTTGCGCTGGAAGGAATTCGTGCGGCGCCTA
GGGCTGAGCGACCACGAGATCGATCGGCTGGAGCTGCAGAACGGGCGCTGCCTGCG
CGAGGCGCAATACAGCATGCTGGCGACCTGGAGGCGGCGCACGCCGCGGCGCGAG
GCCACGCTGGAGCTGCTGGGACGCGTGCTCCGCGACATGGACCTGCTGGGCTGCCT
GGAGGACATCGAGGAGGCGCTTTGCGGCCCCGCCGCCCTCCCGCCCGCGCCCAGTC
TTCTCAGATGA

【１１６０】

ヒトＴＮＦＲ２　ＣＤＳ（配列番号３）

【化２６６】

ATTCTTCCCCTGGTGGCCATGGGACCCAGGTCAATGTCACCTGCATCGTGAACGTCT
GTAGCAGCTCTGACCACAGCTCACAGTGCTCCTCCCAAGCCAGCTCCACAATGGGA
GACACAGATTCCAGCCCCTCGGAGTCCCCGAAGGACGAGCAGGTCCCCTTCTCCAA
GGAGGAATGTGCCTTTCGGTCACAGCTGGAGACGCCAGAGACCCTGCTGGGGAGCA
CCGAAGAGAAGCCCCTGCCCCTTGGAGTGCCTGATGCTGGGATGAAGCCCAGTTAA

【１１６１】

ヒトＴＲＡＤＤ　ＣＤＳ（配列番号４）

【化２６７】

ATGGCAGCTGGGCAAAATGGGCACGAAGAGTGGGTGGGCAGCGCATACCTGTTTGT
GGAGTCCTCGCTGGACAAGGTGGTCCTGTCGGATGCCTACGCGCACCCCCAGCAGA
AGGTGGCAGTGTACAGGGCTCTGCAGGCTGCCTTGGCAGAGAGCGGCGGGAGCCCG
GACGTGCTGCAGATGCTGAAGATCCACCGCAGCGACCCGCAGCTGATCGTGCAGCT
GCGATTCTGCGGGCGGCAGCCCTGTGGCCGCTTCCTCCGCGCCTACCGCGAGGGGGC
GCTGCGCGCCGCGCTGCAGAGGAGCCTGGCGGCCGCGCTCGCCCAGCACTCGGTGC
CGCTGCAACTGGAGCTGCGCGCCGGCGCCGAGCGGCTGGACGCTTTGCTGGCGGAC
GAGGAGCGCTGTTTGAGTTGCATCCTAGCCCAGCAGCCCGACCGGCTCCGGGATGA
AGAACTGGCTGAGCTGGAGGATGCGCTGCGAAATCTGAAGTGCGGCTCGGGGGCCC
GGGGTGGCGACGGGGAGGTCGCTTCGGCCCCCTTGCAGCCCCCGGTGCCCTCTCTGT
CGGAGGTGAAGCCGCCGCCGCCGCCGCCACCTGCCCAGACTTTTCTGTTCCAGGGTC
AGCCTGTAGTGAATCGGCCGCTGAGCCTGAAGGACCAACAGACGTTCGCGCGCTCT
GTGGGTCTCAAATGGCGCAAGGTGGGGCGCTCACTGCAGCGAGGCTGCCGGGCGCT
GCGGGACCCGGCGCTGGACTCGCTGGCCTACGAGTACGAGCGCGAGGGACTGTACG
AGCAGGCCTTCCAGCTGCTGCGGCGCTTCGTGCAGGCCGAGGGCCGCCGCGCCACG
CTGCAGCGCCTGGTGGAGGCACTCGAGGAGAACGAGCTCACCAGCCTGGCAGAGGA
CTTGCTGGGCCTGACCGATCCCAATGGCGGCCTGGCCTAG

【１１６２】

ヒトＴＲＡＦ２　ＣＤＳ（配列番号５）

【化２６８】

ATGGCTGCAGCTAGCGTGACCCCCCCTGGCTCCCTGGAGTTGCTACAGCCCGGCTTC
TCCAAGACCCTCCTGGGGACCAAGCTGGAAGCCAAGTACCTGTGCTCCGCCTGCAG
AAACGTCCTCCGCAGGCCCTTCCAGGCGCAGTGTGGCCACCGGTACTGCTCCTTCTG
CCTGGCCAGCATCCTCAGCTCTGGGCCTCAGAACTGTGCTGCCTGTGTTCACGAGGG
CATATATGAAGAAGGCATTTCTATTTTAGAAAGCAGTTCGGCCTTCCCAGATAATGC
TGCCCGCAGGGAGGTGGAGAGCCTGCCGGCCGTCTGTCCCAGTGATGGATGCACCT
GGAAGGGGACCCTGAAAGAATACGAGAGCTGCCACGAAGGCCGCTGCCCGCTCATG
CTGACCGAATGTCCCGCGTGCAAAGGCCTGGTCCGCCTTGGTGAAAAGGAGCGCCA
CCTGGAGCACGAGTGCCCGGAGAGAAGCCTGAGCTGCCGGCATTGCCGGGCACCCT
GCTGCGGAGCAGACGTGAAGGCGCACCACGAGGTCTGCCCCAAGTTCCCCTTAACT
TGTGACGGCTGCGGCAAGAAGAAGATCCCCCGGGAGAAGTTTCAGGACCACGTCAA
GACTTGTGGCAAGTGTCGAGTCCCTTGCAGATTCCACGCCATCGGCTGCCTCGAGAC
GGTAGAGGGTGAGAAACAGCAGGAGCACGAGGTGCAGTGGCTGCGGGAGCACCTG
GCCATGCTACTGAGCTCGGTGCTGGAGGCAAAGCCCCTCTTGGGAGACCAGAGCCA
CGCGGGGTCAGAGCTCCTGCAGAGGTGCGAGAGCCTGGAGAAGAAGACGGCCACTT
TTGAGAACATTGTCTGCGTCCTGAACCGGGAGGTGGAGAGGGTGGCCATGACTGCC
GAGGCCTGCAGCCGGCAGCACCGGCTGGACCAAGACAAGATTGAAGCCCTGAGTAG
CAAGGTGCAGCAGCTGGAGAGGAGCATTGGCCTCAAGGACCTGGCGATGGCTGACT
TGGAGCAGAAGGTCTTGGAGATGGAGGCATCCACCTACGATGGGGTCTTCATCTGG
AAGATCTCAGACTTCGCCAGGAAGCGCCAGGAAGCTGTGGCTGGCCGCATACCCGC
CATCTTCTCCCCAGCCTTCTACACCAGCAGGTACGGCTACAAGATGTGTCTGCGTAT
CTACCTGAACGGCGACGGCACCGGGCGAGGAACACACCTGTCCCTCTTCTTTGTGGT
GATGAAGGGCCCGAATGACGCCCTGCTGCGGTGGCCCTTCAACCAGAAGGTGACCT
TAATGCTGCTCGACCAGAATAACCGGGAGCACGTGATTGACGCCTTCAGGCCCGAC
GTGACTTCATCCTCTTTTCAGAGGCCAGTCAACGACATGAACATCGCAAGCGGCTGC
CCCCTCTTCTGCCCCGTCTCCAAGATGGAGGCAAAGAATTCCTACGTGCGGGACGAT
GCCATCTTCATCAAGGCCATTGTGGACCTGACAGGGCTCTAA

【１１６３】

ヒトＡＰ－１　ＣＤＳ（配列番号６）

【化２６９】

ATGGAAACACCCTTCTACGGCGATGAGGCGCTGAGCGGCCTGGGCGGCGGCGCCAG
TGGCAGCGGCGGCAGCTTCGCGTCCCCGGGCCGCTTGTTCCCCGGGGCGCCCCCGAC
GGCCGCGGCCGGCAGCATGATGAAGAAGGACGCGCTGACGCTGAGCCTGAGTGAGC
AGGTGGCGGCAGCGCTCAAGCCTGCGGCCGCGCCGCCTCCTACCCCCCTGCGCGCC
GACGGCGCCCCCAGCGCGGCACCCCCCGACGGCCTGCTCGCCTCTCCCGACCTGGG
GCTGCTGAAGCTGGCCTCCCCCGAGCTCGAGCGCCTCATCATCCAGTCCAACGGGCT
GGTCACCACCACGCCGACGAGCTCACAGTTCCTCTACCCCAAGGTGGCGGCCAGCG
AGGAGCAGGAGTTCGCCGAGGGCTTCGTCAAGGCCCTGGAGGATTTACACAAGCAG
AACCAGCTCGGCGCGGGCGCGGCCGCTGCCGCCGCCGCCGCCGCCGCCGGGGGGCC
CTCGGGCACGGCCACGGGCTCCGCGCCCCCCGGCGAGCTGGCCCCGGCGGCGGCCG
CGCCCGAAGCGCCTGTCTACGCGAACCTGAGCAGCTACGCGGGCGGCGCCGGGGGC
GCGGGGGGCGCCGCGACGGTCGCCTTCGCTGCCGAACCTGTGCCCTTCCCGCCGCCG
CCACCCCCAGGCGCGTTGGGGCCGCCGCGCCTGGCTGCGCTCAAGGACGAGCCACA
GACGGTGCCCGACGTGCCGAGCTTCGGCGAGAGCCCGCCGTTGTCGC
CCATCGACATGGACACGCAGGAGCGCATCAAGGCGGAGCGCAAGCGGCTGCGCAA
CCGCATCGCCGCCTCCAAGTGCCGCAAGCGCAAGCTGGAGCGCATCTCGCGCCTGG
AAGAGAAAGTGAAGACCCTCAAGAGTCAGAACACGGAGCTGGCGTCCACGGCGAG
CCTGCTGCGCGAGCAGGTGGCGCAGCTCAAGCAGAAAGTCCTCAGCCACGTCAACA
GCGGCTGCCAGCTGCTGCCCCAGCACCAGGTGCCCGCGTACTGA

【１１６４】

ヒトＡＳＫ１　ＣＤＳ（配列番号７）

【化２７０】

ATGAGCACGGAGGCGGACGAGGGCATCACTTTCTCTGTGCCACCCTTCGCCCCCTCG
GGCTTCTGCACCATCCCCGAGGGCGGCATCTGCAGGAGGGGAGGAGCGGCGGCGGT
GGGCGAGGGCGAGGAGCACCAGCTGCCACCGCCGCCGCCGGGCAGTTTCTGGAACG
TGGAGAGCGCCGCTGCCCCTGGCATCGGTTGTCCGGCGGCCACCTCCTCGAGCAGTG
CCACCCGAGGCCGGGGCAGCTCTGTTGGCGGGGGCAGCCGACGGACCACGGTGGCA
TATGTGATCAACGAAGCGAGCCAAGGGCAACTGGTGGTGGCCGAGAGCGAGGCCCT
GCAGAGCTTGCGGGAGGCGTGCGAGACAGTGGGCGCCACCCTGGAACCCTGCATTT
TGGGAAACTCGACTTTGGAGAAACCACCGTGCTGGACCGCTTTTACAATGCAGATAT
TGCGGTGGTGGAGATGAGCGATGCCTTCCGGCAGCCGTCCTTGTTTTACCACCTTGG
GGTGAGAGAAAGTTTCAGCATGGCCAACAACATCATCCTCTACTGCGATACTAACTC
GGACTCTCTGCAGTCACTGAAGGAAATCATTTGCCAGAAGAATACTATGTGCACTGG
GAACTACACCTTTGTTCCTTACATGATAACTCCACATAACAAAGTCTACTGCTGTGA
CAGCAGCTTCATGAAGGGGTTGACAGAGCTCATGCAACCGAACTTCGAGCTGCTTCT
TGGACCCATCTGCTTACCTCTTGTGGATCGTTTTATTCAACTTTTGAAGGTGGCACAA
GCAAGTTCTAGCCAGTACTTCCGGGAATCTATACTCAATGACATCAGGAAAGCTCGT
AATTTATACACTGGTAAAGAATTGGCAGCTGAGTTGGCAAGAATTCGGCAGCGAGT
AGATAATATCGAAGTCTTGACAGCAGATATTGTCATAAATCTGTTACTTTCCTACAG
AGATATCCAGGACTATGATTCTATTGTGAAGCTGGTAGAGACTTTAGAAAAACTGCC
AACCTTTGATTTGGCCTCCCATCACCATGTGAAGTTTCATTATGCATTTGCACTGAAT
AGGAGAAATCTCCCTGGTGACAGAGCAAAAGCTCTTGATATTATGATTCCCATGGTG
CAAAGCGAAGGACAAGTTGCTTCAGATATGTATTGCCTAGTTGGTCGAATCTACAAA
GATATGTTTTTGGACTCTAATTTCACGGACACTGAAAGCAGAGACCATGGAGCTTCT
TGGTTCAAAAAGGCATTTGAATCTGAGCCAACACTACAGTCAGGAATTAATTATGCG
GTCCTCCTCCTGGCAGCTGGACACCAGTTTGAATCTTCCTTTGAGCTCCGGAAAGTT
GGGGTGAAGCTAAGTAGTCTTCTTGGTAAAAAGGGAAACTTGGAAAAACTCCAGAG
CTACTGGGAAGTTGGATTTTTTCTGGGGGCCAGCGTCCTAGCCAATGACCACATGAG
AGTCATTCAAGCATCTGAAAAGCTTTTTAAACTGAAGACACCAGCATGGTACCTCAA
GTCTATTGTAGAGACAATTTTGATATATAAGCATTTTGTGAAACTGACCACAGAACA
GCCTGTGGCCAAGCAAGAACTTGTGGACTTTTGGATGGATTTCCTGGTCGAGGCCAC
AAAGACAGATGTTACTGTGGTTAGGTTTCCAGTATTAATATTAGAACCAACCAAAAT
CTATCAACCTTCTTATTTGTCTATCAACAATGAAGTTGAGGAAAAGACAATCTCTAT
TTGGCACGTGCTTCCTGATGACAAGAAAGGTATACATGAGTGGAATTTTAGTGCCTC
TTCTGTCAGGGGAGTGAGTATTTCTAAATTTGAAGAAAGATGCTGCTTTCTTTATGTG
CTTCACAATTCTGATGATTTCCAAATCTATTTCTGTACAGAACTTCATTGTAAAAAGT
TTTTTGAGATGGTGAACACCATTACCGAAGAGAAGGGGAGAAGCACAGAGGAAGG
AGACTGTGAAAGTGACTTGCTGGAGTATGACTATGAATATGATGAAAATGGTGACA
GAGTCGTTTTAGGAAAAGGCACTTATGGGATAGTCTACGCAGGTCGGGACTTGAGC

【化２７１】

AACCAAGTCAGAATTGCTATTAAGGAAATCCCAGAGAGAGACAGCAGATACTCTCA
GCCCCTGCATGAAGAAATAGCATTGCATAAACACCTGAAGCACAAAAATATTGTCC
AGTATCTGGGCTCTTTCAGTGAGAATGGTTTCATTAAAATCTTCATGGAGCAGGTCC
CTGGAGGAAGTCTTTCTGCTCTCCTTCGTTCCAAATGGGGTCCATTAAAAGACAATG
AGCAAACAATTGGCTTTTATACAAAGCAAATACTGGAAGGATTAAAATATCTCCATG
ACAATCAGATAGTTCACCGGGACATAAAGGGTGACAATGTGTTGATTAATACCTAC
AGTGGTGTTCTCAAGATCTCTGACTTCGGAACATCAAAGAGGCTTGCTGGCATAAAC
CCCTGTACTGAAACTTTTACTGGTACCCTCCAGTATATGGCACCAGAAATAATAGAT
AAAGGACCAAGAGGCTACGGAAAAGCAGCAGACATCTGGTCTCTGGGCTGTACAAT
CATTGAAATGGCCACAGGAAAACCCCCATTTTATGAACTGGGAGAACCACAAGCAG
CTATGTTCAAGGTGGGAATGTTTAAAGTCCACCCTGAGATCCCAGAGTCCATGTCTG
CAGAGGCCAAGGCATTCATACTGAAATGTTTTGAACCAGATCCTGACAAGAGAGCC
TGTGCTAACGACTTGCTTGTTGATGAGTTTTTAAAAGTTTCAAGCAAAAAGAAAAAG
ACACAACCTAAGCTTTCAGCTCTTTCAGCTGGATCAAATGAATATCTCAGGAGTATA
TCCTTGCCGGTACCTGTGCTGGTGGAGGACACCAGCAGCAGCAGTGAGTACGGCTC
AGTTTCACCCGACACGGAGTTGAAAGTGGACCCCTTCTCTTTCAAAACAAGAGCCAA
GTCCTGCGGAGAAAGAGATGTCAAGGGAATTCGGACACTCTTTTTGGGCATTCCAGA
TGAGAATTTTGAAGATCACAGTGCTCCTCCTTCCCCTGAAGAAAAAGATTCTGGATT
CTTCATGCTGAGGAAGGACAGTGAGAGGCGAGCTACCCTTCACAGGATCCTGACGG
AAGACCAAGACAAAATTGTGAGAAACCTAATGGAATCTTTAGCTCAGGGGGCTGAA
GAACCGAAACTAAAATGGGAACACATCACAACCCTCATTGCAAGCCTCAGAGAATT
TGTGAGATCCACTGACCGAAAAATCATAGCCACCACACTGTCAAAGCTGAAACTGG
AGCTGGACTTCGACAGCCATGGCATTAGCCAAGTCCAGGTGGTACTCTTTGGTTTTC
AAGATGCTGTCAATAAAGTTCTTCGGAATCATAACATCAAGCCGCACTGGATGTTTG
CCTTAGACAGTATCATTCGGAAGGCGGTACAGACAGCCATTACCATCCTGGTTCCAG
AACTAAGGCCACATTTCAGCCTTGCATCTGAGAGTGATACTGCTGATCAAGAAGACT
TGGATGTAGAAGATGACCATGAGGAACAGCCTTCAAATCAAACTGTCCGAAGACCT
CAGGCTGTCATTGAAGATGCTGTGGCTACCTCAGGCGTGAGCACGCTCAGTTCTACT
GTGTCTCATGATTCCCAGAGTGCTCACCGGTCACTGAATGTACAGCTTGGAAGGATG
AAAATAGAAACCAATAGATTACTGGAAGAATTGGTTCGGAAAGAGAAAGAATTACA
AGCACTCCTTCATCGAGCTATTGAAGAAAAAGACCAAGAAATTAAACACCTGAAGC
TTAAGTCCCAACCCATAGAAATTCCTGAATTGCCTGTATTTCATCTAAATTCTTCTGG
CACAAATACTGAAGATTCTGAACTTACCGACTGGCTGAGAGTGAATGGAGCTGATG
AAGACACTATAAGCCGGTTTTTGGCTGAAGATTATACACTATTGGATGTTCTCTACT
ATGTTACACGTGATGACTTAAAATGCTTGAGACTAAGGGGAGGGATGCTGTGCACA
CTGTGGAAGG CTATCATTGACTTTCGAAACAAACAGACTTGA

【１１６５】

ヒトＣＤ１４　ＣＤＳ（配列番号８）

【化２７２】

ATGGAGCGCGCGTCCTGCTTGTTGCTGCTGCTGCTGCCGCTGGTGCACGTCTCTGCG
ACCACGCCAGAACCTTGTGAGCTGGACGATGAAGATTTCCGCTGCGTCTGCAACTTC
TCCGAACCTCAGCCCGACTGGTCCGAAGCCTTCCAGTGTGTGTCTGCAGTAGAGGTG
GAGATCCATGCCGGCGGTCTCAACCTAGAGCCGTTTCTAAAGCGCGTCGATGCGGA
CGCCGACCCGCGGCAGTATGCTGACACGGTCAAGGCTCTCCGCGTGCGGCGGCTCA
CAGTGGGAGCCGCACAGGTTCCTGCTCAGCTACTGGTAGGCGCCCTGCGTGTGCTAG
CGTACTCCCGCCTCAAGGAACTGACGCTCGAGGACCTAAAGATAACCGGCACCATG
CCTCCGCTGCCTCTGGAAGCCACAGGACTTGCACTTTCCAGCTTGCGCCTACGCAAC
GTGTCGTGGGCGACAGGGCGTTCTTGGCTCGCCGAGCTGCAGCAGTGGCTCAAGCC
AGGCCTCAAGGTACTGAGCATTGCCCAAGCACACTCGCCTGCCTTTTCCTGCGAACA
GGTTCGCGCCTTCCCGGCCCTTACCAGCCTAGACCTGTCTGACAATCCTGGACTGGG
CGAACGCGGACTGATGGCGGCTCTCTGTCCCCACAAGTTCCCGGCCATCCAGAATCT
AGCGCTGCGCAACACAGGAATGGAGACGCCCACAGGCGTGTGCGCCGCACTGGCGG
CGGCAGGTGTGCAGCCCCACAGCCTAGACCTCAGCCACAACTCGCTGCGCGCCACC
GTAAACCCTAGCGCTCCGAGATGCATGTGGTCCAGCGCCCTGAACTCCCTCAATCTG
TCGTTCGCTGGGCTGGAACAGGTGCCTAAAGGACTGCCAGCCAAGCTCAGAGTGCT
CGATCTCAGCTGCAACAGACTGAACAGGGCGCCGCAGCCTGACGAGCTGCCCGAGG
TGGATAACCTGACACTGGACGGGAATCCCTTCCTGGTCCCTGGAACTGCCCTCCCCC
ACGAGGGCTCAATGAACTCCGGCGTGGTCCCAGCCTGTGCACGTTCGACCCTGTCGG
TGGGGGTGTCGGGAACCCTGGTGCTGCTCCAAGGGGCCCGGGGCTTTGCCTAA

【１１６６】

ヒトＥＲＫ１　ＣＤＳ（配列番号９）

【化２７３】

ATGGCGGCGGCGGCGGCTCAGGGGGGCGGGGGCGGGGAGCCCCGTAGAACCGAGG
GGGTCGGCCCGGGGGTCCCGGGGGAGGTGGAGATGGTGAAGGGGCAGCCGTTCGAC
GTGGGCCCGCGCTACACGCAGTTGCAGTACATCGGCGAGGGCGCGTACGGCATGGT
CAGCTCGGCCTATGACCACGTGCGCAAGACTCGCGTGGCCATCAAGAAGATCAGCC
CCTTCGAACATCAGACCTACTGCCAGCGCACGCTCCGGGAGATCCAGATCCTGCTGC
GCTTCCGCCATGAGAATGTCATCGGCATCCGAGACATTCTGCGGGCGTCCACCCTGG
AAGCCATGAGAGATGTCTACATTGTGCAGGACCTGATGGAGACTGACCTGTACAAG
TTGCTGAAAAGCCAGCAGCTGAGCAATGACCATATCTGCTACTTCCTCTACCAGATC
CTGCGGGGCCTCAAGTACATCCACTCCGCCAACGTGCTCCACCGAGATCTAAAGCCC
TCCAACCTGCTCATCAACACCACCTGCGACCTTAAGATTTGTGATTTCGGCCTGGCC
CGGATTGCCGATCCTGAGCATGACCACACCGGCTTCCTGACGGAGTATGTGGCTACG
CGCTGGTACCGGGCCCCAGAGATCATGCTGAACTCCAAGGGCTATACCAAGTCCAT
CGACATCTGGTCTGTGGGCTGCATTCTGGCTGAGATGCTCTCTAACCGGCCCATCTTC
CCTGGCAAGCACTACCTGGATCAGCTCAACCACATTCTGGGCATCCTGGGCTCCCCA
TCCCAGGAGGACCTGAATTGTATCATCAACATGAAGGCCCGAAACTACCTACAGTCT
CTGCCCTCCAAGACCAAGGTGGCTTGGGCCAAGCTTTTCCCCAAGTCAGACTCCAAA
GCCCTTGACCTGCTGGACCGGATGTTAACCTTTAACCCCAATAAACGGATCACAGTG
GAGGAAGCGCTGGCTCACCCCTACCTGGAGCAGTACTATGACCCGACGGATGAGCC
AGTGGCCGAGGAGCCCTTCACCTTCGCCATGGAGCTGGATGACCTACCTAAGGAGC
GGCTGAAGGAGCTCATCTTCCAGGAGACAGCACGCTTCCAGCCCGGAGTGCTGGAG
GCCCCCTAG

【１１６７】

ヒトＥＲＫ２　ＣＤＳ（配列番号１０）

【化２７４】

ATGGCGGCGGCGGCGGCGGCGGGCGCGGGCCCGGAGATGGTCCGCGGGCAGGTGTT
CGACGTGGGGCCGCGCTACACCAACCTCTCGTACATCGGCGAGGGCGCCTACGGCA
TGGTGTGCTCTGCTTATGATAATGTCAACAAAGTTCGAGTAGCTATCAAGAAAATCA
GCCCCTTTGAGCACCAGACCTACTGCCAGAGAACCCTGAGGGAGATAAAAATCTTA
CTGCGCTTCAGACATGAGAACATCATTGGAATCAATGACATTATTCGAGCACCAACC
ATCGAGCAAATGAAAGATGTATATATAGTACAGGACCTCATGGAAACAGATCTTTA
CAAGCTCTTGAAGACACAACACCTCAGCAATGACCATATCTGCTATTTTCTCTACCA
GATCCTCAGAGGGTTAAAATATATCCATTCAGCTAACGTTCTGCACCGTGACCTCAA
GCCTTCCAACCTGCTGCTCAACACCACCTGTGATCTCAAGATCTGTGACTTTGGCCT
GGCCCGTGTTGCAGATCCAGACCATGATCACACAGGGTTCCTGACAGAATATGTGGC
CACACGTTGGTACAGGGCTCCAGAAATTATGTTGAATTCCAAGGGCTACACCAAGTC
CATTGATATTTGGTCTGTAGGCTGCATTCTGGCAGAAATGCTTTCTAACAGGCCCAT
CTTTCCAGGGAAGCATTATCTTGACCAGCTGAACCACATTTTGGGTATTCTTGGATCC
CCATCACAAGAAGACCTGAATTGTATAATAAATTTAAAAGCTAGGAACTATTTGCTT
TCTCTTCCACACAAAAATAAGGTGCCATGGAACAGGCTGTTCCCAAATGCTGACTCC
AAAGCTCTGGACTTATTGGACAAAATGTTGACATTCAACCCACACAAGAGGATTGA
AGTAGAACAGGCTCTGGCCCACCCATATCTGGAGCAGTATTACGACCCGAGTGACG
AGCCCATCGCCGAAGCACCATTCAAGTTCGACATGGAATTGGATGACTTGCCTAAGG
AAAAGCTCAAAGAACTAATTTTTGAAGAGACTGCTAGATTCCAGCCAGGATACAGA
TCTTAA

【１１６８】

ヒトＩＫＫ　ＣＤＳ（配列番号１１）

【化２７５】

ATGTTTTCAGGGGGGTGTCATAGCCCCGGGTTTGGCCGCCCCAGCCCCGCCTTCCCC
GCCCCGGGGAGCCCGCCCCCTGCCCCGCGTCCCTGCCGACAGGAAACAGGTGAGCA
GATTGCCATCAAGCAGTGCCGGCAGGAGCTCAGCCCCCGGAACCGAGAGCGGTGGT
GCCTGGAGATCCAGATCATGAGAAGGCTGACCCACCCCAATGTGGTGGCTGCCCGA
GATGTCCCTGAGGGGATGCAGAACTTGGCGCCCAATGACCTGCCCCTGCTGGCCATG
GAGTACTGCCAAGGAGGAGATCTCCGGAAGTACCTGAACCAGTTTGAGAACTGCTG
TGGTCTGCGGGAAGGTGCCATCCTCACCTTGCTGAGTGACATTGCCTCTGCGCTTAG
ATACCTTCATGAAAACAGAATCATCCATCGGGATCTAAAGCCAGAAAACATCGTCCT
GCAGCAAGGAGAACAGAGGTTAATACACAAAATTATTGACCTAGGATATGCCAAGG
AGCTGGATCAGGGCAGTCTTTGCACATCATTCGTGGGGACCCTGCAGTACCTGGCCC
CAGAGCTACTGGAGCAGCAGAAGTACACAGTGACCGTCGACTACTGGAGCTTCGGC
ACCCTGGCCTTTGAGTGCATCACGGGCTTCCGGCCCTTCCTCCCCAACTGGCAGCCC
GTGCAGTGGCATTCAAAAGTGCGGCAGAAGAGTGAGGTGGACATTGTTGTTAGCGA
AGACTTGAATGGAACGGTGAAGTTTTCAAGCTCTTTACCCTACCCCAATAATCTTAA
CAGTGTCCTGGCTGAGCGACTGGAGAAGTGGCTGCAACTGATGCTGATGTGGCACC
CCCGACAGAGGGGCACGGATCCCACGTATGGGCCCAATGGCTGCTTCAAGGCCCTG
GATGACATCTTAAACTTAAAGCTGGTTCATATCTTGAACATGGTCACGGGCACCATC
CACACCTACCCTGTGACAGAGGATGAGAGTCTGCAGAGCTTGAAGGCCAGAATCCA
ACAGGACACGGGCATCCCAGAGGAGGACCAGGAGCTGCTGCAGGAAGCGGGCCTG
GCGTTGATCCCCGATAAGCCTGCCACTCAGTGTATTTCAGACGGCAAGTTAAATGAG
GGCCACACATTGGACATGGATCTTGTTTTTCTCTTTGACAACAGTAAAATCACCTAT
GAGACTCAGATCTCCCCACGGCCCCAACCTGAAAGTGTCAGCTGTATCCTTCAAGAG
CCCAAGAGGAATCTCGCCTTCTTCCAGCTGAGGAAGGTGTGGGGCCAGGTCTGGCA
CAGCATCCAGACCCTGAAGGAAGATTGCAACCGGCTGCAGCAGGGACAGCGAGCCG
CCATGATGAATCTCCTCCGAAACAACAGCTGCCTCTCCAAAATGAAGAATTCCATGG
CTTCCATGTCTCAGCAGCTCAAGGCCAAGTTGGATTTCTTCAAAACCAGCATCCAGA
TTGACCTGGAGAAGTACAGCGAGCAAACCGAGTTTGGGATCACATCAGATAAACTG
CTGCTGGCCTGGAGGGAAATGGAGCAGGCTGTGGAGCTCTGTGGGCGGGAGAACGA
AGTGAAACTCCTGGTAGAACGGATGATGGCTCTGCAGACCGACATTGTGGACTTAC
AGAGGAGCCCCATGGGCCGGAAGCAGGGGGGAACGCTGGACGACCTAGAGGAGCA
AGCAAGGGAGCTGTACAGGAGACTAAGGGAAAAACCTCGAGACCAGCGAACTGAG
GGTGACAGTCAGGAAATGGTACGGCTGCTGCTTCAGGCAATTCAGAGCTTCGAGAA
GAAAGTGCGAGTGATCTATACGCAGCTCAGTAAAACTGTGGTTTGCAAGCAGAAGG
CGCTGGAACTGTTGCCCAAGGTGGAAGAGGTGGTGAGCTTAATGAATGAGGATGAG
AAGACTGTTGTCCGGCTGCAGGAGAAGCGGCAGAAGGAGCTCTGGAATCTCCTGAA
GATTGCTTGTAGCAAGGTCCGTGGTCCTGTCAGTGGAAGCCCGGATAGCATGAATGC
CTCTCGACTTAGCCAGCCTGGGCAGCTGATGTCTCAGCCCTCCACGGCCTCCAACAG
CTTACCTGAGCCAGCCAAGAAGAGTGAAGAACTGGTGGCTGAAGCACATAACCTCT
GCACCCTGCTAGAAAATGCCATACAGGACACTGTGAGGGAACAAGACCAGAGTTTC
ACGGCCCTAGACTGGAGCTGGTTACAGACGGAAGAAGAAGAGCACAGCTGCCTGGA
GCAGGCCTCATGA

【１１６９】

ヒトＩκＢ　ＣＤＳ（配列番号１２）

【化２７６】

ATGTTCCAGGCGGCCGAGCGCCCCCAGGAGTGGGCCATGGAGGGCCCCCGCGACGG
GCTGAAGAAGGAGCGGCTACTGGACGACCGCCACGACAGCGGCCTGGACTCCATGA
AAGACGAGGAGTACGAGCAGATGGTCAAGGAGCTGCAGGAGATCCGCCTCGAGCC
GCAGGAGGTGCCGCGCGGCTCGGAGCCCTGGAAGCAGCAGCTCACCGAGGACGGG
GACTCGTTCCTGCACTTGGCCATCATCCATGAAGAAAAGGCACTGACCATGGAAGTG
ATCCGCCAGGTGAAGGGAGACCTGGCCTTCCTCAACTTCCAGAACAACCTGCAGCA
GACTCCACTCCACTTGGCTGTGATCACCAACCAGCCAGAAATTGCTGAGGCACTTCT
GGGAGCTGGCTGTGATCCTGAGCTCCGAGACTTTCGAGGAAATACCCCCCTACACCT
TGCCTGTGAGCAGGGCTGCCTGGCCAGCGTGGGAGTCCTGACTCAGTCCTGCACCAC
CCCGCACCTCCACTCCATCCTGAAGGCTACCAACTACAATGGCCACACGTGTCTACA
CTTAGCCTCTATCCATGGCTACCTGGGCATCGTGGAGCTTTTGGTGTCCTTGGGTGCT
GATGTCAATGCTCAGGAGCCCTGTAATGGCCGGACTGCCCTTCACCTCGCAGTGGAC
CTGCAAAATCCTGACCTGGTGTCACTCCTGTTGAAGTGTGGGGCTGATGTCAACAGA
GTTACCTACCAGGGCTATTCTCCCTACCAGCTCACCTGGGGCCGCCCAAGCACCCGG
ATACAGCAGCAGCTGGGCCAGCTGACACTAGAAAACCTTCAGATGCTGCCAGAGAG
TGAGGATGAGGAGAGCTATGACACAGAGTCAGAGTTCACGGAGTTCACAGAGGACG
AGCTGCCCTATGATGACTGTGTGTTTGGAGGCCAGCGTCTGACGTT ATGA

【１１７０】

ヒトＩＲＡＫ　ＣＤＳ（配列番号１３）

【化２７７】

ATGGCCGGGGGGCCGGGCCCGGGGGAGCCCGCAGCCCCCGGCGCCCAGCACTTCTT
GTACGAGGTGCCGCCCTGGGTCATGTGCCGCTTCTACAAAGTGATGGACGCCCTGGA
GCCCGCCGACTGGTGCCAGTTCGCCGCCCTGATCGTGCGCGACCAGACCGAGCTGC
GGCTGTGCGAGCGCTCCGGGCAGCGCACGGCCAGCGTCCTGTGGCCCTGGATCAAC
CGCAACGCCCGTGTGGCCGACCTCGTGCACATCCTCACGCACCTGCAGCTGCTCCGT
GCGCGGGACATCATCACAGCCTGGCACCCTCCCGCCCCGCTTCCGTCCCCAGGCACC
ACTGCCCCGAGGCCCAGCAGCATCCCTGCACCCGCCGAGGCCGAGGCCTGGAGCCC
CCGGAAGTTGCCATCCTCAGCCTCCACCTTCCTCTCCCCAGCTTTTCCAGGCTCCCAG
ACCCATTCAGGGCCTGAGCTCGGCCTGGTCCCAAGCCCTGCTTCCCTGTGGCCTCCA
CCGCCATCTCCAGCCCCTTCTTCTACCAAGCCAGGCCCAGAGAGCTCAGTGTCCCTC
CTGCAGGGAGCCCGCCCCTTTCCGTTTTGCTGGCCCCTCTGTGAGATTTCCCGGGGC
ACCCACAACTTCTCGGAGGAGCTCAAGATCGGGGAGGGTGGCTTTGGGTGCGTGTA
CCGGGCGGTGATGAGGAACACGGTGTATGCTGTGAAGAGGCTGAAGGAGAACGCTG
ACCTGGAGTGGACTGCAGTGAAGCAGAGCTTCCTGACCGAGGTGG
AGCAGCTGTCCAGGTTTCGTCACCCAAACATTGTGGACTTTGCTGGCTACTGTGCTC
AGAACGGCTTCTACTGCCTGGTGTACGGCTTCCTGCCCAACGGCTCCCTGGAGGACC
GTCTCCACTGCCAGACCCAGGCCTGCCCACCTCTCTCCTGGCCTCAGCGACTGGACA
TCCTTCTGGGTACAGCCCGGGCAATTCAGTTTCTACATCAGGACAGCCCCAGCCTCA
TCCATGGAGACATCAAGAGTTCCAACGTCCTTCTGGATGAGAGGCTGACACCCAAG
CTGGGAGACTTTGGCCTGGCCCGGTTCAGCCGCTTTGCCGGGTCCAGCCCCAGCCAG
AGCAGCATGGTGGCCCCGGACACAGACAGTGCGGGGCACCCTGGCCTACCTGCCCGA
GGAGTACATCAAGACGGGAAGGCTGGCTGTGGACACGGACACCTTCAGCTTTGGGG
TGGTAGTGCTAGAGACCTTGGCTGGTCAGAGGGCTGTGAAGACGCACGGTGCCAGG
ACCAAGTATCTGAAAGACCTGGTGGAAGAGGAGGCTGAGGAGGCTGGAGTGGCTTT
GAGAAGCACCCAGAGCACACTGCAAGCAGGTCTGGCTGCAGATGCCTGGGCTGCTC
CCATCGCCATGCAGATCTACAAGAAGCACCTGGACCCCAGGCCCGGGCCCTGCCCA
CCTGAGCTGGGCCTGGGCCTGGGCCAGCTGGCCTGCTGCTGCCTGCACCGCCGGGCC
AAAAGGAGGCCTCCTATGACCCAGGTGTACGAGAGGCTAGAGAAGCTGCAGGCAGT
GGTGGCGGGGGTGCCCGGGCATTCGGAGGCCGCCAGCTGCATCCCCCCTTCCCCGC
AGGAGAACTCCTACGTGTCCAGCACTGGCAGAGCCCACAGTGGGGCTGCTCCATGG
CAGCCCCTGGCAGCGCCATCAGGAGCCAGTGCCCAGGCAGCAGAGCAGCTGCAGAG
AGGCCCCAACCAGCCCGTGGAGAGTGACGAGAGCCTAGGCGGCCTCTCTGCTGCCC
TGCGCTCCTGGCACTTGACTCCAAGC
TGCCCTCTGGACCCAGCACCCCTCAGGGAGGCCGGCTGTCCTCAGGGGGACACGGC
AGGAGAATCGAGCTGGGGGAGTGGCCCAGGATCCCGGCCCACAGCCGTGGAAGGA
CTGGCCCTTGGCAGCTCTGCATCATCGTCGTCAGAGCCACCGCAGATTATCATCAAC
CCTGCCCGACAGAAGATGGTCCAGAAGCTGGCCCTGTACGAGGATGGGGCCCTGGA
CAGCCTGCAGCTGCTGTCGTCCAGCTCCCTCCCAGGCTTGGGCCTGGAACAGGACAG
GCAGGGGCCCGAAGAAAGTGATGAATTTCAGAGCTGA

【１１７１】

ヒトＪＮＫ　ＣＤＳ（配列番号１４）

【化２７８】

ATGAGCAGAAGCAAGCGTGACAACAATTTTTATAGTGTAGAGATTGGAGATTCTAC
ATTCACAGTCCTGAAACGATATCAGAATTTAAAACCTATAGGCTCAGGAGCTCAAG
GAATAGTATGCGCAGCTTATGATGCCATTCTTGAAAGAAATGTTGCAATCAAGAAGC
TAAGCCGACCATTTCAGAATCAGACTCATGCCAAGCGGGCCTACAGAGAGCTAGTT
CTTATGAAATGTGTTAATCACAAAAATATAATTGGCCTTTTGAATGTTTTCACACCAC
AGAAATCCCTAGAAGAATTTCAAGATGTTTACATAGTCATGGAGCTCATGGATGCAA
ATCTTTGCCAAGTGATTCAGATGGAGCTAGATCATGAAAGAATGTCCTACCTTCTCT
ATCAGATGCTGTGTGGAATCAAGCACCTTCATTCTGCTGGAATTATTCATCGGGACT
TAAAGCCCAGTAATATAGTAGTAAAATCTGATTGCACTTTGAAGATTCTTGACTTCG
GTCTGGCCAGGACTGCAGGAACGAGTTTTATGATGACGCCTTATGTAGTGACTCGCT
ACTACAGAGCACCCGAGGTCATCCTTGGCATGGGCTACAAGGAAAACGTTGACATT
TGGTCAGTTGGGTGCATCATGGGAGAAATGATCAAAGGTGGTGTTTTGTTCCCAGGT
ACAGATCATATTGATCAGTGGAATAAAGTTATTGAACAGCTTGGAACACCATGTCCT
GAATTCATGAAGAAACTGCAACCAACAGTAAGGACTTACGTTGAAAACAGACCTAA
ATATGCTGGATATAGCTTTGAGAAACTCTTCCCTGATGTCCTTTTCCCAGCTGACTCA
GAACACAACAAACTTAAAGCCAGTCAGGCAAGGGATTTGTTATCCAAAATGCTGGT
AATAGATGCATCTAAAAGGATCTCTGTAGATGAAGCTCTCCAACACCCGTACATCAA
TGTCTGGTATGATCCTTCTGAAGCAGAAGCTCCACCACCAAAGATCCCTGACAAGCA
GTTAGATGAAAGGGAACACACAATAGAAGAGTGGAAAGAATTGATATATAAGGAA
GTTATGGACTTGGAGGAGAGAACCAAGAATGGAGTTATACGGGGGCAGCCCTCTCC
TTTAGGTGCAGCAGTGATCAATGGCTCTCAGCATCCATCATCATCGTCGTCTGTCAA
TGATGTGTCTTCAATGTCAACAGATCCGACTTTGGCCTCTGATACAGACAGCAGTCT
AGAAGCAGCAGCTGGGCCTCTGGGCTGCTGTAGATGA

【１１７２】

ヒトＬＢＰ　ＣＤＳ（配列番号１５）

【化２７９】

ATGGGGGCCTTGGCCAGAGCCCTGCCGTCCATACTGCTGGCATTGCTGCTTACGTCC
ACCCCAGAGGCTCTGGGTGCCAACCCCGGCTTGGTCGCCAGGATCACCGACAAGGG
ACTGCAGTATGCGGCCCAGGAGGGGCTATTAGCTCTGCAGAGTGAGCTGCTCAGGA
TCACGCTGCCTGACTTCACCGGGGACTTGAGGATCCCCCACGTCGGCCGTGGGCGCT
ATGAGTTCCACAGCCTGAACATCCACAGCTGTGAGCTGCTTCACTCTGCGCTGAGGC
CTGTCCCTGGCCAGGGCCTGAGTCTCAGCA
TCTCCGACTCCTCCATCCGGGTCCAGGGCAGGTGGAAGGTGCGCAAGTCATTCTTCA
AACTACAGGGCTCCTTTGATGTCAGTGTCAAGGGCATCAGCATTTCGGTCAACCTCC
TGTTGGGCAGCGAGTCCTCCGGGAGGCCCACAGTTACTGCCTCCAGCTGCAGCAGTG
ACATCGCTGACGTGGAGGTGGACATGTCGGGAGACTTGGGGTGGCTGTTGAACCTCT
TCCACAACCAGATTGAGTCCAAGTTCCAGAAAGTACTGGAGAGCAGGATTTGCGAA
ATGATCCAGAAATCGGTGTCCTCCGATCTACAGCCTTATCTCCAAACTCTGCCAGTT
ACAACAGAGATTGACAGTTTCGCCGACATTGATTATAGCTTAGTGGAAGCCCCTCGG
GCAACAGCCCAGATGCTGGAGGTGATGTTTAAGGGTGAAATCTTTCATCGTAACCAC
CGTTCTCCAGTTACCCTCCTTGCTGCAGTCATGAGCCTTCCTGAGGAACACAACAAA
ATGGTCTACTTTGCCATCTCGGATTATGTCTTCAACACGGCCAGCCTGGTTTATCATG
AGGAAGGATATCTGAACTTCTCCATCACAGATGACATGATACCGCCTGACTCTAATA
TCCGACTGACCACCAAGTCCTTCCGACCCTTCGTCCCACGGTTAGCCAGGCTCTACC
CCAACATGAACCTGGAACTCCAGGGATCAGTGCCCTCTGCTCCGCTCCTGAACTTCA
GCCCTGGGAATCTGTCTGTGGACCCCTATATGGAGATAGATGCCTTTGTGCTCCTGC
CCAGCTCCAGCAAGGAGCCTGTCTTCCGGCTCAGTGTGGCCA
CTAATGTGTCCGCCACCTTGACCTTCAATACCAGCAAGATCACTGGGTTCCTGAAGC
CAGGAAAGGTAAAAGTGGAACTGAAAGAATCCAAAGTTGGACTATTCAATGCAGAG
CTGTTGGAAGCGCTCCTCAACTATTACATCCTTAACACCCTCTACCCCAAGTTCAAT
GATAAGTTGGCCGAAGGCTTCCCCCTTCCTCTGCTGAAGCGTGTTCAGCTCTACGAC
CTTGGGCTGCAGATCCATAAGGACTTCCTGTTCTTGGGTGCCAATGTCCAATACATG
AGAGTTTGA

【１１７３】

ヒトＭＥＫ１　ＣＤＳ（配列番号１６）

【化２８０】

ATGCCCAAGAAGAAGCCGACGCCCATCCAGCTGAACCCGGCCCCCGACGGCTCTGC
AGTTAACGGGACCAGCTCTGCGGAGACCAACTTGGAGGCCTTGCAGAAGAAGCTGG
AGGAGCTAGAGCTTGATGAGCAGCAGCGAAAGCGCCTTGAGGCCTTTCTTACCCAG
AAGCAGAAGGTGGGAGAACTGAAGGATGACGACTTTGAGAAGATCAGTGAGCTGG
GGGCTGGCAATGGCGGTGTGGTGTTCAAGGTCTCCCACAAGCCTTCTGGCCTGGTCA
TGGCCAGAAAGCTAATTCATCTGGAGATCAAACCCGCAATCCGGAACCAGATCATA
AGGGAGCTGCAGGTTCTGCATGAGTGCAACTCTCCGTACATCGTGGGCTTCTATGGT
GCGTTCTACAGCGATGGCGAGATCAGTATCTGCATGGAGCACATGGATGGAGGTTCT
CTGGATCAAGTCCTGAAGAAAGCTGGAAGAATTCCTGAACAAATTTTAGGAAAAGT
TAGCATTGCTGTAATAAAAGGCCTGACATATCTGAGGGAGAAGCACAAGATCATGC
ACAGAGATGTCAAGCCCTCCAACATCCTAGTCAACTCCCGTGGGGAGATCAAGCTCT
GTGACTTTGGGGTCAGCGGGCAGCTCATCGACTCCATGGCCAACTCCTTCGTGGGC
ACAAGGTCCTACATGTCGCCAGAAAGACTCCAGGGGACTCATTACTCTGTGCAGTCA
GACATCTGGAGCATGGGACTGTCTCTGGTAGAGATGGCGGTTGGGAGGTATCCCATC
CCTCCTCCAGATGCCAAGGAGCTGGAGCTGATGTTTGGGTGCCAGGTGGAAGGAGA
TGCGGCTGAGACCCCACCCAGGCCAAGGACCCCCGGGAGGCCCCTTAGCTCATACG
GAATGGACAGCCGACCTCCCATGGCAATTTTTGAGTTGTTGGATTACATAGTCAACG
AGCCTCCTCCAAAACTGCCCAGTGGAGTGTTCAGTCTGGAATTTCAAGATTTTGTGA
ATAAATGCTTAATAAAAAACCCCGCAGAGAGAGCAGATTTGAAGCAACTCATGGTT
CATGCTTTTATCAAGAGATCTGATGCTGAGGAAGTGGATTTTGCAGGTTGGCTCTGC
TCCACCATCGGCCTTAACCAGCCCAGC ACACCAACCCATGCTGCTGGCGTCTAA

【１１７４】
ヒトＭＥＫ２　ＣＤＳ（配列番号１７）
【化２８１】

ATGCTGGCCCGGAGGAAGCCGGTGCTGCCGGCGCTCACCATCAACCCTACCATCGC
CGAGGGCCCATCCCCTACCAGCGAGGGCGCCTCCGAGGCAAACCTGGTGGACCTGC
AGAAGAAGCTGGAGGAGCTGGAACTTGACGAGCAGCAGAAGAAGCGGCTGGAAGC
CTTTCTCACCCAGAAAGCCAAGGTCGGCGAACTCAAAGACGATGACTTCGAAAGGA
TCTCAGAGCTGGGCGCGGGCAACGGCGGGGTGGTCACCAAAGTCCAGCACAGACCC
TCGGGCCTCATCATGGCCAGGAAGCTGATCCACCTTGAGATCAAGCCGGCCATCCG
GAACCAGATCATCCGCGAGCTGCAGGTCCTGCACGAATGCAACTCGCCGTACATCG
TGGGCTTCTACGGGGCCTTCTACAGTGACGGGGAGATCAGCATTTGCATGGAACACA
TGGACGGCGGCTCCCTGGACCAGGTGCTGAAAGAGGCCAAGAGGATTCCCGAGGAG
ATCCTGGGGAAAGTCAGCATCGCGGTTCTCCGGGGCTTGGCGTACCTCCGAGAGAA
GCACCAGATCATGCACCGAGATGTGAAGCCCTCCAACATCCTCGTGAACTCTAGAG
GGGAGATCAAGCTGTGTGACTTCGGGGTGAGCGGCCAGCTCATCGACTCCATGGCC
AACTCCTTCGTGGGCACGCGCTCCTACATGGCTCCGGAGCGGTTGCAGGGCACA
CATTACTCGGTGCAGTCGGACATCTGGAGCATGGGCCTGTCCCTGGTGGAGCTGGCC
GTCGGAAGGTACCCCATCCCCCCCGCCCGACGCCAAAGAGCTGGAGGCCATCTTTGG
CCGGCCCGTGGTCGACGGGGAAGAAGGAGAGCCTCACAGCATCTCGCCTCGGCCGA
GGCCCCCCGGGCGCCCCGTCAGCGGTCACGGGATGGATAGCCGGCCTGCCATGGCC
ATCTTTGAACTCCTGGACTATATTGTGAACGAGCCACCTCCTAAGCTGCCCAACGGT
GTGTTCACCCCCGACTTCCAGGAGTTTGTCAATAAATGCCTCATCAAGAACCCAGCG
GAGCGGGCGGACCTGAAGATGCTCACAAACCACACCTTCATCAAGCGGTCCGAGGT
GGAAGAAGTGGATTTTGCCGGCTGGTTGTGTAAAACCCTGCGGCTGAACCAGCCCG
GCACACCCACGCGCACCGCCGTGTGA

【１１７５】
ヒトＭＥＫ３　ＣＤＳ（配列番号１８）
【化２８２】

ATGTCCAAGCCACCCGCACCCAACCCCACACCCCCCCGGAACCTGGACTCCCGGAC
CTTCATCACCATTGGAGACAGAAACTTTGAGGTGGAGGCTGATGACTTGGTGACCAT
CTCAGAACTGGGCCGTGGAGCCTATGGGGTGGTAGAGAAGGTGCGGCACGCCCAGA
GCGGCACCATCATGGCCGTGAAGCGGATCCGGGCCACCGTGAACTCACAGGAGCAG
AAGCGGCTGCTCATGGACCTGGACATCAACATGCGCACGGTCGACTGTTTCTACACT
GTCACCTTCTACGGGGCACTATTCAGAGAGGGAGACGTGTGGATCTGCATGGAGCTC
ATGGACACATCCTTGGACAAGTTCTACCGGAAGGTGCTGGATAAAAACATGACAAT
TCCAGAGGACATCCTTGGGGAGATTGCTGTGTCTATCGTGCGGGCCCTGGAGCATCT
GCACAGCAAGCTGTCGGTGATCCACAGAGATGTGAAGCCCTCCAATGTCCTTATCAA
CAAGGAGGGCCATGTGAAGATGTGTGACTTTGGCATCAGTGGCTACTTGGTGGACTC
TGTGGCCAAGACGATGGATGCCGGCTGCAAGCCCTACATGGCCCCTGAGAGGATCA
ACCCAGAGCTGAACCAGAAGGGCTACAATGTCAAGTCCGACGTCTGGAGCCTGGGC
ATCACCATGATTGAGATGGCCATCCTGCGGTTCCCTTACGAGTCCTGGGGGACCCCG
TTCCAGCAGCTGAAGCAGGTGGTGGAGGAGCCGTCCCCCCAGCTCCCAGCCGACCG
TTTCTCCCCCGAGTTTGTGGACTTCACTGCTCAGTGCCTGAGGAAGAACCCCGCAGA
GCGTATGAGCTACCTGGAGCTGATGGAGCACCCCTTCTTCACCTTGCACAAAACCAA
GAAGACGGACATTGCTGCCTTCGTGAAGGAGATCCTGGGAGAAGACTCATAG

【１１７６】
ヒトＭＥＫ６　ＣＤＳ（配列番号１９）

【化２８３】

ATGTCTCAGTCGAAAGGCAAGAAGCGAAACCCTGGCCTTAAAATTCCAAAAGAAGC
ATTTGAACAACCTCAGACCAGTTCCACACCACCTCGAGATTTAGACTCCAAGGCTTG
CATTTCTATTGGAAATCAGAACTTTGAGGTGAAGGCAGATGACCTGGAGCCTATAAT
GGAACTGGGACGAGGTGCGTACGGGGTGGTGGAGAAGATGCGGCACGTGCCCAGC
GGGCAGATCATGGCAGTGAAGCGGATCCGAGCCACAGTAAATAGCCAGGAACAGA
AACGGCTACTGATGGATTTGGATATTTCCATGAGGACGGTGGACTGTCCATTCACTG
TCACCTTTTATGGCGCACTGTTTCGGGAGGGTGATGTGTGGATCTGCATGGAGCTCA
TGGATACATCACTAGATAAATTCTACAAACAAGTTATTGATAAAGGCCAGACAATTC
CAGAGGACATCTTAGGGAAAATAGCAGTTTCTATTGTAAAAGCATTAGAACATTTAC
ATAGTAAGCTGTCTGTCATTCACAGAGACGTCAAGCCTTCTAATGTACTCATCAATG
CTCTCGGTCAAGTGAAGATGTGCGATTTTGGAATCAGTGGCTACTTGGTGGACTCTG
TTGCTAAAACAATTGATGCAGGTTGCAAACCATACATGGCCCCTGAAAGAATAAAC
CCAGAGCTCAACCAGAAGGGATACAGTGTGAAGTCTGACATTTGGAGTCTGGGCAT
CACGATGATTGAGTTGGCCATCCTTCGATTTCCCTATGATTCATGGGGAACTCCATTT
CAGCAGCTCAAACAGGTGGTAGAGGAGCCATCGCCACAACTCCCAGCAGACAAGTT
CTCTGCAGAGTTTGTTGACTTTACCTCACAGTGCTTAAAGAAGAATTCCAAAGAACG
GCCTACATACCCAGAGCTAATGCAACATCCATTTTTCACCCTACATGAATCCAAAGG
AACAGATGTGGCATCTTTTGTAAAACTGATTCTTGGAGACTAA

【１１７７】

ヒトＭＥＫＫ１　ＣＤＳ（配列番号２０）

【化２８４】

ATGGCGGCGGCGGCGGGGAATCGCGCCTCGTCGTCGGGATTCCCGGGCGCCAGGGC
TACGAGCCCTGAGGCAGGCGGCGGCGGAGGAGCCCTCAAGGCGAGCAGCGCGCCC
GCGGCTGCCGCGGGACTGCTGCGGGAGGCGGGCAGCGGGGGCCGCGAGCGGGCGG
ACTGGCGGCGGCGGCAGCTGCGCAAAGTGCGGAGTGTGGAGCTGGACCAGCTGCCT
GAGCAGCCGCTCTTCCTTGCCGCCTCACCGCCGGCCTCCTCGACTTCCCCGTCGCCG
GAGCCCGCGGACGCAGCGGGGAGTGGGACCGGCTTCCAGCCTGTGGCGGTGCCGCC
GCCCCACGGAGCCGCGAGCCGCGGCGGCGCCCACCTTACCGAGTCGGTGGCGGCGC
CGGACAGCGGCGCCTCGAGTCCCGCAGCGGCCGAGCCCGGGGAGAAGCGGGCGCC
CGCCGCCGAGCCGTCTCCTGCAGCGGCCCCCGCCGGTCGTGAGATGGAGAATAAAG
AAACTCTCAAAGGGTTGCACAAGATGGATGATCGTCCAGAGGAACGAATGATCAGG
GAGAAACTGAAGGCAACCTGTATGCCAGCCTGGAAGCACGAATGGTTGGAAAGGAG
AAATAGGCGAGGGCCTGTGGTGGTAAAACCAATCCCAGTTAAAGGAGATGGATCTG
AAATGAATCACTTAGCAGCTGAGTCTCCAGGAGAGGTCCAGGCAAGTGCGGCTTCA
CCAGCTTCCAAAGGCCGACGCAGTCCTTCTCCTGGCAACTCCCCATCAGGTCGCACA

【化２８５】

GTGAAATCAGAATCTCCAGGAGTAAGGAGAAAAAGAGTTTCCCCAGTGCCTTTTCA
GAGTGGCAGAATCACACCACCCCGAAGAGCCCCTTCACCAGATGGCTTCTCACCAT
ATAGCCCTGAGGAAACAAACCGCCGTGTTAACAAAGTGATGCGGGCCAGACTGTAC
TTACTGCAGCAGATAGGGCCTAACTCTTTCCTGATTGGAGGAGACAGCCCAGACAAT
AAATACCGGGTGTTTATTGGGCCTCAGAACTGCAGCTGTGCACGTGGAACATTCTGT
ATTCATCTGCTATTTGTGATGCTCCGGGTGTTTCAACTAGAACCTTCAGACCCAATGT
TATGGAGAAAAACTTTAAAGAATTTTGAGGTTGAGAGTTTGTTCCAGAAATATCACA
GTAGGCGTAGCTCAAGGATCAAAGCTCCATCTCGTAACACCATCCAGAAGTTTGTTT
CACGCATGTCAAATTCTCATACATTGTCATCATCTAGTACTTCTACGTCTAGTTCAGA
AAACAGCATAAAGGATGAAGAGGAACAGATGTGTCCTATTTGCTTGTTGGGCATGC
TTGATGAAGAAAGTCTTACAGTGTGTGAAGACGGCTGCAGGAACAAGCTGCACCAC
CACTGCATGTCAATTTGGGCAGAAGAGTGTAGAAGAAATAGAGAACCTTTAATATG
TCCCCTTTGTAGATCTAAGTGGAGATCTCATGATTTCTACAGCCACGAGTTGTCAAG
TCCTGTGGATTCCCCTTCTTCCCTCAGAGCTGCACAGCAGCAAACCGTACAGCAGCA
GCCTTTGGCTGGATCACGAAGGAATCAAGAGAGCAATTTTAACCTTACTCATTATGG
AACTCAGCAAATCCCTCCTGCTTACAAAGATTTAGCTGAGCCATGGATTCAGGTGTT
TGGAATGGAACTCGTTGGCTGCTTATTTTCTAGAAACTGGAATGTGAGAGAGATGGC
CCTCAGGCGTCTTTCCCATGATGTCAGTGGGGCCCTGCTGTTGGCAAATGGGGAGAG
CACTGGAAATTCTGGGGGCAGCAGTGGAAGCAGCCCGAGTGGGGGAGCCACCAGTG
GGTCTTCCCAGACCAGTATCTCAGGAGATGTGGTGGAGGCATGCTGCAGCGTTCTGT
CAATGGTCTGTGCTGACCCTGTCTACAAAGTGTACGTTGCTGCTTTAAAAACATTGA
GAGCCATGCTGGTATATACTCCTTGCCACAGTTTAGCGGAAAGAATCAAACTTCAGA
GACTTCTCCAGCCAGTTGTAGACACCATCCTAGTCAAATGTGCAGATGCCAATAGCC
GCACAAGTCAGCTGTCCATATCAACACTGTTGGAACTGTGCAAAGGCCAAGCAGGA
GAGTTGGCAGTTGGCAGAGAAATACTAAAAGCTGGATCCATTGGTATTGGTGGTGTT
GATTATGTCTTAAATTGTATTCTTGGAAACCAAACTGAATCAAACAATTGGCAAGAA
CTTCTTGGCCGCCTTTGTCTTATAGATAGACTGTTGTTGGAATTTCCTGCTGAATTTT
ATCCTCATATTGTCAGTACTGATGTTTCACAAGCTGAGCCTGTTGAAATCAGGTATA
AGAAGCTGCTGTCCCTCTTAACCTTTGCTTTGCAGTCCATTGATAATTCCCACTCAAT
GGTTGGCAAACTTTCCAGAAGGATCTACTTGAGTTCTGCAAGAATGGTTACTACAGT
ACCCCATGTGTTTTCAAAACTGTTAGAAATGCTGAGTGTTTCCAGTTCCACTCACTTC
ACCAGGATGCGTCGCCGTTTGATGGCTATTGCAGATGAGGTGGAAATTGCCGAAGC
CATCCAGTTGGGCGTAGAAGACACTTTGGATGGTCAACAGGACAGCTTCTTGCAGGC
ATCTGTTCCCAACAACTATCTGGAAACCACAGAGAACAGTTCCCCTGAGTGCACAGT
CCATTTAGAGAAAACTGGAAAAGGATTATGTGCTACAAAATTGAGTGCCAGTTCAG
AGGACATTTCTGAGAGACTGGCCAGCATTTCAGTAGGACCTTCTAGTTCAACAACAA
CAACAACAACAACAACAGAGCAACCAAAGCCAATGGTTCAAACAAAAGGCAGACC
CCACAGTCAGTGTTTGAACTCCTCTCCTTTATCTCATCATTCCCAATTAATGTTTCCA
GCCTTGTCAACCCCTTCTTCTTCTACCCCATCTGTACCAGCTGGCACTGCAACAGATG
TCTCTAAGCATAGACTTCAGGGATTCATTCCCTGCAGAATACCTTCTGCATCTCCTCA
AACACAGCGCAAGTTTTCTCTACAATTCCACAGAAACTGTCCTGAAAACAAAGACTC
AGATAAACTTTCCCCAGTCTTTACTCAGTCAAGACCCTTGCCCTCCAGTAACATACA
CAGGCCAAAGCCATCTAGACCTACCCCAGGTAATACAAGTAAACAGGGAGATCCCT
CAAAAAATAGCATGACACTTGATCTGAACAGTAGTTCCAAATGTGATGACAGCTTTG
GCTGTAGCAGCAATAGTAGTAATGCTGTTATACCCAGTGACGAGACAGTGTTCACCC
CAGTAGAGGAGAAATGCAGATTAGATGTCAATACAGAGCTCAACTCCAGTATTGAG

【化２８６】

GACCTTCTTGAAGCATCTATGCCTTCAAGTGATACAACAGTAACTTTTAAGTCAGAA
GTTGCTGTCCTGTCTCCTGAAAAGGCTGAAAATGATGATACCTACAAAGATGATGTG
AATCATAATCAAAAGTGCAAAGAGAAGATGGAAGCTGAAGAAGAAGAAGCTTTAG
CAATTGCCATGGCAATGTCAGCGTCTCAGGATGCCCTCCCCATAGTTCCTCAGCTGC
AGGTTGAAAATGGAGAAGATATCATCATTATTCAACAGGATACACCAGAGACTCTA
CCAGGACATACCAAAGCAAAACAACCGTATAGAGAAGACACTGAATGGCTGAAAG
GTCAACAGATAGGCCTTGGAGCATTTTCTTCTTGTTATCAGGCTCAAGATGTGGGAA
CTGGAACTTTAATGGCTGTTAAACAGGTGACTTATGTCAGAAACACATCTTCTGAGC
AAGAAGAAGTAGTAGAAGCACTAAGAGAAGAGATAAGAATGATGAGCCATCTGAA
TCATCCAAACATCATTAGGATGTTGGGAGCCACGTGTGAGAAGAGCAATTACAATCT
CTTCATTGAATGGATGGCAGGGGGATCGGTGGCTCATTTGCTGAGTAAATATGGAGC
CTTCAAAGAATCAGTAGTTATTAACTACACTGAACAGTTACTCCGTGGCCTTTCGTA
TCTCCATGAAAACCAAATCATTCACAGAGATGTCAAAGGTGCCAATTTGCTAATTGA
CAGCACTGGTCAGAGACTAAGAATTGCAGATTTTGGAGCTGCAGCCAGGTTGGCAT
CAAAAGGAACTGGTGCAGGAGAGTTTCAGGGACAATTACTGGGGACAATTGCATTT
ATGGCACCTGAGGTACTAAGAGGTCAACAGTATGGAAGGAGCTGTGATGTATGGAG
TGTTGGCTGTGCTATTATAGAAATGGCTTGTGCAAAACCACCATGGAATGCAGAAAA
ACACTCCAATCATCTTGCTTTGATATTTAAGATTGCTAGTGCAACTACTGCTCCATCG
ATCCCTTCACATTTGTCTCCTGGTTTACGAGATGTGGCTCTTCGTTGTTTAGAACTTC
AACCTCAGGACAGACCTCCATCAAGAGAGCTACTGAAGCATCCAGTCTTTCGTACTA
CATGGTAG

【１１７８】

ヒトＭＥＫＫ　３　ＣＤＳ（配列番号２１）

【化２８７】

ATGGACGAACAGGAGGCATTGAACTCAATCATGAACGATCTGGTGGCCCTCCAGAT
GAACCGACGTCACCGGATGCCTGGATATGAGACCATGAAGAACAAAGACACAGGTC
ACTCAAATAGGCAGAAAAAACACAACAGCAGCAGCTCAGCCCTTCTGAACAGCCCC
ACAGTAACAACAAGCTCATGTGCAGGGGCCAGTGAGAAAAAGAAATTTTTGAGTGA
CGTCAGAATCAAGTTCGAGCACAACGGGGAGAGGCGAATTATAGCGTTCAGCCGGC
CTGTGAAATATGAAGATGTGGAGCACAAGGTGACAACAGTATTTGGACAACCTCTT
GATCTACATTACATGAACAATGAGCTCTCCATCCTGCTGAAAAACCAAGATGATCTT
GATAAAGCAATTGACATTTTAGATAGAAGCTCAAGCATGAAAAGCCTTAGGATATT
GCTGTTGTCCCAGGACAGAAACCATAACAGTTCCTCTCCCCACTCTGGGGTGTCCAG
ACAGGTGCGGATCAAGGCTTCCCAGTCCGCAGGGGATATAAATACTATCTACCAGC
CCCCCGAGCCCAGAAGCAGGCACCTCTCTGTCAGCTCCCAGAACCCTGGCCGAAGC
TCACCTCCCCCTGGCTATGTTCCTGAGCGGCAGCAGCACATTGCCCGGCAGGGGTCC
TACACCAGCATCAACAGTGAGGGGGAGTTCATCCCAGAGACCAGCGAGCAGTGCAT
GCTGGATCCCCTGAGCAGTGCAGAAAATTCCTTGTCTGGAAGCTGCCAATCCTTGGA
CAGGTCAGCAGACAGCCCATCCTTCCGGAAATCACGAATGTCCCGTGCCCAGAGCTT
CCCTGACAACAGACAGGAATACTCAGATCGGGAAACTCAGCTTTATGACAAAGGGG
TCAAAGGTGGAACCTACCCCCGGCGCTACCACGTGTCTGTGCACCACAAGGACTAC
AGTGATGGCAGAAGAACATTTCCCCGAATACGGCGTCATCAAGGCAACTTGTTCACC
CTGGTGCCCTCCAGCCGCTCCCTGAGCACAAATGGCGAGAACATGGGTCTGGCTGTG
CAATACCTGGACCCCCGTGGGCGCCTGCGGAGTGCGGACAGCGAGAATGCCCTCTC
TGTGCAGGAGAGGAATGTGCCAACCAAGTCTCCCAGTGCCCCCATCAACTGGCGCC
GGGGAAAGCTCCTGGGCCAGGGTGCCTTCGGCAGGGTCTATTTGTGCTATGACGTGG
ACACGGGACGTGAACTTGCTTCCAAGCAGGTCCAATTTGATCCAGACAGTCCTGAGA
CAAGCAAGGAGGTGAGTGCTCTGGAGTGCGAGATCCAGTTGCTAAAGAACTTGCAG
CATGAGCGCATCGTGCAGTACTATGGCTGTCTGCGGGACCGCGCTGAGAAGACCCT
GACCATCTTCATGGAGTACATGCCAGGGGGCTCGGTGAAAGACCAGTTGAAGGCTT
ACGGTGCTCTGACAGAGAGCGTGACCCGAAAGTACACGCGGCAGATCCTGGAGGGC
ATGTCCTACCTGCACAGCAACATGATTGTTCACCGGGACATTAAGGGAGCCAACATC
CTCCGAGACTCTGCTGGGAATGTAAAGCTGGGGGACTTTGGGGCCAGCAAACGCCT
GCAGACGATCTGTATGTCGGGGACGGGCATGCGCTCCGTCACTGGCACACCCTACTG
GATGAGCCCTGAGGTGATCAGCGGCGAGGGCTATGGAAGGAAAGCAGACGTGTGG
AGCCTGGGCTGCACTGTGGTGGAGATGCTGACAGAGAAACCACCGTGGGCAGAGTA
TGAAGCTATGGCCGCCATCTTCAAGATTGCCACCCAGCCCACCAATCCTCAGCTGCC
CTCCCACATCTCTGAACATGGCCGGGACTTCCTGAGGCGCATTTTTGTGGAGGCTCG
CCAGAGACCTTCAGCTGAGGAGCTGCTCA
CACACCACTTTGCACAGCTCATGTACTGA

【１１７９】

ヒトＭＥＫＫ４　ＣＤＳ（配列番号２２）

【化２８８】

ATGAGAGAAGCCGCTGCCGCGCTGGTCCCTCCTCCCGCCTTTGCCGTCACGCCTGCC
GCCGCCATGGAGGAGCCGCCGCCACCGCCGCCGCCGCCACCACCGCCACCGGAACC
CGAGACCGAGTCAGAACCCGAGTGCTGCTTGGCGGCGAGGCAAGAGGGCACATTGG
GAGATTCAGCTTGCAAGAGTCCTGAATCTGATCTAGAAGACTTCTCCGATGAAACAA
ATACAGAGAATCTTTATGGTACCTCTCCCCCCAGCACACCTCGACAGATGAAACGCA
TGTCAACCAAACATCAGAGGAATAATGTGGGGAGGCCAGCCAGTCGGTCTAATTTG
AAAGAAAAAATGAATGCACCAAATCAGCCTCCACATAAAGACACTGGAAAAACAGT
GGAGAATGTGGAAGAATACAGCTATAAGCAGGAGAAAAAGATCCGAGCAGCTCTTA
GAACAACAGAGCGTGATCATAAAAAAAATGTACAGTGCTCATTCATGTTAGACTCA
GTGGGTGGATCTTTGCCAAAAAAATCAATTCCAGATGTGGATCTCAATAAGCCTTAC
CTCAGCCTTGGCTGTAGCAATGCTAAGCTTCCAGTATCTGTGCCCATGCCTATAGCC
AGACCTGCACGCCAGACTTCTAGGACTGACTGTCCAGCAGATCGTTTAAAGTTTTTT
GAAACTTTACGACTTTTGCTAAAGCTTACCTCAGTCTCAAAGAAAAAAGACAGGGA
GCAAAGAGGACAAGAAAATACGTCTGGTTTCTGGCTTAACCGATCTAACGAACTGA
TCTGGTTAGAGCTACAAGCCTGGCATGCAGGACGGACAATTAACGACCAGGACTTC
TTTTTATATACAGCCCGTCAAGCCATCCCAGATATTATTAATGAAATCCTTACTTTCA
AAGTCGACTATGGGAGCTTCGCCTTTGTTAGAGATAGAGCTGGTTTTAATGGTACTT
CAGTAGAAGGGCAGTGCAAAGCCACTCCTGGAACAAAGATTGTAGGTTACTCAACA
CATCATGAGCATCTCCAACGCCAGAGGGTCTCATTTGAGCAGGTAAAACGGATAAT
GGAGCTGCTAGAGTACATAGAAGCACTTTATCCATCATTGCAGGCTCTTCAGAAGGA
CTATGAAAAATATGCTGCAAAAGACTTCCAGGACAGGGTGCAGGCACTCTGTTTGTG
GTTAAACATCACAAAAGACTTAAATCAGAAATTAAGGATTATGGGCACTGTTTTGGG
CATCAAGAATTTATCAGACATTGGCTGGCCAGTGTTTGAAATCCCTTCCCCTCGACC
ATCCAAAGGTAATGAGCCGGAGTATGAGGGTGATGACACAGAAGGAGAATTAAAG
GAGTTGGAAAGTAGTACGGATGAGAGTGAAGAAGAACAAATCTCTGATCCTAGGGT
ACCGGAAATCAGACAGCCCATAGATAACAGCTTCGACATCCAGTCGCGGGACTGCA
TATCCAAGAAGCTTGAGAGGCTCGAATCTGAGGATGATTCTCTTGGCTGGGGAGCAC
CAGACTGGAGCACAGAAGCAGGCTTTAGTAGACATTGTCTGACTTCTATTTATAGAC
CATTTGTAGACAAAGCACTGAAGCAGATGGGGTTAAGAAAGTTAATTTTAAGACTTC
ACAAGCTAATGGATGGTTCCTTGCAAAGGGCACGTATAGCATTGGTAAAGAACGAT

【化２８９】

CGTCCAGTGGAGTTTTCTGAATTTCCAGATCCCATGTGGGGTTCAGATTATGTGCAG
TTGTCAAGGACACCACCTTCATCTGAGGAGAAATGCAGTGCTGTGTCGTGGGAGGA
GCTGAAGGCCATGGATTTACCTTCATTCGAACCTGCCTTCCTAGTTCTCTGCCGAGTC
CTTCTGAATGTCATACATGAGTGTCTGAAGTTAAGATTGGAGCAGAGACCTGCTGGA
GAACCATCTCTCTTGAGTATTAAGCAGCTGGTGAGAGAGTGTAAGGAGGTCCTGAA
GGGCGG
CCTGCTGATGAAGCAGTACTACCAGTTCATGCTGCAGGAGGTTCTGGAGGACTTGGA
GAAGCCCGACTGCAACATTGACGCTTTTGAAGAGGATCTACATAAAATGCTTATGGT
GTATTTTGATTACATGAGAAGCTGGATCCAAATGCTACAGCAATTACCTCAAGCATC
GCATAGTTTAAAAAATCTGTTAGAAGAAGAATGGAATTTCACCAAAGAAATAACTC
ATTACATACGGGGAGGAGAAGCACAGGCCGGGAAGCTTTTCTGTGACATTGCAGGA
ATGCTGCTGAAATCTACAGGAAGTTTTTTAGAATTTGGCTTACAGGAGAGCTGTGCT
GAATTTTGGACTAGTGCGGATGACAGCAGTGCTTCCGACGAAATCAGGAGGTCTGTT
ATAGAGATCAGTCGAGCCCTGAAGGAGCTCTTCCATGAAGCCAGAGAAAGGGCTTC
CAAAGCACTTGGATTTGCTAAAATGTTGAGAAAGGACCTGGAAATAGCAGCAGAAT
TCAGGCTTTCAGCCCCAGTTAGAGACCTCCTGGATGTTCTGAAATCAAAACAGTATG
TCAAGGTGCAAATTCCTGGGTTAGAAAACTTGCAAATGTTTGTTCCAGACACTCTTG
CTGAGGAGAAGAGTATTATTTTGCAGTTACTCAATGCAGCTGCAGGAAAGGACTGTT
CAAAAGATTCAGATGACGTACTCATCGATGCCTATCTGCTTCTGACCAAGCACGGTG
ATCGAGCCCGTGATTCAGAGGACAGCTGGGGCACCTGGGAGGCACAGCCTGTCAAA
GTCGTGCCTCAGGTGGAGACTGTTGACACCCTGAGAAGCATGCAGGTGGATAATCTT
TTACTAGTTGTCATGCAGTCTGCGCATCTCACAATTCAGAGAAAAGCTTTCCAGCAG
TCCATTGAGGGACTTATGACTCTGTGCCAGGAGCAGACATCCAGTCAGCCGGTCATC
GCCAAAGCTTTGCAGCAGCTGAAGAATGATGCATTGGAGCTATGCAACAGGATAAG
CAATGCCATTGACCGCGTGGACCACATGTTCACATCAGAATTTGATGCTGAGGTTGA
TGAATCTGAATCTGTCACCTTGCAACAGTACTACCGAGAAGCAATGATTCAGGGGTA
CAATTTTGGATTTGAGTATCATAAAGAAGTTGTTCGTTTGATGTCTGGGGAGTTTAG
ACAGAAGAT
AGGAGACAAATATATAAGCTTTGCCCGGAAGTGGATGAATTATGTCCTGACTAAAT
GTGAGAGTGGTAGAGGTACAAGACCCAGGTGGGCGACTCAAGGATTTGATTTTCTA
CAAGCAATTGAACCTGCCTTTATTTCAGCTTTACCAGAAGATGACTTCTTGAGTTTAC
AAGCCTTGATGAATGAATGCATTGGCCATGTCATAGGAAAACCACACAGTCCTGTTA
CAGGTTTGTACCTTGCCATTCATCGGAACAGCCCCCGTCCTATGAAGGTACCTCGAT
GCCATAGTGACCCTCCTAACCCACACCTCATTATCCCCACTCCAGAGGGATTCAGCA
CTCGGAGCATGCCTTCCGACGCGCGGAGCCATGGCAGCCCTGCTGCTGCTGCTGCTG
CTGCTGCTGCTGCTGTTGCTGCCAGTCGGCCCAGCCCCTCTGGTGGTGACTCTGTGCT
GCCCAAATCCATCAGCAGTGCCCATGATACCAGGGGTTCCAGCGTTCCTGAAAATG
ATCGATTGGCTTCCATAGCTGCTGAATTGCAGTTTAGGTCCCTGAGTCGTCACTCAA
GCCCCACGGAGGAGCGAGATGAACCAGCATATCCAAGAGGAGATTCAAGTGGGTCC
ACAAGAAGAAGTTGGGAACTTCGGACACTAATCAGCCAGAGTAAAGATACTGCTTC
TAAACTAGGACCCATAGAAGCTATCCAGAAGTCAGTCCGATTGTTTGAAGAAAAGA
GGTACCGAGAAATGAGGAGAAAGAATATCATTGGTCAAGTTTGTGATACGCCTAAG
TCCTATGATAATGTTATGCACGTTGGCTTGAGGAAGGTGACCTTCAAATGGCAAAGA
GGAAACAAAATTGGAGAAGGCCAGTATGGGAAGGTGTACACCTGCATCAGCGTCGA
CACCGGGGAGCTGATGGCCATGAAAGAGATTCGATTTCAACCTAATGACCATAAGA
CTATCAAGGAAACTGCAGACGAATTGAAAATATTCGAAGGCATCAAACACCCCAAT

【化２９０】

CTGGTTCGGTATTTTGGTGTGGAGCTCCATAGAGAAGAAATGTACATCTTCATGGAG
TACTGCGATGAGGGGACTTTAGAAGAGGTGTCAAGGCTGGGACTTCAGGAACATGT
GATTAGGCTGTATTCAAAGCAGATCACCATTGCGATCAACGTCCTCCATGAGCATGG
CATAGTCCACCGTGACATTAAAGGTGCCAATATCTTCCTTACCTCATCTGGATTAATC
AAACTGGGAGATTTTGGATGTTCAGTAAAGCTCAAAAACAATGCCCAGACCATGCC
TGGTGAAGTGAACAGCACCCTGGGGACAGCAGCATACATGGCACCTGAAGTCATCA
CTCGTGCCAAAGGAGAGGGCCATGGGCGTGCGGCCGACATCTGGAGTCTGGGGTGT
GTTGTCATAGAGATGGTGACTGGCAAGAGGCCTTGGCATGAGTATGAGCACAACTTT
CAAATTATGTATAAAGTGGGGATGGGACATAAGCCACCAATCCCTGAAAGATTAAG
CCCTGAAGGAAAGGACTTCCTTTCTCACTGCCTTGAGAGTGACCCAAAGATGAGATG
GACCGCCAGCCAGCTCCTCGACCATTCGTTTGTCAA
GGTTTGCACAGATGAAGAATG

【１１８０】

ヒトＭＥＫＫ　６　ＣＤＳ（配列番号２３）

【化２９１】

ATGGCGGGGCCGTGTCCCCGGTCCGGGGCGGAGCGCGCCGGCAGCTGCTGGCAGGA
CCCGCTGGCCGTGGCGCTGAGCCGGGGCCGGCAGCTCGCGGCGCCCCCGGGCCGGG
GCTGCGCGCGGAGCCGGCCGCTCAGCGTGGTCTACGTGCTGACCCGGGAGCCGCAG
CCCGGGCTCGAGCCTCGGGAGGGAACCGAGGCGGAGCCGCTGCCCCTGCGCTGCCT
GCGCGAGGCTTGCGCGCAGGTCCCCCGGCCGCGGCCGCCCCCGCAGCTGCGCAGCC
TGCCCTTCGGGACGCTGGAGCTAGGCGACACCGCGGCTCTGGATGCCTTCTACAACG
CGGATGTGGTGGTGCTGGAGGTGAGCAGCTCGCTGGTACAGCCCTCCCTGTTCTACC
ACCTTGGTGTGCGTGAGAGCTTCAGCATGACCAACAATGTGCTCCTCTGCTCCCAGG
CCGACCTCCCTGACCTGCAGGCCCTGCGGGAGGATGTTTTCCAGAAGAACTCGGATT
GCGTTGGCAGCTACACACTGATCCCCTATGTGGTGACGGCCACTGGTCGGGTGCTGT
GTGGTGATGCAGGCCTTCTGCGGGGCCTGGCTGATGGGCTGGTACAGGCTGGAGTG
GGGACCGAGGCCCTGCTCACTCCCCTGGTGGGCCGGCTTGCCCGCCTGCTGGAGGCC
ACACCCACAGACTCTTGTGGCTATTTCCGGGAGACCATTCGGCGGGACATCCGGCAG
GCGCGGGAGCGGTTCAGTGGGCCACAGCTGCGGCAGGAGCTGGCTC
GCCTGCAGCGGAGACTGGACAGCGTGGAGCTGCTGAGCCCCGACATCATCATGAAC
TTGCTGCTCTCCTACCGCGATGTGCAGGACTACTCGGCCATCATTGAGCTGGTGGAG
ACGCTGCAGGCCTTGCCCACCTGTGATGTGGCCGAGCAGCATAATGTCTGCTTCCAC
TACACTTTTGCCCTCAACCGGAGGAACAGGCCTGGGGACCGGGCGAAGGCCCTGTC
TGTGCTGCTGCCGCTGGTACAGCTTGAGGGCTCTGTGGCGCCCGATCTGTACTGCAT
GTGTGGCCGTATCTACAAGGACATGTTCTTCAGCTCGGGTTTCCAGGATGCTGGGCA
CCGGGAGCAGGCCTATCACTGGTATCGCAAGGCTTTTGACGTAGAGCCCAGCCTTCA
CTCAGGCATCAATGCAGCTGTGCTCCTCATTGCTGCCGGGCAGCACTTTGAGGATTC
CAAAGAGCTCCGGCTAATAGGCATGAAGCTGGGCTGCCTGCTGGCCCGCAAAGGCT
GCGTGGAGAAGATGCAGTATTACTGGGATGTGGGTTTCTACCTGGGAGCCCAGATCC
TCGCCAATGACCCCACCCAGGTGGTGCTGGCTGCAGAGCAGCTGTATAAGCTCAAT
GCCCCCATATGGTACCTGGTGTCCGTGATGGAGACCTTCCTGCTCTACCAGCACTTC
AGGCCCACGCCAGAGCCCCCTGGAGGGCCACCACGCCGTGCCCACTTCTGGCTCCA
CTTCTTGCTACAGTCCTGCCAACCATTCAAGACAGCCTGTGCCCAGGGCGACCAGTG
CTTGGTGCTGGTCCTGGAGATGAACAAGGTGCTGCTGCCTGCAAAGCTCGAGGTTCG
GGGTACTGACCCAGTAAGCACAGTGACCCTGAGCCTGCTGGAGCCTGAGACCCAGG
ACATTCCCTCCAGCTGGACCTTCCCAGTCGCCTCCATATGCGGAGTCAGCGCCTCAA
AGCGCGACGAGCGCTGCTGCTTCCTCTATGCACTCCCCCCGGCTCAGGACGTCCAGC

【化２９２】

TGTGCTTCCCCAGCGTAGGGCACTGCCAGTGGTTCTGCGGCCTGATCCAGGCCTGGG
TGACGAACCCGGATTCCACGGCGCCCGCGGAGGAGGCGGAGGGCGCGGGGGAGAT
GTTGGAGTTTGATTATGA
GTACACGGAGACGGGCGAGCGGCTGGTGCTGGGCAAGGGCACGTATGGGGTGGTGT
ACGCGGGCCGCGATCGCCACACGAGGGTGCGCATCGCCATCAAGGAGATCCCGGAG
CGGGACAGCAGGTTCTCTCAGCCCCTGCATGAAGAGATCGCTCTTCACAGACGCCTG
CGCCACAAGAACATAGTGCGCTATCTGGGCTCAGCTAGCCAGGGCGGCTACCTTAA
GATCTTCATGGAGGAAGTGCCTGGAGGCAGCCTGTCCTCCTTGCTGCGGTCGGTGTG
GGGACCCCTGAAGGACAACGAGAGCACCATCAGTTTCTACACCCGCCAGATCCTGC
AGGGACTTGGCTACTTGCACGACAACCACATCGTGCACAGGGACATAAAAGGGGAC
AATGTGCTGATCAACACCTTCAGTGGGCTGCTCAAGATTTCTGACTTCGGCACCTCC
AAGCGGCTGGCAGGCATCACACCTTGCACTGAGACCTTCACAGGAACTCTGCAGTA
TATGGCCCCAGAAATCATTGACCAGGGCCCACGCGGGTATGGGAAAGCAGCTGACA
TCTGGTCACTGGGCTGCACTGTCATTGAGATGGCCACAGGTCGCCCCCCCTTCCACG
AGCTCGGGAGCCCACAGGCTGCCATGTTTCAGGTGGGTATGTACAAGGTCCATCCGC
CAATGCCCAGCTCTCTGTCGGCCGAGGCCCAAGCCTTTCTCCTCCGAACTTTTGAGC
CAGACCCCCGCCTCCGAGCCAGCGCCCAGACACTGCTGGGGGACCCCTTCCTGCAG
CCTGGGAAAAGGAGCCGCAGCCCCAGCTCCCCACGACATGCTCCACGGCCCTCAGA
TGCCCCTTCTGCCAGTCCCACTCCTTCAGCCAACTCAACCACCCAGTCTCAGACATTC
CCGTGCCCTCAGGCACCCTCTCAGCACCCACCCAGCCCCCCGAAGCGCTGCCTCAGT
TATGGGGGCACCAGCCAGCTCCGGGTGCCCGAGGAGCCTGCGGCCGAGGAGCCTGC
GTCTCCGGAGGAGAGTTCGGGGCTGAGCCTGCTGCACCAGGAGAGCAAGCGTCGGG
CCATGCTGGCCGCAGTATTGGAGCAGGAGCTGCCAGCGCTGGCGGAGAATCTGCAC
CAGGAGCAGAAGCAAGAGCAGGGGGCCCGTCTGGGCAGAAACCATGTGGAAGAGC
TGCTGCGCTGCCTCGGGGCACACATCCACACTCCCAACCGCCGGCAGCTCGCCCAGG
AGCTGCGGGCGCTGCAAGGACGGCTGAGGGCCCAGGGCCTTGGGCCTGCGCTTCTG
CACAGACCGCTGTTTGCCTTCCCGGATGCGGTGAAGCAGATCCTCCGCAAGCGCCAG
ATCCGTCCACACTGGATGTTCGTTCTGGACTCACTGCTCAGCCGTGCTGTGCGGGCA
GCCCTGGGTGTGCTAGGACCGGAGGTGGAGAAGGAGGCGGTCTCACCGAGGTCAGA
GGAGCTGAGTAATGAAGGGGACTCCCAGCAGAGCCCAGGCCAGCAGAGCCCGCTTC
CGGTGGAGCCCGAGCAGGGCCCCGCTCCTCTGATGGTGCAGCTGAGCCTCTTGAGG
GCAGAGACTGATCGGCTGCGCGAAATCCTGG
CGGGGAAGGAACGGGAGTACCAGGCCCTGGTGCAGCGGGCTCTACAGCGGCTGAAT
GAGGAAGCCCGGACCTATGTCCTGGCCCCAGAGCCTCCAACTGCTCTTTCAACGGAC
CAGGGCCTGGTGCAGTGGCTACAGGAACTGAATGTGGATTCAGGCACCATCCAAAT
GCTGTTGAACCATAGCTTCACCCTCCACACTCTGCTCACCTATGCCACTCGAGATGA
CCTCATCTACACCCGCATCAGGGGAGGGATGGTATGCCGCATCTGGAGGGCCATCTT
GGCACAGCGAGCAGGATCCACACCAGTCACCTCTGGACCCTGA

【１１８１】

ヒトＭＥＫＫ７　ＣＤＳ（配列番号２４）

【化２９３】

ATGTCTACAGCCTCTGCCGCCTCCTCCTCCTCCTCGTCTTCGGCCGGTGAGATGATCG
AAGCCCCTTCCCAGGTCCTCAACTTTGAAGAGATCGACTACAAGGAGATCGAGGTG
GAAGAGGTTGTTGGAAGAGGAGCCTTTGGAGTTGTTTGCAAAGCTAAGTGGAGAGC
AAAAGATGTTGCTATTAAACAAATAGAAAGTGAATCTGAGAGGAAAGCGTTTATTG
TAGAGCTTCGGCAGTTATCCCGTGTGAACCATCCTA
ATATTGTAAAGCTTTATGGAGCCTGCTTGAATCCAGTGTGTCTTGTGATGGAATATG
CTGAAGGGGGCTCTTTATATAATGTGCTGCATGGTGCTGAACCATTGCCATATTATA
CTGCTGCCCACGCAATGAGTTGGTGTTTACAGTGTTCCCAAGGAGTGGCTTATCTTC
ACAGCATGCAACCCAAAGCGCTAATTCACAGGGACCTGAAACCACCAAACTTACTG
CTGGTTGCAGGGGGGACAGTTCTAAAAATTTGTGATTTTGGTACAGCCTGTGACATT
CAGACACACATGACCAATAACAAGGGGAGTGCTGCTTGGATGGCACCTGAAGTTTT
TGAAGGTAGTAATTACAGTGAAAAATGTGACGTCTTCAGCTGGGGTATTATTCTTTG
GGAAGTGATAACGCGTCGGAAAC
CCTTTGATGAGATTGGTGGCCCAGCTTTCCGAATCATGTGGGCTGTTCATAATGGTA
CTCGACCACCACTGATAAAAAATTTACCTAAGCCCATTGAGAGCCTGATGACTCGTT
GTTGGTCTAAAGATCCTTCCCAGCGCCCTTCAATGGAGGAAATTGTGAAAATAATGA
CTCACTTGATGCGGTACTTTCCAGGAGCAGATGAGCCATTACAGTATCCTTGTCAGT
ATTCAGATGAAGGACAGAGCAACTCTGCCACCAGTACAGGCTCATTCATGGACATT
GCTTCTACAAATACGAGTAACAAAAGTGACACTAATATGGAGCAAGTTCCTGCCAC
AAATGATACTATTAAGCGCTTAGAATCAAAATTGTTGAAAAATCAGGCAAAGCAAC
AGAGTGAATCTGGACGTTTAAGCTTGGGAGCCTCCCGTGGGAGCAGTGTGGAGAGC
TTGCCCCCAACCTCTGAGGGCAAGAGGATGAGTGCTGACATGTCTGAAATAGAAGC
TAGGATCGCCGCAACCACAGGCAACGGACAGCCAAGACGTAGATCCATCCAAGACT
TGACTGTAACTGGAACAGAACCTGGTCAGGTGAGCAGTAGGTCATCCAGTCCCAGT
GTCAGAATGATTACTACCTCAGGACCAACCTCAGAAAAGCCAACTCGAAGTCATCC
ATGGACCCCTGATGATTCCACAGATACCAATGGATCAGATAACTCCATCCCAATGGC
TTATCTTACACTGGATCACCAACTACAGCCTCTAGCACCGTGCCCAAACTCCAAAGA
ATCTATGGCAGTGTTTGAACAGCATTGTAAAATGGCACAAGAATATATGAAAGTTCA
AACAGAAATTGCATTGTTATTACAGAGAAAGCAAGAACTAGTTGCAGAACTGGACC
AGGATGAAAAGGACCAGCAAAATACATCTCGCCTGGTACAGGAACATAAAAAGCTT
TTAGATGAAAACAAAAGCCTTTCTACTTACTACCAGCAATGCAAAAAACAACTAGA
GGTCATCAGAAGTCAGCAGCAGAAACGACAAGGCACTTCATGA

【１１８２】

ヒトＭＫ２　ＣＤＳ（配列番号２５）

【化２９４】

ATGCTGTCCAACTCCCAGGGCCAGAGCCCGCCGGTGCCGTTCCCCGCCCCGGCCCCG
CCGCCGCAGCCCCCCACCCCTGCCCTGCCGCACCCCCCGGCGCAGCCGCCGCCGCCG
CCCCCGCAGCAGTTCCCGCAGTTCCACGTCAAGTCCGGCCTGCAGATCAAGAAGAA
CGCCATCATCGATGACTACAAGGTCACCAGCCAGGTCCTGGGGCTGGGCATCAACG
GCAAAGTTTTGCAGATCTTCAACAAGAGGACCCAGGAGAAATTCGCCCTCAAAATG
CTTCAGGACTGCCCCAAGGCCCGCAGGGAGGTGGAGCTGCACTGGCGGGCCTCCCA
GTGCCCGCACATCGTACGGATCGTGGATGTGTACGAGAATCTGTACGCAGGGAGGA
AGTGCCTGCTGATTGTCATGGAATGTTTGGACGGTGGAGAACTCTTTAGCCGAATCC
AGGATCGAGGAGACCAGGCATTCACAGAAAGAGAAGCATCCGAAATCATGAAGAG
CATCGGTGAGGCCATCCAGTATCTGCATTCAATCAACATTGCCCATCGGGATGTCAA
GCCTGAGAATCTCTTATACACCTCCAAAAGGCCCAACGCCATCCTGAAACTCACTGA
CTTTGGCTTTGCCAAGGAAACCACCAGCCACAACTCTTTGACCACTCCTTGTTATAC
ACCGTACTATGTGGCTCCAGAAGTGCTGGGTCCAGAGAAGTATGACAAGTCCTGTG
ACATGTGGTCCCTGGGTGTCATCATGTACATCCTGCTGTGTGGGTATCCCCCCTTCTA
CTCCAACCACGGCCTTGCCATCTCTCCGGGCATGAAGACTCGCATCCGAATGGGCCA
GTATGAATTTCCCAACCCAGAATGGTCAGAAGTATCAGAGGAAGTGAAGATGCTCA
TTCGGAATCTGCTGAAAACAGAGCCCACCCAGAGAATGACCATCACCGAGTTTATG
AACCACCCTTGGATCATGCAATCAACAAAGGTCCCTCAAACCCCACTGCACACCAG
CCGGGTCCTGAAGGAGGACAAGGAGCGGTGGGAGGATGTCAAGGGGTGTCTTCATG
ACAAGAACAGCGACCAGGCCACTTGGCTGACCAGGTTGTGA

【１１８３】

ヒトＭｙＤ８８　ＣＤＳ（配列番号２６）

【化２９５】

ATGCGACCCGACCGCGCTGAGGCTCCAGGACCGCCCGCCATGGCTGCAGGAGGTCC
CGGCGCGGGGTCTGCGGCCCCGGTCTCCTCCACATCCTCCCTTCCCCTGGCTGCTCTC
AACATGCGAGTGCGGCGCCGCCTGTCTCTGTTCTTGAACGTGCGGACACAGGTGGCG
GCCGACTGGACCGCGCTGGCGGAGGAGATGGACTTTGAGTACTTGGAGATCCGGCA
ACTGGAGACACAAGCGGACCCCACTGGCAGGCTGCTGGACGCCTGGCAGGGACGCC
CTGGCGCCTCTGTAGGCCGACTGCTCGAGCTGCTTACCAAGCTGGGCCGCGACGACG
TGCTGCTGGAGCTGGGACCCAGCATTGAGGAGGATTGCCAAAAGTATATCTTGAAG
CAGCAGCAGGAGGAGGCTGAGAAGCCTTTACAGGTGGCCGCTGTAGACAGCAGTGT
CCCACGGACAGCAGAGCTGGCGGGCATCACCACACTTGATGACCCCCTGGGGCATA
TGCCTGAGCGTTTCGATGCCTTCATCTGCTATTGCCCCAGCGACATCCAGTTTGTGCA
GGAGATGATCCGGCAACTGGAACAGACAAACTATCGACTGAAGTTGTGTGTGTCTG
ACCGCGATGTCCTGCCTGGCACCTGTGTCTGGTCTATTGCTAGTGAGCTCATCGAAA
AGAGGTTGGCTAGAAGGCCACGGGGTGGGTGCCGCCGGATGGTGGTGGTTGTCTCT
GATGATTACCTGCAGAGCAAGGAATGTGACTTCCAGACCAAATTTGCACTCAGCCTC
TCTCCAGGTGCCCATCAGAAGCGACTGATCCCCATCAAGTACAAGGCAATGAAGAA
AGAGTTCCCCAGCATCCTGAGGTTCATCACTGTCTGCGACTACACCAACCCCTGCAC
CAAATCTTGGTTCTGGACTCGCCTTGCCAAGGCCTTGTCCCTGCCCTGA

【１１８４】

ヒトＮＦ－κＢ　ＣＤＳ（配列番号２７）

【化２９６】

ATGGCAGAAGATGATCCATATTTGGGAAGGCCTGAACAAATGTTTCATTTGGATCCT
TCTTTGACTCATACAATATTTAATCCAGAAGTATTTCAACCACAGATGGCACTGCCA
ACAGATGGCCCATACCTTCAAATATTAGAGCAACCTAAACAGAGAGGATTTCGTTTC
CGTTATGTATGTGAAGGCCCATCCCATGGTGGACTACCTGGTGCCTCTAGTGAAAAG
AACAAGAAGTCTTACCCTCAGGTCAAAATCTGCAACTATGTGGGACCAGCAAAGGT
TATTGTTCAGTTGGTCACAAATGGAAAAAATATCCACCTGCATGCCCACAGCCTGGT
GGGAAAACACTGTGAGGATGGGATCTGCACTGTAACTGCTGGACCCAAGGACATGG
TGGTCGGCTTCGCAAACCTGGGTATACTTCATGTGACAAAGAAAAAAGTATTTGAAA
CACTGGAAGCACGAATGACAGAGGCGTGTATAAGGGGCTATAATCCTGGACTCTTG
GTGCACCCTGACCTTGCCTATTTGCAAGCAGAAGGTGGAGGGGACCGGCAGCTGGG
AGATCGGGAAAAAGAGCTAATCCGCCAAGCAGCTCTGCAGCAGACCAAGGAGATG
GACCTCAGCGTGGTGCGGCTCATGTTTACAGCTTTTCTTCCGGATAGCACTGGCAGC
TTCACAAGGCGCCTGGAACCCGTGGTATCAGACGCCATCTATGACAGTAAAGCCCC
CAATGCATCCAACTTGAAAATTGTAAGAATGGACAGGACAGCTGGATGTGTGACTG
GAGGGGAGGAAATTTATCTTCTTTGTGACAAAGTTCAGAAAGATGACATCCAGATTC
GATTTTATGAAGAGGAAGAAAATGGTGGAGTCTGGGAAGGATTTGGAGATTTTTCC
CCCACAGATGTTCATAGACAATTTGCCATTGTCTTCAAAACTCCAAAGTATAAAGAT
ATTAATATTACAAAACCAGCCTCTGTGTTTGTCCAGCTTCGGAGGAAATCTGACTTG
GAAACTAGTGAACCAAAACCTTTCCTCTACTATCCTGAAATCAAAGATAAAGAAGA
AGTGCAGAGGAAACGTCAGAAGCTCATGCCCAATTTTTCGGATAGTTTCGGCGGTGG
TAGTGGTGCTGGAGCTGGAGGCGGAGGCATGTTTGGTAGTGGCGGTGGAGGAGGGG
GCACTGGAAGTACAGGTCCAGGGTATAGCTTCCCACACTATGGATTTCCTACTTATG

【化２９７】

GTGGGATTACTTTCCATCCTGGAACTACTAAATCTAATGCTGGGATGAAGCATGGAA
CCATGGACACTGAATCTAAAAAGGACCCTGAAGGTTGTGACAAAAGTGATGACAAA
AACACTGTAAACCTCTTTGGGAAAGTTATTGAAACCACAGAGCAAGATCAGGAGCC
CAGCGAGGCCACCGTTGGGAATGGTGAGGTCACTCTAACGTATGCAACAGGAACAA
AAGAAGAGAGTGCTGGAGTTCAGGATAACCTCTTTCTAGAGAAGGCTATGCAGCTT
GCAAAGAGGCATGCCAATGCCCTTTTCGACTACGCGGTGACAGGAGACGTGAAGAT
GCTGCTGGCCGTCCAGCGCCATCTCACTGCTGTGCAGGATGAGAATGGGGACAGTGT
CTTACACTTAGCAATCATCCACCTTCATTCTCAACTTGTGAGGGATCTACTAGAAGTC
ACATCTGGTTTGATTTCTGATGACATTATCAACATGAGAAATGATCTGTACCAGACG
CCCTTGCACTTGGCAGTGATCACTAAGCAGGAAGATGTGGTGGAGGATTTGCTGAG
GGCTGGGGCCGACCTGAGCCTTCTGGACCGCTTGGGTAACTCTGTTTTGCACCTAGC
TGCCAAAGAAGGACATGATAAAGTTCTCAGTATCTTACTCAAGCACAAAAAGGCAG
CACTACTTCTTGACCACCCCAACGGGGACGGTCTGAATGCCATTCATCTAGCCATGA
TGAGCAATAGCCTGCCATGTTTGCTGCTGCTGGTGGCCGCTGGGGCTGACGTCAATG
CTCAGGAGCAGAAGTCCGGGCGCACAGCACTGCACCTGGCTGTGGAGCACGACAAC
ATCTCATTGGCAGGCTGCCTGCTCCTGGAGGGTGATGCCCATGTGGACAGTACTACC
TACGATGGAACCACACCCCTGCATATAGCAGCTGGGAGAGGGTCCACCAGGCTGGC
AGCTCTTCTCAAAGCAGCAGGAGCAGATCCCCTGGTGGAGAACTTTGAGCCTCTCTA
TGACCTGGATGACTCTTGGGAAAATGCAGGAGAGGATGAAGGAGTTGTGCCTGGAA
CCACGCCTCTAGATATGGCCACCAGCTGGCAGGTATTTGACATATTAAATGGGAAAC
CATATGAGCCAGAGTTTACATCTGATGATTTACTAGCACAAGGAGACATGAAACAG
CTGGCTGAAGATGTGAAGCTGCAGCTGTATAAGTTACTAGAAATTCCTGATCCAGAC
AAAAACTGGGCTACTCTGGCGCAGAAATTAGGTCTGGGGATACTTAATAATGCCTTC
CGGCTGAGTCCTGCTCCTTCCAAAACACTTATGGACAACTATGAGGTCTCTGGGGGT
ACAGTCAGAGAGCTGGTGGAGGCCCTGAGACAAATGGGCTACACCGAAGCAATTGA
AGTGATCCAGGCAGCCTCCAGCCCAGTGAAGACCACCTCTCAGGCCCACTCGCTGCC
TCTCTCGCCTGCCTCCACAAGGCAGCAAATAGACGAGCTCCGAGACAGTGACAGTG
TCTGCGACAGCGGCGTGGAGACATCCTTCCGCAAACTCAGCTTTACCGAGTCTCTGA
CCAGTGGTGCCTCACTGCTAACTCTCAACAAAATGCCCCATGATTATGGGCAGGAAG
GACCTCTAGAAGGCAAAATTTAG

【１１８５】
ヒトＮＩＫ　ＣＤＳ（配列番号２８）
【化２９８】
ATGGCAGTGATGGAAATGGCCTGCCCAGGTGCCCCTGGCTCAGCAGTGGGGCAGCA
GAAGGAACTCCCCAAAGCCAAGGAGAAGACGCCGCCACTGGGGAAGAAACAGAGC
TCCGTCTACAAGCTTGAGGCCGTGGAGAAGAGCCCTGTGTTCTGCGGAAAGTGGGA
GATCCTGAATGACGTGATTACCAAGGGCACAGCCAAGGAAGGCTCCGAGGCAGGGC
CAGCTGCCATCTCTATCATCGCCCAGGCTGAGTGTGAGAATAGCCAAGAGTTCAGCC
CCACCTTTTCAGAACGCATTTTCATCGCTGGGTCCAAACAGTACAGCCAGTCCGAGA
GTCTTGATCAGATCCCCAACAATGTGGCCCATGCTACAGAGGGCAAAATGGCCCGT
GTGTGTTGGAAGGGAAAGCGTCGCAGCAAAGCCCGGAAGAAACGGAAGAAGAAGA
GCTCAAAGTCCCTGGCTCATGCAGGAGTGGCCTTGGCCAAACCCCTCCCCAGGACCC
CTGAGCAGGAGAGCTGCACCATCCCAGTGCAGGAGGATGAGTCTCCACTCGGCGCC
CCATATGTTAGAAACACCCCGCAGTTCACCAAGCCTCTGAAGGAACCAGGCCTTGG
GCAACTCTGTTTTAAGCAGCTTGGCGAGGGCCTACGGCCGGCTCTGCCTCGATCAGA
ACTCCACAAACTGATCAGCCCCTTGCAATGTCTGAACCACGTGTGGAAACTGCACCA

【化２９９】

CCCCCAGGACGGAGGCCCCCTGCCCCTGCCCACGCACCCCTTCCCCTATAGCAGACT
GCCTCATCCCTTCCCATTCCACCCTCTCCAGCCCTGGAAACCTCACCCTCTGGAGTCC
TTCCTGGGCAAACTGGCCTGTGTAGACAGCCAGAAACCCTTGCCTGACCCACACCTG
AGCAAACTGGCCTGTGTAGACAGTCCAAAGCCCCTGCCTGGCCCACACCTGGAGCC
CAGCTGCCTGTCTCGTGGTGCCCATGAGAAGTTTTCTGTGGAGGAATACCTAGTGCA
TGCTCTGCAAGGCAGCGTGAGCTCAGGCCAGGCCCACAGCCTGACCAGCCTGGCCA
AGACCTGGGCAGCAAGGGGCTCCAGATCCCGGGAGCCCAGCCCCAAAACTGAGGAC
AACGAGGGTGTCCTGCTCACTGAGAAACTCAAGCCAGTGGATTATGAGTACCGAGA
AGAAGTCCACTGGGCCACGCACCAGCTCCGCCTGGGCAGAGGCTCCTTCGGAGAGG
TGCACAGGATGGAGGACAAGCAGACTGGCTTCCAGTGCGCTGTCAAAAAGGTGCGG
CTGGAAGTATTTCGGGCAGAGGAGCTGATGGCATGTGCAGGATTGACCTCACCCAG
AATTGTCCCTTTGTATGGAGCTGTGAGAGAAGGGCCTTGGGTCAACATCTTCATGGA
GCTGCTGGAAGGTGGCTCCCTGGGCCAGCTGGTCAAGGAGCAGGGCTGTCTCCCAG
AGGACCGGGCCCTGTACTACCTGGGCCAGGCCCTGGAGGGTCTG
GAATACCTCCACTCACGAAGGATTCTGCATGGGGACGTCAAAGCTGACAACGTGCT
CCTGTCCAGCGATGGGAGCCACGCAGCCCTCTGTGACTTTGGCCATGCTGTGTGTCT
TCAACCTGATGGCCTGGGAAAGTCCTTGCTCACAGGGGACTACATCCCTGGCACAG
AGACCCACATGGCTCCGGAGGTGGTGCTGGGCAGGAGCTGCGACGCCAAGGTGGAT
GTCTGGAGCAGCTGCTGTATGATGCTGCACATGCTCAACGGCTGCCACCCCTGGACT
CAGTTCTTCCGAGGGCCGCTCTGCCTCAAGATTGCCAGCGAGCCTCCGCCTGTGAGG
GAGATCCCACCCTCCTGCGCCCCTCTCACAGCCCAGGCCATCCAAGAGGGGCTGAG
GAAAGAGCCCATCCACCGCGTGTCTGCAGCGGAGCTGGGAGGGAAGGTGAACCGG
GCACTACAGCAAGTGGGAGGTCTGAAGAGCCCTTGGAGGGGAGAATATAAAGAACC
AAGACATCCACCGCCAAATCAAGCCAATTACCACCAGACCCTCCATGCCCAGCCGA
GAGAGCTTTCGCCAAGGGCCCCAGGGCCCCGGCCAGCTGAGGAGACAACAGGCAG
AGCCCCTAAGCTCCAGCCTCCTCTCCCACCAGAGCCCCCAGAGCCAAACAAGTCTCC
TCCCTTGACTTTGAGCAAGGAGGAGTCTGGGATGTGGGAACCCTTACCTCTGTCCTC
CCTGGAGCCAGCCCCTGCCAGAAACCCCAGCTCACCAGAGCGGAAAGCAACCGTCC
CGGAGCAGGAACTGCAGCAGCTGGAAATAGAATTATTCCTCAACAGCCTGTCCCAG
CCATTTTCTCTGGAGGAGCAGGAGCAAATTCTCTCGTGCCTCAGCATCGACAGCCTC
TCCCTGTCGGATGACAGTGAGAAGAACCCATCAAAGGCCTCTCAAAGCTCGCGGGA
CACCCTGAGCTCAGGCGTACACTCCTGGAGCAGCCAGGCCGAGGCTCGAAGCTCCA
GCTGGAACATGGTGCTGGCCCGGGGGCGGCCCACCGACACCCCAAGCTATTTCAAT
GGTGTGAAAGTCCAAATACAGTCTCTTAATGGTGAACACCTGCACATCCGGGAGTTC
CACCGGGTCAAAGTGGGAGACATCGCCACTGGCATCAGCAGCCAGATCCCAGCTGC
AGCCTTCAGCTTGGTCACCAAAGACGGGCAGCCTGTTCGCTACGACATGGAGGTGC
CAGACTCGGGCATCGACCTGCAGTGCACACTGGCCCCTGATGGCAGCTTCGCCTGGA
GCTGGAGGGTCAAGCATGGCCAGCTGGAGAACAGGCCCTAA

【１１８６】

ヒトｐ３８　ＣＤＳ（配列番号２９）

【化３００】

ATGTCTCAGGAGAGGCCCACGTTCTACCGGCAGGAGCTGAACAAGACAATCTGGGA
GGTGCCCGAGCGTTACCAGAACCTGTCTCCAGTGGGCTCTGGCGCCTATGGCTCTGT
GTGTGCTGCTTTTGACACAAAAACGGGGTTACGTGTGGCAGTGAAGAAGCTCTCCAG
ACCATTTCAGTCCATCATTCATGCGAAAAGAACCTACAGAGAACTGCGGTTACTTAA
ACATATGAAACATGAAAATGTGATTGGTCTGTTGGACGTTTTTACACCTGCAAGGTC
TCTGGAGGAATTCAATGATGTGTATCTGGTGACCCATCTCATGGGGGCAGATCTGAA
CAACATTGTGAAATGTCAGAAGCTTACAGATGACCATGTTCAGTTCCTTATCTACCA
AATTCTCCGAGGTCTAAAGTATATACATTCAGCTGACATAATTCACAGGGACCTAAA
ACCTAGTAATCTAGCTGTGAATGAAGACTGTGAGCTGAAGATTCTGGATTTTGGACT
GGCTCGGCACACAGATGATGAAATGACAGGCTACGTGGCCACTAGGTGGTACAGGG
CTCCTGAGATCATGCTGAACTGGATGCATTACAACCAGACAGTTGATATTTGGTCAG
TGGGATGCATAATGGCCGAGCTGTTGACTGGAAGAACATTGTTTCCTGGTACAGACC
ATATTAACCAGCTTCAGCAGATTATGCGTCTGACAGGAACACCCCCCGCTTATCTCA
TTAACAGGATGCCAAGCCATGAGGCAAGAAACTATATTCAGTCTTTGACTCAGATGC
CGAAGATGAACTTTGCGAATGTATTTATTGGTGCCAATCCCCTGGCTGTCGACTTGC
TGGAGAAGATGCTTGTATTGGACTCAGATAAGAGAATTACAGCGGCCCAAGCCCTT
GCACATGCCTACTTTGCTCAGTACCACGATCCTGATGATGAACCAGTGGCCGATCCT
TATGATCAGTCCTTTGAAAGCAGGGACCTCCTTATAGATGAGTGGAAAAGCCTGACC
TATGATGAAGTCATCAGCTTTGTGCCACCACCCCTTGACCAAGAAGAGATGGAGTCC
TGA

【１１８７】

ヒトＰＫＲ　ＣＤＳ（配列番号３０）

【化３０１】

ATGGCTGGTGATCTTTCAGCAGGTTTCTTCATGGAGGAACTTAATACATACCG
TCAGAAGCAGGGAGTAGTACTTAAATATCAAGAACTGCCTAATTCAGGACCTCCAC
ATGATAGGAGGTTTACATTTCAAGTTATAATAGATGGAAGAGAATTTCCAGAAGGT
GAAGGTAGATCAAAGAAGGAAGCAAAAAATGCCGCAGCCAAATTAGCTGTTGAGAT
ACTTAATAAGGAAAAGAAGGCAGTTAGTCCTTTATTATTGACAACAACGAATTCTTC
AGAAGGATTATCCATGGGGAATTACATAGGCCTTATCAATAGAATTGCCCAGAAGA
AAAGACTAACTGTAAATTATGAACAGTGTGCATCGGGGGTGCATGGGCCAGAAGGA
TTTCATTATAAATGCAAAATGGGACAGAAAGAATATAGTATTGGTACAGGTTCTACT
AAACAGGAAGCAAAACAATTGGCCGCTAAACTTGCATATCTTCAGATATTATCAGA
AGAAACCTCAGTGAAATCTGACTACCTGTCCTCTGGTTCTTTTGCTACTACGTGTGAG
TCCCAAAGCAACTCTTTAGTGACCAGCACACTCGCTTCTGAATCATCATCTGAAGGT
GACTTCTCAGCAGATACATCAGAGATAAATTCTAACAGTGACAGTTTAAACAGTTCT
TCGTTGCTTATGAATGGTCTCAGAAATAATCAAAGGAAGGCAAAAAGATCTTTGGC
ACCCAGATTTGACCTTCCTGACATGAAAGAAACAAAGTATACTGTGGACAAGAGGT
TTGGCATGGATTTTAAAGAAATAGAATTAATTGGCTCAGGTGGATTTGGCCAAGTTT
TCAAAGCAAAACACAGAATTGACGGAAAGACTTACGTTATTAAACGTGTTAAATAT
AATAACGAGAAGGCGGAGCGTGAAGTAAAAGCATTGGCAAAACTTGATCATGTAAA
TATTGTTCACTACAATGGCTGTTGGGATGGATTTGATTATGATCCTGAGACCAGTGA
TGATTCTCTTGAGAGCAGTGATTATGATCCTGAGAACAGCAAAAATAGTTCAAGGTC
AAAGACTAAGTGCCTTTTCATCCAAATGGAATTCTGTGATAAAGGGACCTTGGAACA
ATGGATTGAAAAAAGAAGAGGCGAGAAACTAGACAAAGTTTTGGCTTTGGAACTCT
TTGAACAAATAACAAAAGGGGTGGATTATATACATTCAAAAAAATTAATTCATAGA
GATCTTAAGCCAAGTAATATATTCTTAGTAGATACAAAACAAGTAAAGATTGGAGA
CTTTGGACTTGTAACATCTCTGAAAAATGATGGAAAGCGAACAAGGAGTAAGGGAA
CTTTGCGATACATGAGCCCAGAACAGATTTCTTCGCAAGACTATGGAAAGGAAGTG
GACCTCTACGCTTTGGGGCTAATTCTTGCTGAACTTCTTCATGTATGTGACACTGCTT
TTGAAACATCAAAGTTTTTCACAGACCTACGGGATGGCATCATCTCAGATATATTTG
ATAAAAAAGAAAAAACTCTTCTACAGAAATTACTCTCAAAGAAACCTGAGGATCGA
CCTAACACATCTGAAATACTAAGGACCTTGACTGTGTGGAAGAAAAGCCCAGAGAA
AAATGAACGACACACATGTTAG

【１１８８】

ヒトＲａｃ　ＣＤＳ（配列番号３１）

【化３０２】

ATGAGCGACGTGGCTATTGTGAAGGAGGGTTGGCTGCACAAACGAGGGGAGTACAT
CAAGACCTGGCGGCCACGCTACTTCCTCCTCAAGAATGATGGCACCTTCATTGGCTA
CAAGGAGCGGCCGCAGGATGTGGACCAACGTGAGGCTCCCCTCAACAACTTCTCTG
TGGCGCAGTGCCAGCTGATGAAGACGGAGCGGCCCCGGCCCAACACCTTCATCATC
CGCTGCCTGCAGTGGACCACTGTCATCGAACGCACCTTCCATGTGGAGACTCCTGAG
GAGCGGGAGGAGTGGACAACCGCCATCCAGACTGTGGCTGACGGCCTCAAGAAGCA
GGAGGAGGAGGAGATGGACTTCCGGTCGGGCTCACCCAGTGACAACTCAGGGGCTG
AAGAGATGGAGGTGTCCCTGGCCAAGCCCAAGCACCGCGTGACCATGAACGAGTTT
GAGTACCTGAAGCTGCTGGGCAAGGGCACTTTCGGCAAGGTGATCCTGGTGAAGGA
GAAGGCCACAGGCCGCTACTACGCCATGAAGATCCTCAAGAAGGAAGTCATCGTGG
CCAAGGACGAGGTGGCCCACACACTCACCGAGAACCGCGTCCTGCAGAACTCCAGG
CACCCCTTCCTCACAGCCCTGAAGTACTCTTTCCAGACCCACGACCGCCTCTGCTTTG
TCATGGAGTACGCCAACGGGGGCGAGCTGTTCTTCCACCTGTCCCGGGAGCGTGTGT
TCTCCGAGGACCGGGCCCGCTTCTATGGCGCTGAGATTGTGTCAGCCCTGGACTACC
TGCACTCGGAGAAGAACGTGGTGTACCGGGACCTCAAGCTGGAGAACCTCATGCTG
GACAAGGACGGGCACATTAAGATCACAGACTTCGGGCTGTGCAAGGAGGGGATCAA
GGACGGTGCCACCATGAAGACCTTTTGCGGCACACCTGAGTACCTGGCCCCCGAGG
TGCTGGAGGACAATGACTACGGCCGTGCAGTGGACTGGTGGGGGCTGGGCGTGGTC
ATGTACGAGATGATGTGCGGTCGCCTGCCCTTCTACAACCAGGACCATGAGAAGCTT
TTTGAGCTCATCCTCATGGAGGAGATCCGCTTCCCGCGCACGCTTGGTCCCGAGGCC
AAGTCCTTGCTTTCAGGG
CTGCTCAAGAAGGACCCCAAGCAGAGGCTTGGCGGGGGCTCCGAGGACGCCAAGG
AGATCATGCAGCATCGCTTCTTTGCCGGTATCGTGTGGCAGCACGTGTACGAGAAGA
AGCTCAGCCCACCCTTCAAGCCCCAGGTCACGTCGGAGACTGACACCAGGTATTTTG
ATGAGGAGTTCACGGCCCAGATGATCACCATCACACCACCTGACCAAGATGACAGC
ATGGAGTGTGTGGACAGCGAGCGCAGGCCCCACTTCCCCCAGTTCTCCTACTCGGCC
AGCGGCACGGCCTGA

【１１８９】

ヒトＲａｆ　ＣＤＳ（配列番号３２）

【化３０３】

ATGGCTAGCAAACGAAAATCTACAACTCCATGCATGGTTCGGACATCACAAGTAGT
AGAACAAGATGTGCCCGAGGAAGTAGACAGGGCCAAAGAGAAAGGAATCGGCACA
CCACAGCCTGACGTGGCCAAGGACAGTTGGGCAGCAGAACTTGAAAACTCTTCCAA
AGAAAACGAAGTGATAGAGGTGAAATCTATGGGGGAAAGCCAGTCCAAAAAACTC
CAAGGTGGTTATGAGTGCAAATACTGCCCCTACTCCACGCAAAACCTGAACGAGTTC
ACGGAGCATGTCGACATGCAGCATCCCAACGTGATTCTCAACCCCCTCTACGTGTGT
GCAGAATGTAACTTCACAACCAAAAAGTACGACTCCCTATCCGACCACAACTCCAA
GTTCCATCCCGGGGAGGCCAACTTCAAGCTGAAGTTAATTAAACGCAATAATCAAA
CTGTCTTGGAACAGTCCATCGAAACCACCAACCATGTCGTGTCCATCACCACCAGTG
GCCCTGGAACTGGTGACAGTGATTCTGGGATCTCGGTGAGTAAAACCCCCATCATGA
AGCCTGGAAAACCAAAAGCGGATGCCAAGAAGGTGCCCAAGAAGCCCGAGGAGAT
CACCCCCGAGAACCACGTGGAAGGGACCGCCCGCCTGGTGACAGACACAGCTGAGA
TCCTCTCGAGACTCGGCGGGGTGGAGCTCCTCCAAGACACATTAGGACACGTCATGC
CTTCTGTACAGCTGCCACCAAATATCAACCTTGTGCCCAAGGTCCCTGTCCCACTAA
ATACTACCAAATACAACTCTGCCCTGGATACAAATGCCACGATGATCAACTCTTTCA
ACAAGTTTCCTTACCCGACCCAGGCTGAGTTGTCCTGGCTGACAGCTGCCTCCAAAC
ACCCAGAGGAGCACATCAGAATCTGGTTTGCCACCCAGCGCTTAAAGCATGGCATC
AGCTGGTCCCCAGAAGAGGTGGAGGAGGCCCGGAAGAAGATGTTCAACGGCACCAT
CCAGTCAGTACCCCCGACCATCACTGTGCTGCCCGCCCAGTTGGCCCCCACAAAGGT
GACGCAGCCCATCCTCCAGACGGCTCTACCGTGCCAGATCCTCGGCCAGACTAGCCT
GGTGCTGACTCAGGTGACCAGCGGGTCAACAACCGTCTCTTGCTCCCCCATCACACT
TGCCGTGGCAGGAGTCACCAACCATGGCCAGAAGAGACCCTTGGTGACTCCCCAAG
CTGCCCCCGAACCCAAGCGTCCACACATCGCTCAGGTGCCAGAGCCCCCACCCAAG
GTGGCCAACCCCCCGCTCACACCAGCCAGTGACCGCAAGAAGACAAAGGAGCAGAT
AGCACATCTCAAGGCCAGCTTTCTCCAGAGCCAGTTCCCTGACGATGCCGAGGTTTA
CCGGCTCATCGAGGTGACTGGCCTTGCCAGGAGCGAGATCAAGAAGTGGTTCAGTG
ACCACCGATATCGGTGTCAAAGGGGCATCGTCCACATCACCAGCGAATCCCTTGCCA
AAGACCAGTTGGCCATCGCGGCCTCCCGACACGGTCGCACGTATCATGCGTACCCA
GACTTTGCCCCCCAGAAGTTCAAAGAGAAAACACAGGGTCAGGTTAAAATCTTGGA
AGACAGCTTTTTGAAAAGTTCTTTTCCTACCCAAGCAGAACTGGATCGGCTAAGGGT
GGAGACCAAGCTGAGCAGGAGAGAGATCGACTCCTGGTTCTCGGAGAGGCGGAAGC
TTCGAGACAGCATGGAACAAGCTGTCTTGGATTCCATGGGGTCTGGCAAAAAAGGC
CAAGATGTGGGAGCCCCCAATGGTGCTCTGTCTCGACTCGACCAGCTCTCCGGTGCC
CAGTTAACAAGTTCTCTGCCCAGCCCTTCGCCAGCAATTGCAAAAAGTCAAGAACA
GGTTCATCTCCTGAGGAGCACGTTTGCAAGAACCCAGTGGCCTACTCCCCAGGAGTA
CGACCAGTTAGCGGCCAAGACTGGCCTGGTCCGAACTGAGATTGTGCGTTGGTTCAA
GGAGAACAGATGCTTGCTGAAAACGGGAACCGTGAAGTGGATGGAGCAGTACCAGC
ACCAGCCCATGGCAGATGATCACGGCTACGATGCCGTAGCAAGGAAAGCAACAAAA
CCCATGGCCGAGAGCCCAAAGAACGGGGGTGATGTGGTTCCACAATATTACAAGGA
CCCCAAAAAGCTCTGCGAAGAGGACTTGGAGAAGTTGGTGACCAGGGTAAAAGTAG
GCAGCGAGCCAGCAAAAGACTGTTTGCCAGCAAAGCCCTCAGAGGCCACCTCAGAC
CGGTCAGAGGGCAGCAGCCGGGACGGCCAGGGTAGCGACGAGAACGAGGAGTCGA
GCGTTGTGGATTACGTGGAGGTGACGGTCGGGGAGGAGGATGCGATCTCAGATAGA
TCAGATAGCTGGAGTCAGGCTGCGGCAGAAGGTGTGTCGGAACTGGCTGAATCAGA
CTCCGACTGCGTCC CTGCAGAGGCTGGCCAGGCCTAG

【１１９０】

ヒトＫ－Ｒａｓ　ＣＤＳ（配列番号３３）

【化３０４】

ATGACTGAATATAAACTTGTGGTAGTTGGAGCTGGTGGCGTAGGCAAGAGTGCCTTG
ACGATACAGCTAATTCAGAATCATTTTGTGGACGAATATGATCCAACAATAGAGGAT
TCCTACAGGAAGCAAGTAGTAATTGATGGAGAAACCTGTCTCTTGGATATTCTCGAC
ACAGCAGGTCAAGAGGAGTACAGTGCAATGAGGGACCAGTACATGAGGACTGGGG
AGGGCTTTCTTTGTGTATTTGCCATAAATAATACTAAATCATTTGAAGATATTCACCA
TTATAGAGAACAAATTAAAAGAGTTAAGGACTCTGAAGATGTACCTATGGTCCTAGT
AGGAAATAAATGTGATTTGCCTTCTAGAACAGTAGACACAAAACAGGCTCAGGACT
TAGCAAGAAGTTATGGAATTCCTTTTATTGAAACATCAGCAAAGACAAGACAGGGT
GTTGATGATGCCTTCTATACATTAGTTCGAGAAATTCGAAAACATAAAGAAAAGATG
AGCAAAGATGGTAAAAAGAAGAAAAAGAAGTCAAAGACAAAGTGTGTAATTATGT
AA

【１１９１】

ヒトＮ－Ｒａｓ　ＣＤＳ（配列番号３４）

【化３０５】

ATGACTGAGTACAAACTGGTGGTGGTTGGAGCAGGTGGTGTTGGGAAAAGCGCACT
GACAATCCAGCTAATCCAGAACCACTTTGTAGATGAATATGATCCCACCATAGAGG
ATTCTTACAGAAAACAAGTGGTTATAGATGGTGAAACCTGTTTGTTGGACATACTGG
ATACAGCTGGACAAGAAGAGTACAGTGCCATGAGAGACCAATACATGAGGACAGG
CGAAGGCTTCCTCTGTGTATTTGCCATCAATAATAGCAAGTCATTTGCGGATATTAA
CCTCTACAGGGAGCAGATTAAGCGAGTAAAAGACTCGGATGATGTACCTATGGTGC
TAGTGGGAAACAAGTGTGATTTGCCAACAAGGACAGTTGATACAAAACAAGCCCAC
GAACTGGCCAAGAGTTACGGGATTCCATTCATTGAAACCTCAGCCAAGACCAGACA
GGGTGTTGAAGATGCTTTTTACACACTGGTAAGAGAAATACGCCAGTACCGAATGA
AAAAACTCAACAGCAGTGATGATGGGACTCAGGGTTGTATGGGATTGCCATGTGTG
GTGATGTAA

【１１９２】

ヒトＲＩＰ　ＣＤＳ（配列番号３５）

【化３０６】

ATGCAACCAGACATGTCCTTGAATGTCATTAAGATGAAATCCAGTGACTTCCTGGAG
AGTGCAGAACTGGACAGCGGAGGCTTTGGGAAGGTGTCTCTGTGTTTCCACAGAAC
CCAGGGACTCATGATCATGAAAACAGTGTACAAGGGGCCCAACTGCATTGAGCACA
ACGAGGCCCTCTTGGAGGAGGCGAAGATGATGAACAGACTGAGACACAGCCGGGTG
GTGAAGCTCCTGGGCGTCATCATAGAGGAAGGGAAGTACTCCCTGGTGATGGAGTA
CATGGAGAAGGGCAACCTGATGCACGTGCTGAAAGCCGAGATGAGTACTCCGCTTT
CTGTAAAAGGAAGGATAATTTTGGAAATCATTGAAGGAATGTGCTACTTACATGGA
AAAGGCGTGATACACAAGGACCTGAAGCCTGAAAATATCCTTGTTGATAATGACTTC
CACATTAAGATCGCAGACCTCGGCCTTGCCTCCTTTAAGATGTGGAGCAAACTGAAT
AATGAAGAGCACAATGAGCTGAGGGAAGTGGACGGCACCGCTAAGAAGAATGGCG
GCACCCTCTACTACATGGCGCCCGAGCACCTGAATGACGTCAACGCAAAGCCCACA
GAGAAGTCGGATGTGTACAGCTTTGCTGTAGTACTCTGGGCGATATTTGCAAATAAG
GAGCCATATGAAAATGCTATCTGTGAGCAGCAGTTGATAATGTGCATAAAATCTGG
GAACAGGCCAGATGTGGATGACATCACTGAGTACTGCCCAAGAGAAATTATCAGTC
TCATGAAGCTCTGCTGGGAAGCGAATCCGGAAGCTCGGCCGACATTTCCTGGCATTG
AAGAAAAATTTAGGCCTTTTTATTTAAGTCAATTAGAAGAAAGTGTAGAAGAGGAC
GTGAAGAGTTTAAAGAAAGAGTATTCAAACGAAAATGCAGTTGTGAAGAGAATGCA
GTCTCTTCAACTTGATTGTGTGGCAGTACCTTCAAGCCGGTCAAATTCAGCCACAGA
ACAGCCTGGTTCACTGCACAGTTCCCAGGGACTTGGGATGGGTCCTGTGGAGGAGTC
CTGGTTTGCTCCTTCCCTGGAGCACCCACAAGAAGAGAATGAGCCCAGCCTGCAGA
GTAAACTCCAAGACGAAGCCAACTACCATCTTTATGGCAGCCGCATGGACAGGCAG
ACGAAACAGCAGCCCAGACAGAATGTGGCTTACAACAGAGAGGAGGAAAGGAGAC
GCAGGGTCTCCCATGACCCTTTTGCACAGCAAAGACCTTACGAGAATTTTCAGAATA
CAGAGGGAAAAGGCACTGCTTATTCCAGTGCAGCCAGTCATGGTAATGCAGTGCAC
CAGCCCTCAGGGCTCACCAGCCAACCTCAAGTACTGTATCAGAACAATGGATTATAT
AGCTCACATGGCTTTGGAACAAGACCACTGGATCCAGGAACAGCAGGTCCCAGAGT
TTGGTACAGGCCAATTCCAAGTCATATGCCTAGTCTGCATAATATCCCAGTGCCTGA
GACCAACTATCTAGGAAATACACCCACCATGCCATTCAGCTCCTTGCCACCAACAGA
TGAATCTATAAAATATACCATATACAATAGTACTGGCATTCAGATTGGAGCCTACAA
TTATATGGAGATTGGTGGGACGAGTTCATCACTACTAGACAGCACAAATACGAACTT
CAAAGAAGAGCCAGCTGCTAAGTACCAAGCTATCTTTGATAATACCACTAGTCTGAC
GGATAAACACCTGGACCCAATCAGGGAAAATCTGGGAAAGCACTGGAAAAACTGTG
CCCGTAAACTGGGCTTCACACAGTCTCAGATTGATGAAATTGACCATGACTATGAGC
GAGATGGACTGAAAGAAAAGGTTTACCAGATGCTCCAAAAGTGGGTGATGAGGGAA
GGCATAAAGGGAGCCACGGTGGGGAAGCTGGCCCAGGCGCTCCACCAGTGTTCCAG
GATCGACC TTCTGAGCAGCTTGATTTACGTCAGCCAGAACTAA

【１１９３】

ヒトＴＲＡＦ６　ＣＤＳ（配列番号３６）

【化３０７】

ATGAGTCTGCTAAACTGTGAAAACAGCTGTGGATCCAGCCAGTCTGAAAGTGACTG
CTGTGTGGCCATGGCCAGCTCCTGTAGCGCTGTAACAAAAGATGATAGTGTGGGTGG
AACTGCCAGCACGGGGAACCTCTCCAGCTCATTTATGGAGGAGATCCAGGGATATG
ATGTAGAGTTTGACCCACCCCTGGAAAGCAAGTATGAATGCCCCATCTGCTTGATGG
CATTACGAGAAGCAGTGCAAACGCCATGCGGCCATAGGTTCTGCAAAGCCTGCATC
ATAAAATCAATAAGGGATGCAGGTCACAAATGTCCAGTTGACAATGAAATACTGCT
GGAAAATCAACTATTTCCAGACAATTTTGCAAAACGTGAGATTCTTTCTCTGATGGT
GAAATGTCCAAATGAAGGTTGTTTGCACAAGATGGAACTGAGACATCTTGAGGATC
ATCAAGCACATTGTGAGTTTGCTCTTATGGATTGTCCCCAATGCCAGCGTCCCTTCCA
AAAATTCCATATTAATATTCACATTCTGAAGGATTGTCCAAGGAGACAGGTTTCTTG
TGACAACTGTGCTGCATCAATGGCATTTGAAGATAAAGAGATCCATGACCAGAACT
GTCCTTTGGCAAATGTCATCTGTGAATACTGCAATACTATACTCATCAGAGAACAGA
TGCCTAATCATTATGATCTAGACTGCCCTACAGCCCCAATTCCATGCACATTCAGTA
CTTTTGGTTGCCATGAAAAGATGCAGAGGAATCACTTGGCACGCCACCTACAAGAG
AACACCCAGTCACACATGAGAATGTTGGCCCAGGCTGTTCATAGTTTGAGCGTTATA
CCCGACTCTGGGTATATCTCAGAGGTCCGGAATTTCCAGGAAACTATTCACCAGTTA
GAGGGTCGCCTTGTAAGACAAGACCATCAAATCCGGGAGCTGACTGCTAAAATGGA
AACTCAGAGTATGTATGTAAGTGAGCTCAAACGAACCATTCGAACCCTTGAGGACA
AAGTTGCTGAAATCGAAGCACAGCAGTGCAATGGAATTTATATTTGGAAGATTGGC
AACTTTGGAATGCATTTGAAATGTCAAGAAGAGGAGAAACCTGTTGTGATTCATAGC
CCTGGATTCTACACTGGCAAACCCGGGTACAAACTGTGCATGCGCTTGCACCTTCAG
TTACCGACTGCTCAGCGCTGTGCAAACTATATATCCCTTTTTGTCCACACAATGCAA
GGAGAATATGACAGCCACCTCCCTTGGCCCTTCCAGGGTACAATACGCCTTACAATT
CTTGATCAGTCTGAAGCACCTGTAAGGCAAAACCACGAAGAGATAATGGATGCCAA
ACCAGAGCTGCTTGCTTTCCAGCGACCCACAATCCCACGGAACCCAAAAGGTTTTGG
CTATGTAACTTTTATGCATCTGGAAGCCCTAAGACAAAGAACTTTCATTAAGGATGA
CACATTATTAGTGCGCTGTGAGGTCTCCACCCGCTTTGACATGGGTAGCCTTCGGAG
GGAGGGTTTTCAGCCACGAAGTACTGATGCAGGGGTATAG

【１１９４】

ヒトＴＴＰ　ＣＤＳ（配列番号３７）

【化３０８】

ATGGCCAACCGTTACACCATGGATCTGACTGCCATCTACGAGAGCCTCCTGTCGCTG
AGCCCTGACGTGCCCGTGCCATCCGACCATGGAGGGACTGAGTCCAGCCCAGGCTG
GGGCTCCTCGGGACCCTGGAGCCTGAGCCCCTCCGACTCCAGCCCGTCTGGGGTCAC
CTCCCGCCTGCCTGGCCGCTCCACCAGCCTAGTGGAGGGCCGCAGCTGTGGCTGGGT
GCCCCCACCCCCTGGCTTCGCACCGCTGGCTCCCCGCCTGGGCCCTGAGCTGTCACC
CTCACCCACTTCGCCCACTGCAACCTCCACCACCCCCTCGCGCTACAAGACTGAGCT
ATGTCGGACCTTCTCAGAGAGTGGGCGCTGCCGCTACGGGGCCAAGTGCCAGTTTGC
CCATGGCCTGGGCGAGCTGCGCCAGGCCAATCGCCACCCCAAATACAAGACGGAAC
TCTGTCACAAGTTCTACCTCCAGGGCCGCTGCCCCTACGGCTCTCGCTGCCACTTCAT
CCACAACCCTAGCGAAGACCTGGCGGCCCCGGGCCACCCTCCTGTGCTTCGCCAGA
GCATCAGCTTCTCCGGCCTGCCCTCTGGCCGCCGGACCTCACCACCACCACCAGGCC
TGGCCGGCCCTTCCCTGTCCTCCAGCTCCTTCTCGCCCTCCAGCTCCCCACCACCACC
TGGGGACCTTCCACTGTCACCCTCTGCCTTCTCTGCTGCCCCTGGCACCCCCCTGGCT
CGAAGAGACCCCACCCCAGTCTGTTGCCCCTCCTGCCGAAGGGCCACTCCTATCAGC
GTCTGGGGGCCCTTGGGTGGCCTGGTTCGGACCCCCTCTGTACAGTCCCTGGGATCC
GACCCTGATGAATATGCCAGCAGCGGCAGCAGCCTGGGGGGCTCTGACTCTCCCGT
CTTCGAGGCGGGAGTTTTTGCACCACCCCAGCCCGTGGCAGCCCCCCGGCGACTCCC
CATCTTCAATCGCATCTCTGTTTCTGAGTGA

【１１９５】

アンチセンス核酸分子は、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／

４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ　３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰＭＥＫＫ１タンパク質をコードするヌクレオチド配列のコード鎖の非コード領域の全て又は一部に相補的であり得る。非コード領域（５’及び３’非翻訳領域）は、遺伝子内のコード領域に隣接し、アミノ酸へと翻訳されない５’及び３’配列である。

【１１９６】

本明細書に開示される配列に基づいて、当業者は、本明細書に記載されるＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ　３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰタンパク質をコードする核酸を標的とする多くの適切なアンチセンス核酸のいずれかを容易に選択及び合成することができる。ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ　３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰＭＥＫＫ１タンパク質をコードする核酸を標的とするアンチセンス核酸は、Ｉｎｔｅｇｒａｔｅｄ　ＤＮＡ　Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓウェブサイトから入手可能なソフトウェアを用いて設計され得る。

【１１９７】

アンチセンス核酸は、例えば、約５、１０、１５、１８、２０、２２、２４、２５、２６、２８、３０、３２、３５、３６、３８、４０、４２、４４、４５、４６、４８、又は５０ヌクレオチド長又はそれ以上であり得る。アンチセンス核オリゴヌクレオチドが、当該技術分野において公知の手順を用いた酵素ライゲーション反応及び化学合成を用いて構成され得る。例えば、アンチセンス核酸は、アンチセンス及びセンス核酸の間に形成される二本鎖の物理的安定性を向上させるように、又は分子の生物学的安定性を向上させるように設計された様々に修飾されたヌクレオチド又は天然ヌクレオチド、例えば、ホスホロチオエート誘導体及びアクリジン置換ヌクレオチドを用いて化学的に合成され得る。

【１１９８】

アンチセンス核酸を生成するのに使用され得る修飾ヌクレオチドの例としては、１－メチルグアニン、１－メチルイノシン、２，２－ジメチルグアニン、２－メチルアデニン、２－メチルグアニン、３－メチルシトシン、２－メチルチオ－Ｎ６－イソペンテニルアデニン、ウラシル－５－オキシ酢酸（ｖ）、ワイブトシン、プソイドウラシル、クエオシン、２－チオシトシン、５－フルオロウラシル、５－ブロモウラシル、５－クロロウラシル、５－ヨードウラシル、ヒポキサンチン、キサンチン、４－アセチルシトシン、５－（カルボキシヒドロキシルメチル）ウラシル、５－カルボキシメチルアミノメチル－２－チオウリジン、５－カルボキシメチルアミノメチルウラシル、ジヒドロウラシル、β－Ｄ－ガラクトシルクエオシン、イノシン、Ｎ６－イソペンテニルアデニン、５－メチルシトシン、Ｎ６－アデニン、７－メチルグアニン、５－メチルアミノメチルウラシル、５－メトキシアミノメチル－２－チオウラシル、β－Ｄ－マンノシルクエオシン、５’－メトキシカルボキシメチルウラシル、５－メトキシウラシル、５－メチル－２－チオウラシル、２－チオウラシル、４－チオウラシル、５－メチルウラシル、ウラシル－５－オキシ酢酸メチルエステル、ウラシル－５－オキシ酢酸（ｖ）、５－メチル－２－チオウラシル、３－（３－アミノ－３－Ｎ－２－カルボキシプロピル）ウラシル、（ａｃｐ３）ｗ、及び２，６－ジアミノプリンが挙げられる。或いは、アンチセンス核酸は、核酸がアンチセンス配向にサブクローニングされた発現ベクターを用いて生物学的に生成され得る（すなわち、挿入された核酸から転写されたＲＮＡは、対象とする核酸を標的とするアンチセンス配向のものになるであろう）。

【１１９９】

本明細書に記載されるアンチセンス核酸分子は、インビトロで調製され、対象、例えば、ヒト対象に投与され得る。或いは、それらは、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰタンパク質をコードする細胞ｍＲＮＡ及び／又はゲノムＤＮＡとハイブリダイズするか又はそれと結合して、それによって、例えば、転写及び／又は翻訳を阻害することによって発現を阻害するように、インサイチュで生成され得る。ハイブリダイゼーションは、安定した二本鎖を形成するために従来のヌクレオチド相補性によって、又は、例えば、ＤＮＡ二本鎖に結合するアンチセンス核酸分子の場合、二重らせんの主溝における特異的な相互作用によって行われ得る。アンチセンス核酸分子は、ベクター（例えば、アデノウイルスベクター、レンチウイルス、又はレトロウイルス）を用いて、哺乳動物細胞に送達され得る。

【１２００】

アンチセンス核酸は、α－アノマー核酸分子であり得る。α－アノマー核酸分子は、通常のβ－単位と対照的に、鎖が互いに平行に延びる相補的なＲＮＡとの特異的な二本鎖ハイブリッドを形成する（Ｇａｕｌｔｉｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｎｕｃｌｅｉｃ Ａｃｉｄｓ Ｒｅｓ．１５：６６２５－６６４１，１９８７）。アンチセンス核酸は、キメラＲＮＡ－ＤＮＡ類似体も含み得る（Ｉｎｏｕｅ ｅｔ ａｌ．，ＦＥＢＳ Ｌｅｔｔ．２１５：３２７－３３０，１９８７）又は２’－Ｏ－メチルリボヌクレオチド（Ｉｎｏｕｅ ｅｔ ａｌ．，Ｎｕｃｌｅｉｃ Ａｃｉｄｓ Ｒｅｓ．１５：６１３１－６１４８，１９８７）。

【１２０１】

阻害性核酸の別の例は、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡをコードする核酸に対する特異性、例えば、配列番号１～３７のいずれか１つに対する特異性）を有するリボザイムである。リボザイムは、それらが相補領域を有する、ｍＲＮＡなどの一本鎖核酸を切断することが可能なリボヌクレアーゼ活性を有する触媒ＲＮＡ分子である。したがって、リボザイム（例えば、ハンマーヘッド型リボザイム（Ｈａｓｅｌｈｏｆｆ ａｎｄ Ｇｅｒｌａｃｈ，Ｎａｔｕｒｅ ３３４：５８５－５９１，１９８８に記載される））を用いて、ｍＲＮＡ転写産物を触媒により切断して、ｍＲＮＡによってコードされるタンパク質の翻訳を阻害することができる。ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡを用いて、ＲＮＡ分子のプールから特異的なリボヌクレアーゼ活性を有する触媒ＲＮＡを選択することができる。例えば、Ｂａｒｔｅｌ ｅｔ ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｃｅ ２６１：１４１１－１４１８，１９９３を参照されたい。

【１２０２】

或いは、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡに対する特異性を有するリボザイムが、本明細書に記載されるＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫ

Ｒ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡ配列のいずれかのヌクレオチド配列に基づいて設計され得る。例えば、活性部位のヌクレオチド配列が、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰ ｍＲＮＡにおいて切断されるヌクレオチド配列に相補的であるテトラヒメナ（Ｔｅｔｒａｈｙｍｅｎａ）Ｌ－１９ ＩＶＳ ＲＮＡの誘導体が構築され得る（例えば、米国特許第４，９８７，０７１号明細書及び同第５，１１６，７４２号明細書を参照）。

【１２０３】

阻害性核酸はまた、三重らせん構造を形成する核酸分子であり得る。例えば、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰポリペプチドの発現は、ＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＣＤ１４、ｃ－ｊｕｎ、ＥＲＫ１／２、ＩκＢ、ＩＫＫ、ＩＲＡＫ、ＪＮＫ、ＬＢＰ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫ１／２、ＭＥＫＫ１／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＭＫ２、ＭｙＤ８８、ＮＦ－κＢ、ＮＩＫ、ｐ３８、ＰＫＲ、ｒａｃ、ｒａｓ、ｒａｆ、ＲＩＰ、ＴＮＦα、ＴＮＦＲ１、ＴＮＦＲ２、ＴＲＡＤＤ、ＴＲＡＦ２、ＴＲＡＦ６、又はＴＴＰポリペプチドをコードする遺伝子の調節領域に相補的なヌクレオチド配列（例えば、プロモーター及び／又はエンハンサー、例えば、転写開始開始状態（ｔｒａｎｓｃｒｉｐｔｉｏｎ ｉｎｉｔｉａｔｉｏｎ ｓｔａｒｔ ｓｔａｔｅ）の少なくとも１ｋｂ、２ｋｂ、３ｋｂ、４ｋｂ、又は５ｋｂ上流にある配列）を標的として、標的細胞内の遺伝子の転写を防ぐ三重らせん構造を形成することによって阻害され得る。一般に、Ｍａｈｅｒ，Ｂｉｏａｓｓａｙｓ １４（１２）：８０７－１５，１９９２；Ｈｅｌｅｎｅ，Ａｎｔｉｃａｎｃｅｒ Ｄｒｕｇ Ｄｅｓ．６（６）：５６９－８４、１９９１；及びＨｅｌｅｎｅ，Ａｎｎ．Ｎ．Ｙ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．６６０：２７－３６，１９９２を参照されたい。

【１２０４】

様々な実施形態において、阻害性核酸は、例えば、分子の溶解度、安定性、又はハイブリダイゼーションを向上させるために、糖部分、塩基部分、又はリン酸骨格において修飾され得る。例えば、核酸のデオキシリボースリン酸骨格は、ペプチド核酸を生成するように修飾され得る（例えば、Ｈｙｒｕｐ ｅｔ ａｌ．，Ｂｉｏｏｒｇａｎｉｃ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍ．４（１）：５－２３，１９９６を参照）。ペプチド核酸（ＰＮＡ）は、核酸模倣体、例えば、デオキシリボースリン酸骨格が擬ペプチド骨格で置換され、４つのみの天然核酸塩基が保持されたＤＮＡ模倣体である。ＰＮＡの中性骨格は、低いイオン強度の条件下でＲＮＡ及びＤＮＡに対する特異的なハイブリダイゼーションを可能にする。ＰＮＡオリゴマーは、標準的な固相ペプチド合成プロトコを用いて合成され得る（例えば、Ｐｅｒｒｙ－Ｏ’Ｋｅｅｆｅ ｅｔ ａｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．Ｕ．Ｓ．Ａ．９３：１４６７０－６７５，１９９６を参照）。ＰＮＡは、例えば、転写若しくは翻訳の停止を誘導するか又は複製を阻害することによって、遺伝子発現の配列特異的調節のためのアンチセンス又は抗原薬剤として使用され得る。

【１２０５】

小分子

ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤は小分子である。ある実施形態において、小分子は、腫瘍壊死因子変換酵素（ＴＡＣＥ）阻害剤である（例えば、Ｍｏｓｓ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｃｌｉｎｉｃａｌ Ｐｒａｃｔｉｃｅ Ｒｈｅｕｍａｔｏｌｏｇｙ ４：３００－３０９，２００８）。ある実施形態において、抗ＴＮＦα剤はＣ８７である（Ｍａ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｂｉｏｌ．Ｃｈｅｍ．２８９（１８）：１２４５７－６６，２０１４

）。ある実施形態において、小分子はＬＭＰ－４２０である（例えば、Ｈａｒａｇｕｃｈｉ ｅｔ ａｌ．，ＡＩＤＳ Ｒｅｓ．Ｔｈｅｒ．３：８，２００６）。ある実施形態において、ＴＡＣＥ阻害剤は、ＴＭＩ－００５及びＢＭＳ－５６１３９２である。小分子阻害剤のさらなる例は、例えば、Ｈｅ ｅｔ ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｃｅ ３１０（５７５０）：１０２２－１０２５，２００５に記載されている。

【１２０６】

いくつかの例において、抗ＴＮＦα剤は、細胞（例えば、対象から採取した細胞、哺乳動物細胞）内のＡＰ－１、ＡＳＫ１、ＩＫＫ、ＪＮＫ、ＭＡＰＫ、ＭＥＫＫ １／４、ＭＥＫＫ４／７、ＭＥＫＫ ３／６、ＮＩＫ、ＴＲＡＤＤ、ＲＩＰ、ＮＦ－κＢ、及びＴＲＡＤＤのうちの１つの活性を阻害する小分子である。

【１２０７】

いくつかの例において、抗ＴＮＦα剤は、ＣＤ１４、ＭｙＤ８８（例えば、Ｏｌｓｏｎ ｅｔ ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ Ｒｅｐｏｒｔｓ ５：１４２４６，２０１５を参照）、ｒａｓ（例えば、Ｂａｋｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ ４９７：５７７－５７８，２０１３）、ｒａｆ（例えば、ベムラフェニブ（ＰＬＸ４０３２、ＲＧ７２０４）、トシル酸ソラフェニブ、ＰＬＸ－４７２０、ダブラフェニブ（ＧＳＫ２１１８４３６）、ＧＤＣ－０８７９、ＲＡＦ２６５（ＣＨＩＲ－２６５）、ＡＺ ６２８、ＮＶＰ－ＢＨＧ７１２、ＳＢ５９０８８５、ＺＭ ３３６３７２、ソラフェニブ、ＧＷ５０７４、ＴＡＫ－６３２、ＣＥＰ－３２４９６、エンコラフェニブ（ＬＧＸ８１８）、ＣＣＴ１９６９６９、ＬＹ３００９１２０、ＲＯ５１２６７６６（ＣＨ５１２６７６６）、ＰＬＸ７９０４、及びＭＬＮ２４８０）のうちの１つの活性を阻害する小分子である。

【１２０８】

いくつかの例において、抗ＴＮＦα剤ＴＮＦα阻害剤は、ＭＫ２（ＰＦ ３６４４０２２及びＰＨＡ ７６７４９１）、ＪＮＫ（例えば、ＡＥＧ ３４８２、ＢＩ ７８Ｄ３、ＣＥＰ １３４７、ｃ－ＪＵＮ ペプチド、ＩＱ １Ｓ、ＪＩＰ－１（１５３－１６３）、ＳＰ６００１２５、ＳＵ ３３２７、及びＴＣＳ ＪＮＫ６ｏ）、ｃ－ｊｕｎ（例えば、ＡＥＧ ３４８２、ＢＩ ７８Ｄ３、ＣＥＰ １３４７、ｃ－ＪＵＮペプチド、ＩＱ １Ｓ、ＪＩＰ－１（１５３－１６３）、ＳＰ６００１２５、ＳＵ ３３２７、及びＴＣＳ ＪＮＫ６ｏ）、ＭＥＫ３／６（例えば、Ａｋｉｎｌｅｙｅ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｈｅｍａｔｏｌ．Ｏｎｃｏｌ．６：２７，２０１３）、ｐ３８（例えば、ＡＬ ８６９７、ＡＭＧ ５４８、ＢＩＲＢ ７９６、ＣＭＰＤ－１、ＤＢＭ １２８５二塩酸塩、ＥＯ １４２８、ＪＸ ４０１、ＭＬ ３４０３、Ｏｒｇ ４８７６２－０、ＰＨ ７９７８０４、ＲＷＪ ６７６５７、ＳＢ ２０２１９０、ＳＢ ２０３５８０、ＳＢ ２３９０６３、ＳＢ ７０６５０４、ＳＣＩＯ ４６９、ＳＫＦ ８６００２、ＳＸ ０１１、ＴＡ ０１、ＴＡ ０２、ＴＡＫ ７１５、ＶＸ ７０２、及びＶＸ ７４５）、ＰＫＲ（例えば、２－アミノプリン又はＣＡＳ ６０８５１２－９７－６）、ＴＴＰ（例えば、ＣＡＳ ３２９９０７－２８－０）、ＭＥＫ１／２（例えば、Ｆａｃｃｉｏｒｕｓｓｏ ｅｔ ａｌ．，Ｅｘｐｅｒｔ Ｒｅｖｉｅｗ Ｇａｓｔｒｏｅｎｔｒｏｌ．Ｈｅｐａｔｏｌ．９：９９３－１００３，２０１５）、ＥＲＫ１／２（例えば、Ｍａｎｄａｌ ｅｔ ａｌ．，Ｏｎｃｏｇｅｎｅ ３５：２５４７－２５６１，２０１６）、ＮＩＫ（例えば、Ｍｏｒｔｉｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｂｉｏｏｒｇ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．Ｌｅｔｔ．２０：４５１５－４５２０，２０１０）、ＩＫＫ（例えば、Ｒｅｉｌｌｙ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｍｅｄ．１９：３１３－３２１，２０１３）、ＩκＢ（例えば、Ｓｕｚｕｋｉ ｅｔ ａｌ．，Ｅｘｐｅｒｔ．Ｏｐｉｎ．Ｉｎｖｅｓｔ．Ｄｒｕｇｓ ２０：３９５－４０５，２０１１）、ＮＦ－κＢ（例えば、Ｇｕｐｔａ ｅｔ ａｌ．，Ｂｉｏｃｈｉｍ．Ｂｉｏｐｈｙｓ．Ａｃｔａ １７９９（１０－１２）：７７５－７８７，２０１０）、ｒａｃ（例えば、米国特許第９，２７８，９５６号明細書）、ＭＥＫ４／７、ＩＲＡＫ（Ｃｈａｕｄｈａｒｙ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．５８（１）：９６－１１０，２０１５）、ＬＢＰ（例えば、米国特許第５，７０５，３９８号明細書を参照）、及びＴＲＡＦ６（例えば、３－［（２，５－ジメチルフェニル）アミノ］－１－フェニル－２－プロペン－１－オン）のうちの１つの活性を阻害する小分子

である。

【１２０９】

本明細書に記載される方法のいずれかのある実施形態において、阻害性核酸は、約１０ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド（例えば、約１０ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２４ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２２ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約２０ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約１８ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約１６ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約１４ヌクレオチド、約１０ヌクレオチド～約１２ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２４ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２２ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約２０ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約１８ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約１６ヌクレオチド、約１２ヌクレオチド～約１４ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２４ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２２ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約２０ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約１８ヌクレオチド、約１５ヌクレオチド～約１６ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２４ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２２ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約２０ヌクレオチド、約１６ヌクレオチド～約１８ヌクレオチド、約１８ヌクレオチド～約２０ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約２４ヌクレオチド、約２０ヌクレオチド～約２２ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約２６ヌクレオチド、約２４ヌクレオチド～約２５ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約２６ヌクレオチド～約２８ヌクレオチド、約２８ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約２８ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約２８ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約２８ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約２８ヌクレオチド～約３０ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約３８ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約３６ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約３４ヌクレオチド、約３０ヌクレオチド～約３２ヌクレオチド、約３２ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約３２ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約３２ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド

、約３２ヌクレオチド～約３５ヌクレオチド、約３５ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約３５ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約３５ヌクレオチド～約４０ヌクレオチド、約４０ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約４０ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、約４２ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド、約４２ヌクレオチド～約４５ヌクレオチド、又は約４５ヌクレオチド～約５０ヌクレオチド）長であり得る。当業者は、阻害性核酸が、ＤＮＡ又はＲＮＡの５’又は３’末端のいずれかにおいて少なくとも１つの修飾核酸を含み得ることを理解するであろう。

【１２１０】

ある実施形態において、阻害性核酸は、リポソーム、ミセル（例えば、混合ミセル）、ナノエマルション、又はマイクロエマルション、固体ナノ粒子、又はナノ粒子（例えば、１つ以上の合成ポリマーを含むナノ粒子）中で製剤化され得る。阻害性核酸のさらなる例示的な構造的特徴及び阻害性核酸の製剤が、米国特許出願公開第２０１６／００９０５９８号明細書に記載されている。

【１２１１】

ある実施形態において、阻害性核酸（例えば、本明細書に記載される阻害性核酸のいずれか）は、滅菌生理食塩溶液（例えば、リン酸緩衝生理食塩水（ＰＢＳ））を含み得る。ある実施形態において、阻害性核酸（例えば、本明細書に記載される阻害性核酸のいずれか）は、組織特異的送達分子（例えば、組織特異的抗体）を含み得る。

【１２１２】

化合物の調製及び生物学的アッセイ

当業者によって理解され得るように、本明細書の式の化合物を合成する方法は、当業者に明らかであろう。本明細書に記載される化合物を合成するのに有用な合成化学変換及び保護基方法（保護及び脱保護）は、当該技術分野において公知であり、例えば、Ｒ．Ｌａｒｏｃｋ，Ｃｏｍｐｒｅｈｅｎｓｉｖｅ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｔｒａｎｓｆｏｒｍａｔｉｏｎｓ，ＶＣＨ Ｐｕｂｌｉｓｈｅｒｓ（１９８９）；Ｔ．Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ ａｎｄ ＲＧＭ．Ｗｕｔｓ，Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，２ｄ．Ｅｄ．，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ａｎｄ Ｓｏｎｓ（１９９１）；Ｌ．Ｆｉｅｓｅｒ ａｎｄ Ｍ．Ｆｉｅｓｅｒ，Ｆｉｅｓｅｒ ａｎｄ Ｆｉｅｓｅｒ’ｓ Ｒｅａｇｅｎｔｓ ｆｏｒ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ａｎｄ Ｓｏｎｓ（１９９４）；及びＬ．Ｐａｑｕｅｔｔｅ，ｅｄ．，Ｅｎｃｙｃｌｏｐｅｄｉａ ｏｆ Ｒｅａｇｅｎｔｓ ｆｏｒ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ａｎｄ Ｓｏｎｓ（１９９５）、並びにそれらの後続の版に記載されるようなものが挙げられる。

【実施例】

【１２１３】

調製実施例

以下の略語は、示される意味を有する：

ＡＣＮ＝アセトニトリル

ＡｃＯＨ＝酢酸

ＡＩＢＮ＝アゾジイソブチロニトリル

９－ＢＢＮ＝９－ボラビシクロ［３．３．１］ノナン

Boc_2O＝二炭酸ジ－ｔｅｒｔ－ブチル

$(Bpin)_2$＝４，４，４’，４’，５，５，５’，５’－オクタメチル－２，２’－ビ（１，３，２－ジオキサボロラン）

ＣＡＮ＝硝酸二アンモニウムセリウム（ＩＶ）

CCl_4＝パークロロメタン

$CHCl_3$＝クロロホルム

$ClSO_2OH$＝クロロスルホン酸

Ｃｏｎｃ．＝濃縮

Cs_2CO_3＝炭酸セシウム

ＤＡＳＴ＝三フッ化ジエチルアミノ硫黄
ＤＢＵ＝１，８－ジアザビシクロウンデカ－７－エン
ＤＣＭ＝ジクロロメタン
ＤＥＡ＝ジエチルアミン
ＤＭＦ＝Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド
ＤＭＳＯ＝ジメチルスルホキシド
ＤＩＥＡ＝Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン
ＥｔＯＨ＝エタノール
ＦＡ＝ギ酸
ＨＣＨＯ＝ホルムアルデヒド
Ｈｅｘ＝ヘキサン
ＨＰＬＣ＝高速液体クロマトグラフィー
ＩＰＡ＝プロパン－２－オール
ＬＣ－ＭＳ＝液体クロマトグラフィー－質量分析法
ＬＤＡ＝リチウムジイソプロピルアミド
Ｍｅ＝メチル
ＭｅＯＨ＝メタノール
$NaBH_3CN$＝シアノ水素化ホウ素ナトリウム
ＮａＳＨ＝水硫化ナトリウム
ＮＢＳ＝Ｎ－ブロモスクシンイミド
ｎ－ＢｕＬｉ＝ｎ－ブチルリチウム
ＮＭＲ＝核磁気共鳴
PCl_5＝五塩化リン
Pd_2（ｄｂａ）$_3$＝トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム
Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2＝ジクロロ［１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン］パラジウム
Ｐｄ（PPh_3）$_2Cl_2$＝ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）クロリド
Ｐｈ＝フェニル
ＰＭＢ＝ｐ－メトキシベンジル
PPh_3Cl_2＝ジクロロトリフェニルホスホラン
Ｒｔ＝保持時間
ＲＴ＝室温
ＳＦＣ＝超臨界流体クロマトグラム
Ｓａｔ．＝飽和
ＴＢＡＦ＝フッ化テトラ－ｎ－ブチルアンモニウム
ＴＢＳ＝ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル
ＴＢＤＰＳＣｌ＝ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルクロリド
ＴＢＳＣｌ＝ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルクロリド
ｔ－ＢｕＯＫ＝カリウムｔ－ブトキシド
ｔ－ＢｕＯＮＯ＝ｔｅｒｔ－ブチルニトリル
ＴＥＡ＝トリエチルアミン
ＴＦＡ＝トリフルオロ酢酸
ＴＨＦ＝テトラヒドロフラン
ＴＬＣ＝薄層クロマトグラフィー
ＵＶ＝紫外線
Ｘ－ｐｈｏｓ＝２－（ジシクロヘキシルホスフィノ）－２’，４’，６’－トリイソプロピルビフェニル

【１２１４】

概略

反応の進行を、ＴＬＣ又はＬＣ－ＭＳによってモニターした。生成物の独自性を、多く

の場合、ＬＣ－ＭＳによって確認した。ＬＣ－ＭＳを、以下の方法のうちの１つを用いて記録した。

【１２１５】

方法Ａ：Ｓｈｉｍ－ｐａｃｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、Ｃ１８、３×５０ｍｍ、２．５ｕｍカラム、１．０ｕＬの注入量、１．５ｍＬ／分の流量、９０～９００ａｍｕの走査範囲、１９０～４００ｎｍのＵＶ範囲、ＡＣＮ（０．０５％のＴＦＡ）及び水（０．０５％のＴＦＡ）による５～１００％（１．１分）、１００％（０．６分）の勾配、２分の総運転時間。

【１２１６】

方法Ｂ：Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ、Ｃ１８、３×５０ｍｍ、２．２ｕｍカラム、１．０ｕＬの注入量、１．５ｍＬ／分の流量、９０～９００ａｍｕの走査範囲、１９０～４００ｎｍのＵＶ範囲、ＡＣＮ及び水（０．５％のNH_4HCO_3）による１０～９５％（１．１分）、９５％（０．６分）の勾配、２分の総運転時間。

【１２１７】

方法Ｃ：Ｓｈｉｍ－ｐａｃｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、Ｃ１８、３×５０ｍｍ、２．５ｕｍカラム、１．０ｕＬの注入量、１．５ｍＬ／分の流量、９０～９００ａｍｕの走査範囲、１９０～４００ｎｍのＵＶ範囲、ＡＣＮ（０．０５％のＴＦＡ）及び水（０．０５％のＴＦＡ）による５～１００％（２．１分）、１００％（０．６分）の勾配、３分の総運転時間。

【１２１８】

方法Ｄ：Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ、Ｃ１８、３×５０ｍｍ、２．２ｕｍカラム、１．０ｕＬの注入量、１．５ｍＬ／分の流量、９０～９００ａｍｕの走査範囲、１９０～４００ｎｍのＵＶ範囲、ＡＣＮ及び水（０．５％のNH_4HCO_3）による１０～９５％（２．１分）、９５％（０．６分）の勾配、３分の総運転時間。

【１２１９】

最終目標物を分取ＨＰＬＣによって精製した。分取ＨＰＬＣを、以下の方法を用いて行った。

【１２２０】

方法Ｅ：分取ＨＰＬＣ：カラム、ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｓｈｉｅｌｄ　ＲＰ１８　ＯＢＤ（１９×２５０ｍｍ、１０ｕｍ）；移動相、水（１０ｍｍｏｌ／ＬのNH_4HCO_3）及びＡＣＮ、ＵＶ検出２５４／２１０ｎｍ。

【１２２１】

ＢＲＵＫＥＲ　ＮＭＲ　３００．０３ＭＨｚ、ＤＵＬ－Ｃ－Ｈ、ＵＬＴＲＡＳＨＩＥＬＤ（商標）３００、ＡＶＡＮＣＥ　ＩＩ　３００　Ｂ－ＡＣＳ（商標）１２０又はＢＲＵＫＥＲ　ＮＭＲ　４００．１３ＭＨｚ、ＢＢＦＯ、ＵＬＴＲＡＳＨＩＥＬＤ（商標）４００、ＡＶＡＮＣＥ　ＩＩＩ　４００、Ｂ－ＡＣＳ（商標）１２０においてＮＭＲを記録した。

【１２２２】

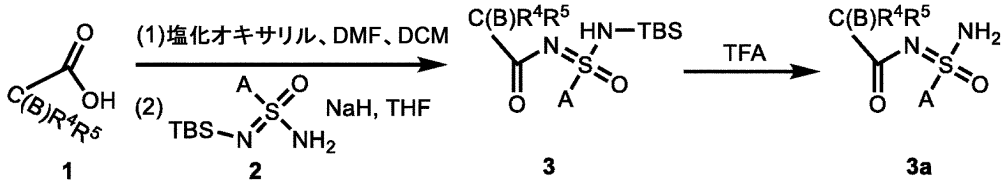
本発明のラセミ化合物を、様々な公知の方法を用いて分割して個々の鏡像異性体を得ることができる。例えば、キラル固定相が使用され得、溶離条件は、酸性又は塩基性添加剤を用いて又は用いずに、順相又は超臨界流体を含み得る。鏡像異性的に純粋な酸又は塩基を用いて、ラセミ化合物とともにジアステレオマー塩を形成することができ、それによって、純粋な鏡像異性体が、分別結晶によって得られる。ラセミ化合物はまた、鏡像異性的に純粋な補助試薬で誘導体化されて、分離可能なジアステレオマー混合物が形成され得る。次に、補助剤が除去されて、純粋な鏡像異性体が得られる。

【１２２３】

最終目標物のスキーム：スキーム１～６は、アシルスルホンイミドイルアミド３を得るための酸１及びスルホンイミドイルアミド２のカップリングのために使用されるいくつかの条件を示す。スキームにおいて使用される際、環「Ａ」及び「Ｂ」は、本明細書に開示されるように置換され得る。

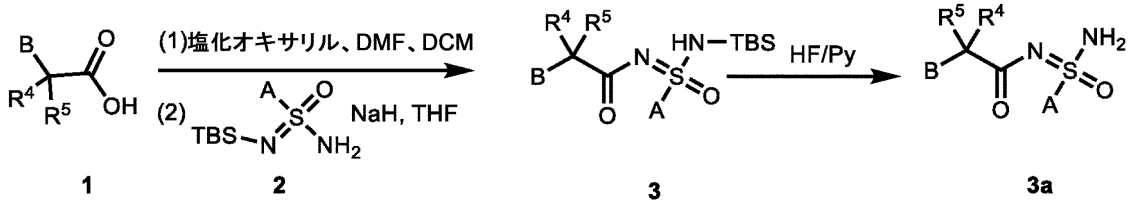
【化３０９】

スキーム1:



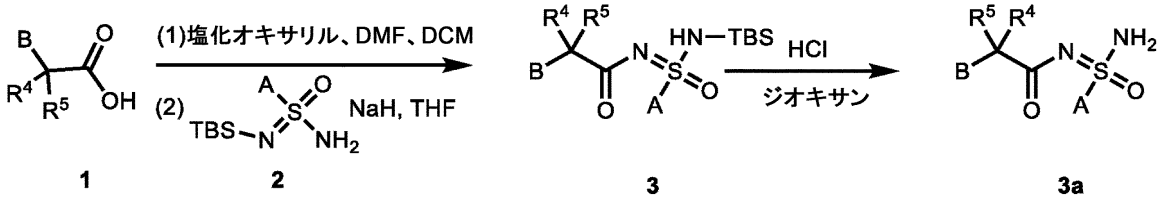
【化３１０】

スキーム1A:



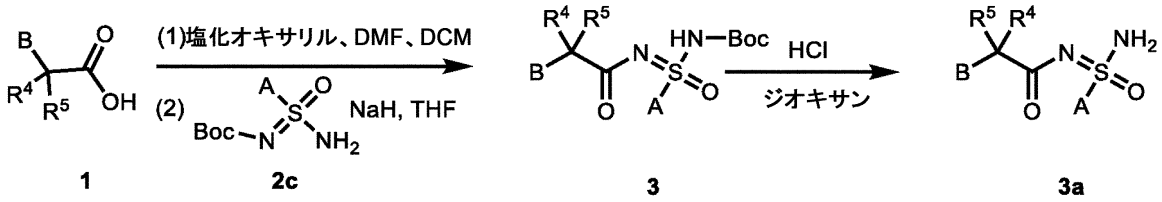
【化３１１】

スキーム1B:



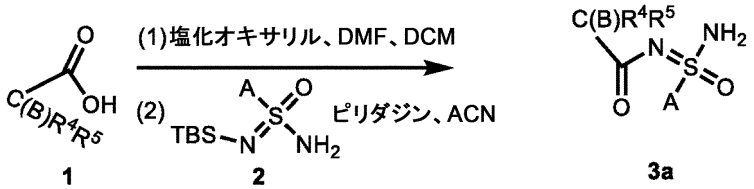
【化３１２】

スキーム1C:



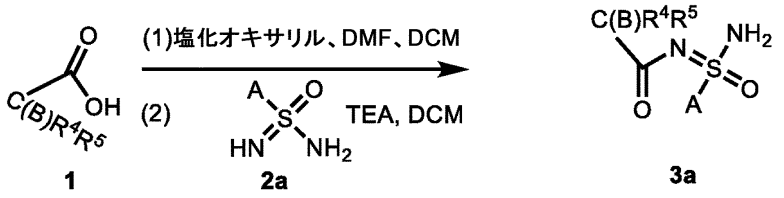
【化３１３】

スキーム2:



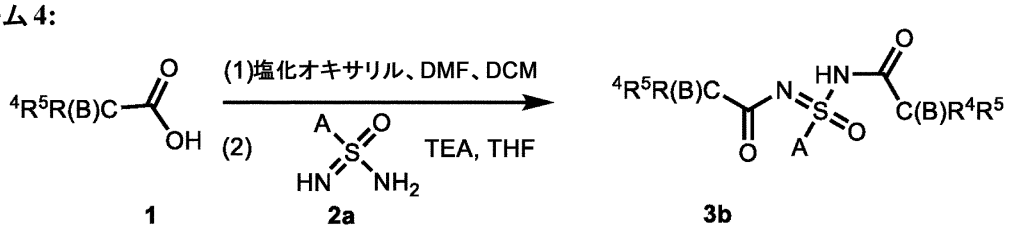
【化３１４】

スキーム 3:



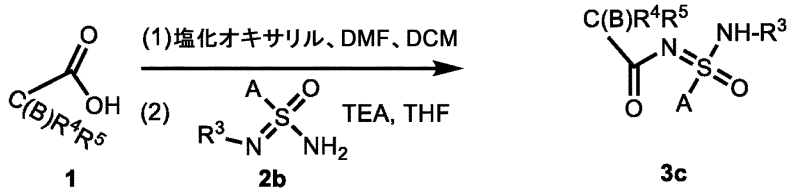
【化３１５】

スキーム 4:



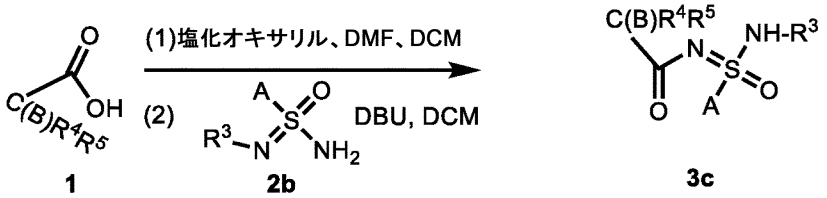
【化３１６】

スキーム 5:



【化３１７】

スキーム 6:



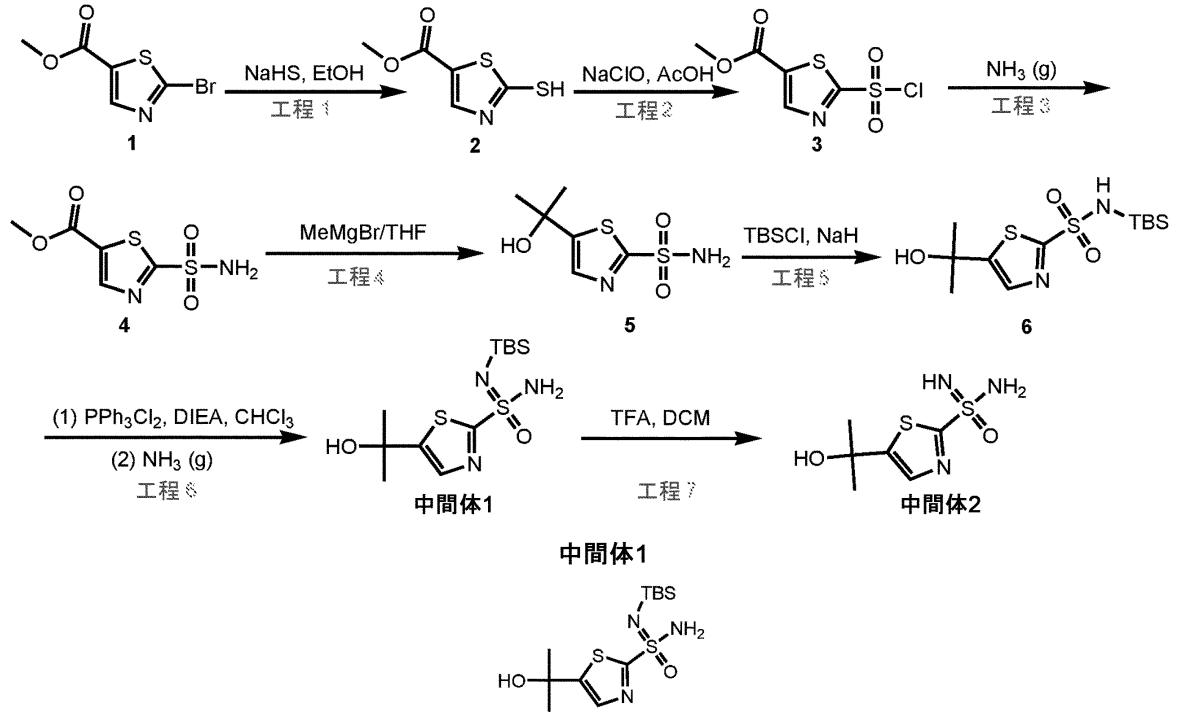
【１２２４】

スルホンイミドイルアミド中間体のスキーム：スキーム７～１２は、スルホンイミドイルアミド中間体の調製を示す。

【１２２５】

【化３１８】

スキーム7:



中間体1

Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド

工程１：メチル２－メルカプトチアゾール－５－カルボキシレート

２０００ｍＬの丸底フラスコ中に、メチル２－ブロモチアゾール－５－カルボキシレート（１００ｇ、４５０ｍｍｏｌ）、ＥｔＯＨ（１０００ｍＬ）、及び硫化水素ナトリウム（５０ｇ、８９０ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を８０℃で２時間撹拌し、次に、水／氷浴を用いて０℃に冷却した。溶液のｐＨ値を、塩化水素（１Ｎ）を用いて３に調整した。固体をろ過によって収集した。これにより、６３．２ｇ（８０％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７６．０（Ｍ＋１）．

【１２２６】

工程２：メチル２－（クロロスルホニル）チアゾール－５－カルボキシレート

１０００Ｌの丸底フラスコ中に、メチル２－メルカプトチアゾール－５－カルボキシレート（３０ｇ、１７０ｍｍｏｌ）及び酢酸（３００ｍＬ）を入れた。この後、次亜塩素酸ナトリウム（３００ｍＬ、８重量％～１０重量％）を、０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、５００ｍＬの水で希釈した。溶液を、３×３００ｍＬのＤＣＭで抽出し、組み合わされた有機層を、２×３００ｍＬの塩水で洗浄し、無水Na_2SO_4上で乾燥させた。ＤＣＭ中の黄色の溶液としての粗生成物を次の工程に使用した。

【１２２７】

工程３：メチル２－スルファモイルチアゾール－５－カルボキシレート

２０００Ｌの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（９００ｍＬ）中の粗製溶液としてメチル２－（クロロスルホニル）チアゾール－５－カルボキシレートを入れた。この溶液に、２０分間０℃未満でNH_3（ｇ）を導入した。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：３）で溶離した。これにより、２３ｇ（７５％、２工程）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２３．０（Ｍ＋１）．

【１２２８】

工程４：５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１

５０ｍＬ）中のメチル２－スルファモイルチアゾール－５－カルボキシレート（１５ｇ、６７．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＭｅＭｇＢｒ／ＴＨＦ（３Ｍ、９０ｍＬ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１４時間撹拌し、次に、１００ｍＬのＮＨ$_4$Ｃｌ（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１５０ｍＬのＤＣＭで抽出した；有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：３）で溶離した。これにより、１１．５ｇ（７８％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：陽イオン及び陰イオンモードでそれぞれ２２３．０（Ｍ＋１）、２２１．０（Ｍ－１）。

【１２２９】

工程５：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンアミド（５ｇ、２２．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、上記に、ＮａＨ（６０重量％、１．８ｇ、４５．０ｍｍｏｌ）を、氷／水浴中で少しずつ加えた。氷／水浴中で２０分間撹拌した後、この後、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中のＴＢＳＣｌ（４．１ｇ、２７．２ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で２分超撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で４時間撹拌した。反応物を、飽和ＮＨ$_4$Ｃｌ（１００ｍＬ）でクエンチし、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層をＮａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗固体を、酢酸エチル／ヘキサン（１：５）（２×１００ｍＬ）で洗浄した。これにより、６．８１ｇ（９０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：陽イオン及び陰イオンモードでそれぞれ３３７．１（Ｍ＋１）、３３５．１（Ｍ－１）。

【１２３０】

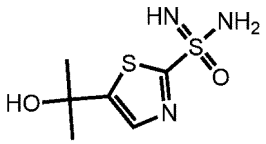
工程６：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（１００ｍＬ）中のＰＰｈ$_3$Ｃｌ$_2$（３ｇ、９．０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＩＥＡ（１．５４ｇ、１１．９ｍｍｏｌ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌した。この後、ＣＨＣｌ$_3$（３０ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンアミド（２．０ｇ、５．９ｍｍｏｌ）の溶液を、氷／水浴中で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を、氷／水浴中で３０分間撹拌した。上記に、１５分間０℃未満でＮＨ$_3$（ｇ）を導入した。得られた溶液を室温で２０分間撹拌した。固体をろ過して取り出し、ろ液を濃縮し、残渣を３００ｍＬの酢酸エチルに溶解させた。溶液を塩水（２×１００ｍＬ）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗固体をＣＨＣｌ$_3$（１００ｍＬ）で洗浄した。次に、ろ液を減圧下で濃縮し、残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：３）を用いてシリカゲルカラムによってさらに精製した。元の洗浄された固体及びシリカゲル精製からの固体を組み合わせた。これにより、１．２ｇ（６０％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３３６．１（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ－ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ７．６６（ｓ，１Ｈ）、７．１２（ｓ，２Ｈ）、５．７８（ｓ，１Ｈ）、１．５１（ｓ，６Ｈ）、０．８６（ｓ，９Ｈ）、０．０２（ｓ，３Ｈ）、０．０１（ｓ，３Ｈ）．

【１２３１】

【化３１９】

中間体2



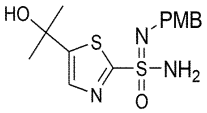
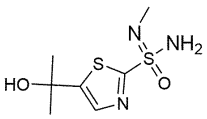
５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド
工程７：５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド（２００ｍｇ、０．６０ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（３ｍＬ）、及びＴＦＡ（０．３ｍＬ）の溶液を入れた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム、Ｃ１８シリカゲル、移動相、水（１０ｍｍｏｌ／ＬのＮＨ$_4$ＨＣＯ$_3$）及びＡＣＮ（２０分で１０％～５０％）、検出器、ＵＶ検出２５４／２１０ｎｍを用いた方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１００ｍｇ（７６％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２２．０（Ｍ＋１）。

【１２３２】

【表７０】

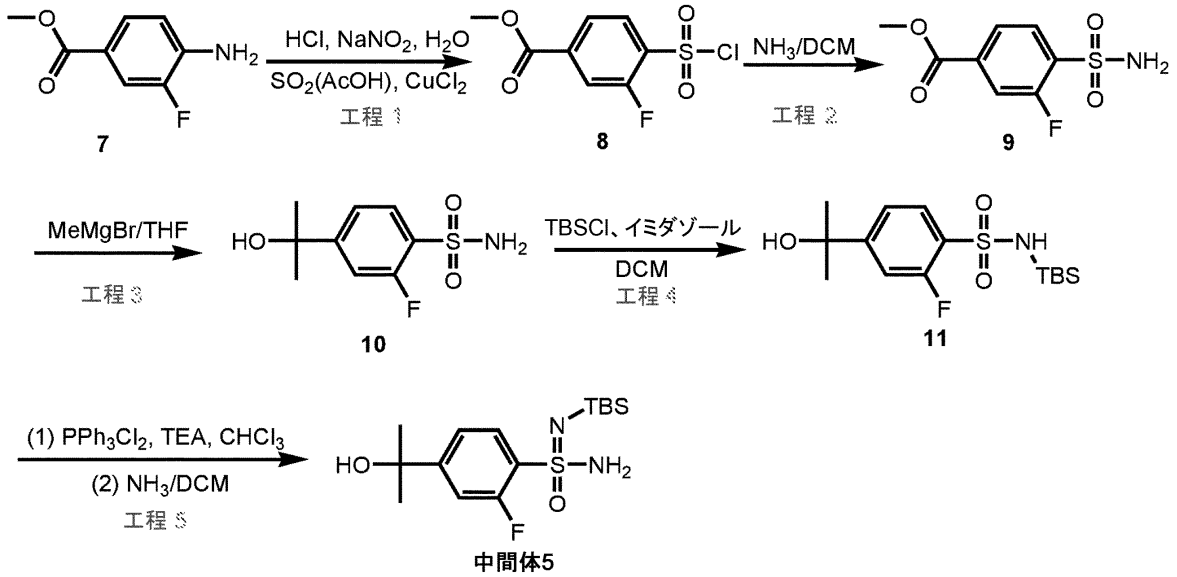
表 2. 工程 6 においてアンモニアを適切なアミンで置換することによって、スキーム 7 に示される化合物 6 を中間体 2 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M+H]$^+$
中間体 3		5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-N'-(4-メトキシベンジル)チアゾール-2-スルホンイミドアミド	342.1
中間体 4		5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-N'-メチルチアゾール-2-スルホンイミドアミド	236.0

【１２３３】

【化３２０】

スキーム8:



中間体5



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－２－フルオロ－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゼンスルホンイミドアミド

工程１：メチル４－（クロロスルホニル）－３－フルオロベンゾエート

１００Ｌの丸底フラスコ中に、ＨＣｌ水溶液（６Ｎ、２０ｍＬ）中のメチル４－アミノ－３－フルオロベンゾエート（１．０ｇ、５．９１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、水（２ｍＬ）中の$NaNO_2$（６１２．４ｍｇ、８．８８ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。上記の混合物を、０℃で撹拌しながらＡｃＯＨ（２０ｍＬ）中のSO_2の飽和溶液に滴下して加えた。次に、上記に、$CuCl_2$（０．７９９ｇ、５．９６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２０ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、１ｇ（粗製、６７％）の表題化合物が黄色の油として得られた。粗生成物を次の工程に使用した。

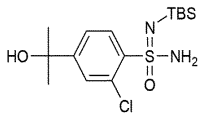
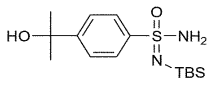
【１２３４】

工程２～５では、スキーム７に示される化合物３を中間体１に転化するための類似の手順を用いて、中間体５を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３４７．２（Ｍ＋１）。

【１２３５】

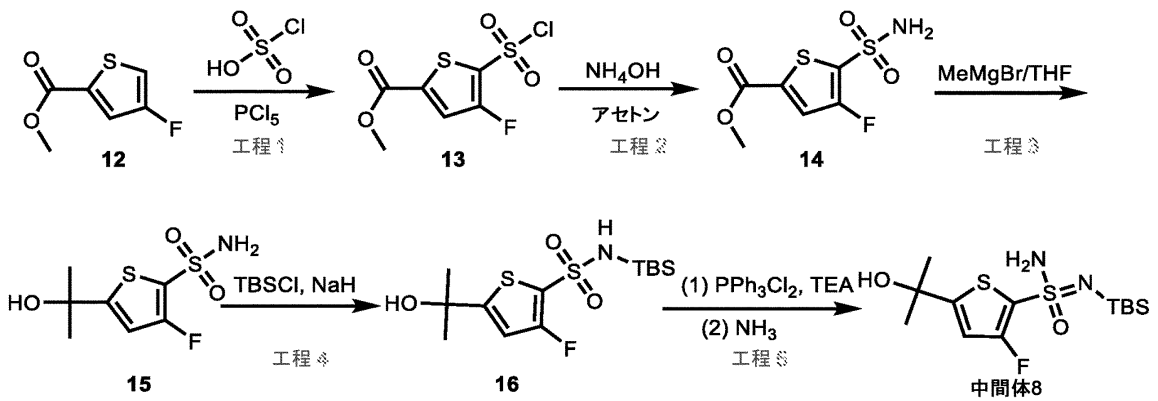
【表７１】

表3. 適切な出発材料から、スキーム8に示される化合物7を中間体5に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

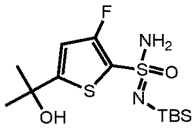
中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M+H]+
中間体 6		N'-(tert-ブチルジメチルシリル)-2-クロロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)ベンゼンスルホンイミドアミド	363.1
中間体 7		N'-(tert-ブチルジメチルシリル)-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)ベンゼンスルホンイミドアミド	329.1

【１２３６】
【化３２１】

スキーム9:



中間体8



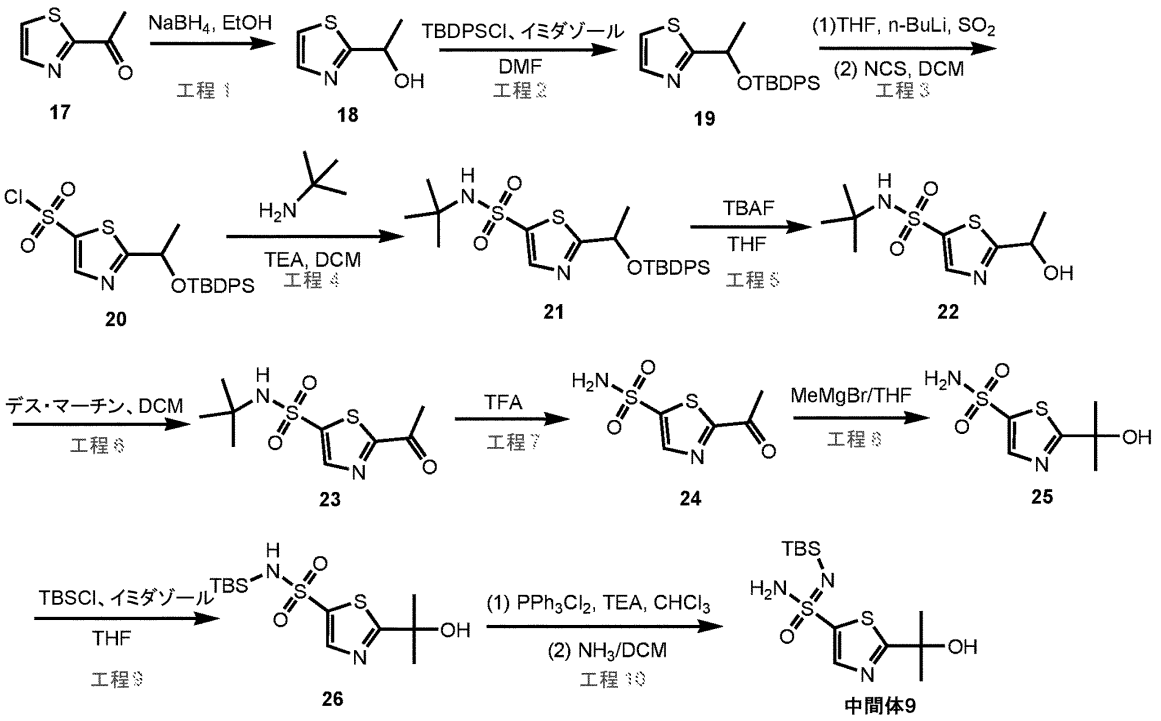
Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－３－フルオロ－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チオフェン－２－スルホンイミドアミド

工程１：メチル５－（クロロスルホニル）－４－フルオロチオフェン－２－カルボキシレート

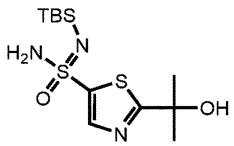
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（１０ｍＬ）中のメチル４－フルオロチオフェン－２－カルボキシレート（１．０ｇ、６．２４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、上記に、ＣｌＳＯ$_3$Ｈ（２．１８ｇ、１８．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１２時間撹拌した。次に、上記に、ＰＣｌ$_5$（６．５ｇ、３１．２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を５０℃で２時間撹拌し、次に、３０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×３０ｍＬの酢酸エチルで抽出し；有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、１．２ｇ（粗製、７４％）の表題化合物が濃い赤色の油として得られた。粗生成物を次の工程に使用した。

【１２３７】
工程２：メチル４－フルオロ－５－スルファモイルチオフェン－２－カルボキシレート
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、アセトン（６ｍＬ）中のメチル５－（クロロスルホニル）－４－フルオロチオフェン－２－カルボキシレート（６００ｍｇ、２．３２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、上記に、NH_4OH水溶液（２５重量％、２ｍＬ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌し、次に、１０ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を、３×１０ｍＬの酢酸エチルで抽出し；有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、５００ｍｇ（粗製、９０％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３８．０（Ｍ－１）。
【１２３８】
工程３～５では、スキーム７に示される化合物４を中間体１に転化するための類似の手順を用いて、中間体８を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３５３．１（Ｍ＋１）。
【１２３９】
【化３２２】

スキーム10A:



中間体9



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド
工程１：１－（チアゾール－２－イル）エタノール
５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＥｔＯＨ（２００ｍＬ）中の１－（チアゾール－２－イル）エタノン（２０ｇ、１５７ｍｍｏｌ）を入れた。この後、$NaBH_4$（３ｇ、８１．３ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、１０ｍＬのNH_4Cl（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、２００ｍ

Ｌの水で希釈し、２×２００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、２０ｇ（９８％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１３０．０（Ｍ＋１）。

【１２４０】

工程２：２－（１－（Ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、１－（チアゾール－２－イル）エタノール（２０ｇ、１５４．８ｍｍｏｌ）、ＤＭＦ（１５０ｍＬ）、及びイミダゾール（２０．５ｇ、３０１ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＴＢＤＰＳＣｌ（４６ｇ、１６７ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。混合物を室温で２時間撹拌し、次に、３００ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を、３×２００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１００～１：８０）で溶離した。これにより、５５ｇ（９７％）の表題化合物が無色油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３６８．１（Ｍ＋１）。

【１２４１】

工程３：２－（１－（Ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール－５－スルホニルクロリド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、２－（１－（ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール（３０ｇ、８１．６ｍｍｏｌ）及びＴＨＦ（２００ｍＬ）を入れた。この後、ｎ－ＢｕＬｉ／ＴＨＦ（２．５Ｍ、３５．２ｍＬ）を、－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を－７８℃で０．５時間撹拌し、次に、SO_2を上記の反応混合物中に導入した。反応物をゆっくりと室温に温め、次に、ＮＣＳ（１２．８ｇ、９５．８６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られたろ液を減圧下で濃縮した。これにより、３０ｇ（粗製、７９％）の表題化合物が褐色の油として得られた。粗生成物を直接次の工程に使用した。

【１２４２】

工程４：Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（１－（ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール－５－スルホンアミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（１－（ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール－５－スルホニルクロリド（粗製、３０ｇ、６４．４ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（２００ｍＬ）、及びＴＥＡ（１３ｇ、１２８ｍｍｏｌ）を入れた。この後、２－メチルプロパン－２－アミン（５．６ｇ、７６．６ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：３０～１：２０）で溶離した。これにより、２５ｇ（７７％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５０３．２（Ｍ＋１）。

【１２４３】

工程５：Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－５－スルホンアミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（１－（ｔｅｒｔ－ブチルジフェニルシリルオキシ）エチル）チアゾール－５－スルホンアミド（２５ｇ、４９．７ｍｍｏｌ）、ＴＨＦ（２００ｍＬ）、及びＴＢＡＦ（３０ｇ、９９．６７ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、２００ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を、３×２００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０～１：１０）で溶離した。これにより、１２ｇ（９１％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６５．１（Ｍ＋１）。

【１２４４】

工程６：２－アセチル－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチルチアゾール－５－スルホンアミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２００ｍＬ）中のＮ－ｔｅｒｔ－ブチル－２

－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－５－スルホンアミド（１２ｇ、４５．４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、デス・マーチン試薬（２０ｇ、４７．２ｍｍｏｌ）を室温で少しずつ加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０～１：１０）で溶離した。これにより、９ｇ（７６％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６３．０（Ｍ＋１）。

【１２４５】

工程７：２－アセチルチアゾール－５－スルホンアミド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２０ｍＬ）中の２－アセチル－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチルチアゾール－５－スルホンアミド（７ｇ、２６．７ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ＴＦＡ（２０ｍＬ）を室温で加えた。得られた溶液を７０℃で１４時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：３）で溶離した。これにより、５ｇ（９１％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０７．０（Ｍ＋１）。

【１２４６】

工程８：２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の２－アセチルチアゾール－５－スルホンアミド（５ｇ、４．８５ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＭｅＭｇＢｒ（ＴＨＦ中３Ｍ、８．１ｍＬ、２４．３ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１４時間撹拌し、次に、１００ｍＬのNH_4Cl（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×１５０ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：３）で溶離した。これにより、２．９ｇ（５４％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２３．０（Ｍ＋１）。

【１２４７】

工程９：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド（１．５ｇ、６．７５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、上記に、イミダゾール（０．９２ｇ、１３．５ｍｍｏｌ）を加えた。この後、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のＴＢＳＣｌ（５．１ｇ、３４ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で２分間にわたって撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：３～１：２）で溶離した。これにより、１．１３ｇ（５０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３３７．１（Ｍ＋１）。

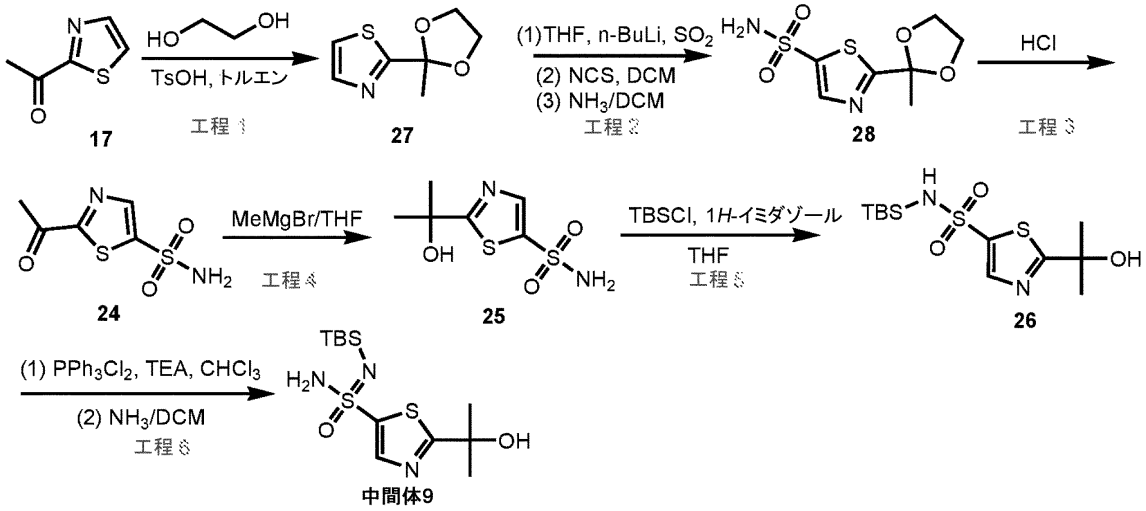
【１２４８】

工程１０では、スキーム７に示される化合物６を中間体１に転化するのに用いられる類似の手順を用いて、中間体９を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３３６．１（Ｍ＋１）。

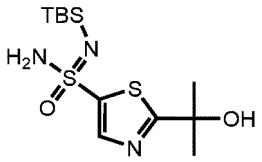
【１２４９】

【化３２３】

スキーム10B:



中間体9



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド

工程１：２－（２－メチル－１，３－ジオキソラン－２－イル）チアゾール

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、トルエン（３００ｍＬ）中の１－（チアゾール－２－イル）エタノン（２０ｇ、１５７ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ＴｓＯＨ（２．７ｇ、１５．７ｍｍｏｌ））及びエタン－１，２－ジオール（１９．５ｇ、３１４ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を一晩還流させ、還流中に水を溶液から分離した。得られた溶液を２００ｍＬの水で希釈し、２×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、２６．６ｇ（９９％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７２．０（Ｍ＋１）。

【１２５０】

工程２：２－（２－メチル－１，３－ジオキソラン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２００ｍＬ）中の２－（２－メチル－１，３－ジオキソラン－２－イル）チアゾール（１４ｇ、８１．６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ｎ－ＢｕＬｉ（ＴＨＦ中２．５Ｍ、３５．２ｍＬ）を、－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を－７８℃で０．５時間撹拌し、次に、SO_2ガスを上記の反応混合物中に導入した。反応物をゆっくりと室温に温め、次に、ＮＣＳ（１２．８ｇ、９５．８６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られたろ液を減圧下で濃縮し、次に、ＤＣＭ（１６０ｍＬ）で希釈した。上記に、ＤＣＭ（３００ｍＬ）中のアンモニアの飽和溶液を加えた。得られた溶液を室温で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０～１：５）の勾配で溶離した。これにより、１２．５ｇ（６１％）の表題化合物が黄色の固体と

して得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５１．０（Ｍ＋１）。

【１２５１】

工程３：２－アセチルチアゾール－５－スルホンアミド

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１２５ｍＬ）中の２－（２－メチル－１，３－ジオキソラン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド（１２．５ｇ、５０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記に、ＨＣｌ水溶液（４Ｎ、５０ｍＬ）を加えた。得られた溶液を７０℃で６時間撹拌した。得られた溶液を１００ｍＬの水で希釈し、２×２００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２～１：１）の勾配で溶離した。これにより、９．３ｇ（９０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０７．０（Ｍ＋１）。

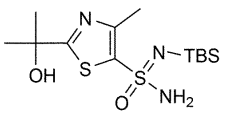
【１２５２】

工程４～６では、スキーム１０Ａに示される化合物２４を中間体９に転化するための同じ手順を用いて、中間体９を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３３６．１（Ｍ＋１）。

【１２５３】

【表７２】

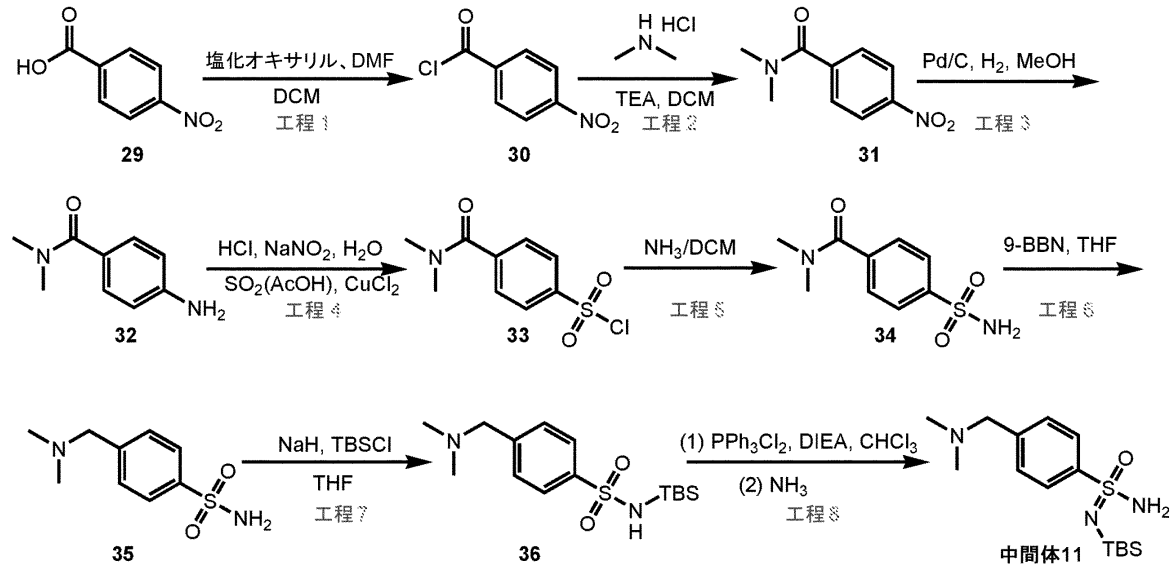
表 4. 適切な出発材料から、スキーム 10B に示される化合物 17 を中間体 9 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M+H]$^+$
中間体 10		N'-(tert-ブチルジメチルシリル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-スルホンイミドアミド	350.2

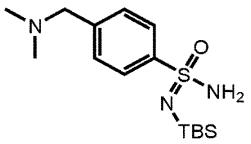
【１２５４】

【化３２４】

スキーム11:



中間体11



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（（ジメチルアミノ）メチル）ベンゼンスルホンイミドアミド

工程１：４－ニトロベンゾイルクロリド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、４－ニトロ安息香酸（２０ｇ、１２０ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（２００ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．２ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（１５ｍＬ、１３５ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で４時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。これにより、２２ｇ（粗製）の表題化合物が黄色の油として得られた。粗生成物を次の工程に使用した。

【１２５５】

工程２：Ｎ，Ｎ－ジメチル－４－ニトロベンズアミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジメチルアミン塩酸塩（９．８ｇ、１２０ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（２００ｍＬ）、及びＴＥＡ（４１．５ｍＬ、３００ｍｍｏｌ）を入れた。この後、４－ニトロベンゾイルクロリド（２２ｇ、粗製）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で６時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。得られた混合物を２×５０ｍＬの水で洗浄した。固体をろ過によって収集した。これにより、１６ｇ（６９％、２工程）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９５．１（Ｍ＋１）．

【１２５６】

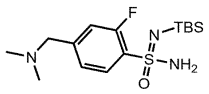
工程３：４－アミノ－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンズアミド

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、Ｎ，Ｎ－ジメチル－４－ニトロベンズアミド（１６ｇ、８２．４ｍｍｏｌ）、ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）、及びＰｄ／Ｃ（１０重量％、１ｇ）を入れた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、室温で１２時間撹拌した。Ｐｄ／Ｃ触媒をろ過して取り出し、ろ液を減圧下で濃縮した。これにより、１３ｇ（９６％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１６５．１（Ｍ＋１）。

【１２５７】
工程４：４－（ジメチルカルバモイル）ベンゼン－１－スルホニルクロリド
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－Ｎ，Ｎ－ジメチルベンズアミド（３ｇ、１８．３ｍｍｏｌ）及びＨＣｌ（６Ｍ、１２ｍＬ）を入れた。この後、水（３ｍＬ）中の$NaNO_2$（１．５ｇ、２１．７ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。上記の混合物を、ＡｃＯＨ（１００ｍＬ）中のSO_2の飽和溶液に、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。上記に、$CuCl_2$（４．８ｇ、３５．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×１００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、５ｇ（粗製）の表題化合物が黄色の油として得られた。粗生成物を次の工程に使用した。
【１２５８】
工程５：Ｎ，Ｎ－ジメチル－４－スルファモイルベンズアミド
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２０ｍＬ）中の４－（ジメチルカルバモイル）ベンゼン－１－スルホニルクロリド（５ｇ、２０．２ｍｍｏｌ）を入れた。上記に、ＤＣＭ（８０ｍＬ）中のアンモニアの飽和溶液を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。得られた混合物を３×１００ｍＬの酢酸エチルで洗浄した。固体をろ過して取り出した。得られたろ液を減圧下で濃縮した。これにより、３．１ｇ（６７％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２９．１（Ｍ＋１）。
【１２５９】
工程６：４－（（ジメチルアミノ）メチル）ベンゼンスルホンアミド
窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５０ｍＬ）中のＮ，Ｎ－ジメチル－４－スルファモイルベンズアミド（１．８ｇ、７．９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、９－ＢＢＮ（５．８ｇ、４７．５ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を７０℃で１２時間撹拌し、次に、２０ｍＬの水／氷の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせた。得られた混合物を２００ｍＬの水で洗浄し、次に、有機層を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、ＤＣＭ／ＭｅＯＨ（２０：１～１５：１）で溶離した。これにより、１ｇ（５９％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１５．１（Ｍ＋１）．
【１２６０】
工程７：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（（ジメチルアミノ）メチル）ベンゼンスルホンアミド
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（４０ｍＬ）中の４－（（ジメチルアミノ）メチル）ベンゼンスルホンアミド（５００ｍｇ、２．３３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％、１７０ｍｇ）を０℃で少しずつ加えた。次に、ＴＢＳＣｌ（１．７５ｇ、１１．６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、３０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×４０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、ＤＣＭ／ＭｅＯＨ（３０：１～２０：１）で溶離した。これにより、５４０ｍｇ（７０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３２９．２（Ｍ＋１）。
【１２６１】
工程８では、スキーム７に示される化合物６を中間体１に転化するための類似の手順を用いて、中間体１１を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３２８．２（Ｍ＋１）。
【１２６２】

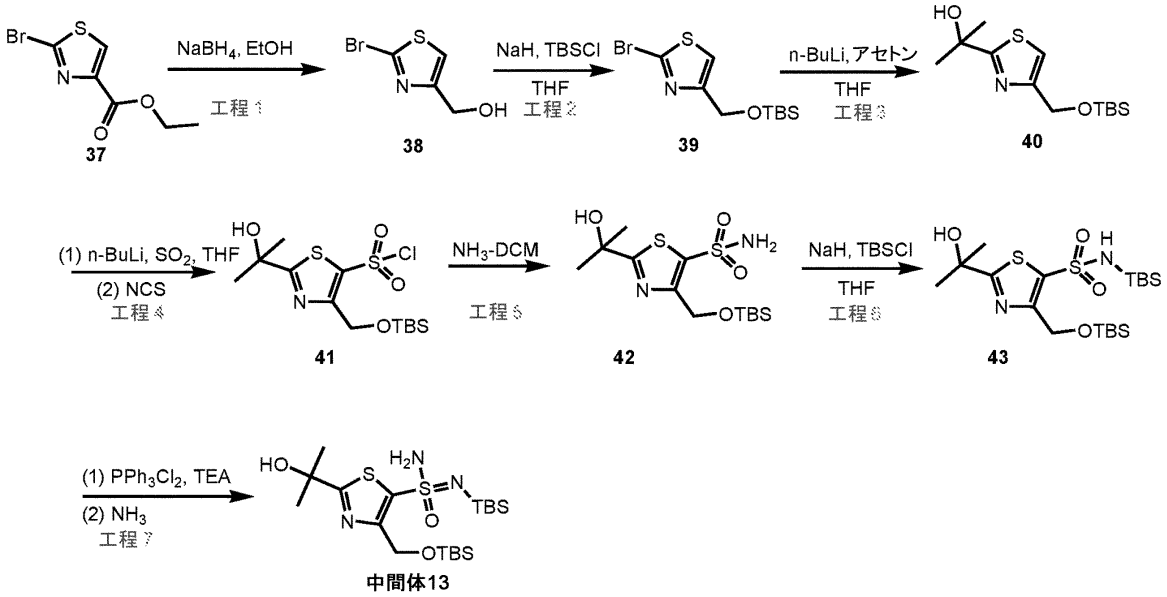
【表７３】

表 4. 適切な出発材料から、スキーム 11 に示される化合物 29 を中間体 11 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

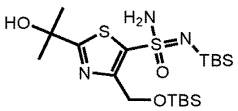
中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M+H]$^+$
中間体 12		N'-(tert-ブチルジメチルシリル)-4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロベンゼンスルホンイミドアミド	346.2

【１２６３】
【化３２５】

スキーム12:



中間体13



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド

工程１：（２－ブロモチアゾール－４－イル）メタノール

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＥｔＯＨ（３０ｍＬ）中のエチル２－ブロモ－１，３－チアゾール－４－カルボキシレート（３ｇ、１２．７１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。ＮａＢＨ$_4$（１．０ｇ、２５．４１ｍｍｏｌ）を、氷／水浴を用いて少しずつ加えた。得られた溶液を室温で３時間撹拌した。次に、反応物を、氷／水浴中での１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し、組み合わされた有機層を濃縮した。これにより、２ｇ（８１％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９６．２、１９４．２（Ｍ＋１）。

【１２６４】

工程２：２－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）チアゾール

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の（２－ブロモ－１，３－チアゾール－４－イル）メタノール（２．０ｇ、１０．３１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ＮａＨ（６０重量％、１．２ｇ、３０．９２ｍｍｏｌ）を、氷／水浴を用いて少しずつ加えた。室温で１５分間撹拌した後、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のＴＢＳＣｌ（４．７ｇ、３０．９２ｍｍｏｌ）の溶液を氷／水浴中で滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。次に、反応物を、５０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：３０）で溶離した。これにより、２．５ｇ（７９％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３１０．２、３０８．２（Ｍ＋１）。

【１２６５】

工程３：２－（４－（（Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）チアゾール－２－イル）プロパン－２－オール

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３０ｍＬ）中の２－ブロモ－４－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ］メチル］－１，３－チアゾール（２．５ｇ、８．１１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５Ｍ、４．８６ｍＬ、１２．１６ｍｍｏｌ）を－７８℃で滴下して加え；得られた混合物を－７８℃で３０分間撹拌した。上記に、アセトン（０．９ｇ、１６．２２ｍｍｏｌ）を－７８℃で滴下して加えた。次に、得られた溶液を室温で１時間撹拌し、その後、反応物を、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し；有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）で溶離した。これにより、２ｇ（８６％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８８．２（Ｍ＋１）。

【１２６６】

工程４：４－（（Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホニルクロリド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の２－（４－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ］メチル］－１，３－チアゾール－２－イル）プロパン－２－オール（２ｇ、６．９６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５Ｍ、８．４ｍＬ、２０．９ｍｍｏｌ）を－７８℃で滴下して加え；混合物を－７８℃で３０分間撹拌した。次に、SO_2を、－３０℃未満で１０分間にわたってこの溶液中に導入し、室温で３０分間撹拌した。得られた溶液を減圧下で濃縮した。粗固体をＤＣＭ（３０ｍｌ）に溶解させた後、ＮＣＳ（１．４ｇ、１０．４ｍｍｏｌ）を氷／水浴中で少しずつ加えた。溶液を室温で２時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、２．５ｇ（粗製）の表題化合物が黄色の固体として得られた。

【１２６７】

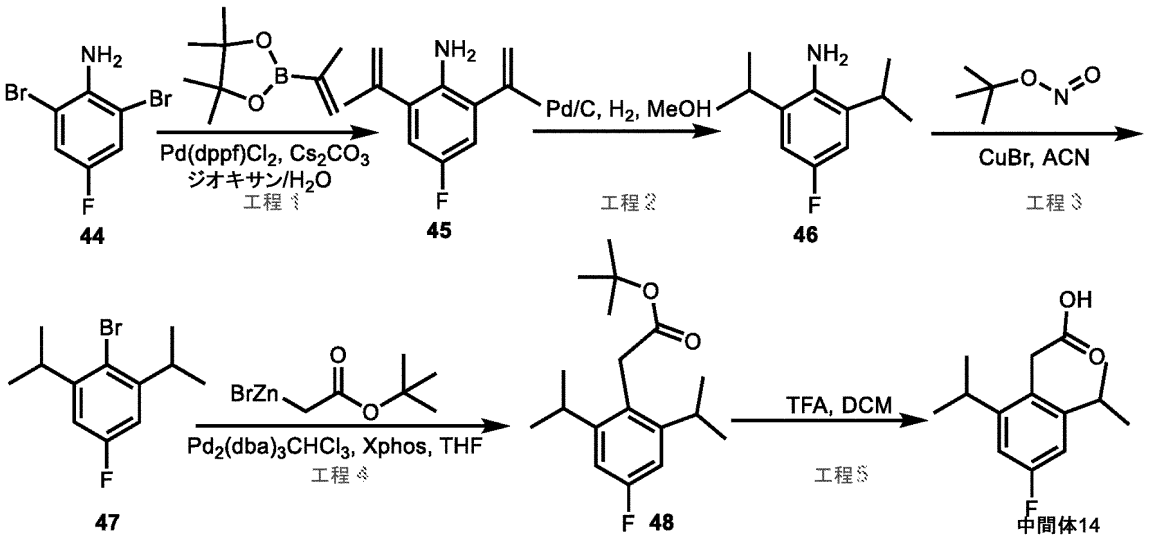
工程５：４－（（Ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（３０ｍＬ）中の４－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ］メチル］－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－スルホニルクロリド（２．５ｇ、６．４８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記に、氷／水浴中で、ＤＣＭ（１０ｍＬ）中のアンモニアの飽和溶液を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）で溶離した。これにより、１．２ｇ（５１％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３６７．２（Ｍ＋１）。

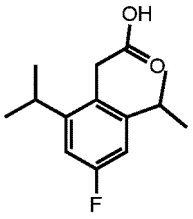
【１２６８】
工程６：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンアミド
ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－スルホンアミド（１．２ｇ、３．２７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＮａＨ（６０重量％、０．４ｇ、９．８２ｍｍｏｌ）を、氷／水浴を用いて少しずつ加えた。室温で１５分間撹拌した後、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のＴＢＳＣｌ（１．５ｇ、９．８２ｍｍｏｌ）の溶液を氷／水浴中で滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。反応物を、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１．３ｇ（８３％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４８１．２（Ｍ＋１）。
【１２６９】
工程７：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）メチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（１０ｍＬ）中のPPh_3Cl_2（１．４ｇ、４．０６ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、ＴＥＡ（０．８ｇ、８．１１ｍｍｏｌ）を氷／水浴中で滴下して加えた。溶液を室温で２０分間撹拌した。この溶液に、$CHCl_3$（１０ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ］メチル］－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－スルホンアミド（１．３ｇ、２．７０ｍｍｏｌ）を、氷／水浴中で滴下して加え、溶液を室温で０．５時間撹拌した。ＤＣＭ（２０ｍＬ）中のアンモニアの飽和溶液を、０℃でこの溶液中に注いだ。溶液を室温で１時間撹拌した。得られた溶液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）で溶離した。これにより、６００ｍｇ（４６％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４８０．２（Ｍ＋１）。
【１２７０】
フェニル酢酸中間体のためのスキーム：スキーム１３～２２は、フェニル酢酸中間体の調製を示す。
【１２７１】

【化３２６】

スキーム13:



中間体14



２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

工程１：４－フルオロ－２，６－ジ（プロパ－１－エン－２－イル）アニリン

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、２，６－ジブロモ－４－フルオロアニリン（１５ｇ、５５．８ｍｍｏｌ）、ジオキサン（１５０ｍＬ）、水（１５ｍＬ）、Cs_2CO_3（５５ｇ、１６９ｍｍｏｌ）、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（２５ｇ、１４９ｍｍｏｌ）、及び$Pd(dppf)Cl_2$（４ｇ、５．４７ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を１００℃で１５時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。混合物を３００ｍＬの水で希釈し、酢酸エチル（３×３００ｍＬ）で抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：８）で溶離した。これにより、９．２ｇ（８６％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９２．１（Ｍ＋１）。

【１２７２】

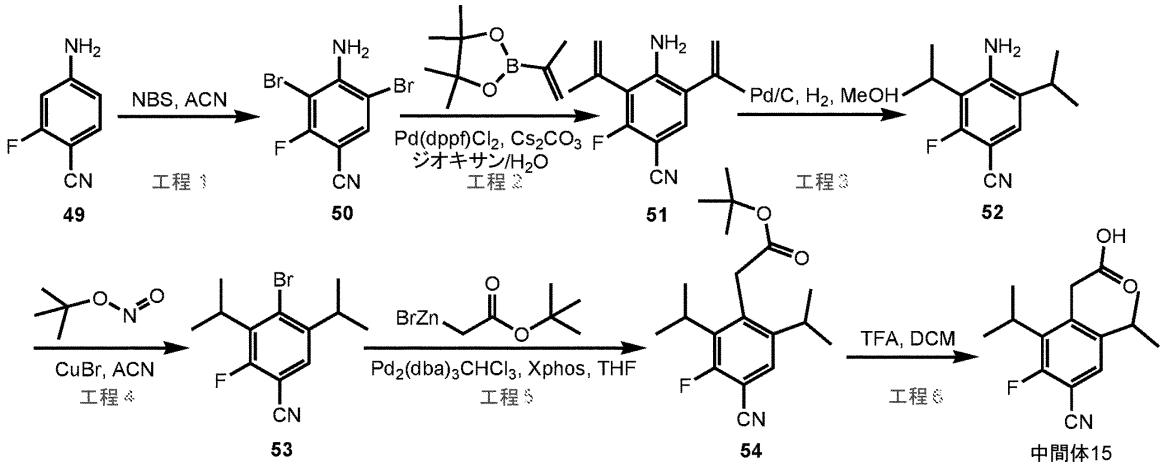
工程２：４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）中の４－フルオロ－２，６－ビス（プロパ－１－エン－２－イル）アニリン（９．２ｇ、４８．１ｍｍｏｌ）を入れた。次に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、９００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、室温で１２時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：８）で溶離した。これにより、７．２ｇ（７７％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９６．１（Ｍ

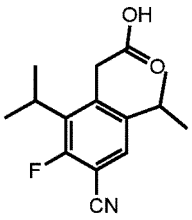
＋１）。
【１２７３】
工程３：２－ブロモ－５－フルオロ－１，３－ビス（プロパン－２－イル）ベンゼン
窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（７ｇ、３５．９ｍｍｏｌ）、ＡＣＮ（３００ｍＬ）、及びＣｕＢｒ（７．７１ｇ、５３．９ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ｔｅｒｔ－ブチルニトリル（５．５５ｇ、５３．８ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を６０℃で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣を、石油エーテルで溶離されるシリカゲルカラム上に適用した。これにより、３．０ｇ（３２％）の表題化合物が黄色の油として得られた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）：δ　７．０９（ｄ，Ｊ＝９．８Ｈｚ、２Ｈ）、３．４０（ｈｅｐｔ、Ｊ＝６．９Ｈｚ、２Ｈ）、１．２０（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ、１２Ｈ）．
【１２７４】
工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート
窒素でパージされ及び窒素下に維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、２－ブロモ－５－フルオロ－１，３－ビス（プロパン－２－イル）ベンゼン（３．０ｇ、１１．６ｍｍｏｌ）、ＴＨＦ（１５０ｍＬ）、Ｘ－ｐｈｏｓ（５５３ｍｇ、１．１６ｍｍｏｌ）、及びＰｄ$_{2}$（ｄｂａ）$_{3}$ＣＨＣｌ$_{3}$（６００ｍｇ、０．５８ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で０．５時間撹拌した。次に、上記に、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（６．０ｇ、２３．０４ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を７０℃で５時間撹拌し、その後、それを、１００ｍＬのＮＨ$_{4}$Ｃｌ（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１００～３：９７）で溶離した。これにより、３．１４ｇ（９２％）の表題化合物が黄色の油として得られた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ　６．９３（ｄ，Ｊ＝１０．４Ｈｚ、２Ｈ）、３．６７（ｓ，２Ｈ）、３．１９－３．０７（ｍ，２Ｈ）、１．３９（ｓ，９Ｈ）、１．１５（ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ、１２Ｈ）．
【１２７５】
工程５：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ｔｅｒｔ－ブチル２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（１．５６ｇ、５．３０ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（１０ｍＬ）、及びＴＦＡ（１０ｍＬ）を入れた。得られた溶液を室温で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を１００ｍＬのＮａＯＨ（４Ｎ）に溶解させ、３×５０ｍＬのＤＣＭで洗浄して、不純物を除去した。水性相のｐＨ値を、ＨＣｌ（４Ｎ）を用いて２に調整し；次に、水性相を、３×１００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１．０９ｇ（８６％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３７．１（Ｍ－１）。
【１２７６】

【化３２７】

スキーム14:



中間体15



２－（４－シアノ－３－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸
工程１：４－アミノ－３，５－ジブロモ－２－フルオロベンゾニトリル
１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－２－フルオロベンゾニトリル（２５ｇ、１８４ｍｍｏｌ）、ＡＣＮ（５００ｍＬ）、及びＮＢＳ（８１．７ｇ、４５９ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を７５℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１００～１：９８）で溶離した。これにより、５０ｇ（９３％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２９４．９／２９２．９／２９６．９（Ｍ＋１）。

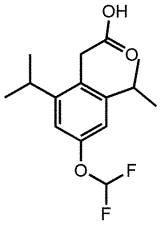
【１２７７】

工程２～６では、スキーム１３に示される化合物４４を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体１５を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２６２．１（Ｍ－１）。

【１２７８】

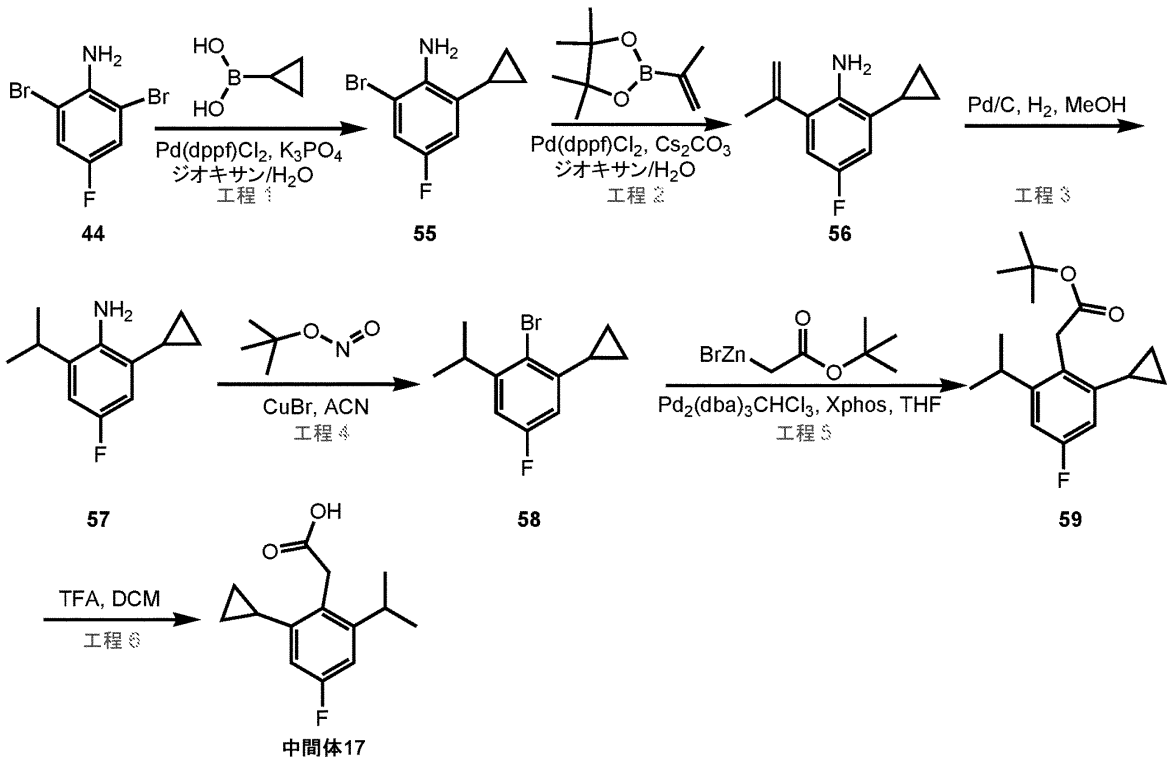
【表７４】

表 5. 適切な出発材料から、スキーム 14 に示される化合物 49 を中間体 15 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

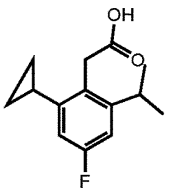
中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M-H]$^+$
中間体 16		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	285.1

【１２７９】
【化３２８】

スキーム15:



中間体17



２－（２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）酢酸
工程１：２－ブロモ－６－シクロプロピル－４－フルオロベンゼンアミン

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、２，６－ジブロモ－４－フルオロベンゼンアミン（１０ｇ、３７．２ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（２００ｍＬ）、水（１０ｍＬ）、K_3PO_4（２３．６ｇ、１１１ｍｍｏｌ）、シクロプロピルボロン酸（９．５９ｇ、１１２ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（１．３６ｇ、１．８６ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を９０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：４０～１：２０）で溶離した。これにより、３．４ｇ（４０％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３０．０（Ｍ＋１）。

【１２８０】

工程２：２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼンアミン

窒素でパージされ及び窒素下に維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－ブロモ－６－シクロプロピル－４－フルオロベンゼンアミン（３．４ｇ、１４．８ｍｍｏｌ）、ジオキサン（１００ｍＬ）、水（１０ｍＬ）、Cs_2CO_3（１４．５ｇ、４４．５ｍｍｏｌ）、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（３．７５ｇ、２２．３ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（１．１ｇ、１．５０ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を１１０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：４０～１：２０）で溶離した。これにより、１．７ｇ（６０％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９２．１（Ｍ＋１）。

【１２８１】

工程３：２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－イソプロピルベンゼンアミン

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼンアミン（１．７ｇ、８．８９ｍｍｏｌ）、及びＭｅＯＨ（１００ｍＬ）を入れた。次に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、１００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、室温で３時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、１．５３ｇ（８９％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９４．１（Ｍ＋１）。

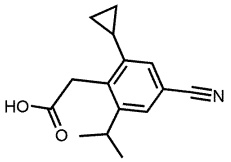
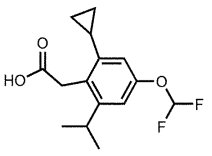
【１２８２】

工程４～６では、スキーム１３に示される化合物４６を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体１７を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２３５．１（Ｍ－１）。

【１２８３】

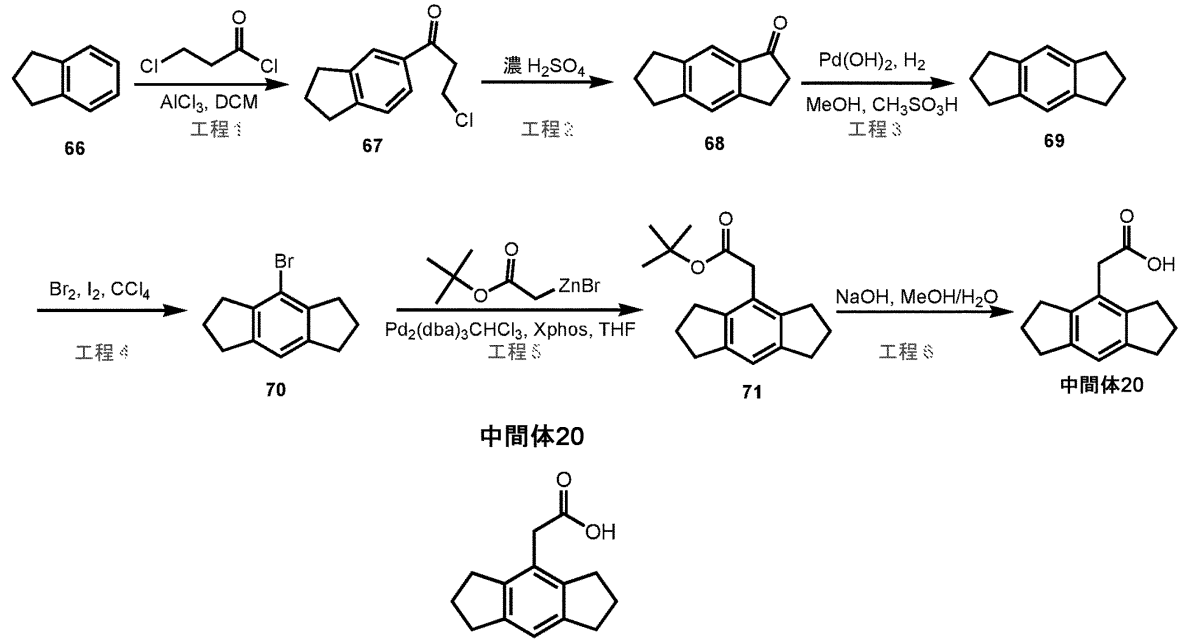
【表７５】

表 7. 適切な出発材料から、スキーム 15 に示される化合物 44 を中間体 17 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M-H]$^+$
中間体 18		2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)酢酸	242.1
中間体 19		2-(2-シクロプロピル-4-(ジフルオロメトキシ)-6-イソプロピルフェニル)酢酸	283.1

【１２８４】
【化３２９】

スキーム16:



中間体20

２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）酢酸
工程１：３－クロロ－１－（２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－５－イル）プロパン－１－オン
１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（４００ｍＬ）中のＡｌＣｌ$_3$（３７ｇ、２７８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＣＭ（１００ｍＬ）中の２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン（３０ｇ、２５４ｍｍｏｌ）及び３－クロロプロパノイルクロリド（３２．１ｇ、２５３ｍｍｏｌ）の溶液を、３０分間で、－１０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。次に、反応混合物を、冷ＨＣｌ（３Ｎ、４００ｍＬ）に、－１０℃で４５分間にわたって滴下して加えた。得られた溶液を、３×２００ｍＬのＤＣＭで抽出し；有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、５３．５ｇ（粗製）の表題化合物が黄色の固体として得られた。粗生成物を次の工程に使用した。

【１２８５】
工程２：１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－１－オン
１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、濃Ｈ$_2$ＳＯ$_4$（３００ｍＬ）中の３－クロロ－１－（２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－５－イル）プロパン－１－オン（５３．５ｇ、２５３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を５５℃で１６時間撹拌し、次に、反応混合物を１５００ｍＬの水／氷に注意深く加えることによってクエンチした。固体をろ過によって収集し、次に、２４時間にわたって赤外線灯で乾燥させた。これにより、３７．４ｇ（８５％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。

【１２８６】
工程３：１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン
１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロｓ－インダセン－１－オン（３７．２ｇ、２１６ｍｍｏｌ）、ＭｅＯＨ（３００ｍＬ）、及びＣＨ$_3$ＳＯ$_3$Ｈ（４２ｇ、４３７．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、Ｐｄ（ＯＨ）$_2$／Ｃ（２０重量％、８ｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、室温で１６時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油

エーテル（１：１５０～１：１００）で溶離した。これにより、２７．１ｇ（７９％）の表題化合物が白色の固体として得られた。

【１２８７】

工程４：４－ブロモ－１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン

窒素でパージされ及び窒素下に維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＣｌ$_4$（２００ｍＬ）中の１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン（１５ｇ、９４．８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、Ｉ$_2$（１．２ｇ、４．７２ｍｍｏｌ）を加えた。この後、ＣＣｌ$_4$（５０ｍＬ）中のＢｒ$_2$（１６ｇ、１００ｍｍｏｌ）の溶液を、１０分間で、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で２時間撹拌した。次に、反応物を、１５０ｍＬのＮＨ$_4$Ｃｌ（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１５０ｍＬのＤＣＭで抽出し、有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテルで溶離した。これにより、１８．０ｇ（８０％）の表題化合物が黄色の油として得られた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ　７．０２（ｓ，１Ｈ）、２．９５－２．７５（ｍ，８Ｈ）、２．０３－２．０１（ｍ，４Ｈ）．

【１２８８】

工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）アセテート

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の４－ブロモ－１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン（１ｇ、４．２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、Ｘ－ｐｈｏｓ（２００ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）及びＰｄ$_2$（ｄｂａ）$_3$ＣＨＣｌ$_3$（２２０ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌した。この後、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（２．２ｇ、８．４５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を８０℃で４時間撹拌し、次に、５０ｍＬのＮＨ$_4$Ｃｌ（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１．４ｇ（粗製）の表題化合物が褐色の油として得られた。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ　６．９６（ｓ，１Ｈ）、３．４７（ｓ，２Ｈ）、２．８０－２．７８（ｍ，８Ｈ）、２．０１－１．９９（ｍ，４Ｈ）、１．３９（ｓ，９Ｈ）．

【１２８９】

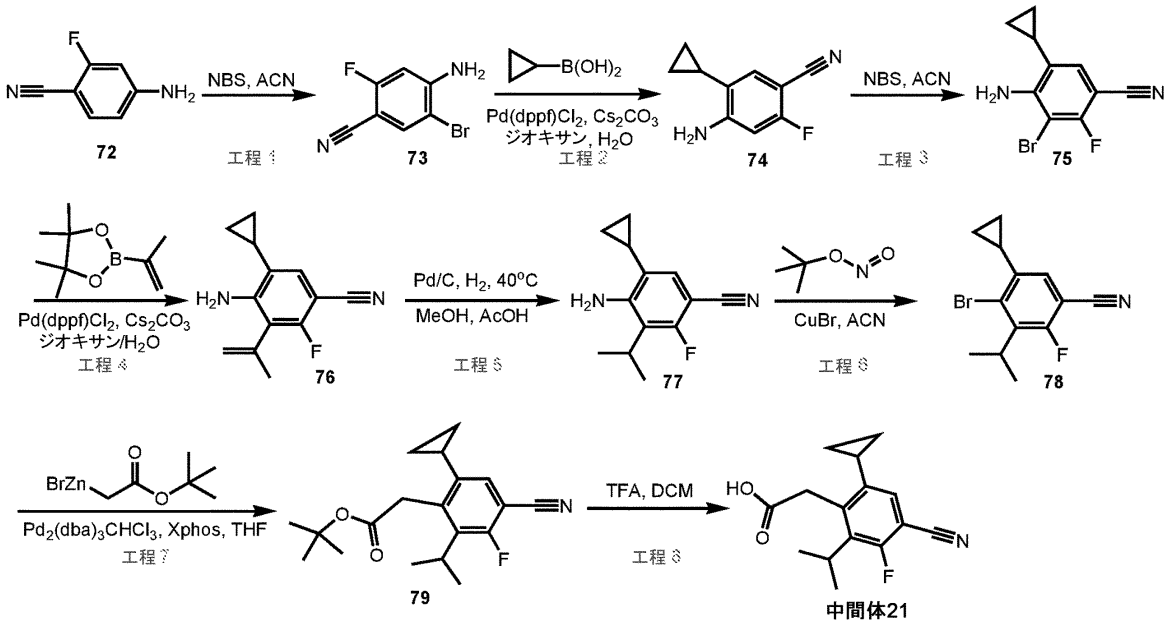
工程６：２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）酢酸

４０ｍＬの密閉管中に、６Ｍの水酸化ナトリウム／ＭｅＯＨ（４／６ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）アセテート（１．４ｇ、５．１４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を１００℃で１６時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×３０ｍＬのＤＣＭで抽出し、水層を組み合わせた。溶液のｐＨ値を、塩化水素（１Ｎ）を用いて２に調整した。得られた溶液を、３×５０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、１８０ｍｇ（１９．８％、２工程）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１５．１（Ｍ－１）。

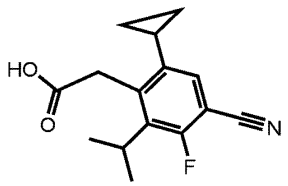
【１２９０】

【化３３０】

スキーム17:



中間体21



２－（４－シアノ－６－シクロプロピル－３－フルオロ－２－イソプロピルフェニル）酢酸

工程１：４－アミノ－５－ブロモ－２－フルオロベンゾニトリル

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（１２０ｍＬ）中の４－アミノ－２－フルオロベンゾニトリル（９ｇ、６６．１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、ＮＢＳ（１２．４ｇ、６９．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を８０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０～１：１０）で溶離した。これにより、１０．９ｇ（７７％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１５．０／２１７．０（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ ７．８９（ｄ，Ｊ＝６．０Ｈｚ、１Ｈ）、６．６９（ｂｒｓ，２Ｈ）、６．６３（ｄ，Ｊ＝１２．０Ｈｚ、１Ｈ）．

【１２９１】

工程２：４－アミノ－５－シクロプロピル－２－フルオロベンゾニトリル

窒素でパージされ及び窒素下に維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－５－ブロモ－２－フルオロベンゾニトリル（６．３７ｇ、２９．６ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（７０ｍＬ）、水（１０ｍＬ）、Ｃｓ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（９．７ｇ、２９．８ｍｍｏｌ）、シクロプロピルボロン酸（３．８ｇ、４４．２ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_{2}$（１．０８ｇ、１．４８ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を９０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：５）で溶離した。これにより、５．０３ｇ（９６％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７７．１（Ｍ＋１）。

【１２９２】

工程３：４－アミノ－３－ブロモ－５－シクロプロピル－２－フルオロベンゾニトリル

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－５－シクロプロピル－２－フルオロベンゾニトリル（５．０３ｇ、２８．７ｍｍｏｌ）、ＡＣＮ（５０ｍＬ）、及びＮＢＳ（５．

６ｇ、３１．５ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を８０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：５）で溶離した。これにより、６．９７２ｇ（９６％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５５．０／２５７．０（Ｍ＋１）。

【１２９３】

工程４：４－アミノ－５－シクロプロピル－２－フルオロ－３－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゾニトリル

窒素でパージされ及び窒素下に維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－３－ブロモ－５－シクロプロピル－２－フルオロベンゾニトリル（６．９７２ｇ、２７．３３ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（１２０ｍＬ）、水（２０ｍＬ）、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（６．９ｇ、４１．０ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（１３．４ｇ、４１．０ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（０．４ｇ、０．５５ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を８０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：５）で溶離した。これにより、４．７３ｇ（８０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１７．１（Ｍ＋１）。

【１２９４】

工程５：４－アミノ－５－シクロプロピル－２－フルオロ－３－イソプロピルベンゾニトリル

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、４－アミノ－５－シクロプロピル－２－フルオロ－３－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゾニトリル（４．７３ｇ、２１．９７ｍｍｏｌ）、ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）、及びＡｃＯＨ（０．５ｍＬ）を入れた。次に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、５００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、４０℃で４時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。ろ液を減圧下で濃縮した。これにより、４．７１ｇ（９９％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１９．１（Ｍ＋１）。

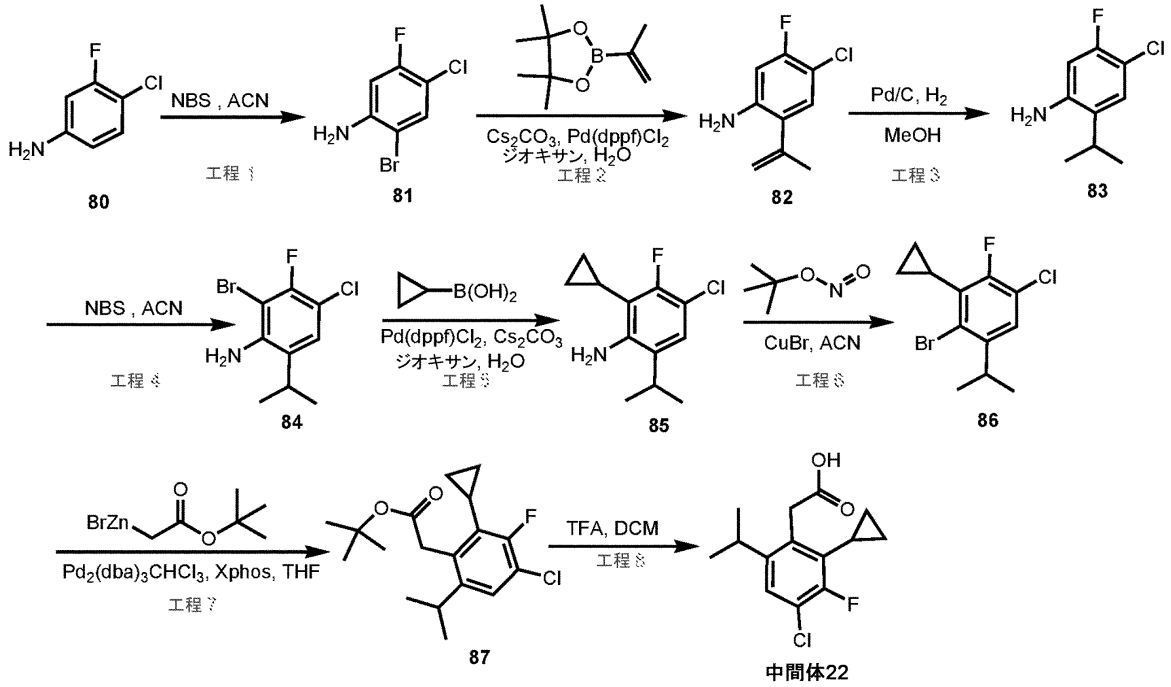
【１２９５】

工程６～８では、スキーム１３に示される化合物４６を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体２１を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２６０．１（Ｍ－１）。

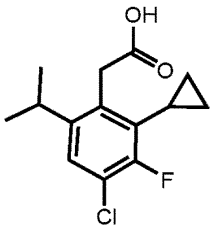
【１２９６】

【化３３１】

スキーム18:



中間体22



２－（４－クロロ－２－シクロプロピル－３－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）酢酸

工程１：２－ブロモ－４－クロロ－５－フルオロベンゼンアミン

１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、４－クロロ－３－フルオロベンゼンアミン（２０ｇ、１３７ｍｍｏｌ、ＡＣＮ（５００ｍＬ）、及びＮＢＳ（２１．９ｇ、１２３ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１５０～１：１００）で溶離した。これにより、２６．３ｇ（８５％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２５．９／２２３．９／２２７．９（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＣＤＣｌ$_{3}$－ｄ）δ ７．４４（ｄ，Ｊ＝８．０Ｈｚ、１Ｈ）、６．５９（ｄ，Ｊ＝８．８Ｈｚ、１Ｈ）、４．２１（ｓ，２Ｈ）．

【１２９７】

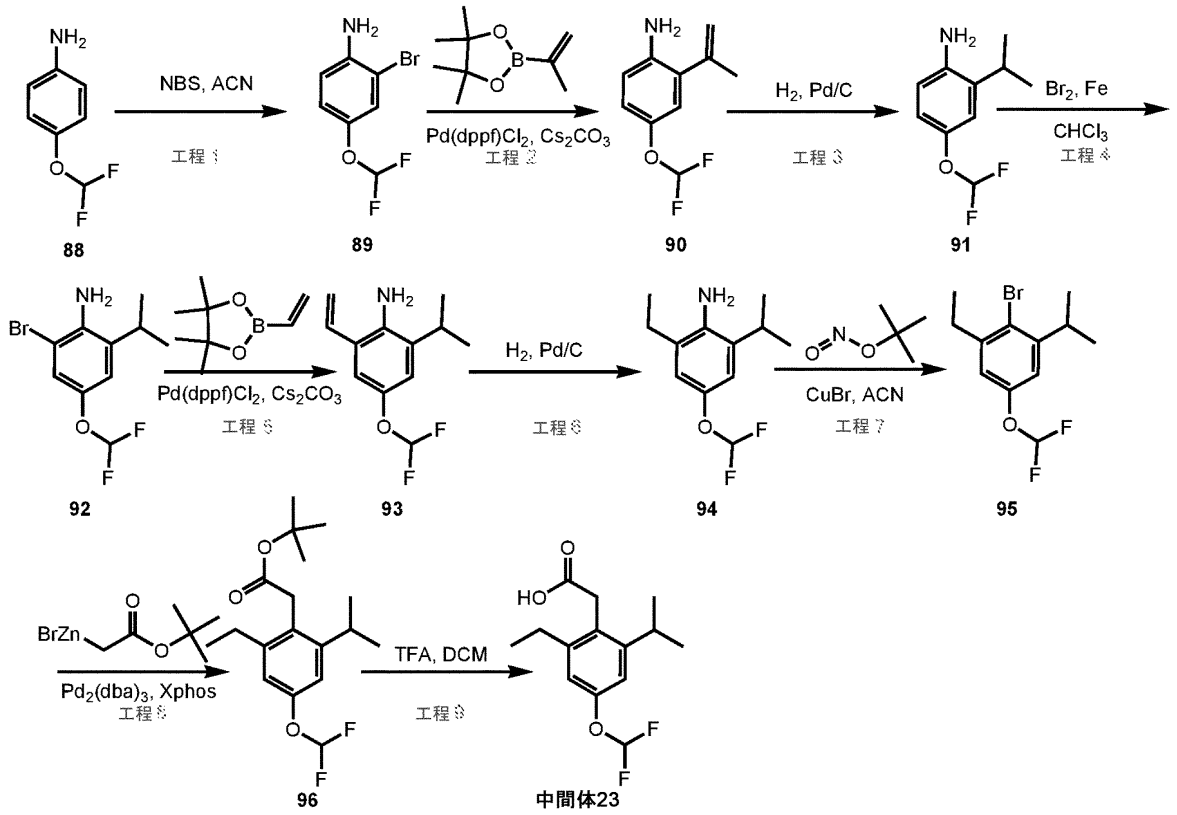
工程２：４－クロロ－５－フルオロ－２－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼンアミン

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、２－ブロモ－４－クロロ－５－フルオロベンゼンアミン（２６．３ｇ、１１７ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（５００ｍＬ）、水（５０ｍＬ）、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（２３．７ｇ、１４１ｍｍｏｌ）、Ｃｓ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（７６．６ｇ、２３５ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_{2}$（１．７１ｇ、２．３４ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を９０℃で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１５０～１：１００）で溶離した。これにより、１２．６ｇ（５８％）の表題化合物が

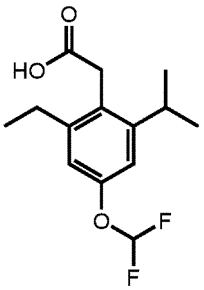
褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１８６．０／１８８．０（Ｍ＋１）。
【１２９８】
工程３：４－クロロ－５－フルオロ－２－イソプロピルベンゼンアミン
５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＭｅＯＨ（２５０ｍＬ）中の４－クロロ－５－フルオロ－２－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼンアミン（１２．６ｇ、６７．８８ｍｍｏｌ）を入れた。次に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、１．２ｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素の雰囲気下で、室温で３時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。ろ液を減圧下で濃縮した。これにより、１２．５ｇ（９８％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１８８．１／１９０．１（Ｍ＋１）。
【１２９９】
工程４：２－ブロモ－４－クロロ－３－フルオロ－６－イソプロピルベンゼンアミン
５００ｍＬの丸底フラスコ中に、４－クロロ－５－フルオロ－２－イソプロピルベンゼンアミン（６ｇ、３２．０ｍｍｏｌ）、ＡＣＮ（２００ｍＬ）、及びＮＢＳ（６．２５ｇ、３５．１ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１５０～１：１００）で溶離した。これにより、８ｇ（９４％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６８．０／２６６．０／２７０．０（Ｍ＋１）。
【１３００】
工程５：４－クロロ－２－シクロプロピル－３－フルオロ－６－イソプロピルベンゼンアミン
窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、２－ブロモ－４－クロロ－３－フルオロ－６－イソプロピルベンゼンアミン（２．９ｇ、１０．９ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（４０ｍＬ）、水（８ｍＬ）、シクロプロピルボロン酸（１．１２ｇ、１３．０ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（７．０８ｇ、２１．７ｍｍｏｌ）、及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（７９５ｍｇ、１．０９ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を９０℃で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：８０～１：５０）で溶離した。これにより、１．１ｇ（４４％）の表題化合物が淡褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２８．１／２３０．１（Ｍ＋１）。
【１３０１】
工程６～８では、スキーム１３に示される化合物４６を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体２２を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２７１．１／２７３．１（Ｍ－１）。
【１３０２】

【化３３２】

スキーム19:



中間体23



２－（４－（ジフルオロメトキシ）－２－エチル－６－イソプロピルフェニル）酢酸

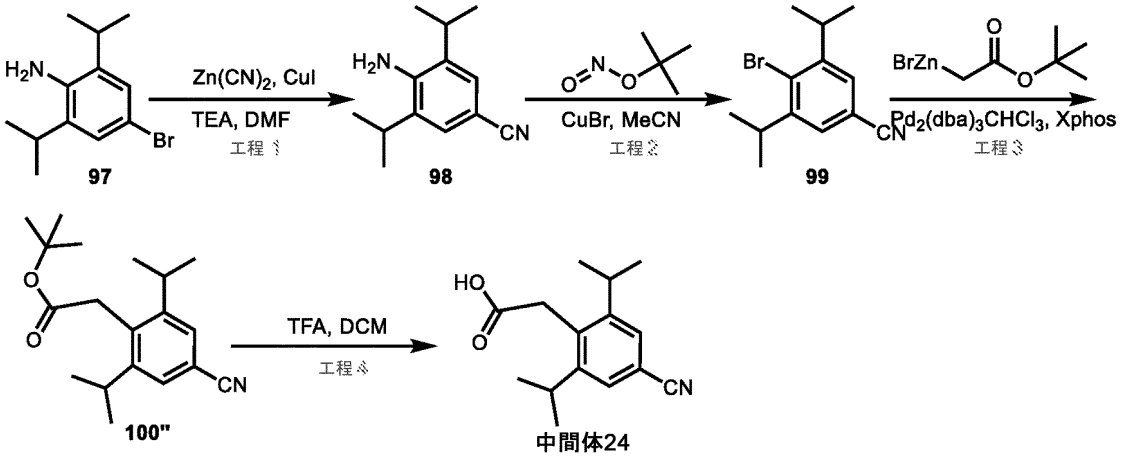
工程１～３では、スキーム１８に示される化合物８０を化合物８３に転化するための類似の手順を用いて、化合物９１を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２０２．１（Ｍ＋１）。

【１３０３】

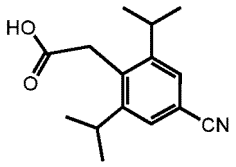
工程４：２－ブロモ－４－（ジフルオロメトキシ）－６－イソプロピルベンゼンアミン

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（５０ｍＬ）中の４－（ジフルオロメトキシ）－２－イソプロピルベンゼンアミン（２．０１ｇ、１０ｍｍｏｌ）及び鉄粉末（１．１２ｇ、２０ｍｍｏｌ）の混合物を入れた。これに、臭素（１．２３ｍＬ、２４ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で６時間撹拌し、水（２００ｍＬ）で希釈した。混合物を、３×５０ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１００～１：１０）で溶離した。これにより、２．２４ｇ（８０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８０．０／２８２．０（Ｍ＋１）。

【１３０４】
工程５～９では、スキーム１３に示される化合物４４を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体２３を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２７１．１（Ｍ－１）。
【１３０５】
【化３３３】
スキーム20:



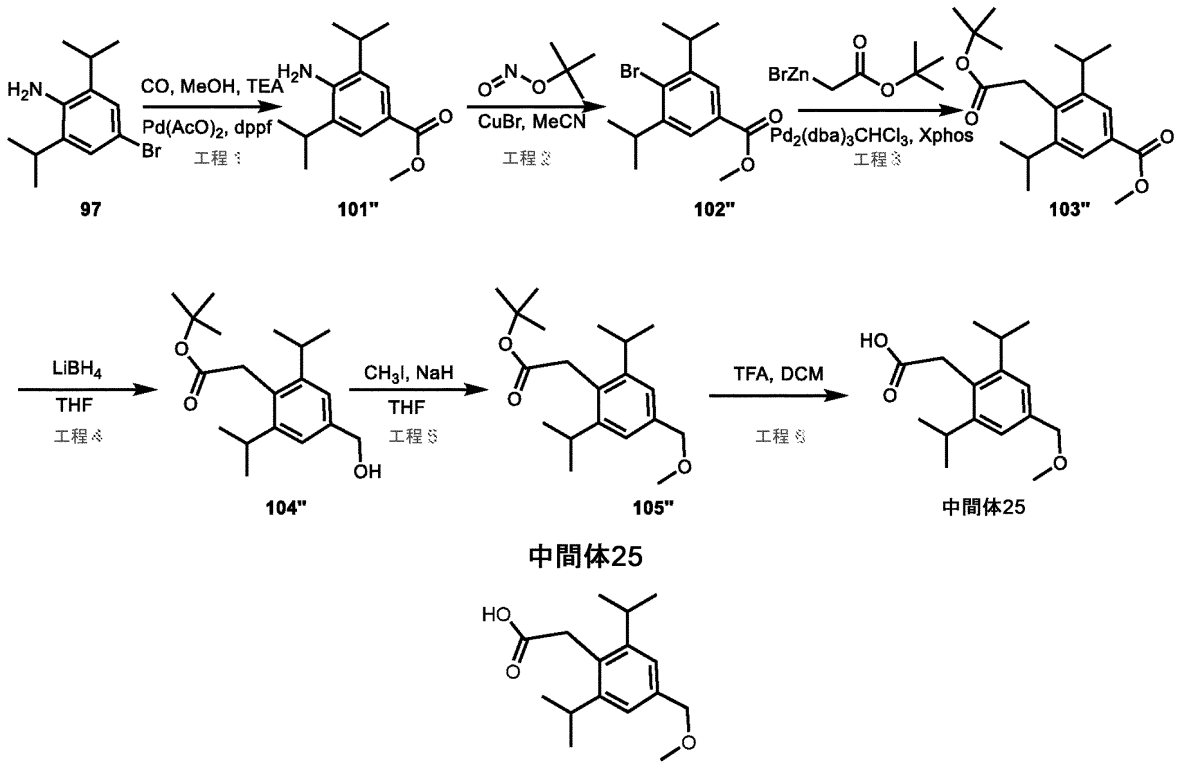
中間体24



２－（４－シアノ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸
工程１：４－アミノ－３，５－ジイソプロピルベンゾニトリル
窒素でパージされ及び窒素下に維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＭＦ（３０ｍＬ）中の４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルベンゼンアミン（市販されている、５．１ｇ、１９．９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、Ｚｎ（ＣＮ）$_2$（２．８０ｇ、２３．９ｍｍｏｌ）、ＣｕＩ（３８０ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）、及びＴＥＡ（３．０ｇ、２９．９ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を１２０℃で１６時間撹拌し、次に、３０ｍＬの水で希釈した。溶液を、３×３０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、組み合わされた有機層を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：３０～１：２０）で溶離した。これにより、２．４ｇ（６０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０３．１（Ｍ＋１）。
【１３０６】
工程２～４では、スキーム１３に示される化合物４６を中間体１４に転化するための類似の手順を用いて、中間体２４を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２４４．１（Ｍ－１）。
【１３０７】

【化３３４】

スキーム 21:



中間体25

２－（２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）酢酸

工程１：メチル４－アミノ－３，５－ジイソプロピルベンゾエート

１Ｌのオートクレーブ中に、ＭｅＯＨ（３００ｍＬ）中の４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルベンゼンアミン（１０ｇ、３９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、Ｐｄ（ＯＡｃ）$_2$（１．７５ｇ、７．８ｍｍｏｌ）、ｄｐｐｆ（４．３ｇ、７．８ｍｍｏｌ）、及びＴＥＡ（２０ｇ、１９５ｍｍｏｌ）を加えた。オートクレーブを密閉した後、ガスをＣＯと３回交換した。反応物を、１２０℃で一晩撹拌した。反応混合物を冷却した後、ガスを$Ｎ_2$と交換し、反応物を濃縮し、水（３００ｍＬ）で希釈した。得られた溶液をＥｔＯＡｃ（３×２００ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水$Ｎａ_2ＳＯ_4$上で乾燥させ、濃縮した。残渣を$ＳｉＯ_2$－ゲルカラム上で精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：５）で溶離した。これにより、５．６ｇ（６２％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３６．２（Ｍ＋１）

【１３０８】

工程２及び３では、スキーム１３に示される、化合物４６を４８に転化するための類似の手順を用いて、化合物１０３’’を無色油として得た。３３５．２（Ｍ＋１）

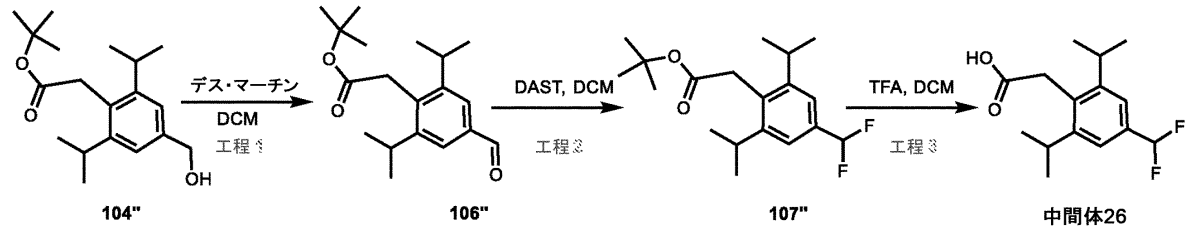
【１３０９】

工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（ヒドロキシメチル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート

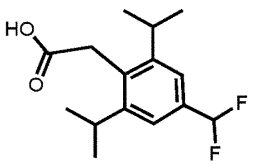
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２５ｍＬ）中のメチル４－（２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル）－３，５－ジイソプロピルベンゾエート（２ｇ、６．０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。$ＬｉＢＨ_4$（２６４ｍｇ、１２．０ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ混合物に加え、混合物を０℃で１時間撹拌した。反応物を、氷－水（２０ｍＬ）でクエンチした。溶液をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出し；組み合わされた有機層を無水$Ｎａ_2ＳＯ_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を$ＳｉＯ_2$－ゲルカラム上で精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：２）で溶離した。これにより、１．１ｇ（６０％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０７．２（Ｍ＋１）。

【１３１０】
工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）アセテート
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（ヒドロキシメチル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート（１．１ｇ、３．６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。ＮａＨ（６０重量％、１７３ｍｇ、４．３ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ混合物に加え、混合物を０℃で３０分間撹拌した。ＭｅＩ（１．０ｇ、７．２ｍｍｏｌ）を、０℃で滴下して混合物に加え；得られた混合物を室温で一晩撹拌した。反応物を、氷－水（２０ｍＬ）でクエンチし、ＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層をNa_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、SiO_2－ゲルカラムを用いて精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０～１：５）で溶離した。これにより、１．１ｇ（９５％）の表題化合物が無色油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３２１．２（Ｍ＋１）。
【１３１１】
工程６：２－（２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）酢酸
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１０ｍＬ）及びＴＦＡ（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（１．１ｇ、３．４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を室温で３時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。これにより、１．０ｇ（粗製）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６３．２（Ｍ－１）。
【１３１２】
【化３３５】

スキーム22:



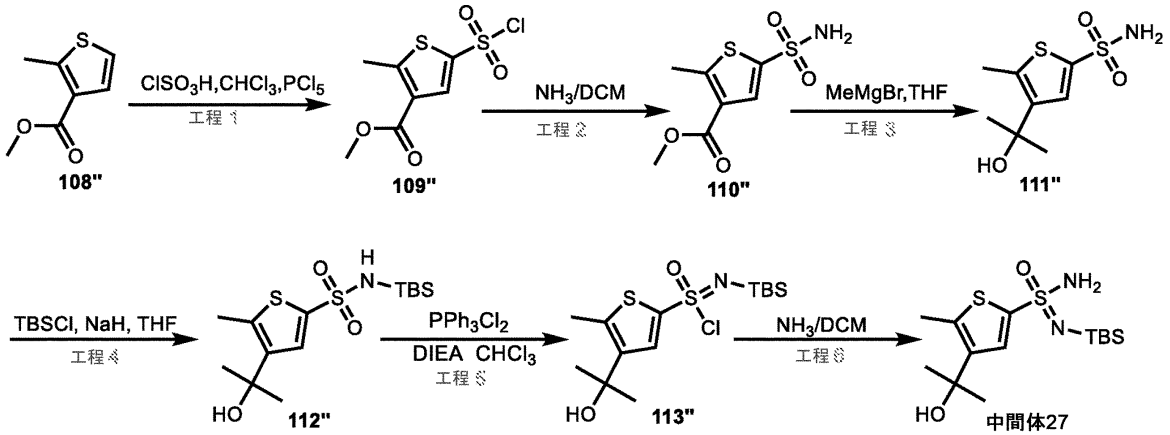
中間体26



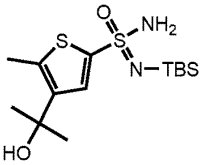
２－（４－（ジフルオロメチル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸
工程１：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－ホルミル－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（ヒドロキシメチル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート（１．１ｇ、３．６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。デス・マーチン・ペルヨージナン（２．２９ｇ、５．４ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ混合物に加えた。混合物を室温で一晩撹拌し、その後、反応物を、氷－水（２０ｍＬ）でクエンチし、ＤＣＭ（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、SiO_2－ゲルカラム上で精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０－１：１０）で溶離した。これにより、０．９８ｇ（９０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０５．２（Ｍ＋１）。

【１３１３】
工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（ジフルオロメチル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（４－ホルミル－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート（９１２ｍｇ、３．０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。ＤＡＳＴ（２．４１ｇ、１５ｍｍｏｌ）を、０℃で少しずつ混合物に加えた。混合物を室温で一晩撹拌し、その後、反応物を、水（１０ｍＬ）でクエンチし、ＤＣＭ（３×３０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層をNa_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、SiO_2－ゲルカラムを用いて精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０～１：１５）で溶離した。これにより、５８６ｍｇ（６０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３２７．２（Ｍ＋１）。
【１３１４】
工程３では、スキーム２１に示される化合物１０５’’を中間体２５に転化するための類似の手順を用いて、中間体２６を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２６９．１（Ｍ－１）。
【１３１５】
スルホンイミドイルアミド中間体のスキーム：スキーム２３～３０は、スルホンイミドイルアミド中間体の調製を示す。
【１３１６】
【化３３６】

スキーム23:



中間体27



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンイミドアミド
工程１：メチル５－（クロロスルホニル）－２－メチルチオフェン－３－カルボキシレート
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メチル２－メチルチオフェン－３－カルボキシレート（５．０ｇ、３２．０ｍｍｏｌ）、$CHCl_3$（７０ｍＬ）を入れた。この後、$ClSO_2OH$（５．６ｇ、４８．０ｍｍｏｌ）を撹拌しながら滴下して加えた。これに、PCl_5（１３．３ｇ、６４．０ｍｍｏｌ）を撹拌しながら加えた。得られた溶液を、油浴中で、６０℃で２時間撹拌した。次に、反応物を、１５０ｍＬの水／氷の添加によってクエンチ

した。得られた溶液を、３×８０ｍｌのジクロロメタンで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。これにより、５．２ｇ（６３．８％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。

【１３１７】

工程２：メチル２－メチル－５－スルファモイルチオフェン－３－カルボキシレート

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（５０ｍＬ）中のメチル５－（クロロスルホニル）－２－メチルチオフェン－３－カルボキシレート（５．２ｇ、２０．４ｍｍｏｌ）を入れ、この溶液に、NH_3／ＤＣＭ（５０ｍＬ、飽和）を撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を、油浴中で、４０℃で２時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（２：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４．６ｇ（９５．８％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３６［Ｍ＋１］。

【１３１８】

工程３：４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンアミド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中のメチル２－メチル－５－スルファモイルチオフェン－３－カルボキシレート（４．６ｇ、１９．５ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＭｅＭｇＢｒ（２９ｍＬ、８７ｍｍｏｌ、３Ｍ）を、氷浴中で、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。溶液のｐＨ値を、ＨＣｌ（２Ｍ）を用いて５に調整した。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．３ｇ（２８．２％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３６［Ｍ＋１］。

【１３１９】

工程４：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンアミド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（４０ｍＬ）中の４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンアミド（１．３ｇ、５．５２ｍｍｏｌ）を入れた。この溶液に、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、４４２ｍｇ、１１．１ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら少しずつ加えた。この後、ＴＢＳＣｌ（１．２５ｇ、８．２９ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、５０ｍＬのNH_4Cl溶液の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×５０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．２ｇ（６２．１％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５０［Ｍ＋１］。

【１３２０】

工程５及び６：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンイミドアミド

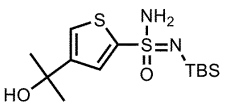
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（４０ｍＬ）中のPPh_3Cl_2（３．５１ｇ、１０．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＩＥＡ（１．７７ｇ、１３．７ｍｍｏｌ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌し、反応混合物を０℃に冷却した。これに、$CHCl_3$（５ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－５－メチルチオフェン－２－スルホンアミド（１．２ｇ、３．４３ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。混合物に、０℃で１５分間にわたってNH_3ガスバブルを導入した。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。得られた溶液を５０ｍＬのH_2Oで希釈した。得られた溶液を、３×１００ｍｌのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離し

た。これにより、９３０ｍｇ（７７．７％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３４９［Ｍ＋１］。

【１３２１】

【表７６】

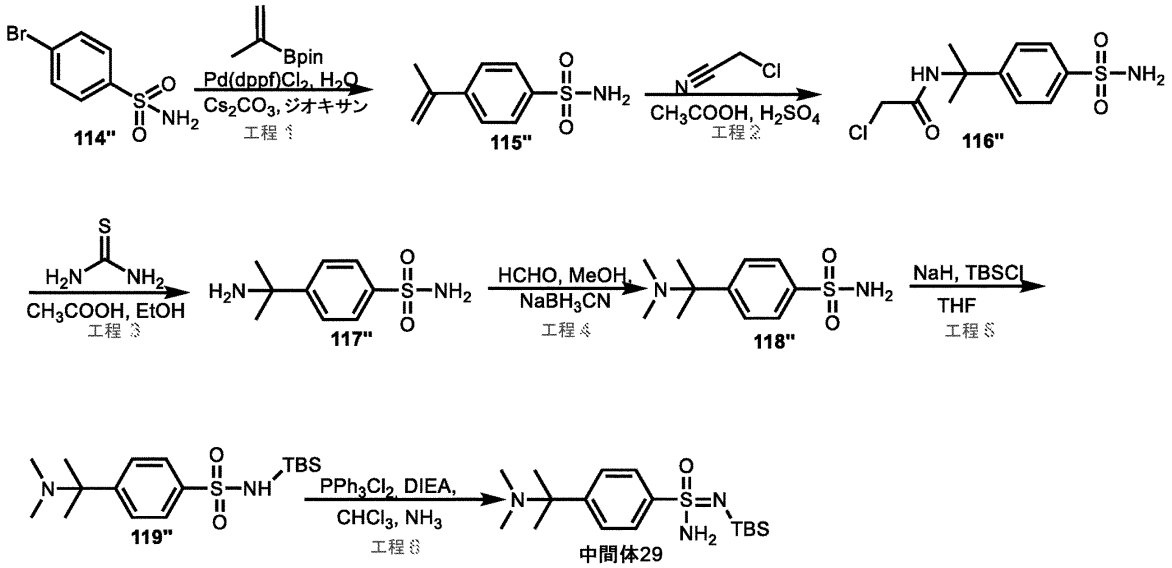
表 12. メチルチオフェン-3-カルボキシレートから出発して、化合物 108''を中間体 27 に転化するための上記のスキーム 23 に示されるのと類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量 $[M+H]^+$
中間体 28		N'-(tert-ブチルジメチルシリル)-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-スルホンイミドアミド	335

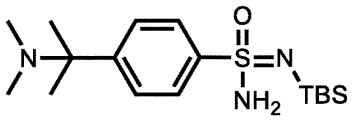
【１３２２】

【化３３７】

スキーム24:



中間体29



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）ベンゼンスルホンイミドアミド

工程１：４－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼンスルホンアミド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ジオキサン（７５ｍＬ）及び$Ｈ_2Ｏ$（７．５ｍＬ）中の４－ブロモベンゼン－１－スルホンアミド（５．０ｇ、２１．２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（７．８３ｇ、４６．５９ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）$Ｃｌ_2$（１．５ｇ、２．１２ｍｍ

ｏｌ）及びCs_2CO_3（２７．６ｇ、８４．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を８５℃で２時間撹拌した。得られた溶液を４００ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を２×５００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４．７ｇ（９８．１％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９８．１［Ｍ＋１］。

【１３２３】

工程２：２－クロロ－Ｎ－（２－（４－スルファモイルフェニル）プロパン－２－イル）アセトアミド

１Ｌの丸底フラスコ中に、ＡｃＯＨ（２８０ｍＬ）中の４－（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゼン－１－スルホンアミド（２．２ｇ、１１．２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、２－クロロアセトニトリル（１６．８ｇ、２２４ｍｍｏｌ）を加えた。この後、H_2SO_4（７０ｍＬ、０．７ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた溶液を５００ｍＬの水／氷で希釈した。溶液のｐＨ値を、Na_2CO_3の飽和溶液を用いて、７に調整した。得られた溶液を３×１０００ｍＬのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（３：２）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２．７ｇ（８３．２％）の粗表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２９１．０［Ｍ＋１］。

【１３２４】

工程３：４－（２－アミノプロパン－２－イル）ベンゼンスルホンアミド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、エタノール（３０ｍＬ）及びＡｃＯＨ（６．０ｍＬ、９９．９３ｍｍｏｌ）中の２－クロロ－Ｎ－［２－（４－スルファモイルフェニル）プロパン－２－イル］アセトアミド（１．０ｇ、３．４４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、チオ尿素（３１４．２ｍｇ、４．１３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を８５℃で一晩撹拌した。得られた混合物を濃縮した。得られた混合物を５０ｍＬのエタノールで洗浄した。固体をろ過によって収集した。固体を１６時間にわたって赤外線下で乾燥させた。これにより、５２０ｍｇ（７０．５６％）の粗表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１５．１［Ｍ＋１］。

【１３２５】

工程４：４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）ベンゼンスルホンアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２０ｍＬ）中の４－（２－アミノプロパン－２－イル）ベンゼン－１－スルホンアミド（５００ｍｇ、２．３３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＨＣＨＯ（１４０ｍｇ、４．６７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。これに、$NaBH_3CN$（４３９ｍｇ、７．０ｍｍｏｌ）を０℃で何回かに分けて加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、５０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた混合物を濃縮し、２０ｍＬのH_2Oで洗浄した。固体をろ過によって収集し、５０℃で、減圧下で、オーブン中で乾燥させた。これにより、３００ｍｇ（５３．１％）の粗表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２４３．１［Ｍ＋１］。

【１３２６】

工程５：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）ベンゼンスルホンアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１５ｍＬ）中の４－［２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル］ベンゼン－１－スルホンアミド（２００ｍｇ、０．８３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、６６ｍｇ、１．６５ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌した。これに、ＴＢＳＣｌ（４９７ｍｇ、３．３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、６０ｍＬの水／氷の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×６０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／

石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２４３ｍｇ（８２．５％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５７．２［Ｍ＋１］。

【１３２７】

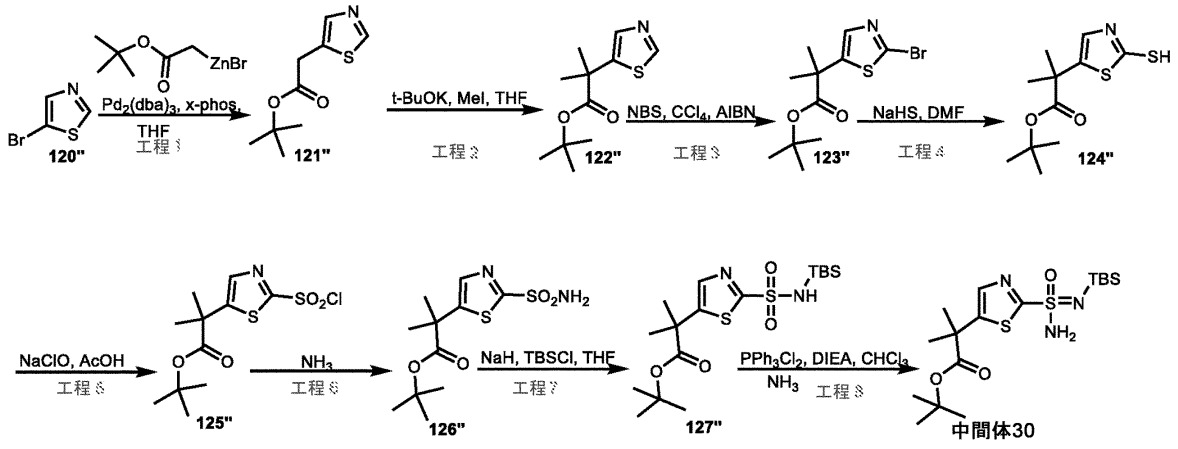
工程６：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）ベンゼンスルホンイミドアミド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（３０ｍＬ）中のジクロロトリフェニル－λ５－ホスファン（４６７ｍｇ、１．４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＩＥＡ（２６１ｍｇ、２．０２ｍｍｏｌ）を撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１５分間撹拌し、反応系を０℃に冷却した。これに、ＣＨＣｌ$_3$（１０ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－［２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル］ベンゼン－１－スルホンアミド（２００ｍｇ、０．５６ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。混合物に、ＤＣＭ（６０ｍＬ、飽和）中のＮＨ$_3$の溶液を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。得られた混合物を８０ｍＬのＨ$_2$Ｏで希釈した。得られた溶液を２×１００ｍＬのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１．４：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１４０ｍｇ（７０．１％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５６．２［Ｍ＋１］。

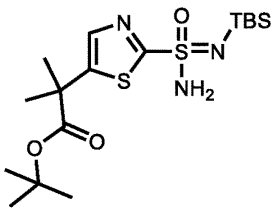
【１３２８】

【化３３８】

スキーム 25:



中間体30



Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－（Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）スルファミドイミドイル）チアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

工程１：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（チアゾール－５－イル）アセテート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の５－ブロモ－１，３－チアゾール（３．０ｇ、１８．３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、Ｐｄ$_2$（ｄｂａ）$_3$（９４７ｍｇ、０．９１ｍｍｏｌ）及びＸｐｈｏｓ（１．０５ｇ、１．８３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１０分間

撹拌した。これに、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（９．５ｇ、３６．５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を６０℃で１．５時間撹拌した。得られた混合物を１５０ｍＬのH_2Oで希釈した。得られた溶液を２×２００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．０ｇ（２７．４％）の表題化合物が黄色の液体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２００．１［Ｍ＋１］。

【１３２９】

工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル２－メチル－２－（チアゾール－５－イル）プロパノエート

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（１，３－チアゾール－５－イル）アセテート（１．０ｇ、５．０２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ｔ－ＢｕＯＫ（２．３０ｇ、２０．４ｍｍｏｌ）及びＭｅＩ（２．９１ｇ、２０．４ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、２００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．０５ｇ（９２．０％）の表題化合物が黄褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２８．１［Ｍ＋１］。

【１３３０】

工程３：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－ブロモチアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、CCl_4（３０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－メチル－２－（１，３－チアゾール－５－イル）プロパノエート（５００ｍｇ、２．２ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ＮＢＳ（７８３ｍｇ、４．４ｍｍｏｌ）及びＡＩＢＮ（７２．２ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を７０℃で５時間撹拌した。次に、反応物を、６０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×１００ｍＬのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：６）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４５０ｍｇ（６６．９％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０６．０［Ｍ＋１］。

【１３３１】

工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－メルカプトチアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＭＦ（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（２－ブロモ－１，３－チアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート（４５０ｍｇ、１．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、ＮａＳＨ（２．９７ｇ、３０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を１００℃で一晩撹拌した。ｐＨ値を、１ＭのＨＣｌを用いて、６に調整した。得られた溶液を２×２５ｍＬのH_2Oで洗浄し、２×５０ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３５０ｍｇ（９１．６％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６０．１［Ｍ＋１］。

【１３３２】

工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－（クロロスルホニル）チアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

２５ｍＬの丸底フラスコ中に、０℃でＡｃＯＨ（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－メチル－２－（２－スルファニル－１，３－チアゾール－５－イル）プロパノエート（３５０ｍｇ、１．３５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。これに、ＮａＣｌＯ（１０重量％、５．０３ｇ、６７．４ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で９０分間撹拌した。得られた混合物を２×１００ｍＬのH_2Oで希釈した。得られた溶液を１５０ｍＬのＤＣＭで抽出し、組み合わされた有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾

燥させ、濃縮した。これにより、１００ｍｇ（５６．８％）の表題化合物が黄色の油として得られた。

【１３３３】

工程６：Ｔｅｒｔ－ブチル２－メチル－２－（２－スルファモイルチアゾール－５－イル）プロパノエート

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［２－（クロロスルホニル）－１，３－チアゾール－５－イル］－２－メチルプロパノエート（１００ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記の溶液に、NH_3（ｇ）を導入した。得られた溶液を室温で２０分間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（３：４）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、９０ｍｇ（９５．７％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０７．１［Ｍ＋１］。

【１３３４】

工程７：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－（Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）スルファモイル）チアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－メチル－２－（２－スルファモイル－１，３－チアゾール－５－イル）プロパノエート（５０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、９．６ｍｇ、０．２４ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。これに、ＴＢＳＣｌ（４９．２ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で４０分間撹拌した。次に、反応物を、３０ｍＬの水／氷の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×５０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１２０ｍｇ（９７．１％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４２１．２［Ｍ＋１］。

【１３３５】

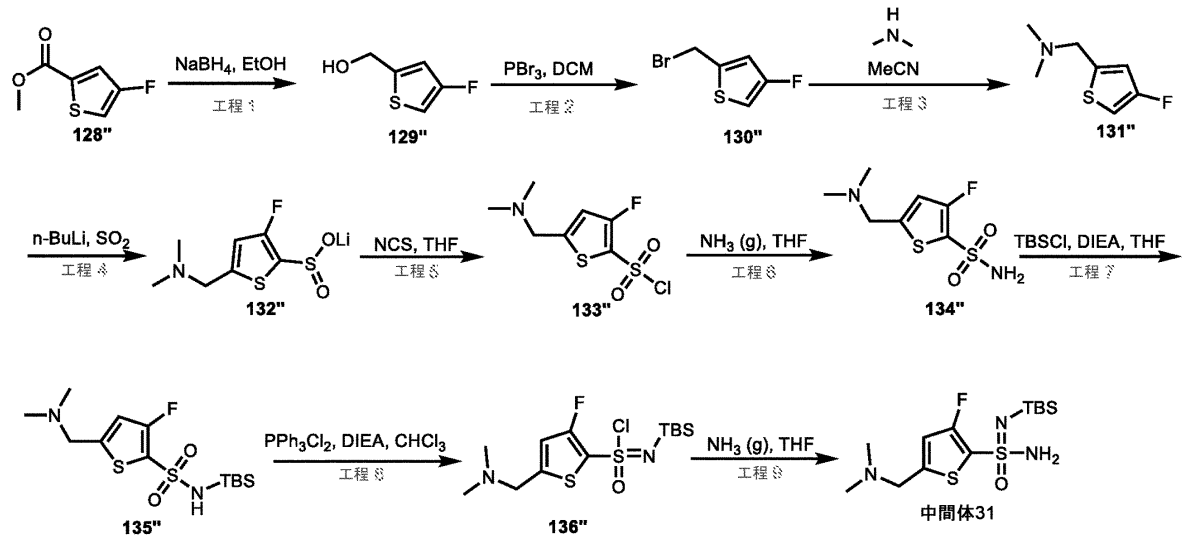
工程８：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－（Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）スルファミドイミドイル）チアゾール－５－イル）－２－メチルプロパノエート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（１５ｍＬ）中のPPh_3Cl_2（２３６ｍｇ、０．７１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＩＥＡ（１４７ｍｇ、１．１４ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１５分間撹拌した。これに、$CHCl_3$（４ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［２－［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）スルファモイル］－１，３－チアゾール－５－イル］－２－メチルプロパノエート（１２０ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。上記の溶液に、NH_3（ｇ）を導入した。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を５０ｍＬのH_2Oで希釈した。得られた溶液を２×７５ｍＬのＤＣＭで抽出し、組み合わされた有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：６）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、８０ｍｇ（６６．６％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４２０．２［Ｍ＋１］。

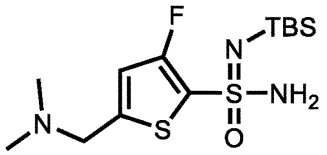
【１３３６】

【化３３９】

スキーム26:



中間体31



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンイミドアミド

工程１：（４－フルオロチオフェン－２－イル）メタノール

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１０００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＥｔＯＨ（３００ｍＬ）中のメチル４－フルオロチオフェン－２－カルボキシレート（１０ｇ、６２．４ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、ＮａＢＨ$_4$（４．７４ｇ、１２４．８ｍｍｏｌ）を０℃で撹拌しながら加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。得られた溶液を室温でさらに１６時間反応させた。次に、反応物を、１０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた混合物を３×１０００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。組み合わされた酢酸エチル溶液を蒸発させることにより、６．４ｇ（７７．５％）の表題化合物が白色の油として得られた。

【１３３７】

工程２：２－（ブロモメチル）－４－フルオロチオフェン

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（７０ｍＬ）中の（４－フルオロチオフェン－２－イル）メタノール（８．５ｇ、６４．３２ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＰＢｒ$_3$（１９．１５ｇ、７０．７５ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌し、その後、それを室温でさらに１２時間反応させた。反応物を、２０ｍＬの水でクエンチし、酢酸エチル３×５０ｍＬで抽出した。組み合わされた有機層をNa_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１５／８５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、７．０ｇ（５５．８％）の表題化合物が黄色の油として得られた。

【１３３８】

工程３：１－（４－フルオロチオフェン－２－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（ブロモメチル）－４－フルオロチオフェン（７．４ｇ、３７．９ｍｍｏｌ）を入れた。この溶液に、ＴＨＦ（２Ｍ、３７．９ｍｍｏｌ）中のジメチルアミンを加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。反応混合物を減

圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１７／８３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、５．６２ｇ（９２．６％）の表題化合物が固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１６０［Ｍ＋１］。

【１３３９】

工程４：リチウム５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルフィネート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（６０ｍＬ）中の［（４－フルオロチオフェン－２－イル）メチル］ジメチルアミン（６．２ｇ、３８．９ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、上記の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（１８．７ｍＬ、４６．７ｍｍｏｌ、２．５Ｍ）を、液体窒素／エタノール浴中で、－７８℃で滴下して加えた。得られた溶液を－７８℃で３０分間撹拌した。撹拌溶液に、SO_2（ｇ）（４．９９ｇ、７８ｍｍｏｌ）を－７８℃で導入した。得られた溶液を室温でさらに１２０分間反応させた。得られた混合物を濃縮した。これにより、１０ｇ（粗製）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２８［Ｍ－１］。

【１３４０】

工程５：５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホニルクロリド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の５－［（ジメチルアミノ）メチル］－３－フルオロチオフェン－２－スルフィン酸（１０ｇ、４４．７ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、上記の溶液に、ＮＣＳ（７．１８ｇ、５４ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。得られた溶液を室温でさらに１００分間反応させた。反応溶液を精製せずに次の工程に使用した。

【１３４１】

工程６：５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンアミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の５－［（ジメチルアミノ）メチル］－３－フルオロチオフェン－２－スルホニルクロリド（１０ｇ、３８．８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記に、NH_3（ｇ）を、０℃で１５分間導入した。得られた溶液を室温でさらに１００分間反応させた。次に、反応溶液を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（６０／４０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２．１ｇ（２２．７％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３９［Ｍ＋１］。

【１３４２】

工程７：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンアミド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３０ｍＬ）中の５－［（ジメチルアミノ）メチル］－３－フルオロチオフェン－２－スルホンアミド（１．８ｇ、７．５５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記の溶液に、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、６００ｍｇ、１５ｍｍｏｌ）を０℃で撹拌しながら加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。この後、ＴＢＳＣｌ（１．３７ｇ、９．０９ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。得られた溶液を室温でさらに１５時間反応させた。反応溶液を濃縮した。残渣を、酢酸エチルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２ｇ（７５．１％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５３［Ｍ＋１］。

【１３４３】

工程８－１：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンイミドイルクロリド

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（１００ｍＬ）中のPPh_3Cl_2（５９．２ｇ、１７８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＩＥＡ（４５．９ｇ、３５５ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１５分間撹拌した。これに、$CHCl_3$（３０ｍＬ）中の

Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンアミド（１５．６ｇ、４４．４ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。反応溶液を、後処理せずに次の工程に使用した。

【１３４４】

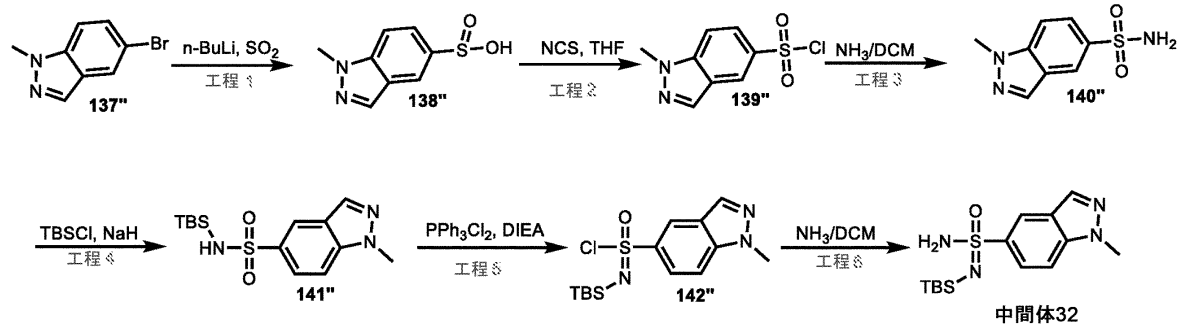
工程８－２：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンイミドアミド

２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（２０ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）－３－フルオロチオフェン－２－スルホンイミドイルクロリド（２．８ｇ、０．２７ｍｍｏｌ）を入れた。上記に、ＮＨ$_3$（ｇ）を０℃で１５分間導入した。得られた溶液を０℃で１５分間撹拌した。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を５０ｍＬのＨ$_2$Ｏで希釈した。得られた溶液を２×７５ｍＬのＤＣＭで抽出し、組み合わされた有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：６）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２５０ｍｇ（９．４％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５２［Ｍ＋１］。

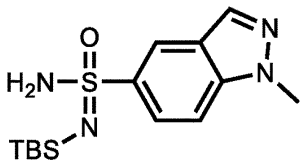
【１３４５】

【化３４０】

スキーム27:



中間体32



工程１：１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－スルフィン酸

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５ｍＬ）中の５－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－インダゾール（７００ｍｇ、３．３２ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（１．６ｍＬ、３．９８ｍｍｏｌ、２．５Ｍ）を、液体窒素／エタノール浴中で、－７８℃で滴下して加えた。次に、溶液を－７８℃で３０分間撹拌した。撹拌溶液に、ＳＯ$_2$（ｇ）を－７８℃で１５分間導入した。得られた溶液を室温でさらに１２０分間反応させた。得られた混合物を濃縮した。これにより、５００ｍｇ（７６．８％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。

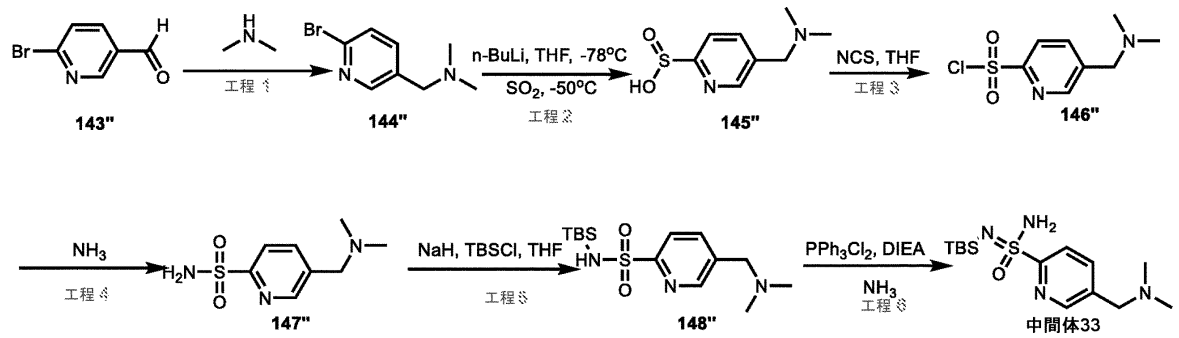
【１３４６】

工程２～６では、スキーム２６に示される化合物１３２’’を中間体３１に転化するための類似の手順を用いて、化合物１３８’’から中間体３２を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３２５（Ｍ＋１）。

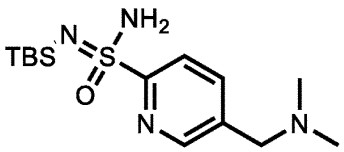
【１３４７】

【化３４１】

スキーム28:



中間体33



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルホンイミドアミド

工程１：１－（６－ブロモピリジン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、室温でメタノール（５０ｍＬ）中のＴｉ（ＯＥｔ）$_4$（１２．２ｇ、５３．７ｍｍｏｌ）及びジメチルアミン（４．８５ｇ、１０７ｍｍｏｌ）を加えた。この撹拌溶液に、メタノール（３０ｍＬ）中の６－ブロモピリジン－３－カルバルデヒド（５ｇ、２６．９ｍｍｏｌ）を０℃で滴下して加えた。室温で３時間撹拌した後、ＮａＢＨ$_4$（１．０２ｇ、２６．９ｍｍｏｌ）を加え、得られた混合物を一晩撹拌した。反応物を、０℃で水／氷（３０ｍＬ）の添加によってクエンチした。得られた混合物を酢酸エチル（３×５０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させた。ろ過の後、ろ液を減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルクロマトグラフィーによって精製し、酢酸エチル／石油エーテル（５：１）で溶離して、表題化合物（３．５ｇ、６０．５％）を黄色の油として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２１５（Ｍ＋１）。

【１３４８】

工程２：５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルフィン酸

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３０ｍＬ）中の［（６－ブロモピリジン－３－イル）メチル］ジメチルアミン（３．５ｇ、１６．２７ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ｎ－ＢｕＬｉ（７．２ｍＬ、１７．９ｍｍｏｌ、２．５Ｍ）を、３０分間で、－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。これに、－７８℃で１５分間にわたってＳＯ$_2$をバブリングした。得られた溶液を－７８℃で１時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。表題化合物の粗生成物（４．０ｇ）を、さらに精製せずに直接次の工程に使用した。

【１３４９】

工程３：５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルホニルクロリド

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、５－［（ジメチルアミノ）メチル］ピリジン－２－スルフィン酸（４．０ｇ　粗製）及びＴＨＦ（２５ｍＬ）を室温で入れた。撹拌溶液に、ＮＣＳ（４ｇ、０．０３ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を室温で１．５時間撹拌した。得られた混合物を、後処理せずに次の工程に使用した。

【１３５０】

工程４：５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルホンアミド

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、５－［（ジメチルアミノ）メチル］ピリジン－２－ス

ルホニルクロリド（前の工程からの粗生成物）を室温で加えた。これに、０℃で１０分間にわたってＮＨ$_3$（ｇ）をバブリングした。得られた混合物を０℃で１時間撹拌した。残渣を、以下の条件（カラム、Ｃ$_{18}$シリカゲル；移動相、水中ＭｅＣＮ、１０分で１０％～５０％の勾配；検出器、ＵＶ　２５４ｎｍ）を用いた逆相フラッシュクロマトグラフィーによって精製して、表題化合物（１．２ｇ、３２．７％）を黄色の固体として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２１６［Ｍ＋１］

【１３５１】

工程５：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルホンアミド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、０℃でＴＨＦ（１５ｍＬ）中の５－［（ジメチルアミノ）メチル］ピリジン－２－スルホンアミド（７００ｍｇ、３．２５ｍｍｏｌ）を加えた。この撹拌溶液に、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、２６０ｍｇ、６．５ｍｍｏｌ）を、窒素雰囲気下で、０℃で少しずつ加えた。得られた混合物を、窒素雰囲気下で、０℃で１５分間撹拌した。次に、ＴＢＳＣｌ（９８０ｍｇ、６．５ｍｍｏｌ）を、上記の反応混合物に加えた。添加が完了した後、得られた混合物を室温で２時間撹拌した。反応物を、０℃で水／氷（１０ｍＬ）の添加によってクエンチした。得られた混合物を酢酸エチル（３×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させた。ろ過の後、ろ液を減圧下で濃縮した。粗表題化合物（１．１５ｇ）を、さらに精製せずに直接次の工程に使用した。ＭＳ－ＥＳＩ：３３０［Ｍ＋１］。

【１３５２】

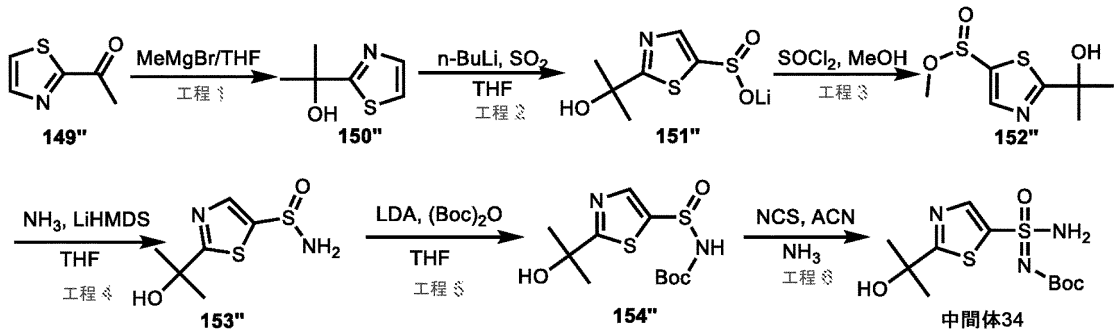
工程６：Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（（ジメチルアミノ）メチル）ピリジン－２－スルホンイミドアミド

２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（１８ｍＬ）中のＰＰｈ$_3$Ｃｌ$_2$（５．８９ｇ、１３．９ｍｍｏｌ）を加えた。この撹拌溶液に、ＤＩＥＡ（３．６１ｇ、２７．９ｍｍｏｌ）を、窒素雰囲気下で、０℃で滴下して加えた。得られた混合物を、窒素雰囲気下で、０℃で１５分間撹拌した。次に、ＣＨＣｌ$_3$（３ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－［（ジメチルアミノ）メチル］ピリジン－２－スルホンアミド（１．１５ｇ、３．４９ｍｍｏｌ）を、上記の得られた混合物に、窒素雰囲気下で、０℃で滴下して加えた。添加が完了した後、得られた混合物を３０分間撹拌した。次に、ＤＣＭ（４０ｍＬ）中のＮＨ$_3$（ｇ）を、得られた混合物に加えた。得られた混合物を一晩撹拌した。得られた混合物をろ過し、ろ過ケーキを酢酸エチル（３×２０ｍＬ）で洗浄した。ろ液を減圧下で濃縮した。残渣を、分取ＴＬＣ（酢酸エチル／メタノール１００：１）によって精製して、表題化合物（６００ｍｇ、５２．３％）を黄色の固体として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３２９（Ｍ＋１）。

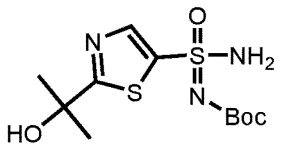
【１３５３】

【化３４２】

スキーム29:



中間体34



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド

工程１：２－（チアゾール－２－イル）プロパン－２－オール

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１０Ｌの４つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（４Ｌ）中の１－（チアゾール－２－イル）エタノン（２００ｇ、１．６ｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＭｅＭｇＢｒ（ＴＨＦ中３Ｍ、９４２ｍＬ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。混合物を０℃で２時間撹拌した。混合物を室温に温めた後、溶液をさらに１６時間撹拌した。次に、反応物を、３ＬのＮＨ$_4$Ｃｌ（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を３×１Ｌの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：３～１：１）の勾配で溶離した。これにより、２１０ｇ（９３％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１４４．０（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ７．６８（ｄ，Ｊ＝３．２Ｈｚ、１Ｈ）、７．５４（ｄ，Ｊ＝３．２Ｈｚ、１Ｈ）、５．９４（ｓ，１Ｈ）、１．５１（ｓ，６Ｈ）．

【１３５４】

工程２：リチウム２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィネート

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１０Ｌの４つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１．５Ｌ）中の２－（チアゾール－２－イル）プロパン－２－オール（５０ｇ、３４９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５Ｍ、３５０ｍＬ）を、－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。混合物を－７８℃で１時間撹拌した。次に、ＳＯ$_2$を、－３０℃未満で１５分間にわたって混合物中にバブリングした。混合物を室温でさらに１時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。これにより、８７ｇ（粗製）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。粗生成物を次の工程に直接使用した。

【１３５５】

工程３：メチル２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィネート

２Ｌの３つ口丸底フラスコ中で、リチウム２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィネート（８７ｇ、粗製）を無水ＭｅＯＨ（５００ｍＬ）に溶解させた。次に、ＳＯＣｌ$_2$（４３ｇ、３６０ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら混合物に滴下して加えた。混合物を室温で一晩撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣を、５００

ｍＬの酢酸エチルで希釈した。得られた溶液を、２×２００ｍＬの水及び２×２００ｍＬの塩水で洗浄した。有機相を無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、７２ｇ（粗製）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。粗生成物を次の工程に直接使用した。ＭＳ－ＥＳＩ：２２２［Ｍ＋１］．^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ８．１５（ｓ，１Ｈ），６．３２（ｓ，１Ｈ），３．６５（ｓ，３Ｈ），１．５３（ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，６Ｈ）．

【１３５６】

工程４：２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィンアミド

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１０Ｌの４つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５００ｍＬ）中のメチル２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィネート（７２ｇ、３２６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、上記に、NH_3（ＴＨＦ中０．５Ｍ、２．０Ｌ）を加えた。－７８℃に冷却した後、ＬｉＨＭＤＳ（ＴＨＦ中１Ｍ、２．０Ｌ）を、撹拌しながら混合物に滴下して加えた。次に、混合物を－７８℃で２時間撹拌した。反応物を、５００ｍＬのNH_4Cl（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×３００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。これにより、３２ｇ（粗製）の表題化合物が褐色の油として得られた。粗生成物を次の工程に直接使用した。ＭＳ－ＥＳＩ：２０７［Ｍ＋１］．^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．７７（ｓ，１Ｈ），６．７３（ｓ，２Ｈ），６．１７（ｓ，１Ｈ），１．５１（ｄ，Ｊ＝１．４Ｈｚ，６Ｈ）．

【１３５７】

工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イルスルフィニルカルバメート

窒素でパージされ及び窒素下に維持された１Ｌの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３００ｍＬ）中の２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルフィンアミド（３２ｇ、粗製）の溶液を入れた。この後、ＬＤＡ（ＴＨＦ中２Ｍ、１１６ｍＬ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。混合物を０℃で１時間撹拌し、次に、$(Boc)_2O$（３３．８ｇ、１５５ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。混合物を室温に温め、さらに２時間撹拌した。反応物を、２００ｍＬの氷－水（２００ｍＬ）でクエンチし、溶液のｐＨ値を、ＨＣＯＯＨを用いて６に調整した。得られた溶液を、３×２００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムから溶出し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２～１：１）の勾配で溶離した。これにより、１９ｇ（１８％、４工程）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０７［Ｍ＋１］．

【１３５８】

工程６：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドアミド

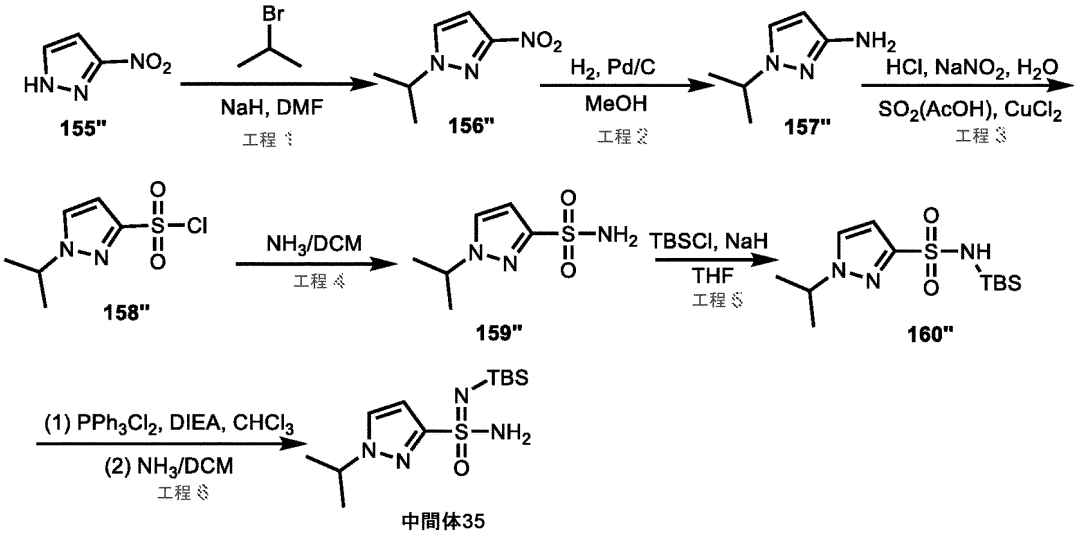
窒素でパージされ及び窒素下に維持された１Ｌの３つ口丸底フラスコ中で、ｔｅｒｔ－ブチル２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イルスルフィニルカルバメート（１９ｇ、６２ｍｍｏｌ）を、新たに蒸留されたＡＣＮ（２００ｍＬ）に溶解させた。次に、上記の溶液に、ＮＣＳ（９．８ｇ、７４ｍｍｏｌ）を少しずつ加えた。混合物を室温で１時間撹拌し、次に、NH_3を、１５分間にわたって混合物にバブリングした。混合物を室温で２時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２～１：１）の勾配で溶離した。これにより、１３ｇ（６５％）の表題化合物が白色の固体として得られた。

ＭＳ－ＥＳＩ：３２２［Ｍ＋１］．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．９９（ｓ，１Ｈ），７．７２（ｓ，２Ｈ），６．２９（ｓ，１Ｈ），１．４９（ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，６Ｈ），１．２７（ｓ，９Ｈ）．

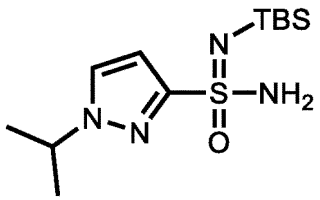
【１３５９】

【化３４３】

スキーム30:



中間体35



Ｎ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－スルホンイミドアミド

工程１：１－イソプロピル－３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＭＦ（１００ｍＬ）中の３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール（１０ｇ、８８．４ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、３．９ｇ、９７．５ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を０℃で０．５時間撹拌した。この後、２－ブロモプロパン（１４．１ｇ、１１４．６ｍｍｏｌ）を、１０分間で、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌し、次に、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルから溶離し、酢酸エチル／石油エーテル（１：５～１：３）の勾配で溶離した。これにより、１１．８ｇ（８６％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１５６．１（Ｍ＋１）。

【１３６０】

工程２：３－アミノ－１－（プロパン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）中の１－イソプロピル－３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール（１０．８ｇ、６９．６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、１．５ｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。混合物を、水素の雰囲気下で、室温で２４時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られたろ液を減圧下で濃縮した。これにより、７．２７ｇ（８３％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１２６．１（Ｍ＋１）。

【１３６１】

工程３：１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－スルホニルクロリド

１Ｌの丸底フラスコ中に、ＨＣｌ水溶液（６Ｎ、２００ｍＬ）中の３－アミノ－１－（プロパン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール（１０ｇ、８０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。こ

の後、水（２０ｍＬ）中のＮａＮＯ$_2$（８．２８ｇ、１２０ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を０℃で３０分間撹拌した。上記の混合物を、ＡｃＯＨ（２００ｍＬ）中のＳＯ$_2$の飽和溶液に、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。次に、上記に、ＣｕＣｌ$_2$（１０．８ｇ、８０．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、２００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２００ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１０ｇ（５９．８％）の表題化合物が黄色の油として得られた。生成物をさらに精製せずに次の工程に使用した。

【１３６２】

工程４：１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－スルホンアミド

１０００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（５０ｍＬ）中の１－イソプロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－スルホニルクロリド（１０ｇ、４７．８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＣＭ（５００ｍＬ）中のアンモニアの飽和溶液を、０℃で撹拌しながら少しずつ加えた。得られた溶液を０℃で１時間撹拌した。得られた溶液を濃縮し、残渣を、ＳｉＯ$_2$－ゲルカラムを用いて精製し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２～１：１）で溶離した。これにより、８．１３ｇ（９０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９０［Ｍ＋１］。

【１３６３】

工程５～６では、スキーム２８に示される化合物１４７’’を中間体３３に転化するための類似の手順を用いて、化合物１５９’’から化合物中間体３５を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３０３（Ｍ＋１）。

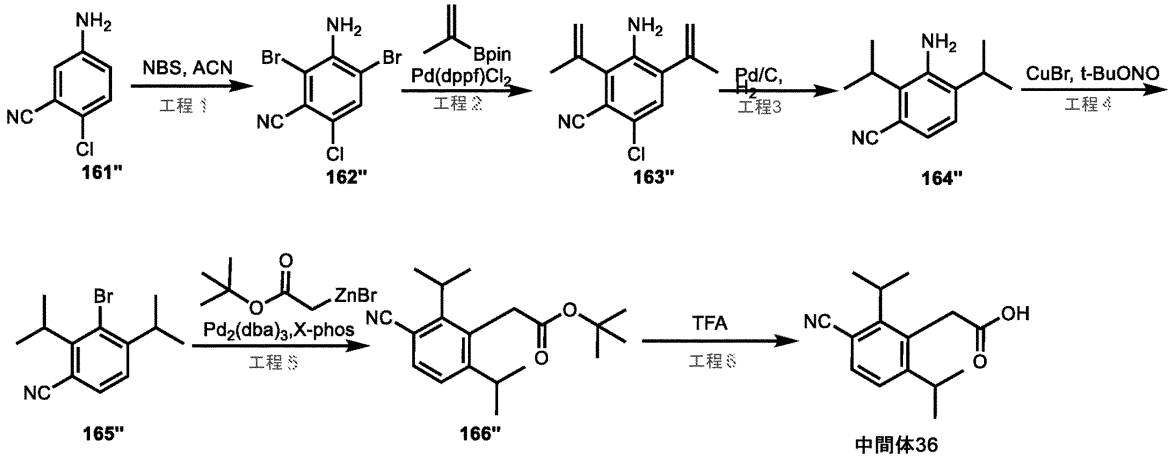
【１３６４】

フェニル酢酸中間体のためのスキーム：スキーム３１～４７は、フェニル酢酸中間体の調製を示す。

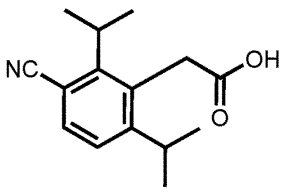
【１３６５】

【化３４４】

スキーム31:



中間体36



２－（３－シアノ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

工程１：３－アミノ－２，４－ジブロモ－６－クロロベンゾニトリル

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（２００ｍＬ）中の５－アミノ－２－クロロベ

ンゾニトリル（１０ｇ、６５．７ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＮＢＳ（２９ｇ、１６２ｍｍｏｌ）を少しずつ加えた。得られた溶液を室温で１４時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１５～１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１８ｇの表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０８／３１０（Ｍ＋１）。

【１３６６】

工程２：３－アミノ－６－クロロ－２，４－ジ（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゾニトリル

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２００ｍＬ）及びH_2O（２０ｍＬ）中の３－アミノ－２，４－ジブロモ－６－クロロベンゾニトリル（１５ｇ、４８．０ｍｍｏｌ）、２－（テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）プロパ－２－エン－１－イリウム（１８．５ｇ、１１１ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（４７ｇ、１４４ｍｍｏｌ）及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（１．５ｇ）を入れた。得られた溶液を、油浴中で、１００℃で１４時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：０～１：２５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１０ｇの表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３３（Ｍ＋１）。

【１３６７】

工程３：３－アミノ－２，４－ジイソプロピルベンゾニトリル

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（５０ｍＬ）中の３－アミノ－６－クロロ－２，４－ビス（プロパ－１－エン－２－イル）ベンゾニトリル（１０ｇ、４３ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、２ｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、８ｇの表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０３（Ｍ＋１）．

【１３６８】

工程４：３－ブロモ－２，４－ジイソプロピルベンゾニトリル

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（１５０ｍＬ）中の３－アミノ－２，４－ビス（プロパン－２－イル）ベンゾニトリル（８ｇ、３９．５ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、ＣｕＢｒ（１１．３ｇ、７９．１ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチルニトリル（８．２ｇ、７９．１ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６０℃で３時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４．２ｇ（３９．９０％）の表題化合物が紫色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６６／２６８［Ｍ＋１］

【１３６９】

工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（３－シアノ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の３－ブロモ－２，４－ビス（プロパン－２－イル）ベンゾニトリル（３．１ｇ、１１．６ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、Ｘｐｈｏｓ（５５５．２ｍｇ、１．１６ｍｍｏｌ）、Pd_2（ｄｂａ）$_3$（５３３．２ｍｇ、０．５８ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（７．６ｇ、２９．１２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で３時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３．０ｇ（８５．５％）の表題化合物が紫色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０２［Ｍ＋１］。

【１３７０】

工程６：２－（３－シアノ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

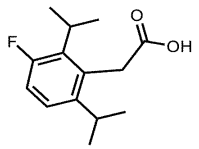
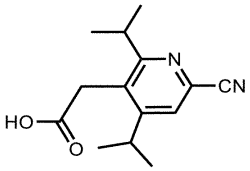
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［３－シアノ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（３．４ｇ、１１．

２８ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、ＴＦＡ（１５ｍＬ）を加えた。得られた溶液を室温で３時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２．６ｇ（９３．９％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２４６［Ｍ＋１］。

【１３７１】

【表７７】

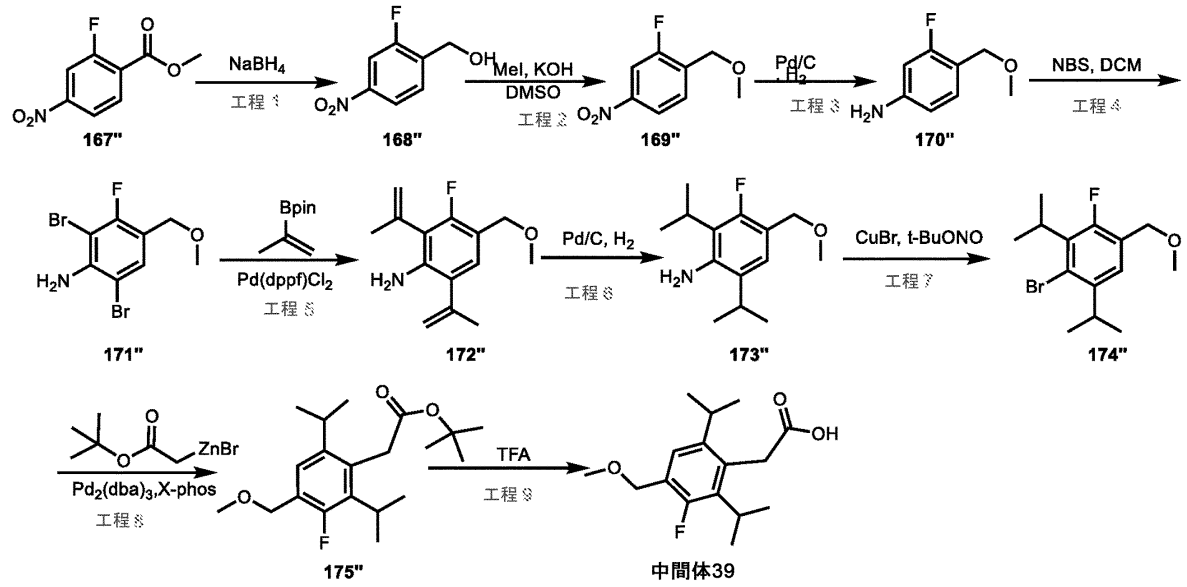
表 13. 適切な出発材料から、スキーム 31 に示される化合物 **161''**を中間体 **36** に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M-H]$^-$
中間体 37		2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	237
中間体 38		2-(6-シアノ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)酢酸	247

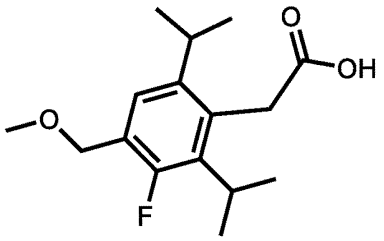
【１３７２】

【化３４５】

スキーム32:



中間体39



２－（３－フルオロ－２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）酢酸

工程１：（２－フルオロ－４－ニトロフェニル）メタノール

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（１００ｍＬ）中のメチル２－フルオロ－４－ニトロベンゾエート（１０ｇ、５０．２ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＮａＢＨ４（９．５ｇ、２５１ｍｍｏｌ）を３０分間にわたって少しずつ加えた。得られた溶液を室温で４時間撹拌した。得られた溶液を４００ｍＬの酢酸エチルで希釈した。得られた混合物を、２００ｍＬの水及び２００ｍＬの塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、次に濃縮した。これにより、３．６ｇの表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７２（Ｍ＋１）。

【１３７３】

工程２：２－フルオロ－１－（メトキシメチル）－４－ニトロベンゼン

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＭＳＯ（１０ｍＬ）中の（２－フルオロ－４－ニトロフェニル）メタノール（３．６ｇ、２１．０ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＫＯＨ（４．７２ｇ、８４．２ｍｍｏｌ）を少しずつ及びＭｅＩ（１１．９ｇ、８４．１ｍｍｏｌ）を滴下して室温で加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。次に、反応物を、水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２００ｍＬのジクロロメタンで抽出した。有機層を組み合わせて、２００ｍＬの塩水で洗浄した。次に、有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離して、表題化合物を２．１ｇの黄色の固体として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：１８６（Ｍ＋１）。

【１３７４】

工程３：３－フルオロ－４－（メトキシメチル）アニリン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（５０ｍＬ）中の２－フルオロ－１－（メトキシメチル）－４－ニトロベンゼン（２．４ｇ、１２．９ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％の油分散体、２４０ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。得られた混合物を濃縮して、表題化合物を２．４ｇの黄色の固体として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：１５６（Ｍ＋１）。

【１３７５】

工程４：２，６－ジブロモ－３－フルオロ－４－（メトキシメチル）アニリン

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（５０ｍＬ）中の３－フルオロ－４－（メトキシメチル）アニリン（１．７ｇ、１０．９６ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＮＢＳ（４．３ｇ、１２．１ｍｍｏｌ）を少しずつ加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、水／氷の添加によってクエンチした。得られた溶液を２００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。得られた混合物を、２００ｍＬの水及び２００ｍＬの塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離して、４ｇの表題化合物を黄色の固体として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３１１／３１３（Ｍ＋１）。

【１３７６】

工程５：３－フルオロ－４－（メトキシメチル）－２，６－ジ（プロパ－１－エン－２－イル）アニリン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２００ｍＬ）及びH_2O（２０ｍＬ）中の２，６－ジブロモ－３－フルオロ－４－（メトキシメチル）アニリン（１４ｇ、４４．７ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（１８．８ｇ、１１１ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（３．２７ｇ、４．４７ｍｍｏｌ）及びCs_2CO_3（２９．２ｇ、８９．５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で５時間撹拌した。次に、反応物を、１０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を３×２０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２．０ｇ（１９．０％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３６（Ｍ＋１）。

【１３７７】

工程６：３－フルオロ－２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）アニリン

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２０ｍＬ）中の３－フルオロ－４－（メトキシメチル）－２，６－ビス（プロパ－１－エン－２－イル）アニリン（２．０ｇ、８．５０ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、２００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を室温で５時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られたろ液を減圧下で濃縮した。これにより、１．８ｇ（８８．５％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２４０（Ｍ＋１）。

【１３７８】

工程７：２－ブロモ－４－フルオロ－１，３－ジイソプロピル－５－（メトキシメチル）ベンゼン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、CH_3CN（３０ｍＬ）中の３－フルオロ－４－（メトキシメチル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（１．０ｇ、４．１８ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、ＣｕＢｒ（２．４ｇ、１６．７ｍｍｏｌ）及びｔ－ＢｕＯＮＯ（－１．７２ｇ、１６．７ｍｍｏｌ）を撹拌しながら加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で３時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、５００ｍｇ（３９．４％）の表題化合

物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０３／３０５［Ｍ＋１］。

【１３７９】

工程８：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（３－フルオロ－２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）アセテート

アルゴンの不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（４０ｍＬ）中の２－ブロモ－４－フルオロ－５－（メトキシメチル）－１，３－ビス（プロパン－２－イル）ベンゼン（１．０ｇ、３．３０ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（２．５８ｇ、９．８９ｍｍｏｌ）、$Pd_2(dba)_3CHCl_3$（１７０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）、及びＸｐｈｏｓ（１５７ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で３時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×３０ｍｌのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２００ｍｇ（１７．９％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３３９［Ｍ＋１］。

【１３８０】

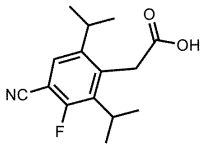
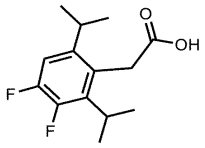
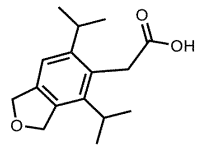
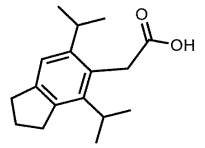
工程９：２－（３－フルオロ－２，６－ジイソプロピル－４－（メトキシメチル）フェニル）酢酸

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（６ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル３－フルオロ－４－（メトキシメチル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）ベンゾエート（３００ｍｇ、０．９２ｍｍｏｌ）に入れ、撹拌溶液に、ＴＦＡ（２ｍＬ）を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、ＤＣＭ／メタノール（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１７０ｍｇの表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８１（Ｍ－１）。

【１３８１】

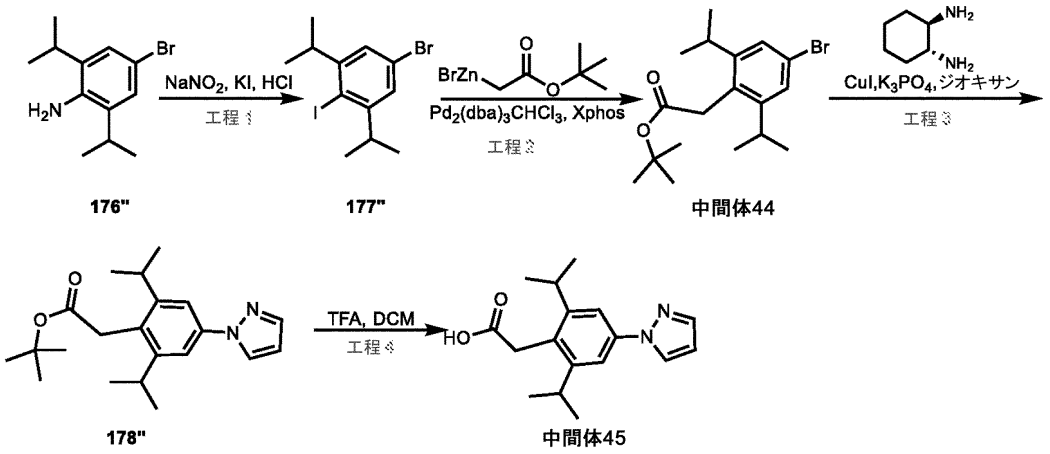
【表７８】

表 14. 適切な出発材料から、スキーム 32 に示される化合物 167''を中間体 39 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

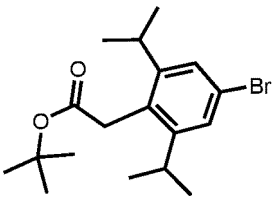
中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M-H]⁻
中間体 40		2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	262
中間体 41		2-(3,4-ジフルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	255
中間体 42		2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)酢酸	261
中間体 43		2-(4,6-ジイソプロピル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)酢酸	259

【１３８２】
【化３４６】

スキーム33:



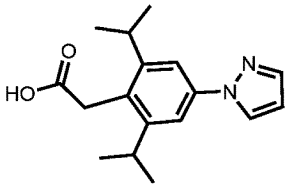
中間体44



Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート
工程１：５－ブロモ－２－ヨード－１，３－ジイソプロピルベンゼン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＨＣｌ（６Ｍ、６０ｍＬ）中の４－ブロモ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（５ｇ、１９．６ｍｍｏｌ）を入れた。この後、水（５ｍＬ）中の$NaNO_2$（２．５ｇ、３６．３ｍｍｏｌ）の溶液を－１０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を－１０℃で３０分間撹拌した。次に、上記に、ＫＩ（１１ｇ、６６．３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×２００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせた。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（０／１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、５．９５ｇ（８３．０％）の表題化合物が褐色の液体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３６６／３６８（Ｍ＋１）。
【１３８３】
工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５０ｍＬ）中の５－ブロモ－２－ヨード－１，３－ビス（プロパン－２－イル）ベンゼン（２．０ｇ、５．４５ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、Pd_2（ｄｂａ）$_3$（５０４ｍｇ、０．５５ｍｍｏｌ）、Ｘｐｈｏｓ（２６２ｍｇ、０．５５ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（２．１３ｇ、８．６６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。得られた溶液を、６０℃でさらに３時間撹拌しながら反応させた。得られた混合物を濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３６０ｍｇ（１８．６％）の表題化合物が固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５５／３５７（Ｍ＋１）。
【１３８４】

【化３４７】

中間体45



２－（２，６－ジイソプロピル－４－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）フェニル）酢酸
工程３：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）フェニル）アセテート
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート（３６０ｍｇ、１．０１ｍｍｏｌ）の混合物を入れた。撹拌溶液に、１Ｈ－ピラゾール（２７５ｍｇ、４．０４ｍｍｏｌ）、ヨウ化銅（Ｉ）（７６ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）及びリン酸カリウム（６４２ｍｇ、３．０３ｍｍｏｌ）を加えた。上記に、（１Ｒ，２Ｒ）－シクロヘキサン－１，２－ジアミン（０．０５ｍＬ、０．４０ｍｍｏｌ）を滴下して加えた。得られた溶液を一晩還流させた。次に、反応物を濃縮し、残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１２０ｍｇ（３５％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３４２．２（Ｍ＋１）。

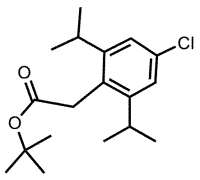
【１３８５】

工程４：２－（２，６－ジイソプロピル－４－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）フェニル）酢酸
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの密閉管中に、ＴＦＡ（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）フェニル）アセテート（１２０ｍｇ、０．３５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。次に、反応物を濃縮し、精製せずに次の工程に使用した。ＭＳ－ＥＳＩ：２８６．２（Ｍ＋１）。

【１３８６】

【表７９】

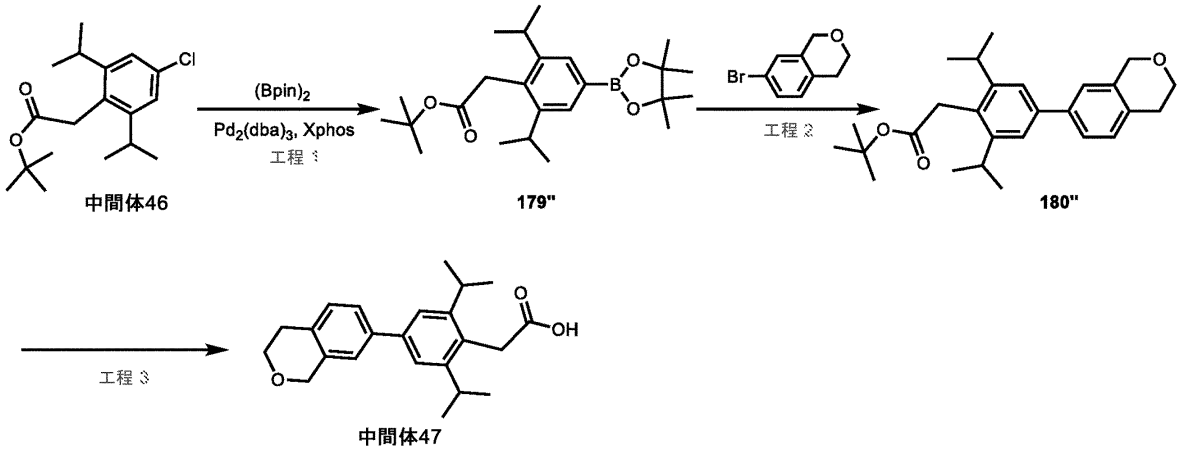
表 15. 適切な出発材料から、スキーム 33 に示される化合物 176''を中間体 44 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量$[M+H]^+$
中間体 46		tert-ブチル 2-(4-クロロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセテート	311

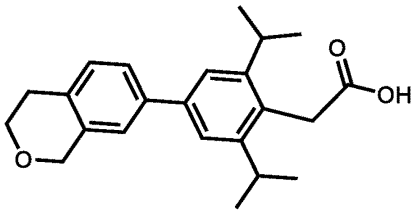
【１３８７】

【化３４８】

スキーム34:



中間体47



２－（４－（イソクロマン－７－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

工程１：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）アセテート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－クロロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（３１０ｍｇ、１．００ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、４，４，４’，４’，５，５，５’，５’－オクタメチル－２，２’－ビ（１，３，２－ジオキサボロラン）（５０８ｍｇ、２．０ｍｍｏｌ）、ＫＯＡｃ（１９５ｍｇ、１．９９ｍｍｏｌ）、Ｘｐｈｏｓ（９５．１ｍｇ、０．２０ｍｍｏｌ）$Pd_2(dba)_3$（９１．３ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、窒素下で、油浴中で、９０℃で１６時間撹拌した。次に、混合物を濃縮し、残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４００ｍｇ（９９．７％）の表題化合物が粗固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４０３（Ｍ＋１）。

【１３８８】

工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（イソクロマン－７－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（１０ｍＬ）及びH_2O（２．５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）フェニル）アセテート（４０２ｍｇ、１．００ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、Cs_2CO_3（６５２．０ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）、７－ブロモ－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－２－ベンゾピラン（２１２．９ｍｇ、１．００ｍｍｏｌ）及び$Pd(dppf)Cl_2$（７３．１ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、８０℃で４時間撹拌した。得られた溶液を２０ｍＬの酢酸エチルで希釈した。得られた混合物を、２×２０ｍＬのH_2O及び２×２０ｍＬの塩水で洗浄した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３００ｍｇ（７３．４

％）の表題化合物が淡褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４０９（Ｍ＋１）。

【１３８９】

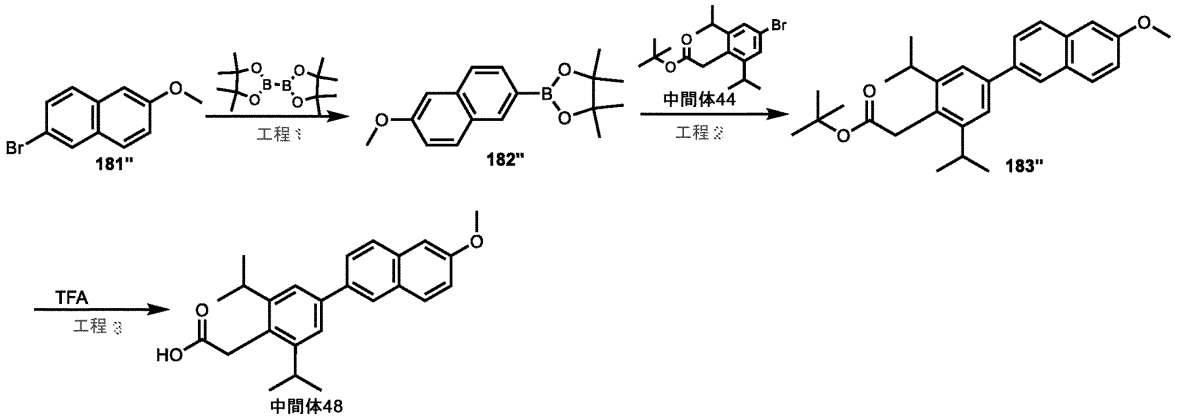
工程３：２－（４－（イソクロマン－７－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（４ｍＬ）及びＴＦＡ（１ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－（３，４－ジヒドロ－１Ｈ－２－ベンゾピラン－７－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（３００ｍｇ、０．７３ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、８０ｍｇ（３０．９％）の表題化合物が淡褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５１（Ｍ－１）。

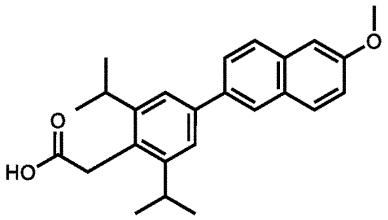
【１３９０】

【化３４９】

スキーム 35:



中間体48



２－（２，６－ジイソプロピル－４－（６－メトキシナフタレン－２－イル）フェニル）酢酸

工程１：２－（６－メトキシナフタレン－２－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（５ｍＬ）中の２－ブロモ－６－メトキシナフタレン（１１５ｍｇ、０．４９ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、酢酸カリウム（１７５ｍｇ、１．２７ｍｍｏｌ）、４，４，５，５－テトラメチル－２－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（１１３ｍｇ、０．４５ｍｍｏｌ）及びＰｄ（ＰＰｈ$_3$）$_2$Ｃｌ$_2$（９ｍｇ）を加えた。得られた溶液を１１０℃で１０時間撹拌した。得られた溶液を、３×２０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、１２０ｍｇの表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８５（Ｍ＋１）。

【１３９１】

工程２：２－（２，６－ジイソプロピル－４－（６－メトキシナフタレン－２－イル）フェニル）酢酸

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（１５ｍＬ）及びＨ$_2$Ｏ（１．５ｍＬ）中の

２－（６－メトキシナフタレン－２－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン（１００ｍｇ）を入れ、撹拌溶液に、Cs_2CO_3（３４４ｍｇ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２７．５ｍｇ）、２－［４－ブロモ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］酢酸（１２５ｍｇ）を加えた。得られた溶液を８０℃で１５時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、９０ｍｇ（５８．９％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４３３（Ｍ＋１）。

【１３９２】

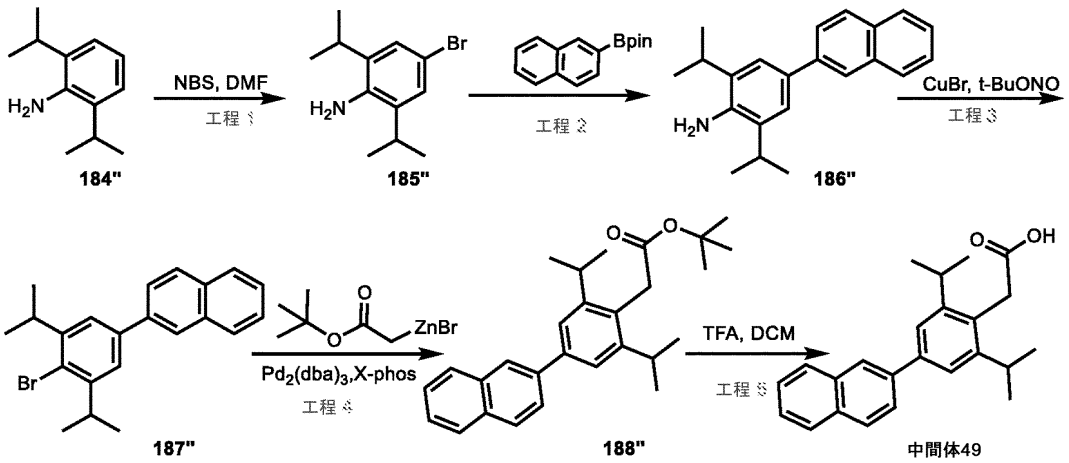
工程３：２－（２，６－ジイソプロピル－４－（６－メトキシナフタレン－２－イル）フェニル）酢酸

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（５ｍＬ）及びＴＦＡ（２．０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－（６－メトキシナフタレン－２－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（８０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。これにより、８０ｍｇ（粗製）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３７７［Ｍ＋１］

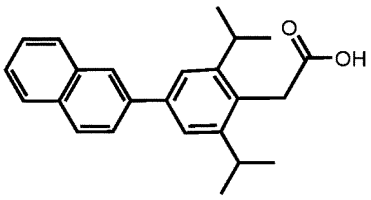
【１３９３】

【化３５０】

スキーム36:



中間体49



２－（２，６－ジイソプロピル－４－（ナフタレン－２－イル）フェニル）酢酸

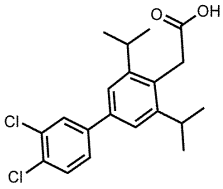
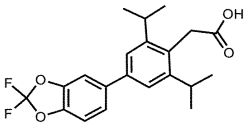
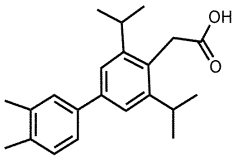
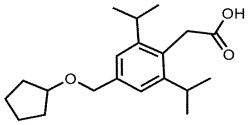
工程１：４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルアニリン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＤＭＦ（２００ｍＬ）中の２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（２０ｇ、５６．４ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、ＮＢＳ（２０．１ｇ、１１２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で６時間撹拌した。得られた混合物を１００ｍｌの水で洗浄した。得られた溶液を、３×１００ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１６ｇ（５５．３％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５６／２５８（Ｍ＋１）。

【１３９４】
工程２：２，６－ビイソプロピル－４－（ナフタレン－２－イル）アニリン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２５０ｍＬ）及びＨ$_2$Ｏ（２５ｍＬ）中の４－ブロモ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（１０ｇ、３９．０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。撹拌溶液に、４，４，５，５－テトラメチル－２－（ナフタレン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（１１．９ｇ、４６．８ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_2$（７．８１ｇ、７．８ｍｍｏｌ）及びＣｓ$_2$ＣＯ$_3$（２５．４ｇ、７８．１ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌した。次に、得られた溶液を、８０℃でさらに１９時間反応させた。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、６．５ｇ（５４．９％）の表題化合物が赤色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３０４（Ｍ＋１）。
【１３９５】
工程３：２－（４－ブロモ－３，５－ジイソプロピルフェニル）ナフタレン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（１００ｍＬ）中の４－（ナフタレン－２－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（６．０ｇ、１９．８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。撹拌溶液に、ｔｅｒｔ－ブチルニトリル（４．０８ｇ、３９．５ｍｍｏｌ）及びＣｕＢｒ（５．６７ｇ、３９．５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。得られた溶液を、６０℃でさらに１８０分間にわたって撹拌しながら反応させた。混合物を濃縮し、残渣を、ＰＥを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１０５ｍｇ（１７．３％）の表題化合物が赤色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３６７／３６９（Ｍ＋１）。
【１３９６】
工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（２，６－ジイソプロピル－４－（ナフタレン－２－イル）フェニル）アセテート
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５０ｍＬ）中の２－［４－ブロモ－３，５－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］ナフタレン（２ｇ、５．４４ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、上記の溶液に、ＸＰｈｏｓ（０．３ｇ、０．５４ｍｍｏｌ）、及びＰｄ$_2$（ｄｂａ）$_3$ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$（０．２ｇ、０．２７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１５分間撹拌した。次に、混合物に、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（２．８ｇ、１０．９ｍｍｏｌ）を撹拌しながら加えた。得られた溶液を、６５℃でさらに１８０分間反応させた。残渣を、ＰＥを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．０ｇ（４５．６％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４０３（Ｍ＋１）。
【１３９７】
工程５：２－（２，６－ジイソプロピル－４－（ナフタレン－２－イル）フェニル）酢酸
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＦＡ（２０ｍＬ）及びＤＣＭ（２０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－（ナフタレン－２－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（２．４８ｇ、６．１６ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で５時間撹拌した。次に、混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１３／１００）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．６８ｇ（７８．５％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３４７（Ｍ＋１）。
【１３９８】

【表８０】

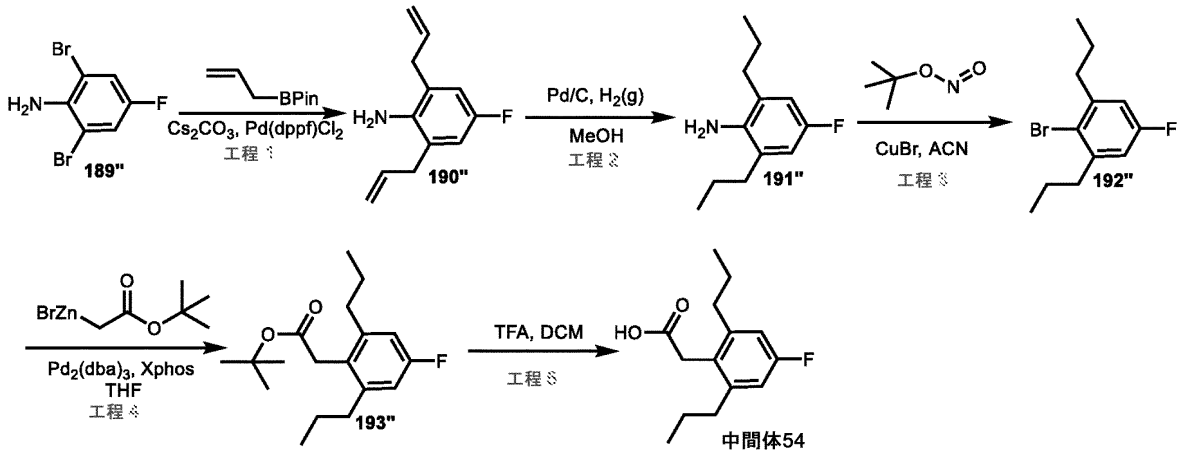
表 16. 適切な出発材料から、スキーム 36 に示される化合物 **184''**を中間体 **49** に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M-H]⁻
中間体 50		2-(3',4'-ジクロロ-3,5-ジイソプロピル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)酢酸	363
中間体 51		2-(4-(2,2-ジフルオロベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	375
中間体 52		2-(3,5-ジイソプロピル-3',4'-ジメチル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)酢酸	323
中間体 53		2-(4-((シクロペンチルオキシ)メチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)酢酸	317

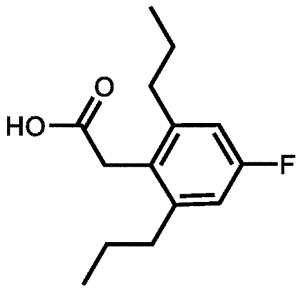
【１３９９】

【化３５１】

スキーム37:



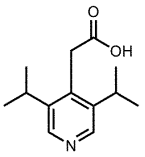
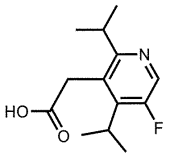
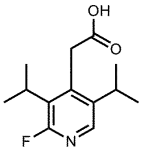
中間体54



２－（４－フルオロ－２，６－ジプロピルフェニル）酢酸
工程１：２，６－ジアリル－４－フルオロアニリン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の２－ブロモ－４－フルオロ－６－（プロパ－２－エン－１－イル）アニリン（３．７ｇ、１６．１ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－２－エン－１－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（８．１ｇ、４８．２ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（１５．７ｇ、４８．２ｍｍｏｌ）及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（５８８ｍｇ、０．８０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、７０℃で一晩撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２．６ｇ（８４．５％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９２［Ｍ＋１］。
【１４００】
工程２：４－フルオロ－２，６－ジプロピルアニリン
１００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（５０ｍＬ）中の４－フルオロ－２，６－ビス（プロパ－２－エン－１－イル）アニリン（２．６ｇ、１３．５９ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、３００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を、水素下で、室温で５時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、２．５ｇ（９４．１％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９６［Ｍ＋１］
【１４０１】
工程３：２－ブロモ－５－フルオロ－１，３－ジプロピルベンゼン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（２０ｍＬ）中の４－フルオロ－２，６－ジプロピルアニリン（８４０ｍｇ、４．３０ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＣｕＢｒ（１．２ｇ、８．６０ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチルニトリル（８８８ｍｇ、８．６１ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６０℃で３時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、６４０ｍｇ（５７．４％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５９／２６１［Ｍ＋１］。
【１４０２】
工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－フルオロ－２，６－ジプロピルフェニル）アセテート
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の２－ブロモ－５－フルオロ－１，３－ジプロピルベンゼン（４６０ｍｇ、１．７７ｍｍｏｌ）を入れた。混合物に、Ｘｐｈｏｓ（８５ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）及びPd_2（ｄｂａ）$_3$（８２ｍｇ、０．０９ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。次に、上記に、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（１．４ｇ、５．３２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で３時間撹拌した。次に、反応物を、１０ｍＬのNH_4Cl（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１０ｍＬのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、３００ｍｇ（５７．４％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２９５［Ｍ＋１］。
【１４０３】
工程５：２－（４－フルオロ－２，６－ジプロピルフェニル）酢酸
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（４ｍＬ）及びＴＦＡ（２ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－（４－フルオロ－２，６－ジプロピルフェニル）アセテート（３００ｍｇ）を入れた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。粗生成物を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いた分取ＴＬＣによって精製した。これにより、１６５ｍｇ（６７．９％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２３９［Ｍ＋１］
【１４０４】

【表８１】

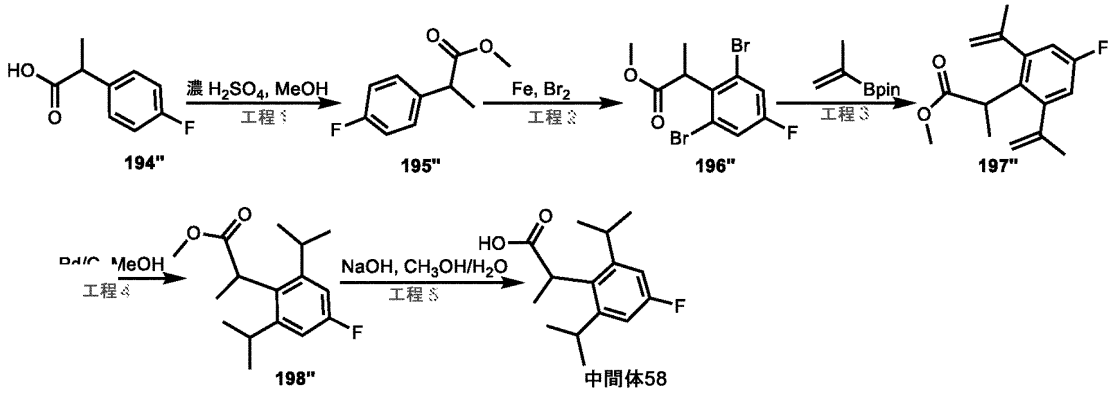
表 17. 適切な出発材料から、スキーム 37 に示される化合物 189''を中間体 54 に転化するための類似の手順を用いて、以下の表中の中間体を調製した。

中間体番号	構造	IUPAC 名	精密質量[M+H]+
中間体 55		2-(3,5-ジイソプロピルピリジン-4-イル)酢酸	222
中間体 56		2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)酢酸	240
中間体 57		2-(2-フルオロ-3,5-ジイソプロピルピリジン-4-イル)酢酸	240

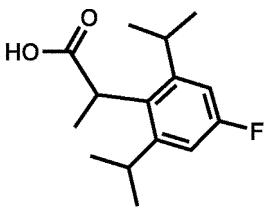
【１４０５】

【化３５２】

スキーム38:



中間体58



２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパン酸

工程１：メチル２－（４－フルオロフェニル）プロパノエート

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２０ｍＬ）中の２－（４－フルオロフェニル）プロパン酸（２ｇ、１１．８９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。混合物に、濃H_2SO_4（０．０５ｍＬ）を加えた。得られた溶液を８５℃で１６時間撹拌した。次に、反応物を、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×５０ｍＬのジクロロメタンで抽出し、有機層を組み合わせた。固体をろ過して取り出した。混合物を無水硫

酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、２．１ｇ（９７％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１８３［Ｍ＋１］。

【１４０６】

工程２：メチル２－（２，６－ジブロモ－４－フルオロフェニル）プロパノエート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、$CHCl_3$（２０ｍＬ）中のメチル２－（４－フルオロフェニル）プロパノエート（１．７ｇ、９．３３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。撹拌溶液に、Ｆｅ粉末（０．２１ｇ）及びBr_2（１．９２ｍＬ）を加えた。得られた溶液を５０℃で１６時間撹拌した。次に、反応物を、５０ｍＬの飽和$Na_2S_2O_3$溶液の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×５０ｍＬのＤＣＭで抽出し、有機層を組み合わせて、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１．０３ｇ（３２％）の表題化合物が黄色の粗製油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３３９／３４１［Ｍ＋１］。

【１４０７】

工程３：メチル２－（４－フルオロ－２，６－ジ（プロパ－１－エン－２－イル）フェニル）プロパノエート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された４０ｍＬの密閉管中に、ジオキサン（１０ｍＬ）及びH_2O（１ｍＬ）中のメチル２－（２，６－ジブロモ－４－フルオロフェニル）プロパノエート（１．０３ｇ、３．０３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。撹拌溶液に、Cs_2CO_3（２ｇ、６．１４ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２３０ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）及び４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（１．０７ｇ、６．３７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を１１０℃で６時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：６）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、７５４ｍｇ（９５％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６３［Ｍ＋１］。

【１４０８】

工程４：メチル２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパノエート

H_2の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２０ｍＬ）中のメチル２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパ－１－エン－２－イル）フェニル］プロパノエート（８２０ｍｇ、３．１３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、０．２ｇ）を加えた。得られた溶液を室温で４時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、７００ｍｇ（８４％）の表題化合物が黄色の粗製油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６７［Ｍ＋１．

【１４０９】

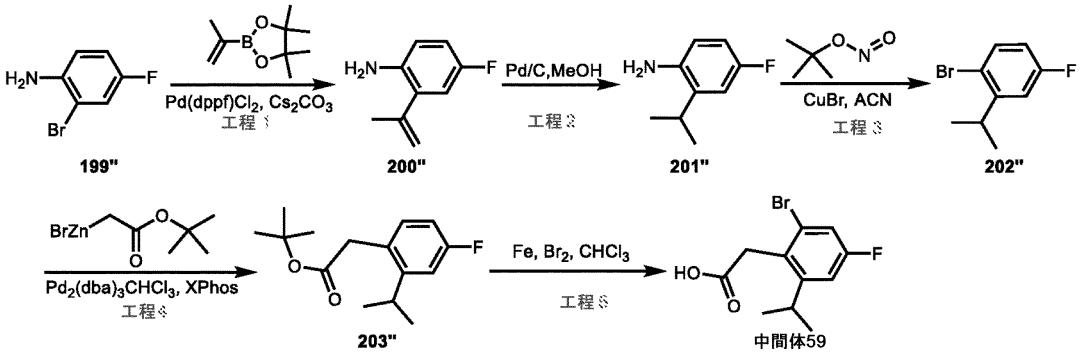
工程５：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパン酸

４０ｍＬの密閉管中に、６Ｍの水酸化ナトリウム（３ｍＬ）及びＭｅＯＨ（３ｍＬ）中のメチル２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］プロパノエート（３００ｍｇ、１．１３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を９０℃で３時間撹拌した。次に、反応物を、５０ｍＬの水の添加によってクエンチした。溶液のｐＨ値を、塩化水素（１Ｍ）を用いて２に調整した。得られた溶液を２×５０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせた。固体をろ過して取り出した。混合物を無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１５０ｍｇ（５３％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５３［Ｍ＋１］。

【１４１０】

【化３５３】

スキーム39:



工程１～４では、スキーム３７に示される化合物１８９’’を化合物１９３’’に転化するための類似の手順を用いて、化合物１９９’’から化合物２０３’’を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２５３（Ｍ＋１）。

【１４１１】

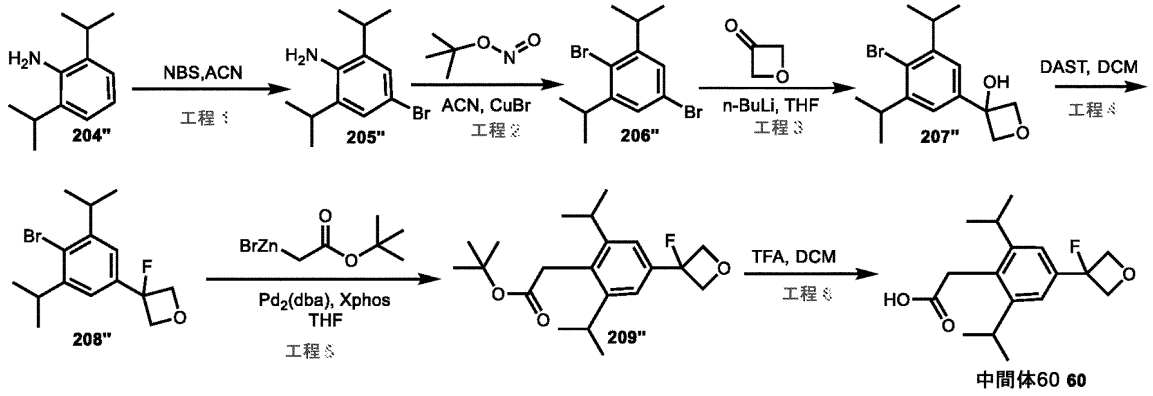
工程５：２－（２－ブロモ－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）酢酸

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＣＨＣｌ$_3$（２５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－フルオロ－２－（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（１．０ｇ、３．９６ｍｍｏｌ）を入れた。この溶液に、ＡｃＯＨ（０．０１ｍＬ）、Ｆｅ粉末（２２．１ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）及びＢｒ$_2$（３．１７ｇ、１９．８ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、５０℃で１６時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬのＮａ$_2$Ｓ$_2$Ｏ$_3$の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×２０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、７００ｍｇ（６４．２％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２７５［Ｍ＋１］。

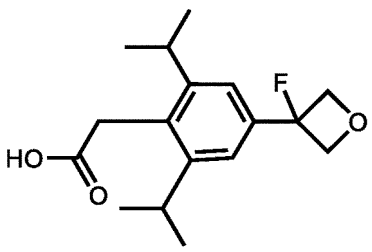
【１４１２】

【化３５４】

スキーム40:



中間体60



２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

工程１：４－ブロモ－２，６－ジイソプロピルアニリン

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（２００ｍＬ）中の２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（１０ｇ、５６．４ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、ＮＢＳ（１１．０ｇ、６２．０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、９．５ｇ（６５．７％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５６／２５８［Ｍ＋１］。

【１４１３】

工程２：２，５－ジブロモ－１，３－ジイソプロピルベンゼン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（２００ｍＬ）中の４－ブロモ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）アニリン（６．４ｇ、２４．９ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＣｕＢｒ（７．２ｇ、５０．２ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチルニトリル（５．２ｇ、５０．５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６５℃で３時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、５ｇ（６２．５％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３１９／３２１／３２３［Ｍ＋１］。

【１４１４】

工程３：３－（４－ブロモ－３，５－ジイソプロピルフェニル）オキセタン－３－オール

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５０ｍＬ）中の２，５－ジブロモ－１，３－ビス（プロパン－２－イル）ベンゼン（５ｇ、１５．６ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ｎ－ＢｕＬｉ（２．５Ｍ、６．２５ｍＬ、１５．６ｍｍｏｌ）を－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を－７８℃で３０分間撹拌した。上記に、ＴＨＦ（２ｍＬ）中のオキセタン－３－オン（１．１３ｇ、１５．６ｍｍｏｌ）の溶液を－７８℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液をゆっくりと室温に温め、室温で２時間撹拌した。次に、反応物を、１００ｍＬのNH_4Cl（飽和）の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、有機層を組み合わせて、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。粗生成物を、以下の条件：カラム、C_{18}シリカゲル；移動相、H_2O（０．１％のＦＡ）及びＡＣＮ（３０分で４０％～７０％のＡＣＮの勾配）、検出器、ＵＶ　２５４／２１０ｎｍを用いたフラッシュ－分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１．２５ｇ（２５．５％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３１３／３１５［Ｍ＋１］。

【１４１５】

工程４：３－（４－ブロモ－３，５－ジイソプロピルフェニル）－３－フルオロオキセタン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の３－［４－ブロモ－３，５－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］オキセタン－３－オール（６００ｍｇ、１．９２ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＤＡＳＴ（６１８ｍｇ、３．８３ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。次に、反応物を、５ｍＬのメタノールの添加によってクエンチした。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４３０ｍｇ（７１．２％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３１５／３１７［Ｍ＋１］。

【１４１６】

工程５：Ｔｅｒｔ－ブチル２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセテート

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の３－［４－ブロモ－３，５－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］－３－フルオロオキセタン（４２０ｍｇ、１．３

３ｍｍｏｌ）を入れ、混合物に、Ｘｐｈｏｓ（６０ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）及び$Pd_2(dba)_3$（６１ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。次に、上記に、ｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（６９４．０ｍｇ、２．６６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、６０℃で３時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４５０ｍｇ（９６．３％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３５１［Ｍ＋１］。

【１４１７】

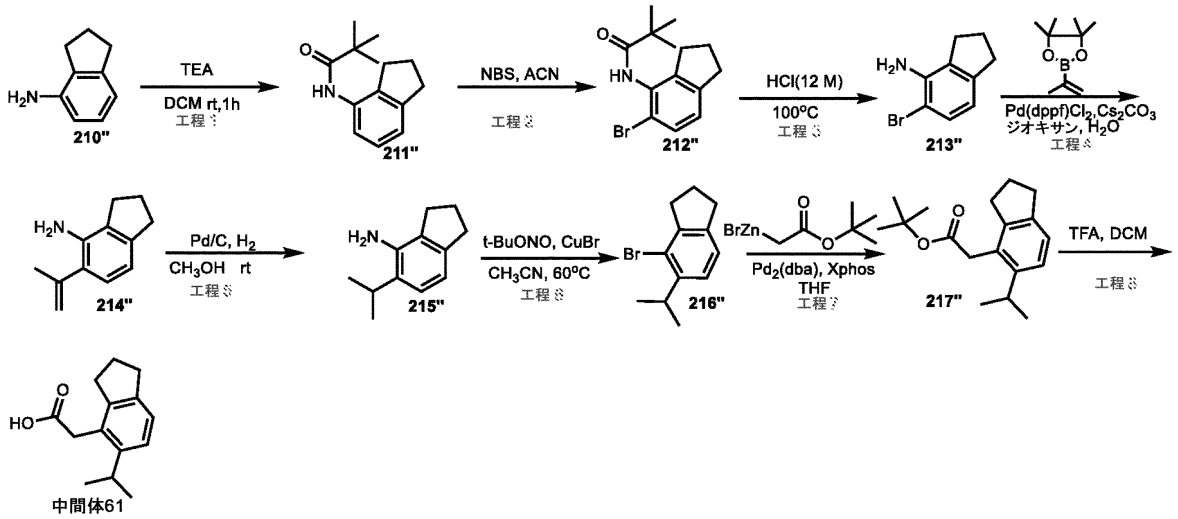
工程６：２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（４ｍＬ）及びＴＦＡ（２ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセテート（４５０ｍｇ、１．２８ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：３）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３００ｍｇ（７９．３％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２９５［Ｍ＋１］。

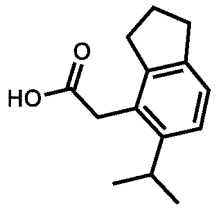
【１４１８】

【化３５５】

スキーム41:



中間体61



２－（５－イソプロピル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－イル）酢酸

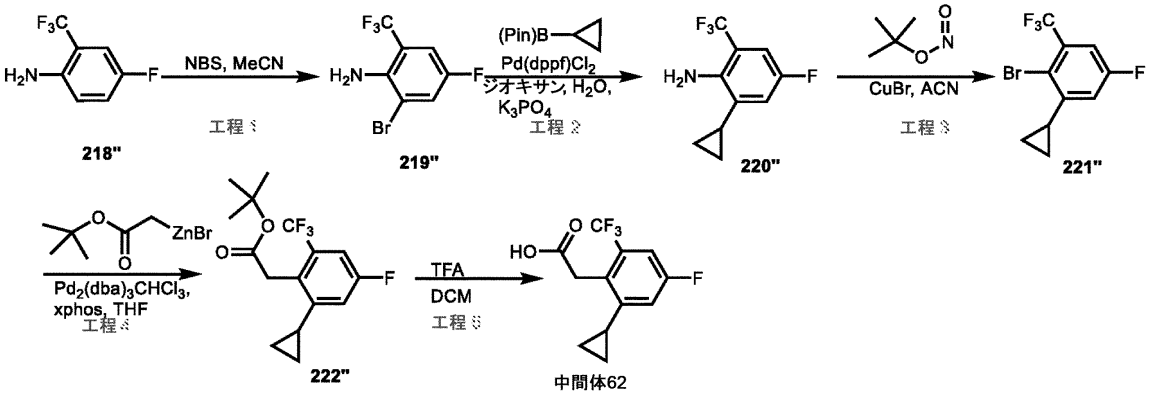
工程１：Ｎ－（２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－イル）ピバル酸アミド

５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１００ｍＬ）中の２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン（１０ｇ、７５．１ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、２，２－ジメチルプロパノイルクロリド（９．０５ｇ、７５．１ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（１１．４ｇ、１１２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、１００ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍｌのＤＣＭで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。これにより、１５ｇ（９１．９％

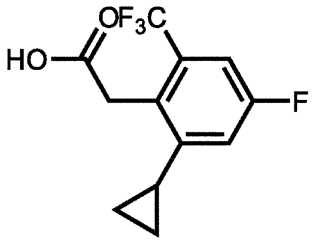
）の表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１８［Ｍ＋１］。
【１４１９】
工程２：Ｎ－（５－ブロモ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－イル）ピバル酸アミド
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（２００ｍＬ）中のＮ－（２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－イル）－２，２－ジメチルプロパンアミド（９ｇ、４１．５ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記の溶液に、ＮＢＳ（８．８６ｇ、４９．８ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１５時間撹拌し、その後、それを、３×２００ｍｌのＤＣＭで抽出した。有機層を組み合わせて、３×２００ｍｌのNa_2CO_3水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。これにより、１２ｇの表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２９６／２９８［Ｍ＋１］
【１４２０】
工程３：５－ブロモ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン
５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＨＣｌ（２００ｍＬ）中のＮ－（５－ブロモ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－イル）－２，２－ジメチルプロパンアミド（１０ｇ、３３．８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。得られた溶液を１００℃で１５時間撹拌した。次に、反応物を、水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×５００ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、７ｇ（９７．７％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２１２／２１４［Ｍ＋１］。
【１４２１】
工程４：５－（プロパ－１－エン－２－イル）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２５０ｍＬ）及びH_2O（２５ｍＬ）中の５－ブロモ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン（７ｇ、３３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。上記に、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（８．３２ｇ、４９．５ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（３２．２ｇ、９９．０ｍｍｏｌ）及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２．４１ｇ、３．３ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を９５℃で１５時間撹拌した。次に、反応物を、水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２００ｍＬのＤＣＭで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、４ｇ（６９．９％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７４［Ｍ＋１］。
【１４２２】
工程５：５－イソプロピル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（１００ｍＬ）中の５－（プロパ－１－エン－２－イル）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－４－アミン（４ｇ、２３．０９ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、４００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素で３回フラッシュした。得られた溶液を、水素下で、室温で一晩撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、４ｇ（９８．８％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１７６［Ｍ＋１］。
【１４２３】
工程６～８では、スキーム３７に示される化合物１９１’’を中間体５４に転化するための類似の手順を用いて、化合物２１５’’から中間体６１を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２１９（Ｍ＋１）。
【１４２４】

【化３５６】

スキーム 42:



中間体62



２－（２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）フェニル）酢酸

工程１：２－ブロモ－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）アニリン

２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（１００ｍＬ）中の４－フルオロ－２－（トリフルオロメチル）アニリン（１１．６ｇ、６４．７ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＮＢＳ（１２．６ｍｇ、７１．２ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら少しずつ加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。次に、反応物を、水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１００ｍＬの酢酸エチルで抽出した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１３ｇ（７７．８％）の表題化合物が赤色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２５８／２６０（Ｍ＋１）。

【１４２５】

工程２：２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）アニリン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２００ｍＬ）及びH_2O（１０ｍＬ）中の２－ブロモ－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）アニリン（１０ｇ、３８．７ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、K_3PO_4（２４．６ｇ、１１６．２ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２．８４ｇ、３．８８ｍｍｏｌ）及びシクロプロピルボロン酸又はエステル（４．９９ｇ、５８．１ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、９０℃で一晩撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、７．５ｇ（８８．２％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２２０（Ｍ＋１）。

【１４２６】

工程３：２－ブロモ－１－シクロプロピル－５－フルオロ－３－（トリフルオロメチル）ベンゼン

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＡＣＮ（３０ｍＬ）中の２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）アニリン（１．５ｇ、６．８５ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、ｔｅｒｔ－ブチルニトリル（１．４１ｇ、１３．７ｍｍｏｌ）及びＣｕＢｒ（１．９６ｇ、１３．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を６０℃で３時間撹拌し

た。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１ｇ（５１．６％）の表題化合物が黄色の液体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８３／２８５（Ｍ＋１）。

【１４２７】

工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル２－［２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）フェニル］アセテート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の２－ブロモ－１－シクロプロピル－５－フルオロ－３－（トリフルオロメチル）ベンゼン（３６０ｍｇ、１．２７ｍｍｏｌ）、Ｘｐｈｏｓ（１２１．２６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）、$Pd_2(dba)_3$．$CHCl_3$（１３１．６ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）、及びｔｅｒｔ－ブチル２－（ブロモジンシオ）アセテート（６６２．４ｍｇ、２．５４ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を６５℃で２時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、３００ｍｇ（７４．１％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：３１９（Ｍ＋１）。

【１４２８】

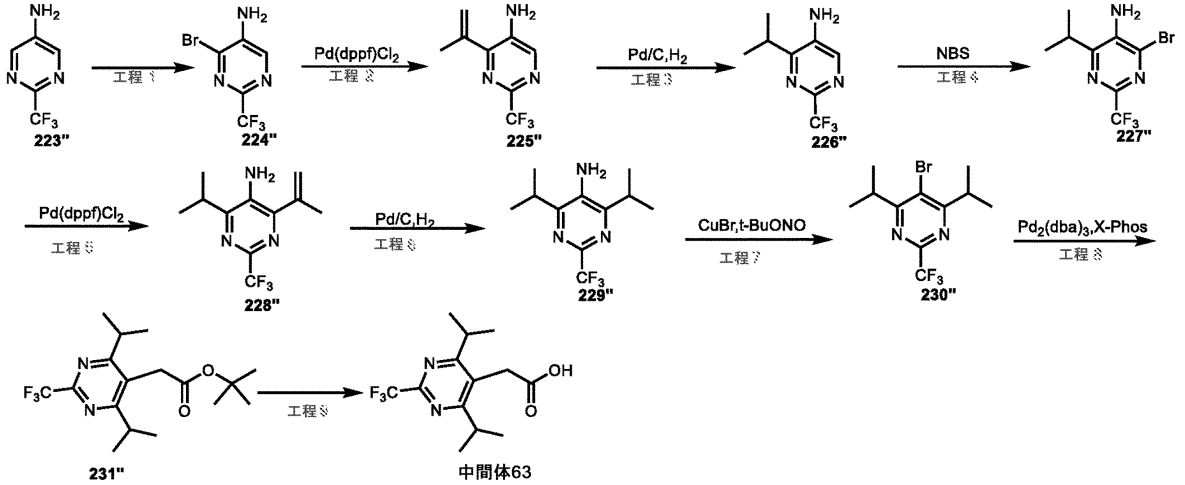
工程５：２－［２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）フェニル］酢酸

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＦＡ（２ｍＬ）及びＤＣＭ（２ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル２－［２－シクロプロピル－４－フルオロ－６－（トリフルオロメチル）フェニル］アセテート（３００ｍｇ、０．９４ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２３０ｍｇ（９３．０％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６３（Ｍ＋１）。

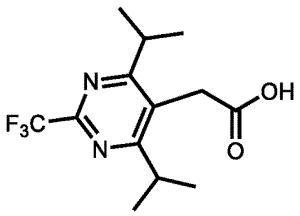
【１４２９】

【化３５７】

スキーム43:



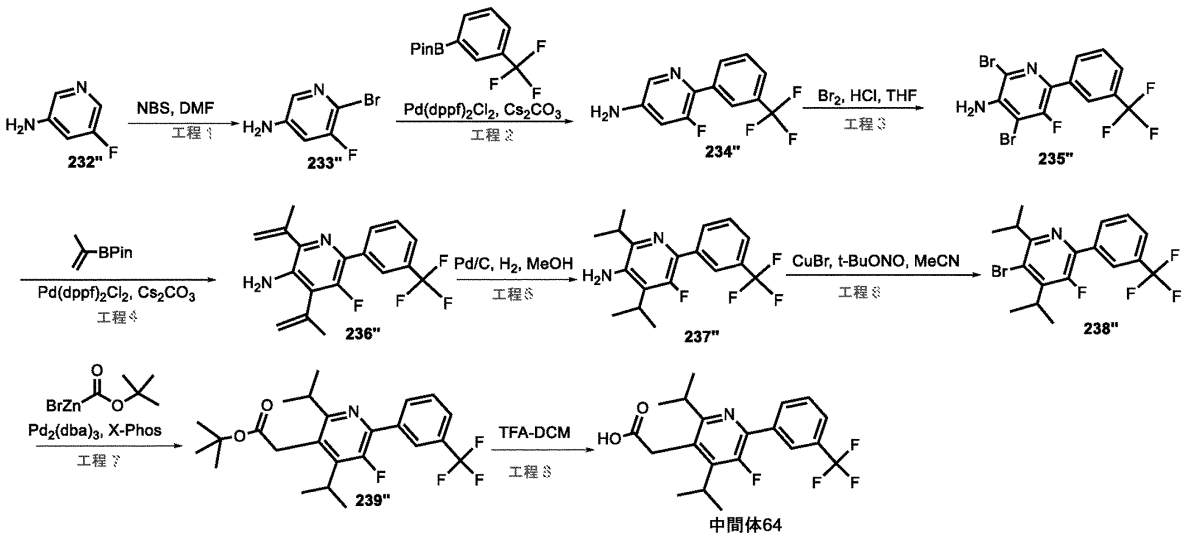
中間体63



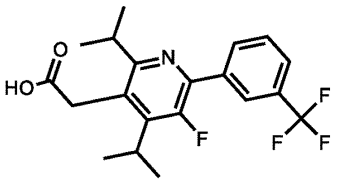
２－（４，６－ジイソプロピル－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－イル）酢酸
工程１：４－ブロモ－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、アセトニトリル（２０ｍＬ）中の２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン（２ｇ、１２．３ｍｍｏｌ）を入れ、この撹拌溶液に、ＮＢＳ（２．６２ｇ、１４．７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１２時間撹拌した。得られた溶液を４０ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を２×３０ｍＬのジクロロメタンで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５０～１：２０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．６ｇ（５３．９％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２４２／２４４［Ｍ＋１］
【１４３０】
工程２：４－（プロパ－１－エン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２０ｍＬ）中の４－ブロモ－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン（１．６ｇ、６．６１ｍｍｏｌ）を入れた。この後、４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（１．４４ｇ、８．５７ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２４１ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）、及びCs_2CO_3（３．２３ｇ、９．９２ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、１００℃で１４時間撹拌した。得られた溶液を４０ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を、３×３０ｍＬのＤＣＭで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：５）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．１ｇ（８１．８％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０４［Ｍ＋１］。
【１４３１】
工程３：４－イソプロピル－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２０ｍＬ）中の４－（プロパ－１－エン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン（１．２ｇ、５．９１ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、２００ｍｇ）を加えた。フラスコを排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を、水素下で、室温で１６時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、１．１ｇ（９０．８％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２０６［Ｍ＋１］。
【１４３２】
工程４：４－ブロモ－６－イソプロピル－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの丸底フラスコ中に、アセトニトリル（２０ｍＬ）中の４－（プロパン－２－イル）－２－（トリフルオロメチル）ピリミジン－５－アミン（１．１ｇ、５．３６ｍｍｏｌ）を入れ、この溶液に、ＮＢＳ（１．１５ｇ、６．４６ｍｍｏｌ）を撹拌しながら少しずつ加えた。得られた溶液を室温で１２時間撹拌した。得られた溶液を４０ｍＬの水で希釈した。得られた溶液を２×３０ｍＬのＤＣＭで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：４０～１：３０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１．０ｇ（６５．６％）の表題化合物が褐色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２８４／２８６［Ｍ＋１］。
【１４３３】
工程５～９では、スキーム３７に示される化合物１８９’’を中間体５４に転化するための類似の手順を用いて、化合物２２７’’から中間体６３を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２９１（Ｍ＋１）。
【１４３４】

【化３５８】

スキーム 44:



中間体64



２－（５－フルオロ－２，４－ジイソプロピル－６－（３－（トリフルオロメチル）フェニル）ピリジン－３－イル）酢酸

工程１：６－ブロモ－５－フルオロピリジン－３－アミン

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、室温でＤＭＦ（１５ｍＬ）中の５－フルオロピリジン－３－アミン（２ｇ、１７．９ｍｍｏｌ）を加えた。撹拌溶液に、ＤＭＦ（５ｍＬ）中のＮＢＳ（３．１９ｇ、１７．９ｍｍｏｌ）を、室温で滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、水（７５ｍＬ）で希釈した。得られた混合物を酢酸エチル（３×２０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水Na_2SO_4上で乾燥させた。ろ過の後、ろ液を減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルクロマトグラフィーによって精製し、ＥｔＯＡｃ／石油エーテル（８：１）で溶離して、表題化合物（３ｇ、７９％）を暗黄色の固体として得た。ＭＥ－ＥＳＩ：１９１／１９３［Ｍ＋１］。

【１４３５】

工程２：ｓ５－フルオロ－６－（３－（トリフルオロメチル）フェニル）ピリジン－３－アミン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（２００ｍＬ）及びH_2O（２０ｍＬ）中の６－ブロモ－５－フルオロピリジン－３－アミン（３ｇ、１５．７ｍｍｏｌ）を室温で加えた。撹拌溶液に、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（１．１５ｇ、１．５７ｍｍｏｌ）及びCs_2CO_3（１０．２ｇ、３１．４ｍｍｏｌ）を、窒素雰囲気下で、室温で加えた。次に、４，４，５，５－テトラメチル－２－［３－（トリフルオロメチル）フェニル］－１，３，２－ジオキサボロラン（１７．１ｇ、６２．８ｍｍｏｌ）を、上記の混合物に加えた。添加が完了した後、得られた混合物を、一晩、油浴中で、８０℃で撹拌した。混合物を濃縮し、シリカゲルへと適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１２：１）で溶離して、表題化合物（４．１ｇ、９４．７％）を黄色の油として得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２５７［Ｍ＋１］。

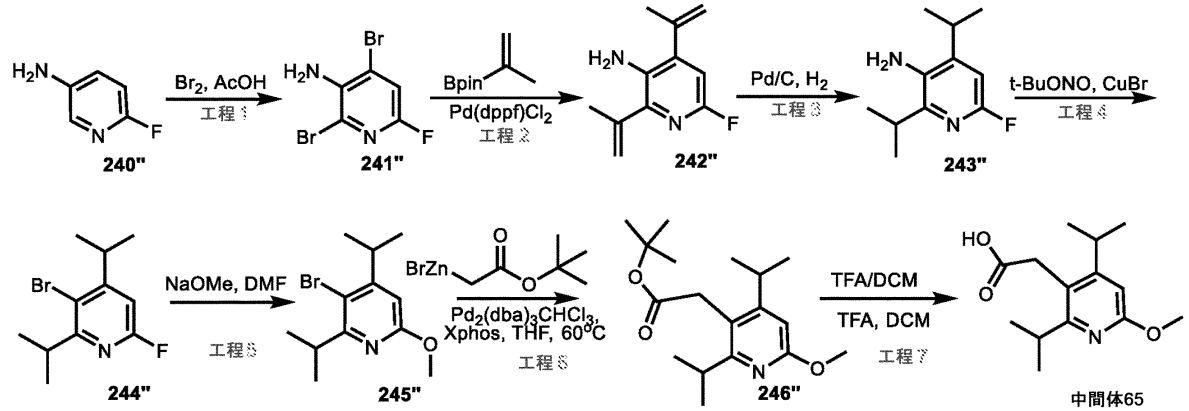
【１４３６】

工程３：２，４－ジブロモ－５－フルオロ－６－（３－（トリフルオロメチル）フェニル

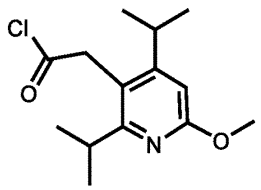
）ピリジン－３－アミン
２５０ｍＬの丸底フラスコ中に、室温でＴＨＦ（２５ｍＬ）中の５－フルオロ－６－［３－（トリフルオロメチル）フェニル］ピリジン－３－アミン（４．１ｇ、１６．０ｍｍｏｌ）を加えた。撹拌溶液に、ＨＣｌ（２Ｍ、１３．５ｍＬ）を室温で一度に加えた。この混合物に、Br_2（２．４ｍＬ）を滴下して加えた。添加が完了した後、得られた混合物を室温で４時間撹拌した。得られた混合物を酢酸エチル（３×９０ｍＬ）で抽出した。組み合わされた有機層を無水Na_2SO_4上で乾燥させた。ろ過の後、ろ液を減圧下で濃縮した。残渣を、シリカゲルクロマトグラフィーによって精製し、ＥｔＯＡｃ／石油エーテル（２０：１）で溶離して、表題化合物（２．２５ｇ、３３．９％）を黄色の固体として得た。ＭＥ－ＥＳＩ：４１３／４１５／４１７［Ｍ＋１］。

【１４３７】
工程４～８では、スキーム３７に示される化合物１８９’’を中間体５４に転化するための手順を用いて、化合物２３５’’から中間体６４を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３８４（Ｍ＋１）。

【１４３８】
【化３５９】
スキーム45:



中間体65



２－（２，４－ジイソプロピル－６－メトキシピリジン－３－イル）アセチルクロリド
工程１：２，４－ジブロモ－６－フルオロピリジン－３－アミン
１Ｌの丸底フラスコ中に、ＡｃＯＨ（４０ｍＬ）中の６－フルオロピリジン－３－アミン（４．０５ｇ、３６．１ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＡｃＯＨ（５０ｍＬ）中のBr_2（４．１ｍＬ、７９．９ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。得られた混合物を、$NaHCO_3$の１５０ｍｌの飽和溶液で洗浄し、３×２００ｍｌのジクロロメタンで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。これにより、５ｇ（５１．２％）の表題化合物が黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２６９／２７１／２７３［Ｍ＋１］。

【１４３９】
工程２～４では、スキーム３７に示される化合物１８９を化合物１９２に転化するための類似の手順を用いて、化合物２４１から化合物２４４を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２６０／２６２（Ｍ＋１）。

【１４４０】

工程５：３－ブロモ－２，４－ジイソプロピル－６－メトキシピリジン
２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＭＦ（５ｍＬ）中の３－ブロモ－６－フルオロ－２，４－ビス（プロパン－２－イル）ピリジン（１３０ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液に、CH_3ONa（１０８ｍｇ、２．０ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた混合物を２０ｍｌのH_2Oで洗浄した。得られた溶液を２×２５ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、石油エーテルを用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１００ｍｇ（７３．５％）の表題化合物が黄色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２７２／２７４［Ｍ＋１］。

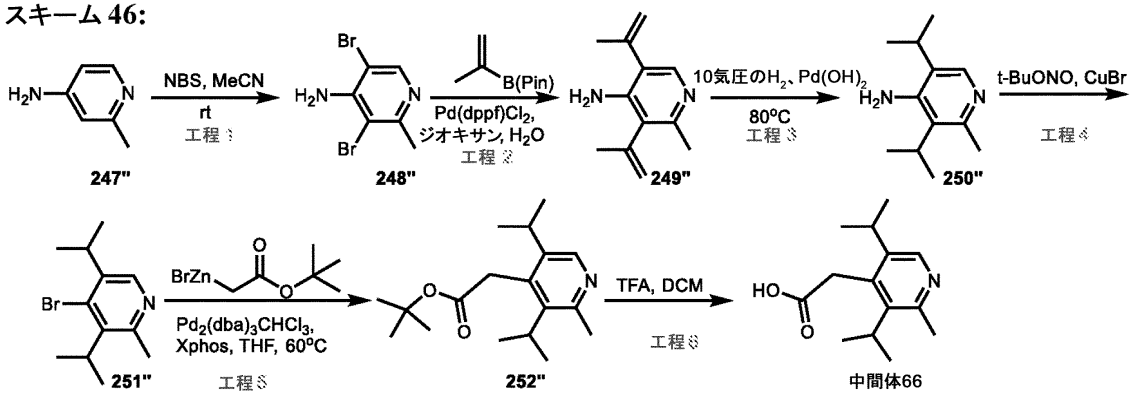
【１４４１】

工程６～７では、スキーム３７に示される化合物１９２’’を中間体５４に転化するための類似の手順を用いて、化合物２４５’’から中間体６５を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２５２（Ｍ＋１）。

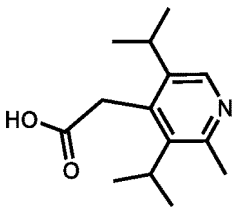
【１４４２】

【化３６０】

スキーム 46:



中間体66



２－（３，５－ジイソプロピル－２－メチルピリジン－４－イル）酢酸
工程１～２では、スキーム３１に示される化合物１６１’’を化合物１６３’’に転化するための類似の手順を用いて、化合物２４７’’から化合物２４９’’を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：１８９（Ｍ＋１）。

【１４４３】

工程３：３，５－ジイソプロピル－２－メチルピリジン－４－アミン
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１Ｌの圧力タンク反応器中に、ＭｅＯＨ（４００ｍＬ）中の２－メチル－３，５－ビス（プロパ－１－エン－２－イル）ピリジン－４－アミン（２２．０ｇ、１１７ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、$Pd(OH)_2$／Ｃ（１０重量％、２．０ｇ）を加えた。反応溶液を排気し、水素を３回充填した。得られた混合物を、水素雰囲気下で、８０℃で３日間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、１７．５ｇ（７７．７％）の表題化合物が褐色の油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：１９３［Ｍ＋１］。

【１４４４】

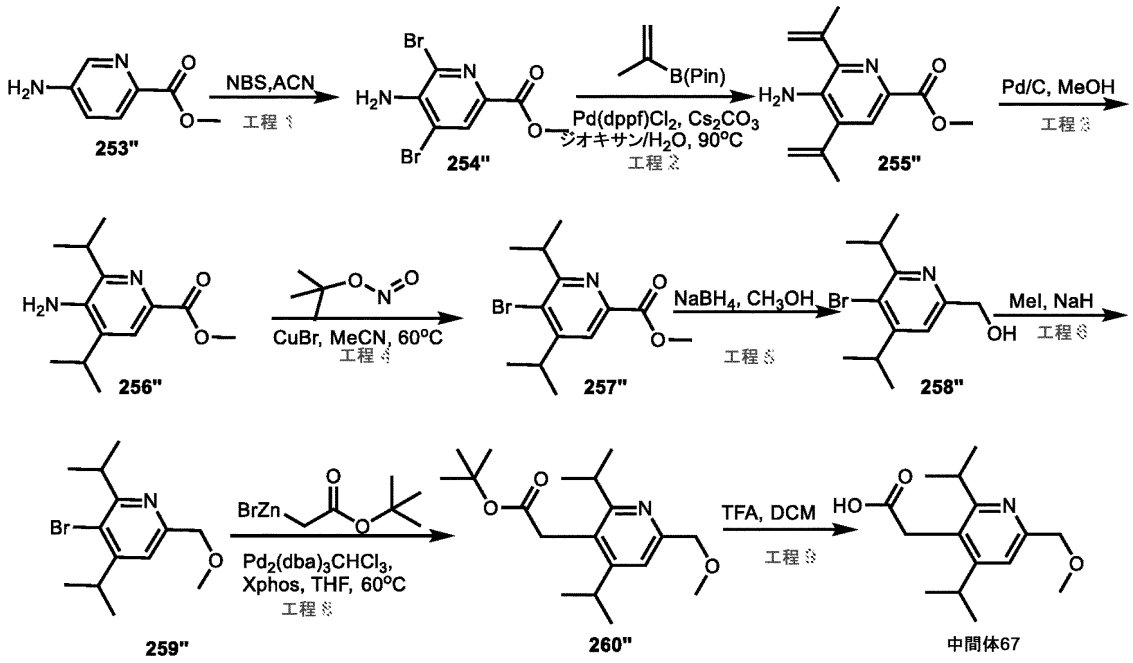
工程４～６では、スキーム３１に示される化合物１６４’’を中間体３６に転化するため

の類似の手順を用いて、化合物２５０’’から中間体６６を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２３５（Ｍ＋１）。

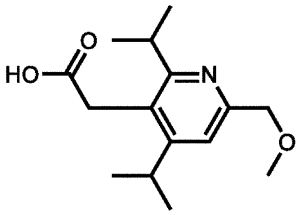
【１４４５】

【化３６１】

スキーム 47:



中間体67 67



２－（２，４－ジイソプロピル－６－（メトキシメチル）ピリジン－３－イル）酢酸

工程１～４では、スキーム３１に示される化合物１６１’’を化合物１６５’’に転化するための類似の手順を用いて、化合物２５３’’から化合物２５７’’を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：３００／３０２（Ｍ＋１）。

【１４４６】

工程５：（５－ブロモ－４，６－ジイソプロピルピリジン－２－イル）メタノール

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（１０ｍＬ）中のメチル５－ブロモ－４，６－ビス（プロパン－２－イル）ピリジン－２－カルボキシレート（１．４ｇ、４．６６ｍｍｏｌ）を入れた。この後、$NaBH_4$（５３２ｍｇ、１３．９ｍｍｏｌ）を、０℃で何回かに分けて加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×３０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、濃縮した。これにより、１．２ｇ（９４．５％）の表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：２７２／２７４［Ｍ＋１］。

【１４４７】

工程６：３－ブロモ－２，４－ジイソプロピル－６－（メトキシメチル）ピリジン

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の［５－ブロモ－４，６－ビス（プロパン－２－イル）ピリジン－２－イル］メタノール（８００ｍｇ、２．９４ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、３５３ｍｇ、８．８２ｍｍｏｌ）を、０℃で何回かに分けて加えた。得られ

た溶液を室温で２０分間撹拌した。これに、CH_3I（１．２５ｇ、８．８２ｍｍｏｌ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を、室温で一晩、撹拌しながら反応させた。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×３０ｍＬのジクロロメタンで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１０）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、８２０ｍｇ（９７．４％）の表題化合物が淡黄色の油として得られた。

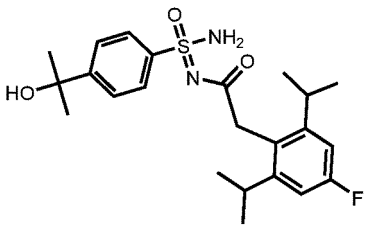
【１４４８】

工程８～９では、スキーム３１に示される化合物１６５’’を中間体３６に転化するための類似の手順を用いて、化合物２５９’’から中間体６７を得た。ＭＳ－ＥＳＩ：２８６／２８７（Ｍ＋１）。

【１４４９】

実施例１（１３１）

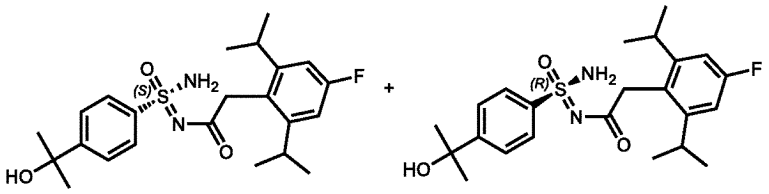
【化３６２】



２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）フェニルスルホンイミドイル）アセトアミド　（スキーム１）

実施例２（１３１ｂ）及び３（１３１ａ）

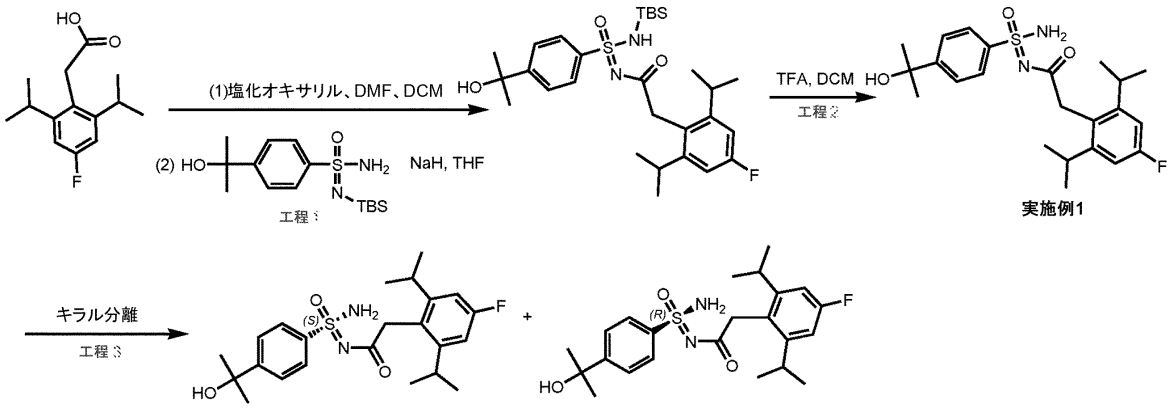
【化３６３】



実施例2及び3(立体化学は指定されていない)

（Ｓ）－及び（Ｒ）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）フェニルスルホンイミドイル）アセトアミド

【化３６４】



実施例2及び3(立体化学は指定されていない)

工程１：Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルアミノ－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）フェニルヒドロスルホンイミドイル）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸（７３ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（２ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３ｍＬ）中のＮ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゼンスルホンイミドアミド（１００ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％、４２ｍｇ、１．０４ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。溶液を室温で５分間撹拌した。次に、上記に、上に示されるように調製されたＴＨＦ（１ｍＬ）中の２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセチルクロリドの溶液を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、その後、それを、５ｍＬの水の添加によってクエンチし、２×５ｍＬの酢酸エチルで抽出した。組み合わされた有機層を無水Na_2SO_4上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、１５９ｍｇ（９６％）の表題化合物が黄色の粗製油として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５４７．３（Ｍ－１）。

【１４５０】

工程２：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）フェニルスルホンイミドイル）アセトアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（１０ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルアミノ－４－（２－ヒドロキシルプロパン－２－イル）フェニルヒドロスルホンイミドイル）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド（１５９ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。次に、ＴＦＡ（０．２ｍＬ）を加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、その後、減圧下で濃縮した。粗生成物を、２６～５０％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１３．０ｍｇ（１０％）の実施例１が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４３５．３（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．７５（ｄ，Ｊ＝８．７Ｈｚ、２Ｈ）、７．６１（ｄ，Ｊ＝８．７Ｈｚ、２Ｈ）、７．５７（ｓ，２Ｈ）、６．８２（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．２１（ｓ，１Ｈ）、３．６２－３．５４（ｍ，２Ｈ）３．０７－２．９８（ｍ，２Ｈ）、１．４１（ｓ，６Ｈ）、１．１３（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）、１．０８（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４５１】

工程３：キラル分離

前の工程に記載されるように得られた生成物（９０ｍｇ）を、以下の条件：カラム、ＣｈｉｒａｌＰａｋ ＩＤ、２＊２５ｃｍ、５ｕｍ；移動相、Ｈｅｘ及びＩＰＡ（１６分間にわたって４０％のＩＰＡを保持）；流量、２０ｍＬ／分；検出器、ＵＶ ２５４／２２０ｎｍを用いたキラル－分取ＨＰＬＣによって分割した。これにより、１６．０ｍｇ（最初のピーク、鏡像異性体１、９９％のｅｅ）の実施例２が白色の固体として、及び４４．８ｍｇ（第２のピーク、鏡像異性体２、９９％のｅｅ）の実施例３が淡黄色の固体として得られた。これらの２つの異性体の絶対立体化学は、指定されていない。

【１４５２】

実施例２：ＭＳ－ＥＳＩ：４３５．１（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．７５（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、２Ｈ）、７．６１（ｄ，Ｊ＝９．０Ｈｚ、４Ｈ）、６．８２（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．１８（ｓ，１Ｈ）、３．６２－３．５８（ｍ，２Ｈ）、３．０７－２．９８（ｍ，２Ｈ）、１．４１（ｓ，６Ｈ）、１．０８（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）、１．００（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４５３】

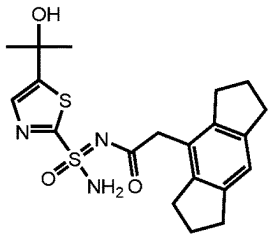
実施例３：ＭＳ－ＥＳＩ：４３５．１（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．７４（ｄ，Ｊ＝８．７Ｈｚ、２Ｈ）、７．５７（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ

、４Ｈ）、６．８１（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．２１（ｓ，１Ｈ）、３．５８－３．５７（ｍ，２Ｈ）、３．０９－３．０２（ｍ，２Ｈ）、１．４１（ｓ，６Ｈ）、１．０７（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ、６Ｈ）、１．０１（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４５４】

実施例４（１２９）

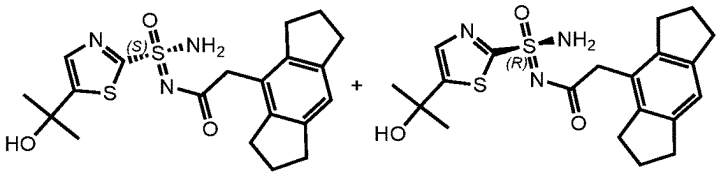
【化３６５】



２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イルスルホンイミドイル）アセトアミド（スキーム２）

実施例５（１２９ｂ）及び６（１２９ａ）

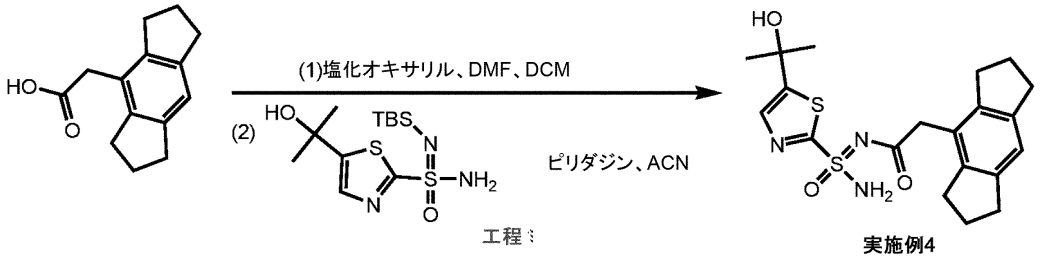
【化３６６】

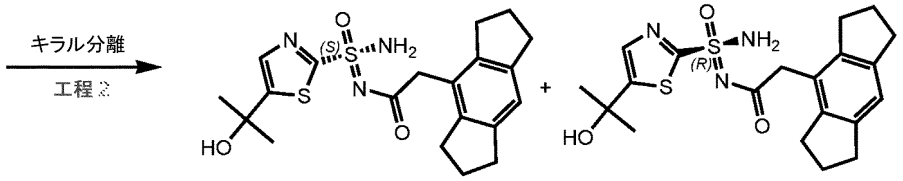


実施例5及び6(立体化学は指定されていない)

（Ｓ）－及び（Ｒ）－　２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イルスルホンイミドイル）アセトアミド

【化３６７】





実施例5及び6(立体化学は指定されていない)

工程１：２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イルスルホンイミドイル）アセトアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－イ

ンダセン－４－イル）酢酸（１００ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（２ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。上記の混合物を、ＡＣＮ（３ｍＬ）中で希釈した。この後、ＡＣＮ（１ｍＬ）中のピリダジン（３７ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）の溶液を加えた。溶液を室温で１分間撹拌し、次に、ＡＣＮ（２ｍＬ）中のＮ’－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド（１５４ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）の溶液を加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、その後、それを減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラム上に適用し、酢酸エチル／石油エーテル（１：２～１：１）で溶離した。粗生成物を、２６～５０％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１０ｍｇ（５％）の実施例４が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４２０．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－$ｄ_{6}$）δ ７．８４（ｂｒ ｓ，２Ｈ）、７．７２（ｓ，１Ｈ）、６．８９（ｓ，１Ｈ）、５．８５（ｓ，１Ｈ）、３．４８－３．３７（ｍ，２Ｈ）、２．８０－２．７０（ｍ，８Ｈ）、１．９９－１．９０（ｍ，４Ｈ）、１．５２－１．５１（ｍ，６Ｈ）．

【１４５５】

工程２：キラル分離

前の工程に記載されるように得られた生成物（４０ｍｇ）を、以下の条件：ＣｈｉｒａｌＰａｋ ＩＧ、２＊２５ｃｍ、５ｕｍ；移動相、Ｈｅｘ（０．１％のＴＦＡ）及びＥｔＯＨ（１３．５分間にわたって３０％のＥｔＯＨを保持）；流量、２０ｍＬ／分；検出器、ＵＶ ２５４／２２０ｎｍを用いたキラル－分取ＨＰＬＣによって分割した。これにより、１５．３ｍｇ（最初のピーク、鏡像異性体１、１００％のｅｅ）の実施例５が白色の固体として、及び１４．４ｍｇ（第２のピーク、鏡像異性体２、１００％のｅｅ）の実施例６が白色の固体として得られた。これらの２つの異性体の絶対立体化学は、指定されていない。

【１４５６】

実施例５：ＭＳ－ＥＳＩ：４２０．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－$ｄ_{6}$）δ ８．１２（ｓ，２Ｈ）、７．８０（ｓ，１Ｈ）、６．９０（ｓ，１Ｈ）、５．９３（ｓ，１Ｈ）、３．４８－３．４０（ｍ，２Ｈ）、２．８０－２．５０（ｍ，８Ｈ）、２．０８－１．８９（ｍ，４Ｈ）、１．５４－１．５２（ｍ，６Ｈ）．

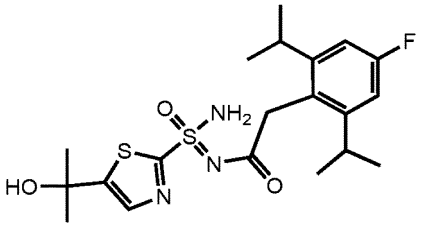
【１４５７】

実施例６：ＭＳ－ＥＳＩ：４２０．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－$ｄ_{6}$）δ ８．１２（ｓ，２Ｈ）、７．８０（ｓ，１Ｈ）、６．９１（ｓ，１Ｈ）、５．９３（ｓ，１Ｈ）、３．４８－３．４０（ｍ，２Ｈ）、２．８０－２．６９（ｍ，８Ｈ）、１．９９－１．９０（ｍ，４Ｈ）、１．５４－１．５２（ｍ，６Ｈ）．

【１４５８】

実施例７（１３２）

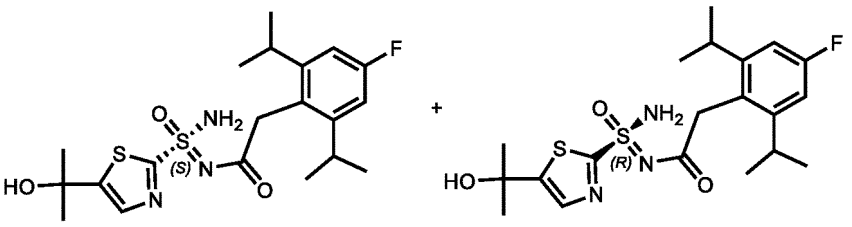
【化３６８】



２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドイル）アセトアミド （スキーム３）

実施例８（１３２ｂ）及び９（１３２ａ）

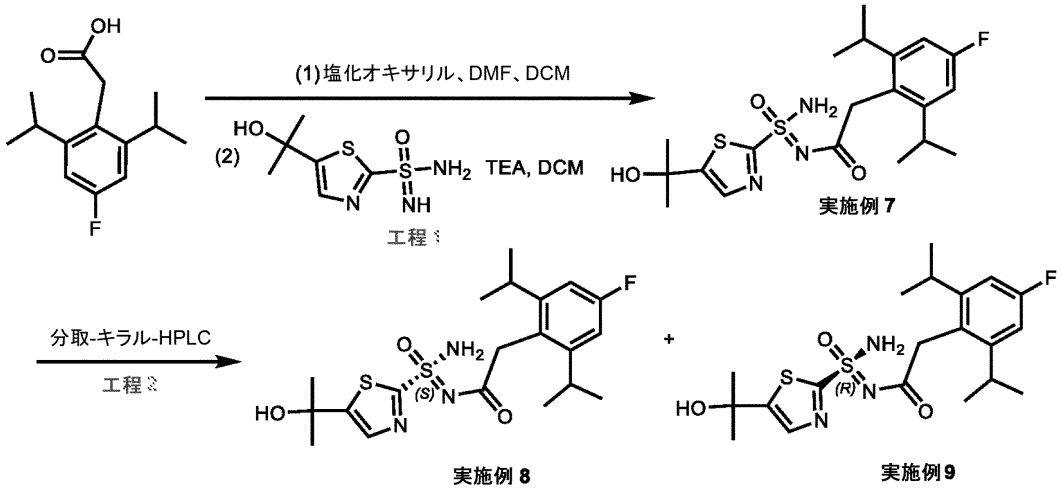
【化３６９】



実施例８　　実施例９

（Ｓ）－及び（Ｒ）－
２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドイル）アセトアミド

【化３７０】



実施例８　　実施例９

工程１：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドイル）アセトアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸（１０８ｍｇ、０．４５ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（３ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。ＤＣＭ（１ｍＬ）中で希釈された上記の混合物に、ＤＣＭ（３ｍＬ）中の５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド（６０ｍｇ、０．２７ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（１５０ｍｇ、１．４８ｍｍｏｌ）の溶液を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を、２２～４４％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、２．１ｍｇ（１％）の実施例７が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４４２．３（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ　ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、CD_3OD-d_4）δ　７．６７（ｓ，１Ｈ）、６．７５（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、３．７４（ｓ，２Ｈ）、３．１７－３．０３（ｍ，２Ｈ）、１．５８（ｓ，６Ｈ）、１．１２（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ、６Ｈ）、１．１０（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４５９】

工程２：キラル分離

前の工程において得られた生成物（１０ｍｇ）を、以下の条件：カラム、ＣｈｉｒａｌＰａｋ　ＩＤ、２＊２５ｃｍ、５ｕｍ；移動相、Ｈｅｘ（０．１％のＦＡ）及びＥｔＯＨ（１０分間にわたって２０％のＥｔＯＨを保持）；流量、２０ｍＬ／分；検出器、ＵＶ２５４／２２０ｎｍを用いたキラル－分取ＨＰＬＣによって分割した。これにより、３．６ｍｇ（最初のピーク、鏡像異性体１、９９％のｅｅ）の実施例８が黄色の固体として、

及び３．１ｍｇ（第２のピーク、鏡像異性体２、９９％のｅｅ）の実施例９が黄色の固体として得られた。単結晶Ｘ線結晶構造解析を、化合物１３２ｂについて行った。以下の表Ｎは、化合物１３２ｂの分率原子座標を示し、図１は、明瞭さのために水素原子を省略した、化合物１３２ｂの２つの結晶学的に独立した分子を含有する非対称単位の球棒モデルを示す。これらの結果に基づいて、化合物１３２ｂの絶対立体化学は、単結晶Ｘ線構造決定によって（Ｓ）と指定された。したがって、化合物１３２ａは、（Ｒ）異性体と指定された。

【１４６０】

実施例８：ＭＳ－ＥＳＩ：４４２．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ ８．２１（ｂｒ ｓ，２Ｈ）、７．７５（ｓ，１Ｈ）、６．８４（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．８８（ｓ，１Ｈ）、３．６５－３．６３（ｍ，２Ｈ）、３．１０－２．９７（ｍ，２Ｈ）、１．５１（ｓ，６Ｈ）、１．０９（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）、１．０４（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４６１】

実施例９：ＭＳ－ＥＳＩ：４４２．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．７３（ｓ，１Ｈ）、６．８３（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．８７（ｓ，１Ｈ）、３．６３－３．５９（ｍ，２Ｈ）、３．１０－３．０３（ｍ，２Ｈ）、１．５１（ｓ，６Ｈ）、１．０９（ｄ，Ｊ＝６．９Ｈｚ、６Ｈ）、１．０４（ｄ，Ｊ＝６．６Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４６２】

【表８２】

表 N.

実施例 8 についての分率原子座標($\times 10^4$)及び等価等方性変位パラメータ($Å^2\times 10^3$)。U_{eq} は、直交 U_{IJ} テンソルのトレースの 1/3 として定義される。

原子	*x*	*y*	*z*	U(eq)
S3	6096(2)	1631.9(12)	6214.0(7)	43.8(3)
S1	4186(3)	6312.8(13)	3775.3(8)	49.4(4)
S4	7832(3)	4132.7(15)	5650.5(8)	53.7(4)
S2	4909(3)	9172.1(15)	3606.7(9)	64.2(5)
O4	7737(8)	1198(4)	5669(2)	56.1(11)
O5	9907(8)	1617(5)	7085(2)	62.4(12)

【１４６３】

【表８３】

O1	2799(9)	5566(4)	4214(2)	64.9(13)
F2	14863(9)	1324(5)	9826(3)	88.3(14)
N4	6228(9)	1015(5)	6933(2)	47.7(11)
O2	102(9)	7078(6)	2977(2)	70.3(14)
F1	-4874(11)	7107(6)	161(3)	100.7(17)
N5	3489(10)	1470(6)	6026(3)	54.6(13)
O3	2378(9)	12418(4)	4594(2)	60.3(12)
N3	1905(9)	8406(5)	4478(2)	46.5(11)
N1	4115(10)	6318(5)	3000(3)	55.1(13)
N2	6903(11)	5865(6)	3894(3)	60.1(15)
N6	5327(10)	4040(5)	6756(3)	58.1(14)
O6	8678(13)	6628(6)	5147(3)	86.0(18)
C3	3284(10)	10337(6)	4107(3)	45.2(13)
C27	8106(11)	1236(5)	7308(3)	46.2(14)
C29	9664(12)	1054(6)	8500(3)	50.9(15)
C32	13181(13)	1229(7)	9385(3)	59.3(17)
C24	7970(11)	6826(6)	5836(3)	50.5(14)
C6	6192(12)	11937(7)	4004(4)	63.5(18)
C30	10056(13)	2297(6)	8708(3)	55.4(16)
C22	5791(13)	5307(6)	6651(3)	59.0(17)
C28	7637(12)	955(6)	8054(3)	51.2(15)
C23	7090(11)	5560(6)	6085(3)	46.0(14)
C1	3454(11)	7995(6)	4013(3)	46.6(13)
C2	1819(11)	9753(6)	4535(3)	48.0(13)
C34	11159(13)	-85(6)	8717(3)	55.8(16)
C9	415(13)	7159(7)	1501(3)	57.2(17)
C31	11805(14)	2368(7)	9156(4)	63.5(18)
C10	-915(15)	8349(7)	1276(4)	65.2(19)
C33	12915(14)	27(7)	9168(3)	60.3(17)
C4	3585(11)	11787(6)	4018(3)	46.4(14)
C7	2090(13)	6835(7)	2692(3)	55.1(16)
C8	2514(14)	7140(8)	1955(3)	64.7(19)

【１４６４】

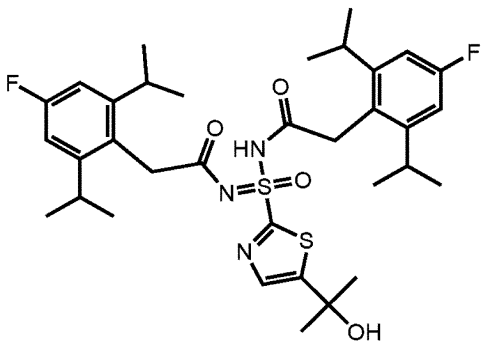
【表８４】

C13	-1943(16)	5980(8)	843(4)	71(2)
C12	-3143(15)	7121(8)	616(4)	70(2)
C14	-148(15)	5971(7)	1295(4)	67(2)
C38	8604(16)	3579(7)	8461(4)	73(2)
C5	2485(14)	12376(7)	3372(4)	64.0(18)
C35	10957(16)	-1446(7)	8477(4)	72(2)
C11	-2668(16)	8307(8)	821(4)	76(2)
C21	6299(10)	3342(6)	6257(3)	45.8(14)
C39	10220(20)	4381(9)	8022(5)	99(3)
C40	7385(19)	4354(9)	9037(6)	101(3)
C15	1040(20)	4634(9)	1552(6)	95(3)
C26	9960(20)	7080(12)	6237(6)	120(5)
C18	-480(20)	9672(9)	1490(5)	98(3)
C37	10310(40)	-2330(12)	9044(6)	153(6)
C25	5915(17)	7965(8)	5857(6)	92(3)
C17	-680(30)	3869(11)	1918(6)	132(5)
C16	2410(20)	3878(10)	979(8)	124(5)
C19	80(40)	10550(14)	950(8)	198(10)
C36	13120(30)	-2025(15)	8091(10)	199(10)
C20	-2400(50)	10316(15)	1931(10)	292(18)

【１４６５】

実施例１０（１３４）

【化３７１】



Ｎ，Ｎ’－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イルスルフィニル）ビス（２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド）　（スキーム４）

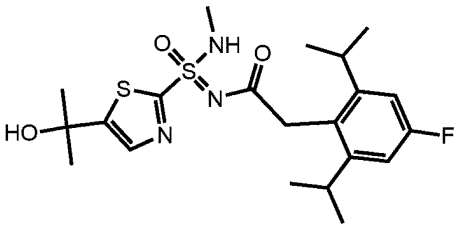
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸（２４２ｍｇ、１．０２ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（３ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。ＤＣＭ（２ｍＬ）中で希釈された上記の混合物に、ＤＣＭ（３ｍＬ）中の５－（２－ヒドロキシプロパン－２－

イル）チアゾール－２－スルホンイミドアミド（２２０ｍｇ、０．９９ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（４００ｍｇ、３．９５ｍｍｏｌ）の溶液を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を、６３～６５％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、５１．６ｍｇ（８％）の実施例１０が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：６６０．５（Ｍ－１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、CD_3OD-d_4）δ ７．５９（ｓ，１Ｈ）、５．７５（ｄ，Ｊ＝１０．２Ｈｚ、４Ｈ）、３．８２（ｓ，４Ｈ）、３．１６－３．０６（ｍ，４Ｈ）、１．５９（ｓ，６Ｈ）、１．３２－１．１３（ｍ，２４Ｈ）．

【１４６６】

実施例１１（１３７）

【化３７２】



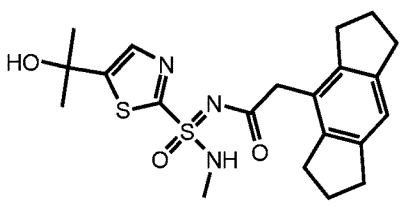
２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－Ｎ－メチルチアゾール－２－スルホンイミドイル）アセトアミド（スキーム５）

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）酢酸（２３３ｍｇ、０．９８ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（３ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。ＤＣＭ（２ｍＬ）中で希釈された上記の混合物に、ＤＣＭ（３ｍＬ）中の５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－Ｎ’－メチルチアゾール－２－スルホンイミドアミド（２３０ｍｇ、０．９８ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（４００ｍｇ、３．９５ｍｍｏｌ）の溶液を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を、２０～８０％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１７．７ｍｇ（４％）の実施例１１が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４５６．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、$DMSO-d_6$）ｍａｊｏｒ ｔａｕｔｏｍｅｒ δ ８．３４（ｓ，１Ｈ）、７．８５（ｓ，１Ｈ）、６．８６（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ、２Ｈ）、５．９４（ｓ，１Ｈ）、３．７１（ｄ，Ｊ＝３．６Ｈｚ、２Ｈ）、３．１４－３．０２（ｍ，２Ｈ）、２．５５（ｓ，３Ｈ）、１．５２（ｓ，６Ｈ）、１．１３（ｄ，Ｊ＝４．５Ｈｚ、６Ｈ）、１．０９（ｄ，Ｊ＝４．５Ｈｚ、６Ｈ）．

【１４６７】

実施例１２（１３６）

【化３７３】



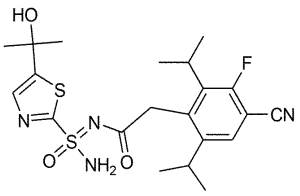
２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）－Ｎ－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－Ｎ－メチルチアゾール－２－スルホンイミド

イル）アセトアミド　（スキーム６）
　５０ｍＬの丸底フラスコ中に、２－（１，２，３，５，６，７－ヘキサヒドロ－ｓ－インダセン－４－イル）酢酸（１５６ｍｇ、０．７２ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（３ｍＬ）、及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）を入れた。この後、塩化オキサリル（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。溶液を室温で３０分間撹拌し、次に、減圧下で濃縮した。ＤＣＭ（２ｍＬ）中で希釈された上記の混合物に、ＤＣＭ（３ｍＬ）中の５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－Ｎ’－メチルチアゾール－２－スルホンイミドアミド（１７０ｍｇ、０．７２ｍｍｏｌ）及びＤＢＵ（３７０ｍｇ、２．４３ｍｍｏｌ）の溶液を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌し、次に、１０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×１０ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水Na_2SO_4上で乾燥させ、次に、減圧下で濃縮した。粗生成物を、５～１５％のＡＣＮの勾配で溶離される方法Ｅを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１１．３ｍｇ（４％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４３４．３（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ　ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、CD_3OD-d_4）ｍａｊｏｒ　ｔａｕｔｏｍｅｒ　δ　７．７５（ｓ，１Ｈ）、６．８９（ｓ，１Ｈ）、３．５６（ｓ，２Ｈ）、２．８３－２．７３（ｍ，８Ｈ）、２．６１（ｓ，３Ｈ）、２．０６－１．９５（ｍ，４Ｈ）、１．５９（ｓ，６Ｈ）．

【１４６８】

【表８５】

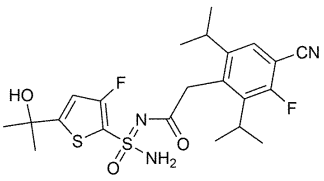
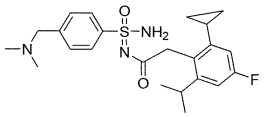
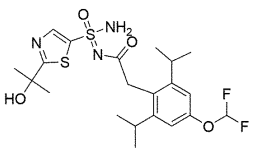
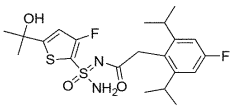
表 8. 適切な出発材料から、実施例 1 及びスキーム 1 に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	LC-MS $[M+H]^+$
13	133		2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	467.2

【１４６９】

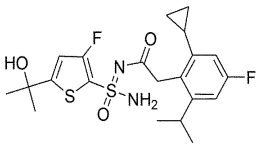
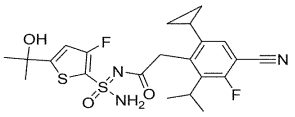
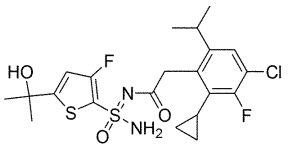
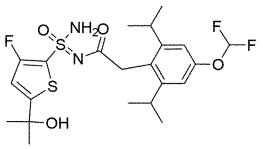
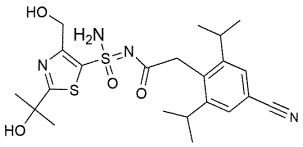
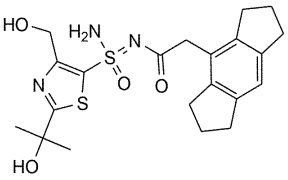
【表８６】

表 9. 適切な出発材料から、**実施例 4** 及び**スキーム 2** に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	LC-MS $[M+H]^+$
14	141		2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	484.2
15	139		2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	432.2
16	138		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	490.3
17	140		2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	459.2

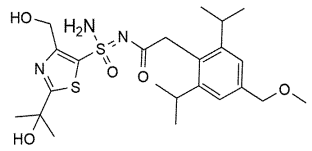
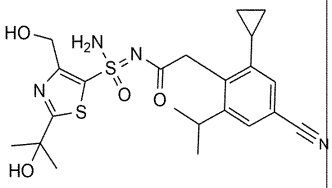
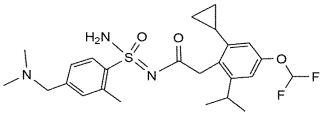
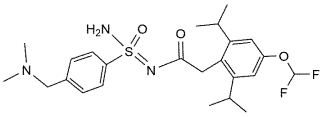
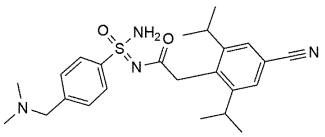
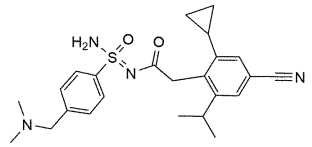
【１４７０】

【表８７】

18	142		2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	457.2
19	143		2-(4-シアノ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	482.2
20	197		2-(4-クロロ-2-シクロプロピル-3-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	491.2
21	101		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	507.2
22	152		2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	479.2
23	150		2-(1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ s-インダセン-4-イル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	450.2

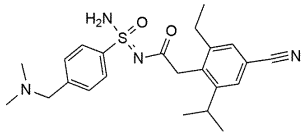
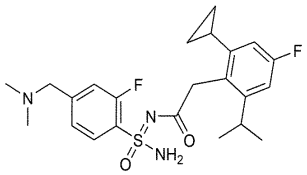
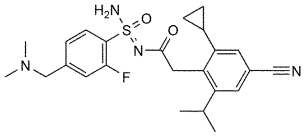
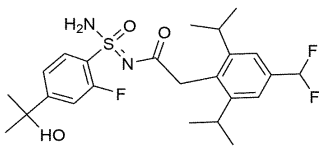
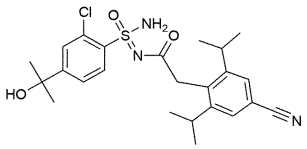
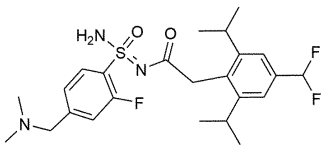
【１４７１】

【表８８】

24	148		2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	498.2
25	147		2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	477.2
26	113		2-(2-シクロプロピル-4-(ジフルオロメトキシ)-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-メチルフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	494.2
27	151		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	482.2
28	114		2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	441.2
29	112		2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	439.2

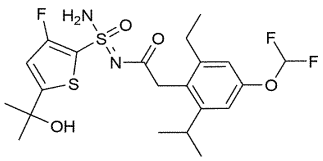
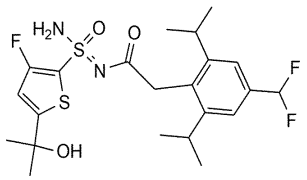
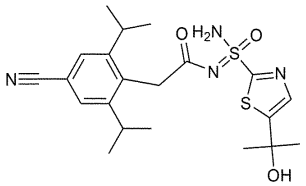
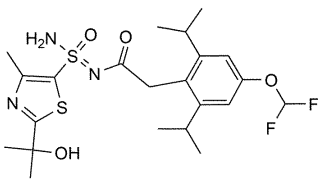
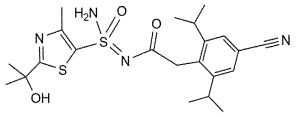
【１４７２】

【表８９】

30	116		2-(4-シアノ-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	427.2
31	105		2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	450.2
32	117		2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	457.2
33	109		2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-フルオロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	485.2
34	146		N-(2-クロロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニルスルホンイミドイル)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	476.2
35	110		2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	484.2

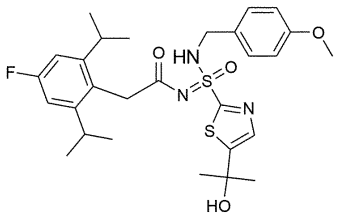
【１４７３】

【表９０】

36	126		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-スルホンイミドイル)アセトアミド	493.1
37	104		2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-スルホンイミドイル)アセトアミド	491.2
38	130		2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-スルホンイミドイル)アセトアミド	449.2
39	107		2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	504.2
40	106		2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	463.2

【１４７４】
【表９１】

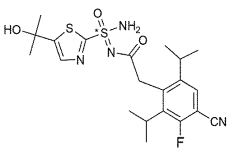
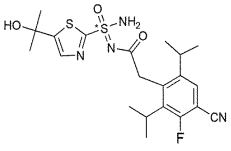
表 10. 適切な出発材料から、**実施例 11** 及び**スキーム 5** に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	LC-MS $[M+H]^+$
41	**135**		2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-N-(4-メトキシベンジル)チアゾール-2-スルホンイミドイル)アセトアミド	562.5

【１４７５】

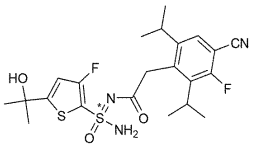
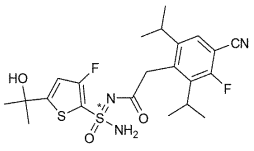
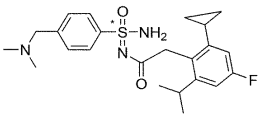
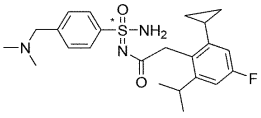
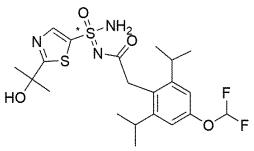
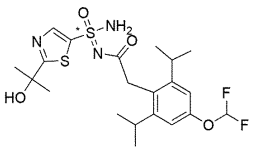
【表９２】

表 11. 以下の表中の実施例を、上述されるラセミ実施例のキラル HPLC 分割から得た。キラルカラム及び溶離剤は、表中に列挙される。慣例として、より速く溶出する鏡像異性体が、常に、表中で最初に列挙された後、対のうちのより遅く溶出する鏡像異性体が続く。キラル中心における記号*は、このキラル中心が分割されており、その中心における絶対立体化学が決定されていないことを示す。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	カラム	溶離剤	LC-MS $[M+H]^+$
42	**133b 又は 133a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	CO_2 中 50%の IPA	467.2
43	**133a 又は 133b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	CO_2 中 50%の IPA	467.2

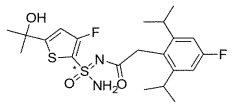
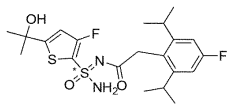
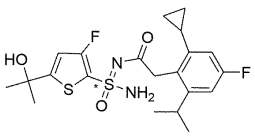
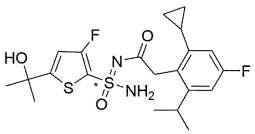
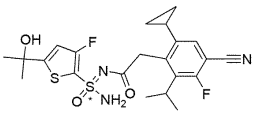
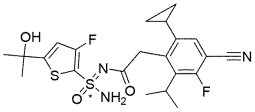
【１４７６】

【表９３】

44	**141b 又は 141a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(1% の TFA)中 30%の EtOH	484.2
45	**141a 又は 141b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(1% の TFA)中 30%の EtOH	484.2
46	**139b 又は 139a**		(S)-又は(R)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex 中 15%の EtOH	432.1
47	**139a 又は 139b**		(R)-又は(S)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex 中 15%の EtOH	432.1
48	**138b 又は 138a**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex (1%の TFA)中 8%の IPA	490.1
49	**138a 又は 138b**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex (1%の TFA)中 8%の IPA	490.1

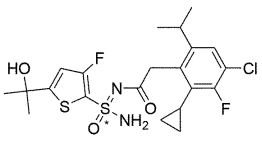
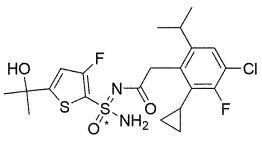
【１４７７】

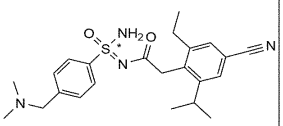
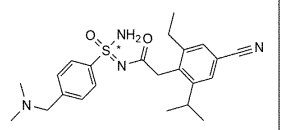
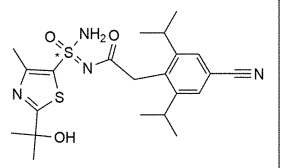
【表９４】

50	**140b 又は 140a**		(S)-又は(R)-2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の DEA)中 30%の IPA	459.2
51	**140a 又は 140b**		(R)-又は(S)-2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の DEA)中 30%の IPA	459.2
52	**144b 又は 144a**		(S)-又は(R)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex 中 30%の IPA	457.2
53	**144a 又は 144b**		(R)-又は(S)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex 中 30%の IPA	457.2
54	**145b 又は 145a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 30%の IPA	482.2
55	**145a 又は 145b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 30%の IPA	482.2

【１４７８】

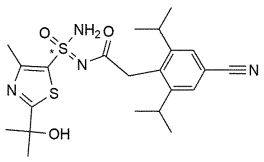
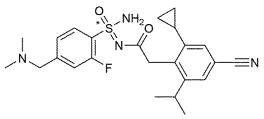
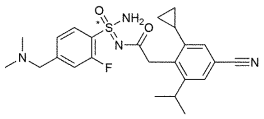
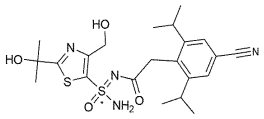
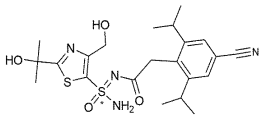
【表９５】

56	**197b 又は 197a**		(S)-又は(R)-2-(4-クロロ-2-シクロプロピル-3-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex (0.1%のDEA)中30%のIPA	491.2
57	**197a 又は 197b**		(R)-又は(S)-2-(4-クロロ-2-シクロプロピル-3-フルオロ-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中30%のIPA	491.2

58	**116**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ADH、2*25cm、5um	Hex(0.1%DEA)中30%のEtOH	427.2
59	**116a 又は 116b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ADH、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中30%のEtOH	427.2
60	**106**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex (0.1%のDEA)中30%のIPA	463.2

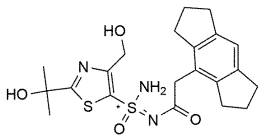
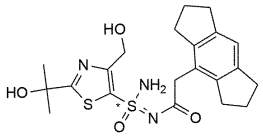
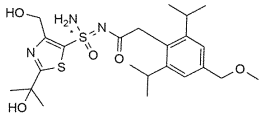
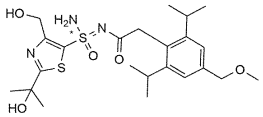
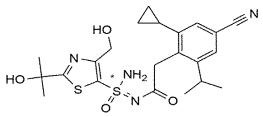
【１４７９】

【表９６】

61	**106a 又は 106b**		(R)-又は(S)- 2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-スルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex(0.1%の DEA)中 30%の IPA	463.2
62	**117a 又は 117b**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralCEL OD、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 30%の EtOH	457.2
63	**117b 又は 117a**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralCEL OD、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 30%の EtOH	457.2
64	**152b 又は 152a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 80%の EtOH	480.2
65	**152a 又は 152b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 80%の EtOH	480.2

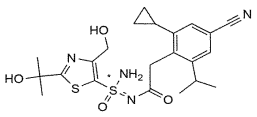
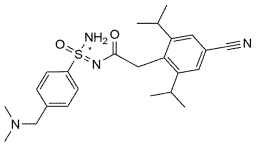
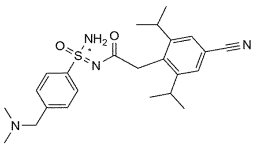
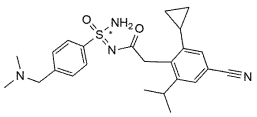
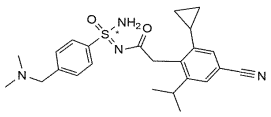
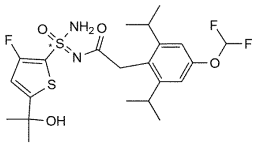
【１４８０】

【表９７】

66	**150b 又は 150a**		(S)-又は(R)-2-(1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ s-インダセン-4-イル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 88%の IPA	450.2
67	**150a 又は 150b**		(R)-又は(S)-2-(1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ s-インダセン-4-イル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 88%の IPA	450.2
68	**148b 又は 148a**		(S)-又は(R)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 75%の IPA	498.2
69	**148a 又は 148b**		(R)-又は(S)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%の FA)中 75%の IPA	498.2
70	**147b 又は 147a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex 中 15%の EtOH	477.2

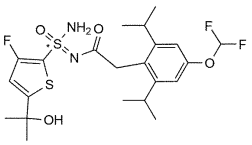
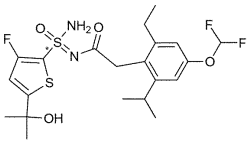
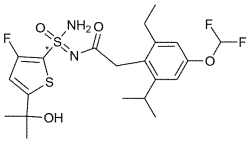
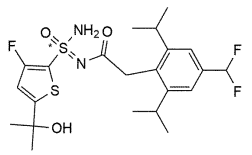
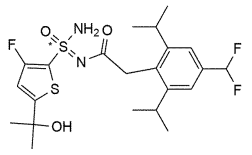
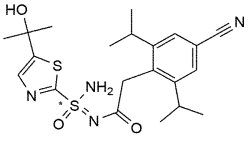
【１４８１】

【表９８】

71	**147a 又は 147b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex 中 15%の EtOH	477.2
72	**114b 又は 114a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex (0.1%の DEA)中 50%の IPA	441.2
73	**114a 又は 114b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1% の DEA) 中 50%の IPA	441.2
74	**112b 又は 112a**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex(0.1% の DEA) 中 25%の IPA	439.2
75	**112a 又は 112b**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2-シクロプロピル-6-イソプロピルフェニル)-N-(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex(0.1% の DEA) 中 25%の EtOH	439.2
76	**101b 又は 101a**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1% の DEA) 中 30%の IPA	507.2

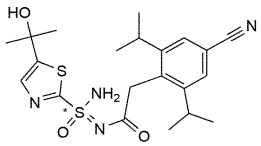
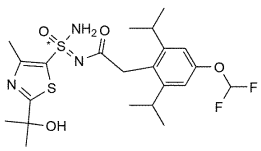
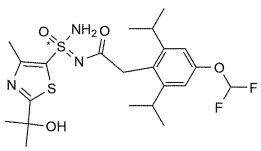
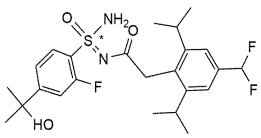
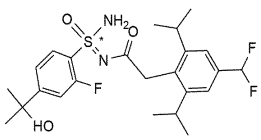
【１４８２】

【表９９】

77	**101a 又は 101b**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中30%のIPA	507.2
78	**126b 又は 126a**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中25%のIPA	493.2
79	**126a 又は 126b**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2-エチル-6-イソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak ID、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中25%のIPA	493.2
80	**104b 又は 104a**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中15%のIPA	491.2
81	**104a 又は 104b**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中15%のIPA	491.2
82	**130b 又は 130a**		(R)-又は(S)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中15%のIPA	449.2

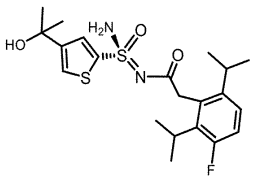
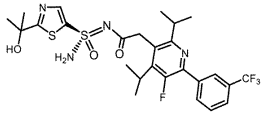
【１４８３】

【表１００】

83	**130a 又は 130b**		(S)-又は(R)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IG、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中15%のIPA	449.2
84	**107b 又は 107a**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中10%のIPA	504.2
85	**107a 又は 107b**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメトキシ)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-4-メチルチアゾール-5-イルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IC、2*25cm、5um	Hex(0.1%のFA)中10%のIPA	504.2
86	**109a 又は 109b**		(S)-又は(R)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-フルオロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IF、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中15%のEtOH	485.2
87	**109b 又は 109a**		(R)-又は(S)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)-N-(2-フルオロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニルスルホンイミドイル)アセトアミド	ChiralPak IF、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中15%のEtOH	485.2

【１４８４】

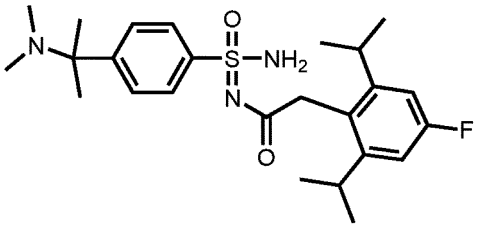
【表１０１】

88	**201b**		(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	ChiralPak IF、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中15%のEtOH	440.59
89	**301**		(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピル-6-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)アセトアミド	ChiralPak IF、2*25cm、5um	Hex(0.1%のDEA)中15%のEtOH	586.66

【１４８５】

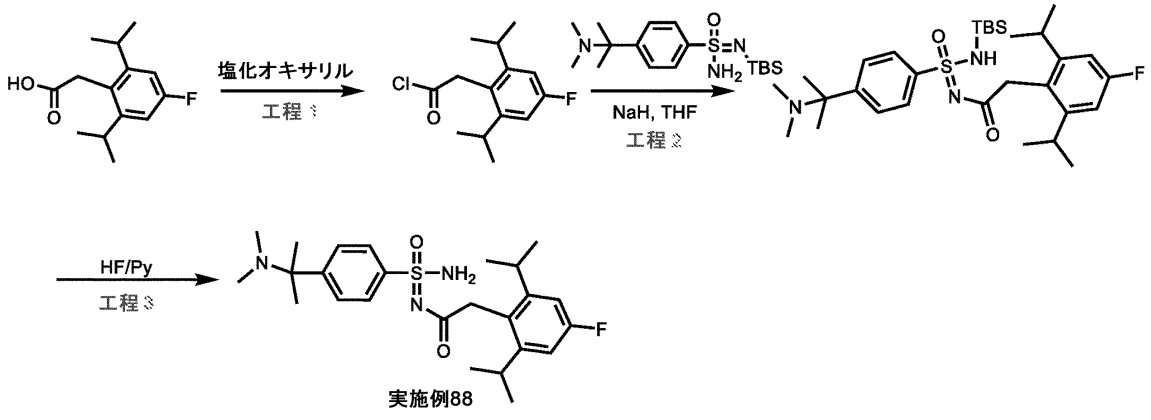
実施例８８（化合物２４１）

【化３７４】



Ｎ－（アミノ（４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）フェニル）（オキソ）－λ⁶－スルファニリデン（ｓｕｌｆａｎｅｙｌｉｄｅｎｅ））－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド（スキーム１Ａ）

【化３７５】



工程１：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセチルクロリド

２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２ｍＬ）中の２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］酢酸（２０ｍｇ、０．０８ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＤＭＦ（０．００５ｍＬ）を撹拌しながら加えた。これに、シュウ酸二塩化物（０．５ｍＬ）を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。これにより、２１ｍｇ（９７．４％）の表題化合

物が黄色の固体として得られた。この粗生成物を次の工程に使用した。

【１４８６】

工程２：Ｎ－（（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）アミノ）（４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）フェニル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド

２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（３ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－４－［２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル］ベンゼン－１－スルホンイミドアミド（２０ｍｇ、０．０６ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。これに、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、１２ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。混合物に、ＤＣＭ（１ｍＬ）中の２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセチルクロリド（１４．４ｍｇ、０．０６ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×２５ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２０ｍｇ（６１．７％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５７６（Ｍ＋１）。

【１４８７】

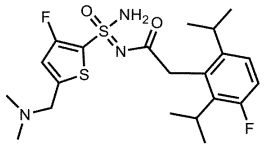
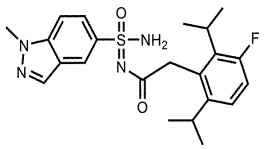
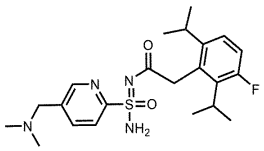
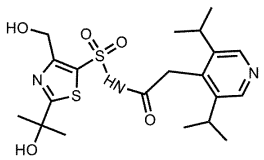
工程３：Ｎ－（アミノ（４－（２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル）フェニル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド

２５ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２ｍＬ）中のＮ－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）アミノ］（［４－［２－（ジメチルアミノ）プロパン－２－イル］フェニル］）オキソ－λ^{6}－スルファニリデン］－２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセトアミド（２０ｍｇ、０．０３ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この後、ＨＦ－ピリジン（７０重量％、１ｍＬ）を撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。得られた混合物を２０ｍＬの$Ｈ_{2}Ｏ$で洗浄した。得られた溶液を２×２５ｍＬの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。得られた混合物を濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム、ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｓｈｉｅｌｄ　ＲＰ１８　ＯＢＤ、１９＊２５０ｍｍ、１０ｕｍ；移動相、水（１０ｍＭの$ＮＨ_{4}ＨＣＯ_{3}$）及びＡＣＮ（１０分で３０％～５０％のＡＣＮの勾配）；検出器、ＵＶ２２０／２５４ｎｍを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、５．２ｍｇ（３２．４％）の実施例８８が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４６２．３（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、$ＣＤ_{3}ＯＤ－ｄ_{4}$）δ　７．８７（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、２Ｈ）、７．６９（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、２Ｈ）、６．７６（ｄ，Ｊ＝１０．４Ｈｚ、２Ｈ）、３．７４（ｓ，２Ｈ）、３．１２－３．０８（ｍ，２Ｈ）、２．１６（ｓ，６Ｈ）、１．３９（ｓ，６Ｈ）、１．１１（ｄｄ，Ｊ＝１５．２、６．８Ｈｚ、１２Ｈ）．

【１４８８】

【表１０２】

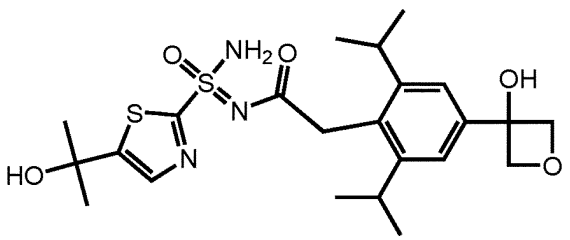
表 18. 適切な出発材料から、実施例 88 及びスキーム 1A に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	精密質量 $[M+H]^+$
89	219		N-(アミノ(5-((ジメチルアミノ)メチル)-3-フルオロチオフェン-2-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	458
90	218		N-(アミノ(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	431
91	217		N-(アミノ(5-((ジメチルアミノ)メチル)ピリジン-2-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	435
92	214		2-(3,5-ジイソプロピルピリジン-4-イル)-N-((4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)スルホニル)アセトアミド	456

【１４８９】

実施例９３（化合物２３５）

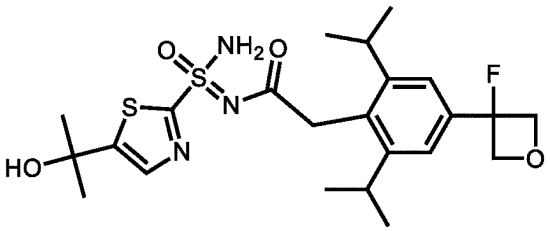
【化３７６】



Ｎ－（アミノ（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル）（オキソ）－λ６－スルファニリデン）－２－（４－（３－ヒドロキシオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド　（スキーム１Ｂ）

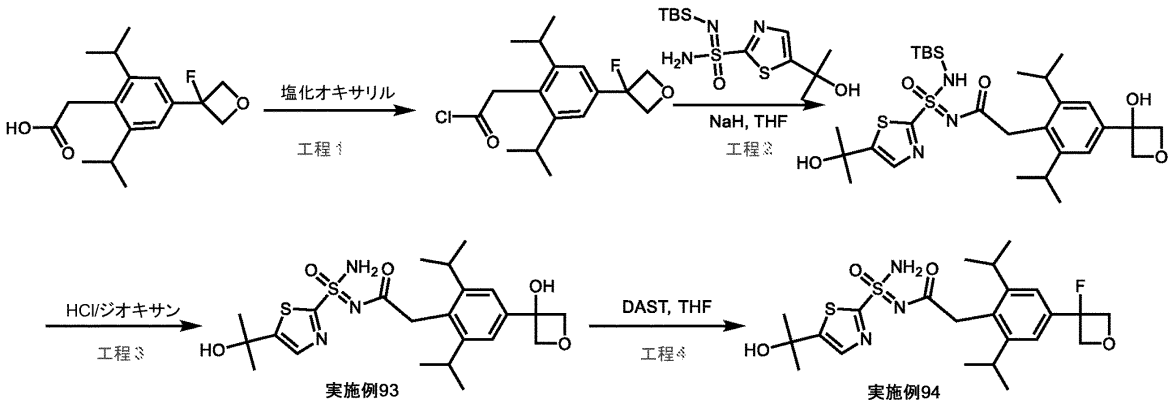
実施例９４（化合物２３０）

【化３７７】



Ｎ－（アミノ（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド　（スキーム１Ｂ）

【化３７８】



工程１：２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセチルクロリド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（３ｍＬ）及びＤＭＦ（０．０５ｍＬ）中の２－［４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］酢酸（１５０ｍｇ、０．５１ｍｍｏｌ）を入れた。この後、シュウ酸二塩化物（０．５ｍＬ）を、室温で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。これにより、１５９ｍｇ（９９．７％）の表題化合物が淡黄色の固体として得られた。

【１４９０】

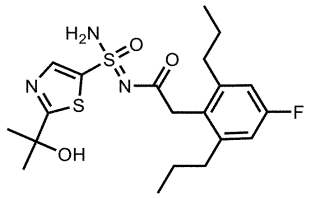
工程２：Ｎ－（（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）アミノ）（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－（３－ヒドロキシオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のＮ－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）－５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－２－スルホノイミドアミド（１７３ｍｇ、０．５２ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、６２．４ｍｇ、１．５６ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。得られた溶液を室温で１０分間撹拌した。次に、上記に、ＴＨＦ（２ｍＬ）中の２－［４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセチルクロリド（１５９ｍｇ、０．５１ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で２時間撹拌した。次に、反応物を、５ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×５ｍＬの酢酸エチルで抽出した。有機層を組み合わせて、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。これにより、２００ｍｇ（６４．５％）の表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：６１０（Ｍ＋１）。

【１４９１】
工程３：Ｎ－（アミノ（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－（３－ヒドロキシオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２ｍＬ）中のＮ－［［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）アミノ］［５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－２－イル］オキソ－λ^{6}－スルファニリデン］－２－［４－（３－ヒドロキシオキセタン－３－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセトアミド（２００ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）を入れ、撹拌溶液に、ＨＣｌ／ジオキサン（４Ｍ、５ｍＬ）を加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム、ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　Ｃ１８　ＯＢＤ、５ｕｍ、１９＊１５０ｍｍ；移動相、水（１０ｍＭのNH_4HCO_3）及びＡＣＮ（８分間にわたって５％～４０％のＡＣＮの勾配）；検出器、ＵＶ　２５４／２１０ｎｍを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１４．０ｍｇ（８．６１％）の実施例９３が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４９６．３（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ－ＮＭＲ：（ＤＭＳＯ－d_6、４００ＭＨｚ）：δ　７．４０（ｓ，１Ｈ）、７．２３（ｓ，２Ｈ）、６．１４（ｓ，１Ｈ）、５．５４（ｓ，１Ｈ）、４．７３－４．６６（ｍ，４Ｈ）、３．９２（ｓ，１Ｈ）、３．４９－３．４６（ｍ，２Ｈ）、３．３１－３．２２（ｍ，２Ｈ）、１．４７（ｓ，６Ｈ）、１．１２（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、６Ｈ）、１．１０（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、６Ｈ）．
【１４９２】
工程４：Ｎ－（アミノ（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－（３－フルオロオキセタン－３－イル）－２，６－ジイソプロピルフェニル）アセトアミド
窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された５０ｍＬの３つ口丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のＮ－［アミノ［５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－２－イル］オキソ－λ^{6}－スルファニリデン］－２－［４－（３－ヒドロキシオキセタン－３－イル）－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］アセトアミド（８３ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）を入れた。この後、ＤＣＭ（１ｍＬ）中のＤＡＳＴ（５４．０ｍｇ、０．３３ｍｍｏｌ）の溶液を、０℃で撹拌しながら滴下して加えた。得られた溶液を室温で一晩撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム、ＸＢｒｉｄｇｅ　ＢＥＨ１３０　Ｐｒｅｐ　Ｃ１８　ＯＢＤ、１９×１５０ｍｍ、５ｕｍ　１３ｎｍ；移動相、水（１０ｍＭのNH_4HCO_3）及びＡＣＮ（７分で３０％～６０％のＡＣＮの勾配）；検出器、ＵＶ　２５４／２１０ｎｍを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、１５．１ｍｇ（１７．９％）の実施例９４が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４９８．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ　ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－d_6、４００ＭＨｚ）：δ　７．９６（ｓ，２Ｈ）、７．７６（ｓ，１Ｈ）、７．１８（ｓ，２Ｈ）、５．８７（ｓ，１Ｈ）、４．９８－４．８７（ｍ，４Ｈ）、３．７７－３．６５（ｍ，２Ｈ）、３．１３－３．０５（ｍ，２Ｈ）、１．５１（ｓ，６Ｈ）、１．１３（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、６Ｈ）、１．１１（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ、６Ｈ）．
【１４９３】

【表１０３】

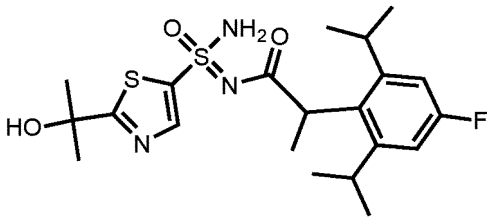
表 19. 適切な出発材料から、実施例 94 及びスキーム 1B に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	精密質量 $[M+H]^+$
95	245		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(4-フルオロ-2,6-ジプロピルフェニル)アセトアミド	442

【１４９４】

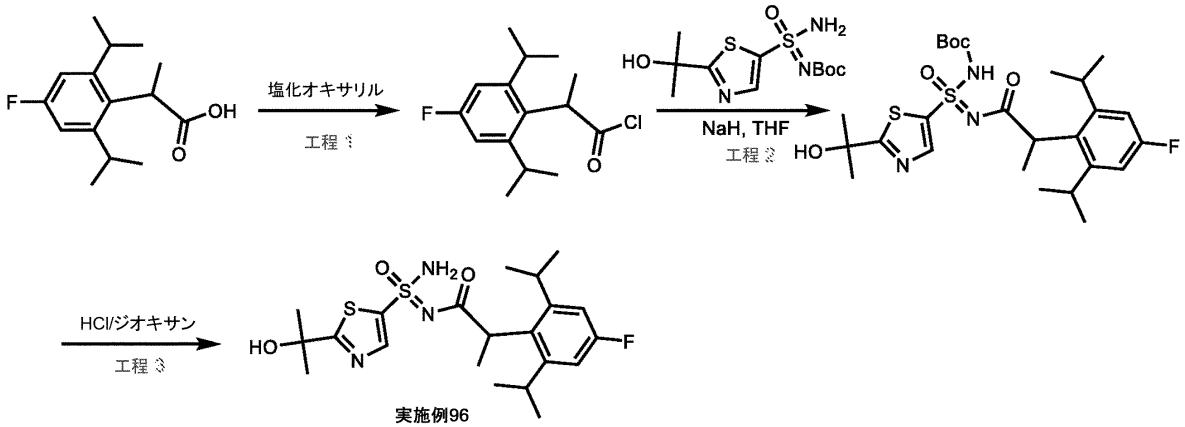
実施例９６（化合物２４４）

【化３７９】



Ｎ－（アミノ（２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イル）（オキソ）－λ６－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパンアミド　（スキーム１Ｃ）

【化３８０】



工程１：２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパノイルクロリド

５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２０ｍＬ）中の２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］プロパン酸（２００ｍｇ、０．７９ｍｍｏｌ）を入れ、この後、シュウ酸二塩化物（２ｍＬ）を加えた。得られた溶液を室温で１５分間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。これにより、２００ｍｇ（９３．１％）の表題化合物がオフホワイトの油として得られた。

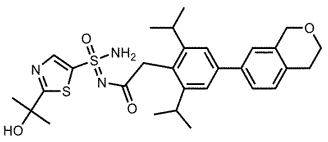
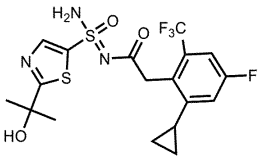
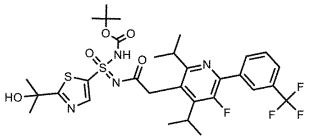
【１４９５】

工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル（Ｎ－（２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパノイル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スル

ホンイミドイル）カルバメート
　５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチルＮ－［アミノ［２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－イル］メチリデン－λ^{6}－スルファニリデン］カルバメート（２３５．９ｍｇ、０．７４ｍｍｏｌ）を入れた。混合物に、２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］プロパノイルクロリド（２００ｍｇ、０．７４ｍｍｏｌ）及びＮａＨ（６０重量％の油分散体、５９．２ｍｇ、１．４８ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。次に、反応物を、２０ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を、３×２０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２００ｍｇ（４８．９％）の表題化合物がオフホワイトの固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５５６（Ｍ＋１）。
【１４９６】
工程３：Ｎ－（アミノ（２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イル）（オキソ）－λ^{6}－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２，６－ジイソプロピルフェニル）プロパンアミド
　５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチルＮ－［（［２－［４－フルオロ－２，６－ビス（プロパン－２－イル）フェニル］プロパノイル］イミノ）［２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－イル］メチリデン－λ^{6}－スルファニル］カルバメート（１００ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を入れた。撹拌溶液に、ＨＣｌ／ジオキサン（１０ｍＬ、４Ｍ）を滴下して加えた。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ Ｓｈｉｅｌｄ ＲＰ１８ ＯＢＤ Ｃｏｌｕｍｎ １９＊２５０ｍｍ、１０ｕｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭのＮＨ$_{4}$ＨＣＯ$_{3}$）、移動相Ｂ：ＡＣＮ；流量：２５ｍＬ／分；勾配：９分で２７％のＢ～４５％のＢ；２５４／２１０ｎｍ；Ｒｔ：７．７７分を用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、２０ｍｇ（２４．４％）の実施例９６が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４５６．２（Ｍ＋１）．^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$、ｐｐｍ）δ：８．００－７．９２（ｍ，３Ｈ）、７．０５－６．９１（ｍ，２Ｈ）、６．２５（ｓ，１Ｈ）、３．８７－３．８１（ｍ，１Ｈ）、３．１６－２．９８（ｍ，２Ｈ）、１．４９（ｓ，６Ｈ）、１．２７－１．２４（ｍ，３Ｈ）、１．１９－１．１３（ｍ，１２Ｈ）．
【１４９７】

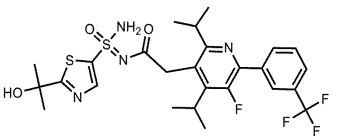
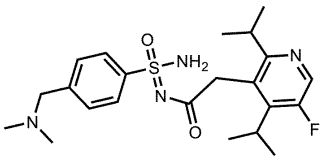
【表１０４】

表 20. 適切な出発材料から、実施例 96 及びスキーム 1C に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	精密質量 $[M+H]^+$
97	221		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(4-(イソクロマン-7-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	556
98	220		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル)アセトアミド	466
99	304		tert-ブチル(N-(2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピル-6-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)アセチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-スルホンイミドイル)カルバメート	687

【１４９８】

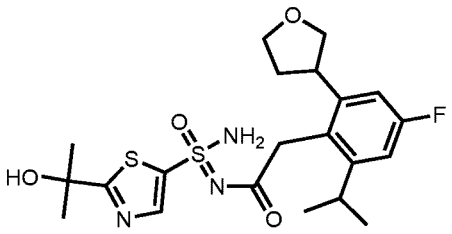
【表１０５】

100	301		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピル-6-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)アセトアミド	587
101	212		N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニル)(オキソ)-λ^6-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	435

【１４９９】

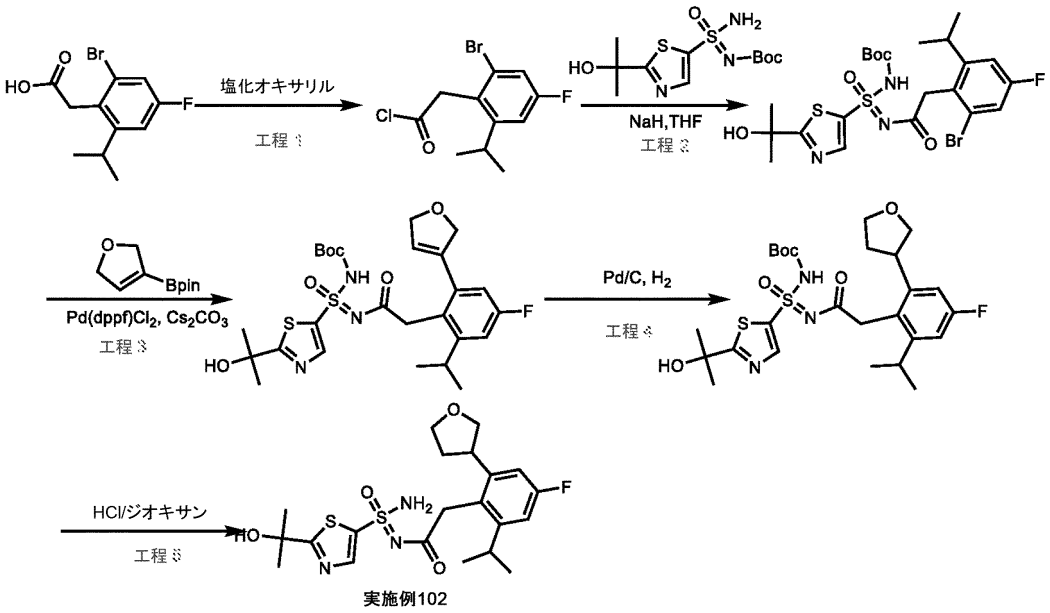
実施例１０２（化合物２４０）

【化３８１】



Ｎ－（アミノ（２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イル）（オキソ）－λ^6－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２－イソプロピル－６－（テドラヒドロフラン－３－イル）フェニル）アセトアミド（スキーム１Ｃ）

【化３８２】



実施例102

工程１：２－（２－ブロモ－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）アセチルクロリド

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＤＣＭ（２５ｍＬ）及びＤＭＦ（０．０１ｍＬ）中の２－［２－ブロモ－４－フルオロ－６－（プロパン－２－イル）フェニル］酢酸（１００ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、シュウ酸二塩化物（０．５ｍＬ）を滴下して加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。これにより、１００ｍｇ（９３．７％）の表題化合物が黄色の油として得られた。

【１５００】

工程２：Ｔｅｒｔ－ブチル（Ｎ－（２－（２－ブロモ－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）アセチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドイル）カルバメート

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ＴＨＦ（２５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチルＮ－［アミノ［２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－イル］オキソ－λ^{6}－スルファニリデン］カルバメート（１１６．７ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）を入れた。混合物に、ＮａＨ（６０重量％の油分散体、２９．２ｍｇ、０．７３ｍｍｏｌ）を撹拌しながら少しずつ加えた。得られた溶液を室温で３０分間撹拌した。２－［２－ブロモ－４－フルオロ－６－（プロパン－２－イル）フェニル］アセチルクロリド（１００ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）を、溶液に加えた。得られた溶液を室温でさらに１時間撹拌した。次に、反応物を、５ｍＬの水の添加によってクエンチした。得られた溶液を２×１０ｍｌの酢酸エチルで抽出し、濃縮した。これにより、２１９ｍｇ（粗製）表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５７８（Ｍ＋１）。

【１５０１】

工程３：Ｔｅｒｔ－ブチル（Ｎ－（２－（２－（２，５－ジヒドロフラン－３－イル）－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）アセチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドイル）カルバメート

窒素の不活性雰囲気でパージ及び維持された１００ｍＬの丸底フラスコ中に、ジオキサン（６０ｍＬ）及びH_2O（１２ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチル（Ｎ－（２－（２－ブロモ－４－フルオロ－６－イソプロピルフェニル）アセチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドイル）カルバメート（３９５ｍｇ、０．６８ｍｍｏｌ）を入れた。この後、Cs_2CO_3（６６７．４ｍｇ、２．０５ｍｍｏｌ）、２－（２，５－ジヒドロフラン－３－イル）－４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン（２０１ｍｇ、１．０２ｍｍｏｌ）及びＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（５０ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を加えた。得られた溶液を、油浴中で、９５℃で１６時

間撹拌した。得られた溶液をH_2O（５０ｍＬ）で希釈し、２×１５ｍｌの酢酸エチルで抽出し、濃縮した。残渣を、酢酸エチル／石油エーテル（１：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、１８７ｍｇ（５０．９％）の表題化合物が濃いオレンジ色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５６８（Ｍ＋１）。

【１５０２】

工程４：Ｔｅｒｔ－ブチル（Ｎ－（２－（４－フルオロ－２－イソプロピル－６－（テトラヒドロフラン－３－イル）フェニル）アセチル）－２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－スルホンイミドイル）カルバメート

１００ｍＬの丸底フラスコ中に、メタノール（２５ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチルＮ－（［２－［２－（２，５－ジヒドロフラン－３－イル）－４－フルオロ－６－（プロパン－２－イル）フェニル］アセトアミド］［２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－オキサゾール－５－イル］オキソ－λ^6－スルファニリデン）カルバメート（２３７ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）を入れた。上記の溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１０重量％、３０ｍｇ）を撹拌しながら加えた。溶液を排気し、水素を３回充填した。得られた溶液を室温で１６時間撹拌した。固体をろ過して取り出した。得られた混合物を濃縮した。残渣を、ＤＣＭ／メタノール（１０：１）を用いてシリカゲルから溶離した。これにより、２３４ｍｇ（９８．３％）の表題化合物が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：５７０（Ｍ＋１）。

【１５０３】

工程５：Ｎ－（アミノ（２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－５－イル）（オキソ）－λ^6－スルファニリデン）－２－（４－フルオロ－２－イソプロピル－６－（テトラヒドロフラン－３－イル）フェニル）アセトアミド

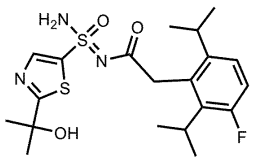
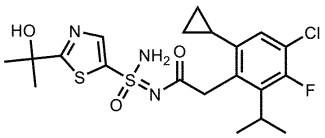
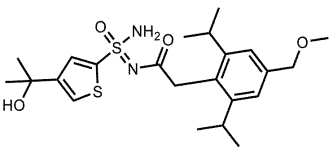
５０ｍＬの丸底フラスコ中に、ＨＣｌ／ジオキサン（４Ｍ、１０ｍＬ）中のｔｅｒｔ－ブチルＮ－［（［２－［４－フルオロ－２－（オキソラン－３－イル）－６－（プロパン－２－イル）フェニル］アセチル］イミノ）［２－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－１，３－チアゾール－５－イル］オキソ－λ^6－スルファニル］カルバメート（２００ｍｇ、０．３５ｍｍｏｌ）を入れた。得られた溶液を室温で１時間撹拌した。得られた混合物を濃縮した。粗生成物を、以下の条件：カラム、ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　Ｃ１８　ＯＢＤ、５ｕｍ、１９＊１５０ｍｍ；移動相、水（１０ｍＭのNH_4HCO_3）及びＡＣＮ（７分で７％～４５％のＡＣＮの勾配）；検出器、ＵＶ　２５４／２１０ｎｍを用いた分取ＨＰＬＣによって精製した。これにより、２０ｍｇ（１２．１３％）の実施例１０２が白色の固体として得られた。ＭＳ－ＥＳＩ：４７０（Ｍ＋１）。

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6、ｐｐｍ）δ：８．０６（ｂｒ　ｓ，２Ｈ）、７．０３（ｄ，Ｊ＝８．０Ｈｚ、１Ｈ）、７．０３（ｄ，Ｊ＝１２．４Ｈｚ、１Ｈ）、６．２８（ｓ，１Ｈ）、４．０１－３．９７（ｍ，１Ｈ）、３．９１－３．８９（ｍ，１Ｈ）、３．７９－３．７７（ｍ，１Ｈ）、３．５５（ｓ，２Ｈ）、３．５５－３．４５（ｍ，３Ｈ）、２．９１－２．８６（ｍ，１Ｈ）、２．２５－２．２３（ｍ，１Ｈ）、１．４８（ｓ，６Ｈ）、１．０６（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ、３Ｈ）、１．０１（ｄ，Ｊ＝６．８Ｈｚ、３Ｈ）．

【１５０４】

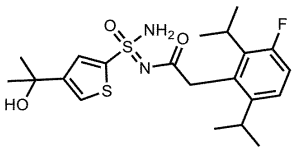
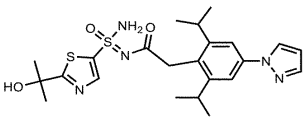
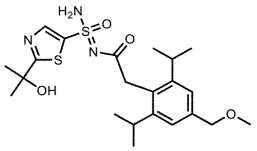
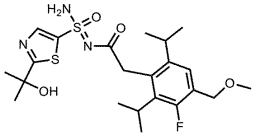
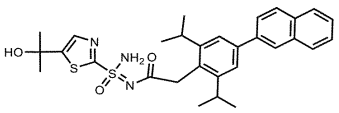
【表１０６】

表 21. 適切な出発材料から、実施例 4 及びスキーム 2 に記載されるのと類似の条件を用いて、以下の表中の実施例を調製した。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	精密質量 $[M+H]^+$
103	258		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	442
104	257		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-クロロ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)アセトアミド	474
105	256		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	467

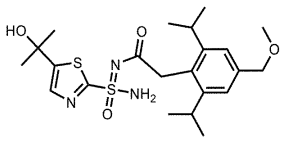
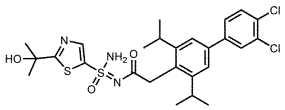
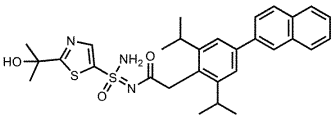
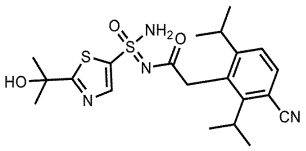
【１５０５】

【表１０７】

106	201		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	441
107	255		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(1H-ピラゾール-1-イル)フェニル)アセトアミド	490
108	254		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	468
109	253		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	486
110	252		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(ナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	550

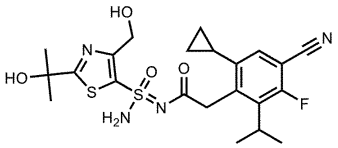
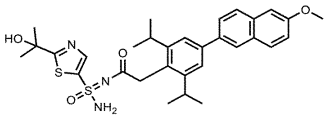
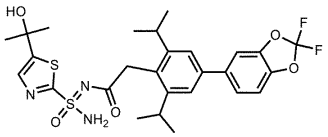
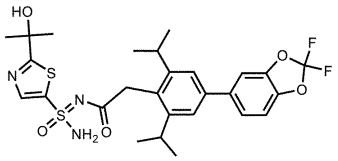
【１５０６】

【表１０８】

111	251		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	468
112	250		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3',4'-ジクロロ-3,5-ジイソプロピル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	568
113	249		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(ナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	550
114	248		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	449

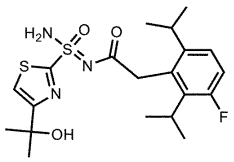
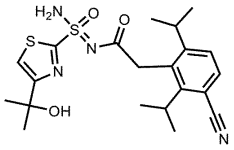
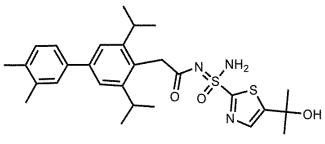
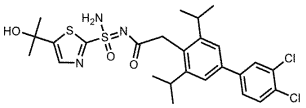
【１５０７】

【表１０９】

115	247		N-(アミノ(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)アセトアミド	495
116	246		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(6-メトキシナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	580
117	309		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(2,2-ジフルオロベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	580
118	310		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(2,2-ジフルオロベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	580

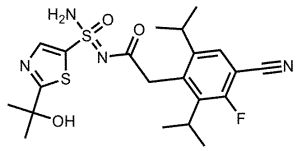
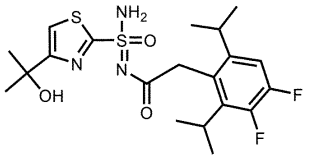
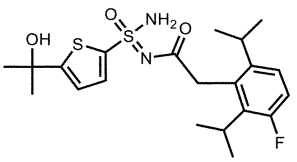
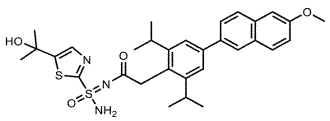
【１５０８】

【表１１０】

119	243		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	442
120	242		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	449
121	239		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,5-ジイソプロピル-3',4'-ジメチル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	528
122	238		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3',4'-ジクロロ-3,5-ジイソプロピル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	568

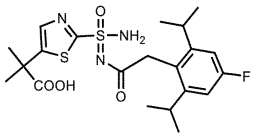
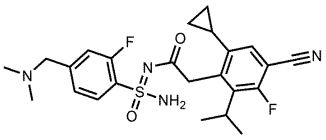
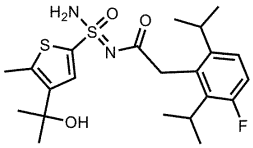
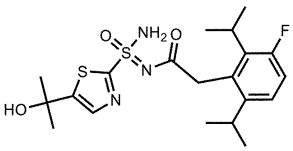
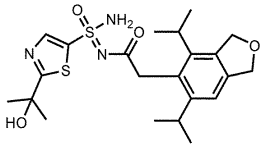
【１５０９】

【表１１１】

123	237		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	467
124	236		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,4-ジフルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	460
125	234		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	441
126	233		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(6-メトキシナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	580

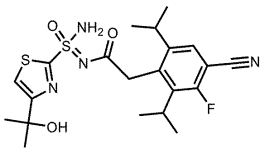
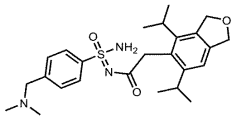
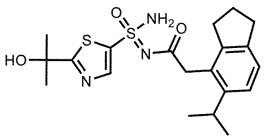
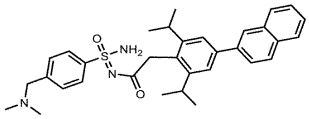
【１５１０】

【表１１２】

127	232		2-(2-(N'-(2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセチル)スルファミドイミドイル)チアゾール-5-イル)-2-メチルプロパン酸	470
128	120		N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-6-シクロプロピル-3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル)アセトアミド	475
129	229		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-5-メチルチオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	455
130	228		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	442
132	227		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	466

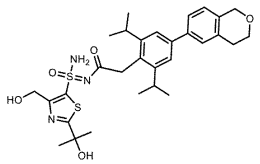
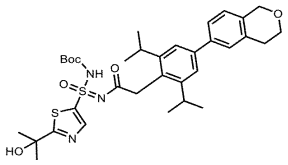
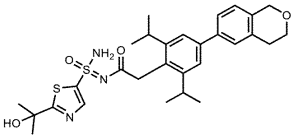
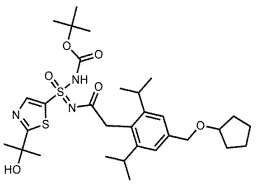
【１５１１】

【表１１３】

133	226		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	467
134	225		N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	458
135	224		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-イソプロピル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)アセトアミド	422
136	191		N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(ナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	542

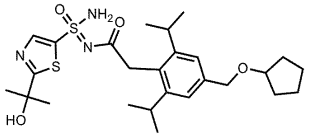
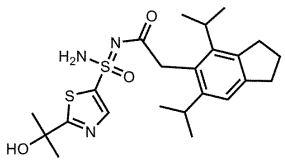
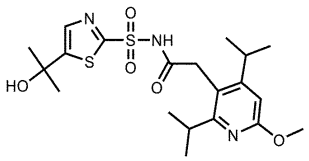
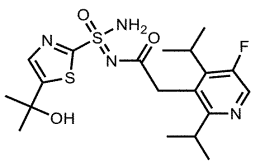
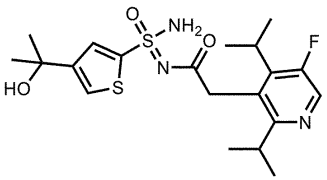
【１５１２】

【表１１４】

137	222		N-(アミノ(4-(ヒドロキシメチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(イソクロマン-6-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	586
138	307		tert-ブチル(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-N-(2-(4-(イソクロマン-6-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセチル)チアゾール-5-スルホンイミドイル)カルバメート	656
139	231		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(イソクロマン-6-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	556
140	306		tert-ブチル(N-(2-(4-((シクロペンチルオキシ)メチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセチル)-2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-スルホンイミドイル)カルバメート	622

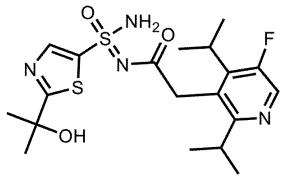
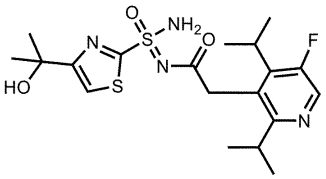
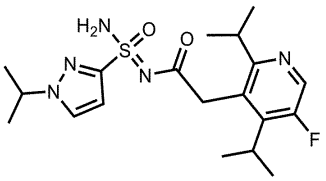
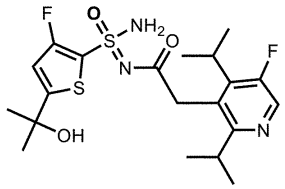
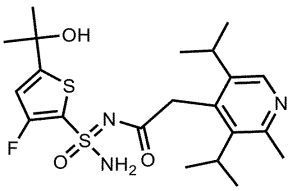
【１５１３】

【表１１５】

141	305		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-((シクロペンチルオキシ)メチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	522
142	216		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)アセトアミド	464
143	215		2-(2,4-ジイソプロピル-6-メトキシピリジン-3-イル)-N-((5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)スルホニル)アセトアミド	456
144	203		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	443
145	213		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	442

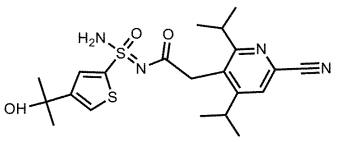
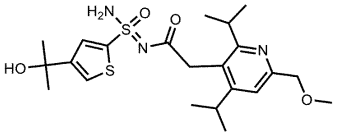
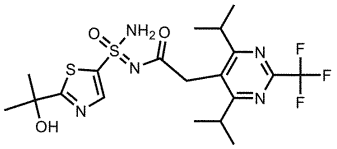
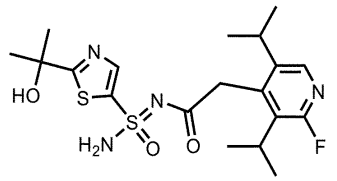
【１５１４】

【表１１６】

146	204		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	443
147	202		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	443
148	211		N-(アミノ(1-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	410
149	210		N-(アミノ(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	460
150	209		N-(アミノ(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,5-ジイソプロピル-2-メチルピリジン-4-イル)アセトアミド	456

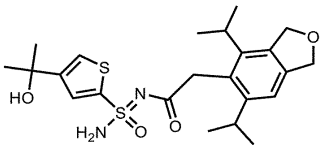
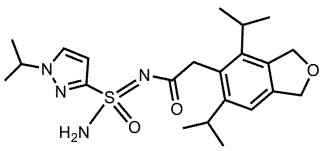
【１５１５】

【表１１７】

151	208		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(6-シアノ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	449
152	207		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,4-ジイソプロピル-6-(メトキシメチル)ピリジン-3-イル)アセトアミド	468
153	206		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-イル)アセトアミド	494
154	205		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2-フルオロ-3,5-ジイソプロピルピリジン-4-イル)アセトアミド	443

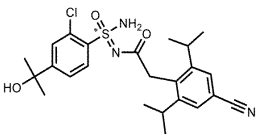
【１５１６】

【表１１８】

220	263		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	465
221	264		N-(アミノ(1-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	433

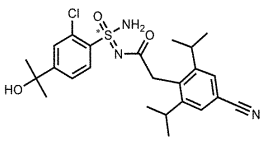
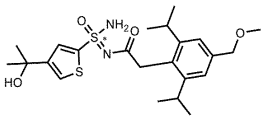
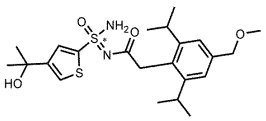
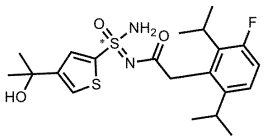
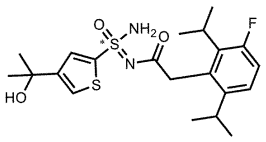
【１５１７】
【表１１９】

表 22. 以下の表中の実施例を、上述されるラセミ実施例のキラル HPLC 分割から得た。キラルカラム及び溶離剤は、表中に列挙される。慣例として、より速く溶出する鏡像異性体が、常に、表中で最初に列挙された後、対のうちのより遅く溶出する鏡像異性体が続く。キラル中心における記号*は、このキラル中心が分割されており、その中心における絶対立体化学が決定されていないことを示す。化合物名中の指定された立体化学は一時的なものである。

実施例番号	化合物番号	構造	IUPAC 名	カラム	溶離剤	LC-MS [M+H]⁺
155	261b		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-クロロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK ID、2*25 cm (5 um)	Hex (0.1%のFA)中のIPA	476

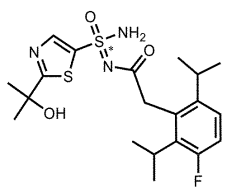
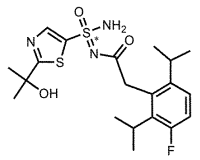
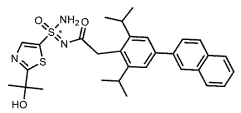
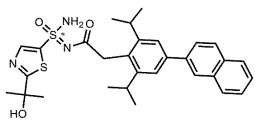
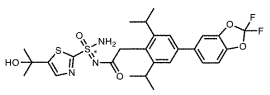
【１５１８】

【表１２０】

156	261a		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-クロロ-4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAKID、2*25 cm (5 um)	Hex (0.1%のFA)中のIPA	476
157	256a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	CHIRALPAKID、2*25 cm (5 um)	Hex:DCM=5:1 中のIPA	465 (M-1)
158	256b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	CHIRALPAKID、2*25 cm (5 um)	Hex:DCM=5:1 中のIPA	465 (M-1)
159	201b		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAKID、2*25 cm (5 um)	Hex:DCM=5:1 中のIPA	441
160	201a		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAKID、2*25 cm (5 um)	Hex:DCM=5:1 中のIPA	441

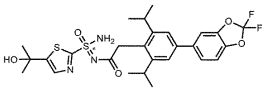
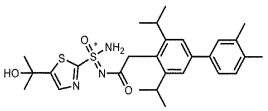
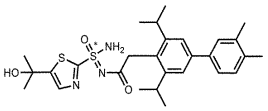
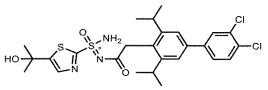
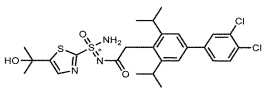
【１５１９】

【表１２１】

161	258a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	440 (M-1)
162	258b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	ChiralpakID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	440 (M-1)
163	249a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(ナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	550
164	249b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(ナフタレン-2-イル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	550
165	309b		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(2,2-ジフルオロベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	580

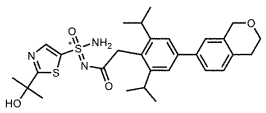
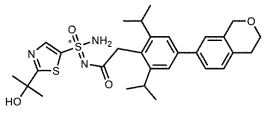
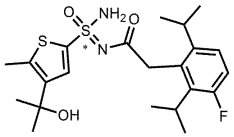
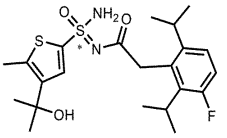
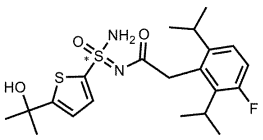
【１５２０】

【表１２２】

166	309a		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(2,2-ジフルオロベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	580
167	239a		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,5-ジイソプロピル-3',4'-ジメチル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	528
168	239b		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,5-ジイソプロピル-3',4'-ジメチル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	528
169	238a		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3',4'-ジクロロ-3,5-ジイソプロピル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	568
170	238b		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3',4'-ジクロロ-3,5-ジイソプロピル-[1,1'-ビフェニル]-4-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	568

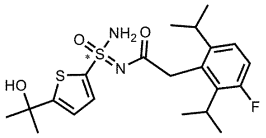
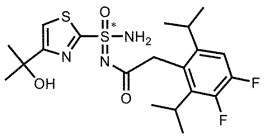
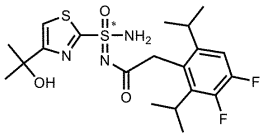
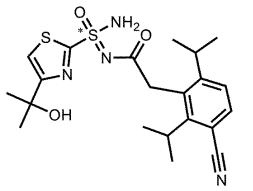
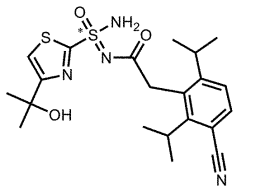
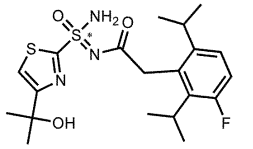
【１５２１】

【表１２３】

171	221a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(イソクロマン-7-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	556
172	221b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(イソクロマン-7-イル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	556
173	229a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-5-メチルチオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IC、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	455
174	229b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-5-メチルチオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IC、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	455
175	234b		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	441

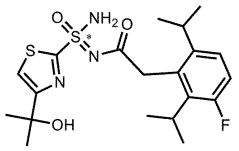
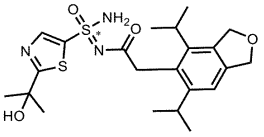
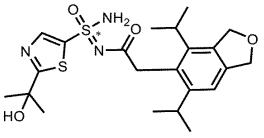
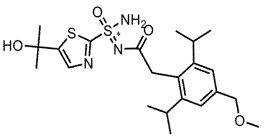
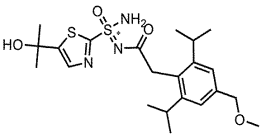
【１５２２】

【表１２４】

176	234a		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	441
177	236a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,4-ジフルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	460
178	236b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3,4-ジフルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	460
179	242a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	449
180	242b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-シアノ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	449
181	243a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442

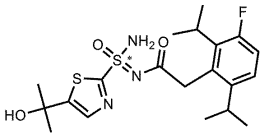
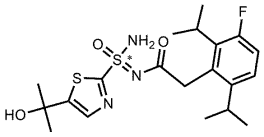
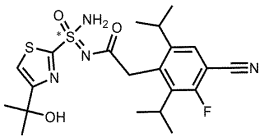
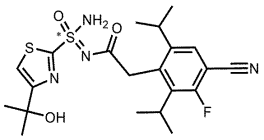
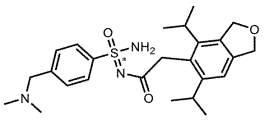
【１５２３】

【表１２５】

182	243b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442
183	227a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak IA、2*25 cm、5 um,	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	466
184	227b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak IA、2*25 cm、5 um,	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	466
185	251b		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	468
186	251a		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2,6-ジイソプロピル-4-(メトキシメチル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	468

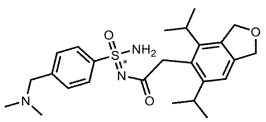
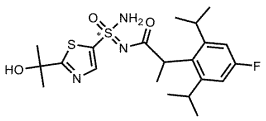
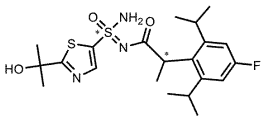
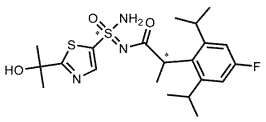
【１５２４】

【表１２６】

187	228a		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442
188	228b		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442
189	226a		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、20*250 mm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	467
190	226b		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-シアノ-3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、20*250 mm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	467
191	225a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex 中のEtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	458

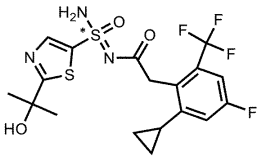
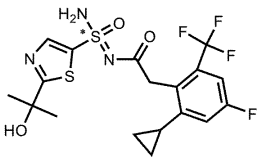
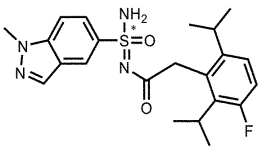
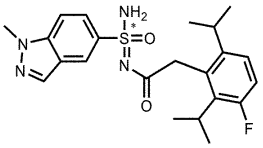
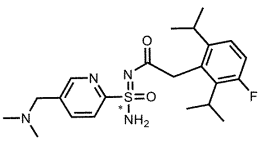
【１５２５】

【表１２７】

192	225b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)フェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex 中の EtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	458
193	224b		(S,S)及び(S,R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)プロパンアミド	Chiralpak IA、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%の FA)中の IPA	456
194	244ba		(R,S)又は(R,R) -N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)プロパンアミド	Chiralpak IA、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%の FA)中の IPA	456
195	244aa		(R,R)又は(R,S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)プロパンアミド	Chiralpak IA、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%の FA)中の IPA	456

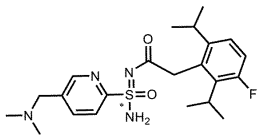
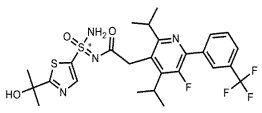
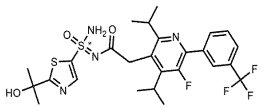
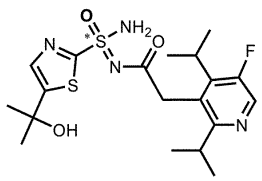
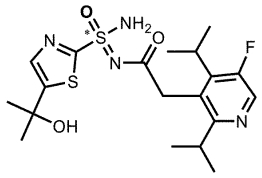
【１５２６】

【表１２８】

196	220a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak IC、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	466
197	220b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(2-シクロプロピル-4-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)フェニル)アセトアミド	Chiralpak IC、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	466
198	218a		(R)又は(S)-N-(アミノ(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	431
199	218b		(S)又は(R)-N-(アミノ(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	431
200	217a		(R)又は(S)-N-(アミノ(5-((ジメチルアミノ)メチル)ピリジン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK ID、2*25 cm (5 um)	Hex 中のIPA (8 mM の NH_3.MeOH)	435

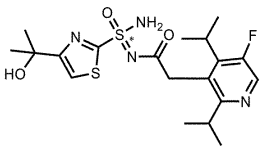
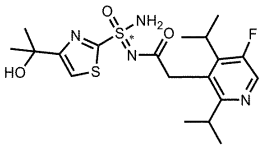
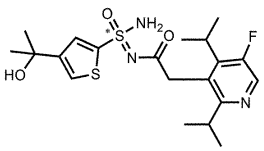
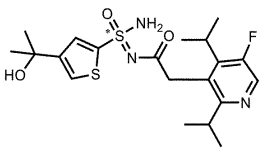
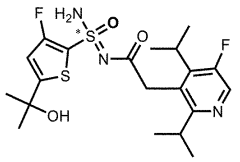
【１５２７】

【表１２９】

201	217b		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-((ジメチルアミノ)メチル)ピリジン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(3-フルオロ-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK ID、2*25 cm (5 um)	Hex 中の IPA (8 mM の NH_3.MeOH)	435
202	303		N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピル-6-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	587
203	302		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピル-6-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	587
204	203b		N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	443
205	203a		(S)又は(R)-N-(アミノ(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IF、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	443

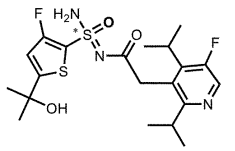
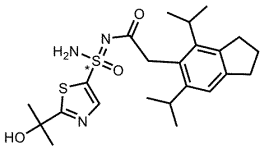
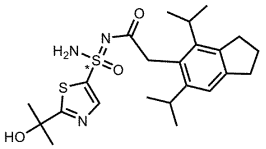
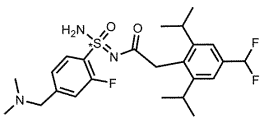
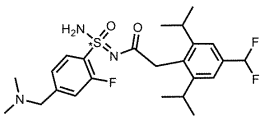
【１５２８】

【表１３０】

206	202a		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	443
207	202b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	443
208	213a		N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442
209	213b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	442
210	210a		(S)又は(R)-N-(アミノ(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、20*250 mm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	460

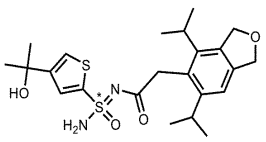
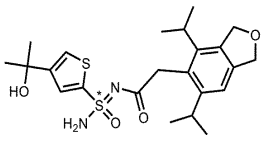
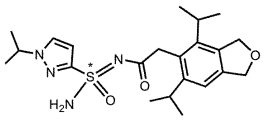
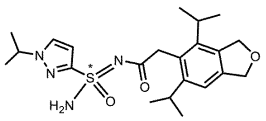
【１５２９】

【表１３１】

211	210b		N-(アミノ(3-フルオロ-5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(5-フルオロ-2,4-ジイソプロピルピリジン-3-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、20*250 mm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のIPA	460
212	216a		(R)又は(S)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	MTBE (0.1%のFA)中のEtOH	464
213	216b		(S)又は(R)-N-(アミノ(2-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-5-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	MTBE (0.1%のFA)中のEtOH	464
214	110a'		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM のNH₃.MeOH)	484
215	110b'		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-((ジメチルアミノ)メチル)-2-フルオロフェニル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4-(ジフルオロメチル)-2,6-ジイソプロピルフェニル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM のNH₃.MeOH)	484

【１５３０】

【表１３２】

216	263a		(R)又は(S)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	465
217	263b		(S)又は(R)-N-(アミノ(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チオフェン-2-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	CHIRALPAK IG、2*25 cm (5 um)	Hex 中のEtOH (8 mM の NH_3.MeOH)	465
218	264a		(R)又は(S)-N-(アミノ(1-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	433
219	264b		(S)又は(R)-N-(アミノ(1-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-イル)(オキソ)-λ⁶-スルファニリデン)-2-(4,6-ジイソプロピル-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)アセトアミド	Chiralpak ID、2*25 cm、5 um	Hex (0.1%のFA)中のEtOH	433

【１５３１】
実施例１５９：^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ７．９２（ｓ，２Ｈ）、７．６２（ｓ，１Ｈ）、７．６０（ｓ，１Ｈ）、７．０８（ｄｄ，Ｊ＝８．７、５．５Ｈｚ、１Ｈ）、６．９１（ｄｄ，Ｊ＝１１．９、８．６Ｈｚ、１Ｈ）、５．１９（ｓ，１Ｈ）、３．６８（ｄ，Ｊ＝２．５Ｈｚ、２Ｈ）、３．２０－２．９０（ｍ，２Ｈ）、１．３９（ｓ，６Ｈ）、１．２５－１．０４（ｍ，１２Ｈ）．
【１５３２】
実施例１８３：：^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ８．０７（ｂｒ ｓ，３Ｈ）、７．０４（ｓ，１Ｈ）、６．２９（ｓ，１Ｈ）、５．０５（ｓ，２Ｈ）、４．８８（ｓ，２Ｈ）、３．７７－３．６２（ｍ，２Ｈ）、３．２５－２．９０（ｍ，２Ｈ）、１．４８（ｓ，６Ｈ）、１．１５－０．９９（ｍ，１２Ｈ）．
【１５３３】
実施例２１６：^{1}Ｈ ＮＭＲ（３００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ７．８２（ｂｒ ｓ，２Ｈ）、７．５９（ｓ，１Ｈ）、７．５８（ｓ，１Ｈ）、７．０３（ｓ，１Ｈ）、５．１９（ｓ，１Ｈ）、５．０４（ｓ，２Ｈ）、４．８７（ｓ，２Ｈ）、３．６７（ｓ，２Ｈ）、３．２５－３．００（ｍ，２Ｈ）、１．３８（ｓ，６Ｈ）、１．２０－０．８０（ｍ，１２Ｈ）．
【１５３４】

以下のプロトコルは、本明細書に開示される化合物の活性を試験するのに好適である。

【１５３５】

手順１：グラミシジンで刺激されたＰＭＡ分化ＴＨＰ－１細胞におけるＩＬ－１β産生

ＴＨＰ－１細胞を、米国培養細胞系統保存機関（Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｔｙｐｅ Ｃｕｌｔｕｒｅ Ｃｏｌｌｅｃｔｉｏｎ）から購入し、供給者からの説明書にしたがって継代培養した。細胞を、完全ＲＰＭＩ １６４０（１０％の熱不活性化ＦＢＳ、ペニシリン（１００単位／ｍｌ）及びストレプトマイシン（１００μｇ／ｍｌ）を含有する）中で培養し、実験準備前に対数期に維持した。実験前に、化合物をジメチルスルホキシド（ＤＭＳＯ）に溶解させて、３０ｍＭのストックを生成した。化合物ストックを、まず、ＤＭＳＯ中で３、０．３４、０．０４２及び０．００８３ｍＭの中間体濃度になるまで予め希釈し、その後、Ｅｃｈｏ５５０液体ハンドラーを用いて、空の３８４ウェルアッセイプレート中に分注して、所望の最終濃度（例えば１００、３３、１１、３．７、１．２、０．４１、０．１４、０．０４６、０．０１５、０．００５１、０．００１７μＭ）を達成した。０．３７％の最終的なＤＭＳＯアッセイ濃度を達成するようにプレートにＤＭＳＯを再充填した。次に、プレートを密閉し、必要とされるまで室温で貯蔵した。

【１５３６】

ＴＨＰ－１細胞を、ＰＭＡ（ホルボール１２－ミリステート１３－アセテート））（２０ｎｇ／ｍｌ）で１６～１８時間処理した。実験の当日に、培地を取り出し、付着細胞を、５分間にわたってトリプシンで剥離させた。次に、細胞を収集し、完全ＲＰＭＩ １６４０で洗浄し、遠心沈降させ、ＲＰＭＩ １６４０（２％の熱不活性化ＦＢＳ、ペニシリン（１００単位／ｍｌ）及びストレプトマイシン（１００μｇ／ｍｌ）を含有する）中で再懸濁させた。細胞を、５０，０００個の細胞／ウェルの密度（最終的なアッセイ体積５０μｌ）で分注された化合物を含有する３８４ウェルアッセイプレートにおいて平板培養した。細胞を、１時間にわたって化合物とともにインキュベートし、次に、２時間にわたってグラミシジン（５μＭ）（Ｅｎｚｏ）で刺激した。次に、プレートを、５分間にわたって３４０ｇで遠心分離した。無細胞上清（４０μＬ）を、９６チャネルＰｌａｔｅＭａｓｔｅｒ（Ｇｉｌｓｏｎ）を用いて収集し、ＩＬ－１βの産生を、ＨＴＲＦ（ｃｉｓｂｉｏ）によって評価した。プレートを、４℃で１８時間インキュベートし、ＳｐｅｃｔｒａＭａｘ ｉ３ｘ分光光度計（Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ Ｄｅｖｉｃｅｓ、ソフトウェアＳｏｆｔＭａｘ ６）の予め設定されたＨＴＲＦプログラム（６２０ｎｍにおけるドナー発光、６６８ｎｍにおけるアクセプター発光）を用いて読み取った。ビヒクルのみの対照及びＣＲＩＤ３の用量漸増（１００～０．００１７μＭ）を、各実験と同時に行った。データを、ビヒクル処理試料（０％の阻害に相当する）及び１００μＭのＣＲＩＤ３（１００％の阻害に相当する）に対して正規化した。化合物は、ＰＭＡ分化ＴＨＰ－１細胞におけるＩＬ－１β産生の濃度依存的な阻害を示した。

【１５３７】

手順２：グラミシジンで刺激されたＰＭＡ分化ＴＨＰ－１細胞におけるＩＬ－１β産生

ＴＨＰ－１細胞を、米国培養細胞系統保存機関（Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｔｙｐｅ Ｃｕｌｔｕｒｅ Ｃｏｌｌｅｃｔｉｏｎ）から購入し、供給者からの説明書にしたがって継代培養した。実験前に、細胞を、完全ＲＰＭＩ １６４０（１０％の熱不活性化ＦＢＳ、ペニシリン（１００単位／ｍｌ）及びストレプトマイシン（１００μｇ／ｍｌ）を含有する）中で培養し、実験準備前に対数期に維持した。実験前に、ＴＨＰ－１を、ＰＭＡ（ホルボール１２－ミリステート１３－アセテート））（２０ｎｇ／ｍｌ）で１６～１８時間処理した。化合物をジメチルスルホキシド（ＤＭＳＯ）に溶解させて、３０ｍＭのストックを生成した。実験の当日に、培地を取り出し、付着細胞を、５分間にわたってトリプシンで剥離させた。次に、細胞を収集し、完全ＲＰＭＩ １６４０で洗浄し、遠心沈降させ、ＲＰＭＩ １６４０（２％の熱不活性化ＦＢＳ、ペニシリン（１００単位／ｍｌ）及びストレプトマイシン（１００μｇ／ｍｌ）を含有する）中で再懸濁させた。細胞を、５０，０００個の細胞／ウェルの密度（最終的なアッセイ体積５０μｌ）で３８４ウェルプレートにおいて平板培養した。化合物を、まず、アッセイ培地に溶解させて、５００μＭの５倍の

最高濃度を得た。次に、１０段階希釈（１：３）を、１．６７％のＤＭＳＯを含有するアッセイ培地において行った。５倍の化合物溶液を培養培地に加えて、所望の最終濃度（例えば１００、３３、１１、３．７、１．２、０．４１、０．１４、０．０４６、０．０１５、０．００５１、０．００１７μＭ）を達成した。最終的なＤＭＳＯ濃度は、０．３７％であった。細胞を、１時間にわたって化合物とともにインキュベートし、次に、２時間にわたってグラミシジン（５μＭ）（Ｅｎｚｏ）で刺激した。次に、プレートを、５分間にわたって３４０ｇで遠心分離した。無細胞上清（４０μＬ）を、９６チャネルＰｌａｔｅＭａｓｔｅｒ（Ｇｉｌｓｏｎ）を用いて収集し、ＩＬ－１βの産生を、ＨＴＲＦ（ｃｉｓｂｉｏ）によって評価した。ビヒクルのみの対照及びＣＲＩＤ３の用量漸増（１００～０．００１７μＭ）を、各実験と同時に行った。データを、ビヒクル処理試料（０％の阻害に相当する）及び１００μＭのＣＲＩＤ３（１００％の阻害に相当する）に対して正規化した。化合物は、ＰＭＡ分化ＴＨＰ－１細胞におけるＩＬ－１β産生の濃度依存的な阻害を示した。

【１５３８】

手順３

１．実験手順

１．１　細胞培養

１）３７℃、５％のCO_2で、１０％のＦＢＳを含む完全ＲＰＭＩ－１６４０培地中で、ＴＨＰ－１細胞を培養する。

２）ｍｌ当たり３×10^5個の細胞を接種することによって、３日毎に細胞を継代する。

【１５３９】

１．２　化合物調製

ＴＥＣＡＮ　ＥＶＯシステムを用いて３８４ウェルＬＤＶマイクロプレート中のＤＭＳＯを用いて３倍連続希釈の化合物を調製して、１０の濃度を有する化合物源プレートを生成する。最高濃度は、３０ｍＭである。

【１５４０】

１．３　細胞調製

１）ＴＨＰ－１細胞を、５分間にわたって３５０ｇで遠心分離する。

２）完全ＲＭＰＩ－１６４０培地で細胞を再懸濁させ、細胞を計数する。

３）Ｔ２２５フラスコ中に、フラスコ当たり約２．５×10^7個の細胞を播種し、細胞を２０ｎｇ／ｍｌのＰＭＡ（１％未満の最終的なＤＭＳＯ濃度）で処理する。

４）一晩インキュベートする。

【１５４１】

１．４　ＴＨＰ－１刺激

１）付着ＴＨＰ－１細胞をＰＢＳで洗浄し、Ｔ２２５フラスコに対して４ｍｌのトリプシンで細胞を剥離させる。

２）細胞を、５分間にわたって３５０ｇで遠心分離し、２％のＦＢＳを含有するＲＰＭＩ－１６４０で細胞を再懸濁させ、トリパンブルーを用いて細胞を計数する。

３）５０ｎｌ／ウェルの連続希釈の試験化合物を、Ｅｃｈｏによって３８４ウェルプレートに移し；高い対照及び第１の点のＣＲＩＤ３（ＭＣＣ９５０）のために、１６５ｎｌを移し、次に、ＤＭＳＯ濃度を全てのウェル中で一致させるように再充填し、プレートの配置は以下のとおりである。

４）３８４ウェルプレート中のウェル当たり２％のＦＢＳを含む４０ｕｌのＲＰＭＩ－１６４０に５０ｋ細胞を播種する。

５）３７℃、５％のCO_2で１時間インキュベートする。

６）５倍のグラミシジンを調製し、ウェル当たり１０μｌを加え、最終濃度は５μＭであり、３７℃、５％のCO_2で２時間インキュベートする。

７）１分間にわたって３５０ｇで遠心分離する。

８）１６μｌの上清をａｐｒｉｃｏｔによってピペットで取り、白色の３８４　ｐｒｏｘｉｐｌａｔｅ中に移す。図３は、プレートの配置：ＨＣ：１００μＭのＣＲＩＤ３（Ｍ

ＣＣ９５０）＋５μＭのグラミシジンＬＣ：５μＭのグラミシジンを示す。
【１５４２】
１．５　ＩＬ－１β検出
　１）５倍の希釈剤＃５をボルテックスにより均質化し、４体積の蒸留水中１体積のストック溶液を加える。
　２）抗ＩＬ１β－クリプテート－抗体及び抗ＩＬ１β　ＸＬ－抗体の２０倍ストック溶液を解凍する。これらの２つの抗体を、検出緩衝液＃３を用いて１倍に希釈する。
　３）２つの調製済み抗体溶液を、使用の直前に予め混合する。
　４）４ｕｌの予め混合された抗ＩＬ１β抗体の希釈標準溶液を、全てのウェルに分配する。
　５）プレートを密閉し、４℃で一晩インキュベートする。
　６）ＥｎＶｉｓｏｎを用いて細胞プレートを読み取り、読み取り値を試験化合物濃度に対してプロットして、IC_{50}を計算する。
【１５４３】
２．データ分析：
　１．化合物のIC_{50}は、下式を用いて計算され得る。
IC_{50}のための式
阻害％＝１００－１００×［ＨＣａｖｅ－読み取り値／（ＨＣａｖｅ－ＬＣａｖｅ）］
　２．正規化されたデータを、ＸＬｆｉｔを用いて用量反応的に適合させ、化合物濃度を計算する。
【１５４４】
　表１２は、２％のウシ胎仔血清を含有するｈＴＨＰ－１アッセイにおける化合物の生物学的活性を示す：＜０．００８μＭ＝「＋＋＋＋＋＋」；≧０．００８及び＜０．０４μＭ＝「＋＋＋＋＋」；≧０．０４及び＜０．２μＭ＝「＋＋＋＋」；≧０．２及び＜１μＭ＝「＋＋＋」；≧１及び＜５μＭ＝「＋＋」；≧５及び＜３０μＭ＝「＋」。
【１５４５】
【表１３３】

表 12. hTHP-1 アッセイにおける化合物の平均 IC_{50}

実施例番号	化合物番号	hTHP-1 IC_{50}
1	131	++
2	131b 又は 131a	++

【１５４６】

【表１３４】

3	131a 又は 131b	>30 μM
4	129	+
5	129b 又は 129a	>30 μM
6	129a 又は 129b	++
7	132	+++
8	132b	++
9	132a	+++
10	134	+
11	137	+
12	136	>30 μM
13	133	+++
14	141	+++++
15	139	++
16	138	+++
17	140	+++++
18	142	++++
19	143	+++++
20	197	+++
21	101	++++
22	152	+++
23	150	++
24	148	+++
25	147	++
26	113	++
27	151	++
28	114	++
29	112	+
30	116	+
31	105	++
32	117	+
33	109	+++
34	146	++
35	110	+++
36	126	+++
37	104	++++
38	130	+++
39	107	+++
40	106	+++
41	135	+
42	133b 又は 133a	++++

【１５４７】

【表１３５】

43	133a 又は 133b	++
44	141b 又は 141a	++++
45	141a 又は 141b	++
46	139b 又は 139a	>30 μM
47	139a 又は 139b	+++
48	138b 又は 138a	++++
49	138a 又は 138b	+
50	140b 又は 140a	+++++
51	140a 又は 140b	+++
52	144b 又は 144a	+++++
53	144a 又は 144b	++
54	145b 又は 145a	+++++
55	145a 又は 145b	++
56	197b 又は 197a	+++
57	197a 又は 197b	++
58	116b 又は 116a	>30 μM
59	116a 又は 116b	+
60	106b 又は 106a	++++
61	106a 又は 106b	+
62	117b 又は 117a	++
63	117a 又は 117b	>30 μM
64	152b 又は 152a	+++
65	152a 又は 152b	+
66	150b 又は 150a	+++
67	150a 又は 150b	>30 μM
68	148b 又は 148a	+++
69	148a 又は 148b	+
70	147b 又は 147a	+++
71	147a 又は 147b	+
72	114b 又は 114a	++
73	114a 又は 114b	>30 μM
74	112b 又は 112a	>30 μM
75	112a 又は 112b	++
76	101b 又は 101a	++++
77	101a 又は 101b	++
78	126b 又は 126a	+++
79	126a 又は 126b	+
80	104b 又は 104a	+++++
81	104a 又は 104b	+++
82	130b 又は 130a	+

【１５４８】

【表１３６】

83	130a 又は 130b	++++
84	107b 又は 107a	++++
85	107a 又は 107b	+
86	110b 又は 110a	++
87	110a 又は 110b	++++
88	241	+++
89	219	+++
90	218	+
91	217	+
92	214	>30 μM
93	235	>30 μM
94	230	++
95	245	+++
96	244	>30 μM
97	221	+++
98	220	+
99	304	++
100	301	+++
101	212	+
102	240	+
103	258	+++
104	257	+++
105	256	++++
106	201	++++
107	255	+
108	254	++++
109	253	++++
110	252	+++
111	251	++++
112	250	+++
113	249	+++++
114	248	++
115	247	+++
116	246	+
117	309	++++
118	310	+++
119	243	+++
120	242	+++
121	239	+++
122	238	+++

【１５４９】

【表１３７】

123	237	+++
124	236	+++
125	234	+++
126	233	+++
127	232	+
128	120	+++
129	229	++++
130	228	++
131	308	+
132	227	++
133	226	+++
134	225	++
135	224	++
136	191	+++
137	222	+++
138	307	++
139	231	+++
140	306	+++
141	305	++++
142	216	++
143	215	++
144	203	+
145	213	+++
146	204	+
147	202	++
148	211	+
149	210	+++
150	209	+
151	208	+++
152	207	+++
153	206	++
154	205	+
155	261b	+++
156	261a	+++
157	256a	+++++
158	256b	++
159	201a	++++
160	201b	+++
161	258a	++++
162	258b	+

【１５５０】

【表１３８】

163	249a	++++
164	249b	++
165	309b	++
166	309a	++++
167	239a	++
168	239b	+++
169	238a	++
170	238b	+++
171	221a	+++
172	221b	+
173	229a	+++
174	229b	+
175	234b	++
176	234a	+++
177	236a	++++
178	236b	++
179	242a	+++
180	242b	+
181	243a	++++
182	243b	+
183	227a	+++
184	227b	+
185	251b	++++
186	251a	+
187	228a	+
188	228b	+++
189	226a	++
190	226b	++++
191	225a	++
192	225b	>30 μM
193	244b	>30 μM
194	244ab	+
195	244aa	>30 μM
196	220a	+
197	220b	>30 μM
198	218a	+
199	218b	>30 μM
200	217a	++
201	217b	>30 μM
202	303	+++

【１５５１】

【表１３９】

203	302	+
204	203b	++
205	203a	>30 μM
206	202a	+++
207	202b	>30 μM
208	213a	++++
209	213b	++
210	210a	+
211	210b	+++
212	216a	>30 μM
213	216b	++
214	110a’	++++
215	110b’	++
216	263a	+++
217	263b	+
218	264a	+
219	264b	>30 μM
220	263	++++
221	264	+
	259	>17 μM
	259a	+
	259b	>30 μM
	262a	>30 μM
	262b	+

【１５５２】

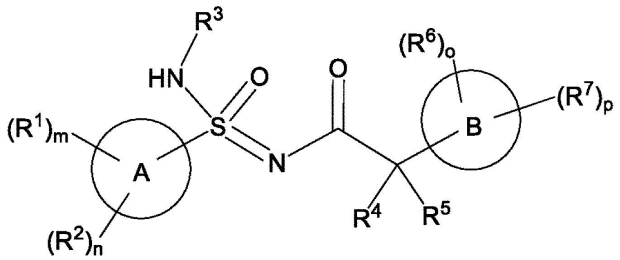
本発明のいくつかの実施形態を説明してきた。それにもかかわらず、様々な変更が、本発明の趣旨及び範囲から逸脱せずに行われ得ることが理解されるであろう。したがって、他の実施形態は、以下の特許請求の範囲内である。

また、本発明は以下を提供する。

［１］

式ＡＡ

【化３８３】



式AA

（式中、

ｍ＝０、１、又は２であり；

ｎ＝０、１、又は２であり；

ｏ＝１又は２であり；
ｐ＝０、１、２、又は３であり、
ここで、
Ａは、５員～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
Ｂは、５～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール、又はＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$単環式若しくは二環式アリールであり；
ここで、
少なくとも１つのＲ^{6}は、式ＡＡのＢ環をＣ（Ｒ^{4}Ｒ^{5}）基に連結する結合に対してオルトであり；
Ｒ^{1}及びＲ^{2}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯ－Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ$_{2}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{8}$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨ$_{2}$、ＮＨＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）$_{2}$、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、ＮＨＣＯＯＣＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨ－（Ｃ＝ＮＲ^{13}）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、ＳＦ$_{5}$、ＳＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ$_{2}$）ＮＲ^{11}Ｒ^{12}、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、前記Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル及び３員～７員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}、３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＯＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、前記Ｒ^{1}又はＲ^{2}　Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル又は前記Ｒ^{1}又はＲ^{2}　３員～７員ヘテロシクロアルキルの各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル置換基及び各Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ置換基は、１～３つのヒドロキシ、ハロ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、又はオキソでさらに任意選択的に独立して置換され；
ここで、前記３員～７員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＮＨＣＯＣ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）及びＮＨＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、及びＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のＲ^{1}及びＲ^{2}の少なくとも１つの対は、それらを連結する前記原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_{4}$～Ｃ$_{8}$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され、ここで、前記Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシは、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、ＮＲ^{8}Ｒ^{9}、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{6}$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}で任意選択的に置換され；
Ｒ^{6}及びＲ^{7}はそれぞれ、独立して、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＮＯ$_{2}$、ＯＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アル

キル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_8シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、NH_2、NHC_1～C_6アルキル、N（C_1～C_6アルキル）$_2$、$CONR^8R^9$、SF_5、S（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_{10}シクロアルキル及び３員～１０員ヘテロシクロアルキル、及びC_2～C_6アルケニルから選択され、

ここで、R^6及びR^7はそれぞれ、ヒドロキシ、ハロ、CN、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、OCO（５員～１０員ヘテロアリール）、OCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）、NHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_2$～C_6アルキニル、C_6～C_{10}アリールオキシ、及びS（O_2）C_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；ここで、R^6又はR^7が置換される前記C_1～C_6アルキル又はC_1～C_6アルコキシは、１つ以上のヒドロキシル、C_6～C_{10}アリール又はNR^8R^9で任意選択的に置換され、又はR^6又はR^7は、５員～７員炭素環又は酸素、硫黄及び窒素から独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する複素環に任意選択的に縮合され；

ここで、前記３員～７員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、NHCO（５員～１０員ヘテロアリール）及びNHCO（３員～７員ヘテロシクロアルキル）は、ハロ、C_1～C_6アルキル、及びOC_1～C_6アルキルから独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する前記原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_8炭素環又はO、N、及びSから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～８員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$CH_2NR^8R^9$、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換され；

R^4及びR^5のそれぞれは、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^{10}はC_1～C_6アルキルであり；

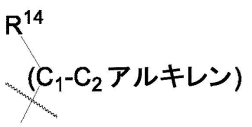
R^8及びR^9のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素、C_1～C_6アルキル、（C＝NR^{13}）$NR^{11}R^{12}$、S（O_2）C_1～C_6アルキル、S（O_2）$NR^{11}R^{12}$、COR^{13}、CO_2R^{13}及び$CONR^{11}R^{12}$から選択され；ここで、前記C_1～C_6アルキルは、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、C_3～C_7シクロアルキル又は３員～７員ヘテロシクロアルキルで任意選択的に置換され；又はR^8及びR^9は、それらが結合される窒素と一緒になって、それらが結合される窒素に加えて１つ以上のヘテロ原子を任意選択的に含有する３員～７員環を形成し；

R^{13}は、C_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、又は５員～１０員ヘテロアリールであり；

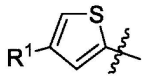
R^{11}及びR^{12}のそれぞれは、出現するごとに、独立して、水素及びC_1～C_6アルキルから選択され；

R^3は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、及び

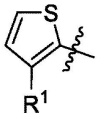
【化３８４】



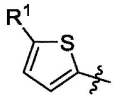
から選択され、ここで、前記C_1～C_2アルキレン基は、オキソで任意選択的に置換され；
R^{14}は、水素、C_1～C_6アルキル、５員～１０員単環式若しくは二環式ヘテロアリール又はC_6～C_{10}単環式若しくは二環式アリールであり、ここで、各C_1～C_6アルキル、アリール又はヘテロアリールは、１つ又は２つのR^6で任意選択的に独立して置換される）
の化合物、
又はその薬学的に許容される塩。
［２］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換される５員～６員単環式ヘテロアリールである、［１］に記載の化合物。
［３］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換されるフラニルである、［１］又は［２］に記載の化合物。
［４］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換されるチオフェニルである、［１］又は［２］に記載の化合物。
［５］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換されるオキサゾリルである、［１］又は［２］に記載の化合物。
［６］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換されるチアゾリルである、［１］又は［２］に記載の化合物。
［７］
Ａは、１つ又は２つのR^1で任意選択的に置換され、且つ１つ又は２つのR^2で任意選択的に置換されるフェニルである、［１］に記載の化合物。
［８］
ｍ＝１であり、ｎ＝０である、［１］～［７］のいずれか一項に記載の化合物。
［９］
置換される環Ａは、
【化３８５】



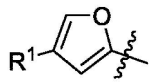
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１０］
置換される環Ａは、
【化３８６】



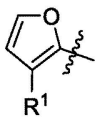
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１１］
前記置換される環Ａは、
【化３８７】



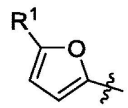
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１２］
前記置換される環Ａは、
【化３８８】



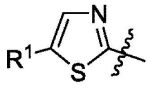
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１３］
前記置換される環Ａは、
【化３８９】



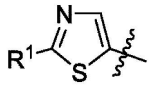
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１４］
前記置換される環Ａは、
【化３９０】



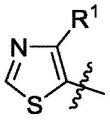
である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１５］
前記置換される環Ａは、
【化３９１】



である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１６］
前記置換される環Ａは、
【化３９２】

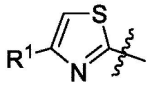


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１７］
前記置換される環Ａは、
【化３９３】



である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。
［１８］
前記置換される環Ａは、

【化３９４】

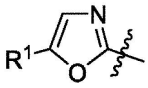


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［１９］

前記置換される環Ａは、

【化３９５】

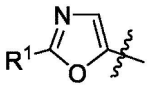


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［２０］

前記置換される環Ａは、

【化３９６】

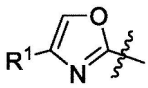


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［２１］

前記置換される環Ａは、

【化３９７】

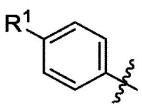


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［２２］

前記置換される環Ａは、

【化３９８】

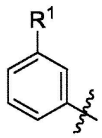


である、［１］又は［８］に記載の化合物。

［２３］

前記置換される環Ａは、

【化３９９】

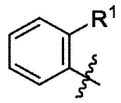


である、［１］又は［８］に記載の化合物。

［２４］

前記置換される環Ａは、

【化４００】

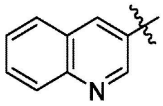


である、［１］又は［８］に記載の化合物。

［２５］

前記置換される環Ａは、

【化４０１】

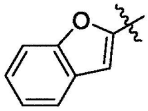


である、［１］に記載の化合物。

［２６］

前記置換される環Ａは、

【化４０２】

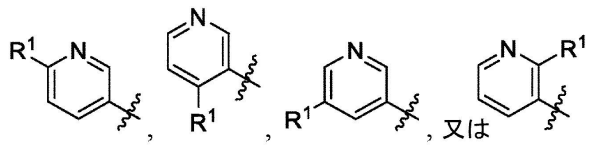


である、［１］に記載の化合物。

［２７］

前記置換される環Ａは、

【化４０３】

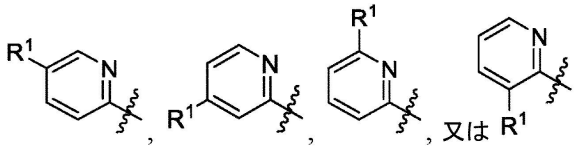


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［２８］

前記置換される環Ａは、

【化４０４】

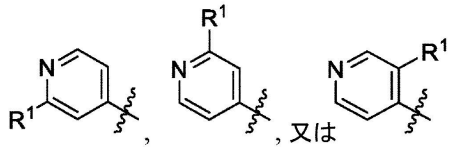


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

［２９］

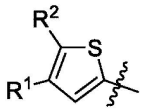
前記置換される環Ａは、

【化４０５】

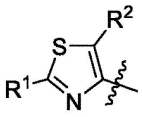


である、［１］、［２］、又は［８］のいずれか一項に記載の化合物。

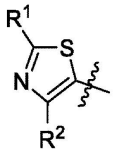
［３０］
ｍ＝１であり、ｎ＝１である、［１］～［７］のいずれか一項に記載の化合物。
［３１］
前記置換される環Ａは、
【化４０６】



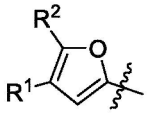
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３２］
前記置換される環Ａは、
【化４０７】



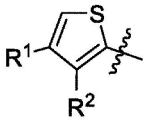
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３３］
前記置換される環Ａは、
【化４０８】



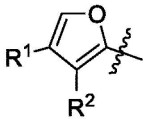
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３４］
前記置換される環Ａは、
【化４０９】



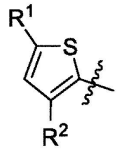
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３５］
前記置換される環Ａは、
【化４１０】



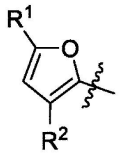
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３６］
前記置換される環Ａは、
【化４１１】



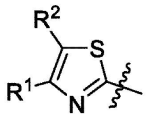
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３７］
前記置換される環Ａは、
【化４１２】



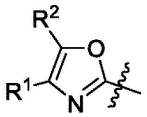
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３８］
前記置換される環Ａは、
【化４１３】



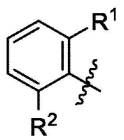
である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［３９］
前記置換される環Ａは、
【化４１４】



である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［４０］
前記置換される環Ａは、
【化４１５】

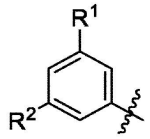


である、［１］、［２］、又は［３０］のいずれか一項に記載の化合物。
［４１］
前記置換される環Ａは、
【化４１６】



である、［１］又は［３０］に記載の化合物。
［４２］
前記置換される環Ａは、

【化４１７】

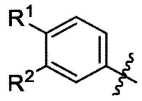


である、［１］又は［３０］に記載の化合物。

［４３］

前記置換される環Ａは、

【化４１８】

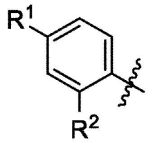


である、［１］又は［３０］に記載の化合物。

［４４］

前記置換される環Ａは、

【化４１９】

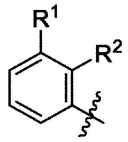


である、［１］又は［３０］に記載の化合物。

［４５］

前記置換される環Ａは、

【化４２０】

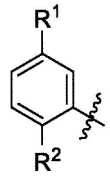


である、［１］又は［３０］に記載の化合物。

［４６］

前記置換される環Ａは、

【化４２１】



である、［１］又は［３０］に記載の化合物。

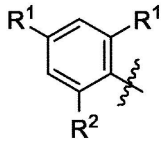
［４７］

ｍ＝２であり、ｎ＝１である、［１］～［４］及び［７］のいずれか一項に記載の化合物。

［４８］

前記置換される環Ａは、

【化４２２】

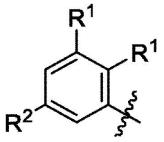


である、［１］又は［４７］に記載の化合物。

［４９］

前記置換される環Ａは、

【化４２３】

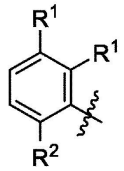


である、［１］又は［４７］に記載の化合物。

［５０］

前記置換される環Ａは、

【化４２４】

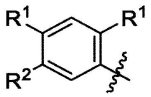


である、［１］又は［４７］に記載の化合物。

［５１］

前記置換される環Ａは、

【化４２５】



である、［１］又は［４７］に記載の化合物。

［５２］

R^1及びR^2のそれぞれは、存在する場合、独立して、１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルコキシ、又はNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル；１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルキル、又はNR^8R^9で任意選択的に置換されるC_3～C_7シクロアルキル（ここで、前記C_1～C_6アルコキシ又はC_1～C_6アルキルは、１～３つのヒドロキシ、ハロ、NR^8R^9、又はオキソでさらに任意選択的に置換される）；１つ以上のヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、又はNR^8R^9で任意選択的に置換される３員～７員ヘテロシクロアルキル（ここで、前記C_1～C_6アルコキシ又はC_1～C_6アルキルは、１～３つのヒドロキシ、ハロ、NR^8R^9、又はオキソでさらに任意選択的に置換される）；C_1～C_6ハロアルキル；C_1～C_6アルコキシ；C_1～C_6ハロアルコキシ；ハロ；ＣＮ；ＣＯ－C_1～C_6アルキル；ＣＯ－C_6～C_{10}アリール；ＣＯ－５員～１０員ヘテロアリール；CO_2C_1～C_6アルキル；CO_2C_3～C_8シクロアルキル；ＯＣＯＣ$_1$～C_6アルキル；ＯＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール；ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）；ＯＣＯ（３員～７員ヘテ

ロシクロアルキル）；C_6～C_{10}アリール；５員～１０員ヘテロアリール；NH_2；NHC_1～C_6アルキル；Ｎ（C_1～C_6アルキル）$_2$；$CONR^8R^9$；SF_5；Ｓ（O_2）$NR^{11}R^{12}$；Ｓ（Ｏ）C_1～C_6アルキル；及びＳ（O_2）C_1～C_6アルキルからなる群から選択される、［１］～［５１］のいずれか一項に記載の化合物。

［５３］

R^1は、１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；メチル；イソプロピル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロブチル；１－ヒドロキシ－１－シクロペンチル；１－ヒドロキシ－１－シクロヘキシル；モルホリニル；１，３－ジオキソラン－２－イル；$COCH_3$；$COCH_2CH_3$；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；１－（ジメチルアミノ）エチル；フルオロ；クロロ；フェニル；ピリジル；ピラゾリル；Ｓ（O_2）CH_3；及びＳ（O_2）$NR^{11}R^{12}$からなる群から選択される、［１］～［５１］のいずれか一項に記載の化合物。

［５４］

R^2は、フルオロ、クロロ、シアノ、メチル；メトキシ；エトキシ；イソプロピル；１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル；２－ヒドロキシ－２－プロピル；ヒドロキシメチル；１－ヒドロキシエチル；２－ヒドロキシエチル；１－ヒドロキシ－２－プロピル；１－ヒドロキシ－１－シクロプロピル；$COCH_3$；ＣＯＰｈ；２－メトキシ－２－プロピル；（ジメチルアミノ）メチル；Ｓ（O_2）CH_3；及びＳ（O_2）$NR^{11}R^{12}$からなる群から選択される、［５２］又は［５３］に記載の化合物。

［５５］

Ｂは、１つ又は２つのR^6で置換され、且つ１、２、又は３つのR^7で任意選択的に置換されるフェニルである、［１］～［５４］のいずれか一項に記載の化合物。

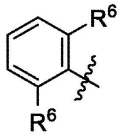
［５６］

ｏ＝２であり、ｐ＝０である、［５５］に記載の化合物。

［５７］

置換される環Ｂは、

【化４２６】



である、［５５］又は［５６］に記載の化合物。

［５８］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル；$CONR^8R^9$、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される、［５７］に記載の化合物。

［５９］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシからなる群から選択され、ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、及びC_3～C_7シクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、及びオキソからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換される、［５７］又は［５８］に記載の化合物。

［６０］

ｏ＝１であり、ｐ＝１である、［５５］に記載の化合物。

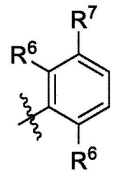
［６１］

ｏ＝２であり、ｐ＝１である、［５５］に記載の化合物。

［６２］

置換される環Ｂは、

【化４２７】



である、［６１］に記載の化合物。

［６３］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル；ＣＯＮR^8R^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮR^8R^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯC_1～C_6アルキル、ＮＨＣＯC_6～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯC_2～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

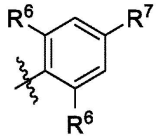
ここで、R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮR^8R^9、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する前記原子と一緒になって、C_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及びＣＯＮR^8R^9から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［６２］に記載の化合物。

［６４］

置換される環Ｂは、

【化４２８】



である、［６１］に記載の化合物。

［６５］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯC_1～C_6アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～C_6アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～C_6シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～C_6アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換される、［６４］に記載の化合物。

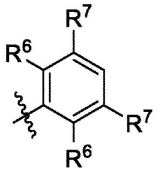
［６６］

ｏ＝２であり、ｐ＝２である、［６５］に記載の化合物。

［６７］

置換される環Ｂは、

【化４２９】



である、［６６］に記載の化合物。

［６８］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員

ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

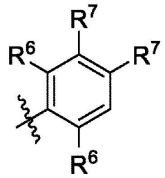
ここで、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルは、１～２つのＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシで任意選択的に置換され；

又は隣接する原子上のＲ^{6}及びＲ^{7}の少なくとも１つの対は、それらを連結する前記原子と一緒になって、少なくとも１つのＣ$_4$～Ｃ$_7$炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［６７］に記載の化合物。

［６９］

置換される環Ｂは、

【化４３０】



である、［６６］に記載の化合物。

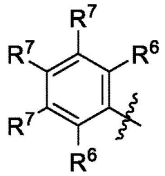
［７０］

各Ｒ^{6}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル；ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＮＨＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯＣ$_2$～Ｃ$_6$アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、各Ｒ^{7}は、独立して、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＣＯ$_2$Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、ＯＣＯＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、ＯＣＯＣ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、Ｃ$_6$～Ｃ$_{10}$アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（Ｏ$_2$）Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_7$シクロアルキル及び４員～６員ヘ

テロシクロアルキルから選択され、前記C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7は、それらを連結する前記原子と一緒になって、C_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［６９］に記載の化合物。
［７１］
ｏ＝２であり、ｐ＝３である、［５５］に記載の化合物。
［７２］
置換される環Ｂは、
【化４３１】



である、［７１］に記載の化合物。
［７３］
各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CO-C_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、
ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；
ここで、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記C_1～C_6アルキルは、１～２つのC_1～C_6アルコキシで任意選択的に置換され；
又は隣接する原子上のR^6及びR^7の少なくとも１つの対は、それらを連結する前記原子と一緒になって、少なくとも１つのC_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する少なくとも１つの５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、$=NR^{10}$、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［７２］に記載の化合物。
［７４］

Ｂはピリジルであり；ｏ＝１又は２であり；ｐ＝０、１、又は２である、［１］～［５４］のいずれか一項に記載の化合物。

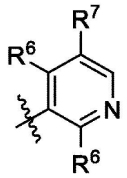
［７５］

ｏ＝２であり、ｐ＝１である、［７４］に記載の化合物。

［７６］

前記置換される環Ｂは、

【化４３２】



である、［７５］に記載の化合物。

［７７］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、$CONR^8R^9$、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、$NHCOC_1$～C_6アルキル、$NHCOC_6$～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及び$NHCOC_2$～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、COC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、$OCOC_1$～C_6アルキル、$OCOC_6$～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、$CONR^8R^9$、SF_5、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記C_6～C_{10}アリールは、１～３つのハロで任意選択的に置換される１～２つのC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換され；

又はR^6及びR^7は、それらを連結する前記原子と一緒になって、C_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、NR^8R^9、＝NR^{10}、$COOC_1$～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及び$CONR^8R^9$から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［７６］に記載の化合物。

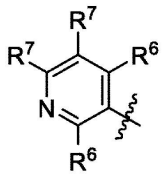
［７８］

ｏ＝２であり、ｐ＝２である、［７４］に記載の化合物。

［７９］

前記置換される環Ｂは、

【化４３３】



である、［７８］に記載の化合物。

［８０］

各R^6は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯ－C_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、

ここで、前記C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルは、ヒドロキシ、ハロ、ＣＮ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、４員～６員ヘテロシクロアルキル、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、ＮＨＣＯC_1～C_6アルキル、ＮＨＣＯC_6～C_{10}アリール、ＮＨＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＮＨＣＯ（４員～６員ヘテロシクロアルキル）、及びＮＨＣＯC_2～C_6アルキニルからそれぞれ独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に置換され；

ここで、各R^7は、独立して、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルコキシ、ハロ、ＣＮ、ＣＯC_1～C_6アルキル、CO_2C_1～C_6アルキル、CO_2C_3～C_6シクロアルキル、ＯＣＯC_1～C_6アルキル、ＯＣＯC_6～C_{10}アリール、ＯＣＯ（５員～１０員ヘテロアリール）、ＯＣＯ（３員～７員ヘテロシクロアルキル）、C_6～C_{10}アリール、５員～１０員ヘテロアリール、ＣＯＮＲ^{8}Ｒ^9、ＳＦ$_5$、Ｓ（O_2）C_1～C_6アルキル、C_3～C_7シクロアルキル及び４員～６員ヘテロシクロアルキルから選択され、ここで、前記C_6～C_{10}アリールは、１～３つのハロで任意選択的に置換される１～２つのC_1～C_6アルキルで任意選択的に置換され；

又はR^6及びR^7は、それらを連結する前記原子と一緒になって、C_4～C_7炭素環又はＯ、Ｎ、及びＳから独立して選択される１個又は２個のヘテロ原子を含有する５員～７員複素環を独立して形成し、ここで、前記炭素環又は複素環は、ヒドロキシ、ハロ、オキソ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、ＮＲ^{8}Ｒ^9、＝ＮＲ^{10}、ＣＯＯC_1～C_6アルキル、C_6～C_{10}アリール、及びＣＯＮＲ^{8}Ｒ^{9}から独立して選択される１つ以上の置換基で任意選択的に独立して置換される、［７９］に記載の化合物。

［８１］

R^4及びR^5のそれぞれは水素である、［１］～［８０］のいずれか一項に記載の化合物。

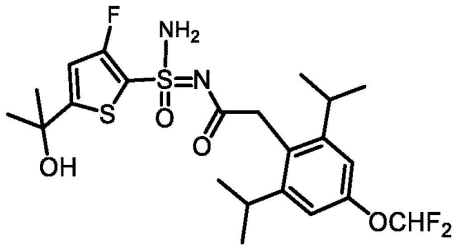
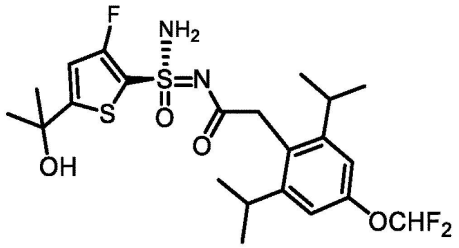
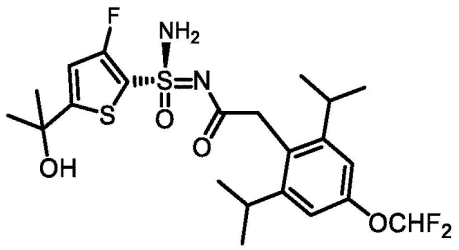
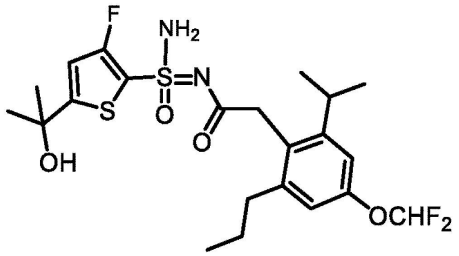
［８２］

R^3は水素である、［１］～［８１］のいずれか一項に記載の化合物。

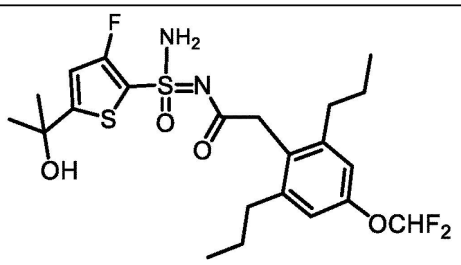
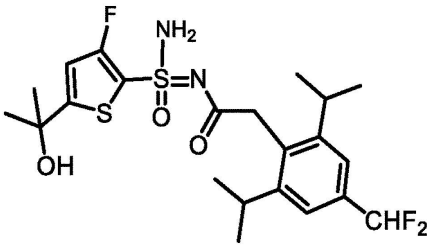
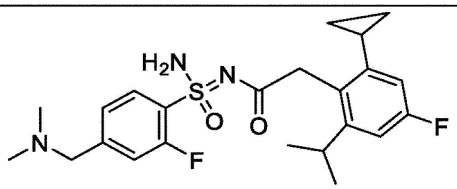
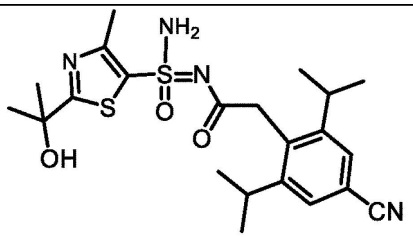
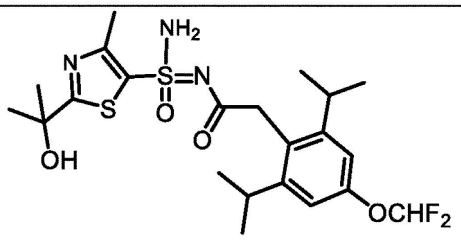
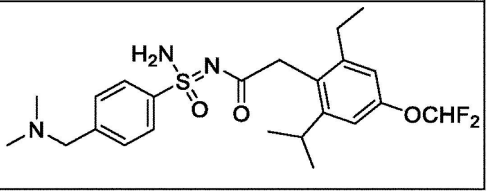
［８３］

以下の化合物：

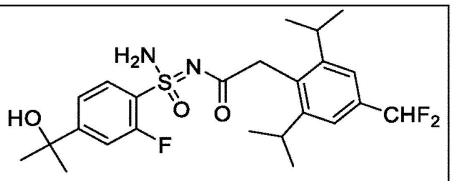
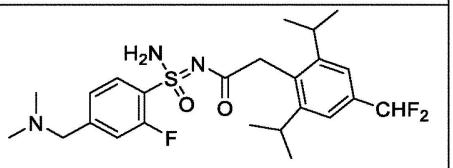
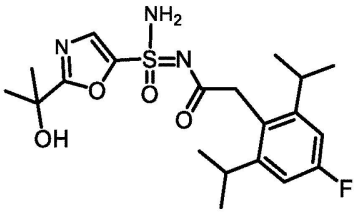
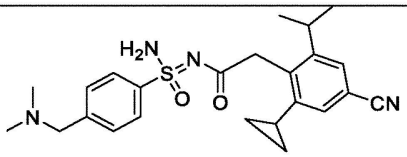
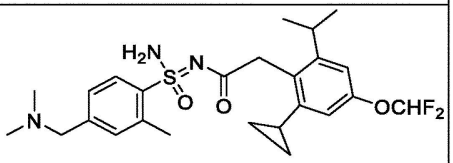
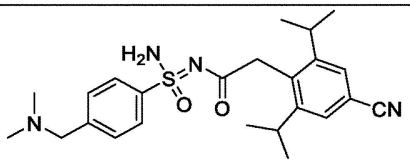
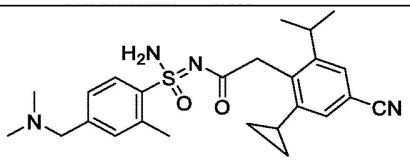
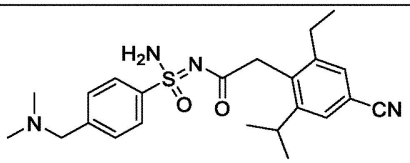
【表１４０】

化合物	構造
101	
101a	
101b	
102	

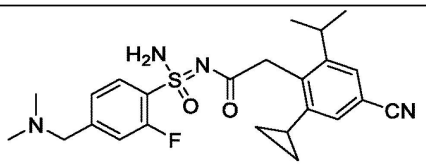
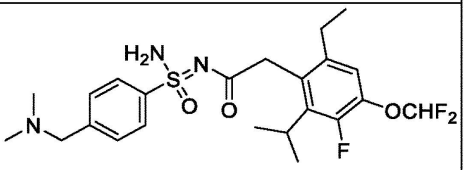
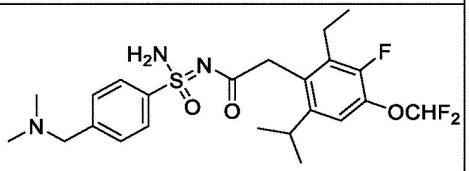
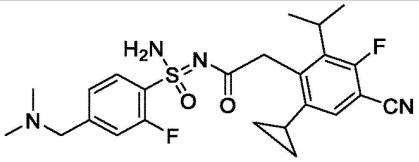
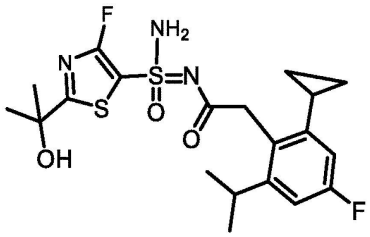
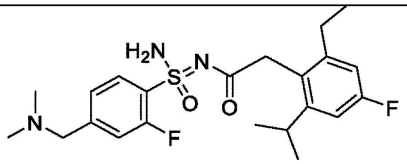
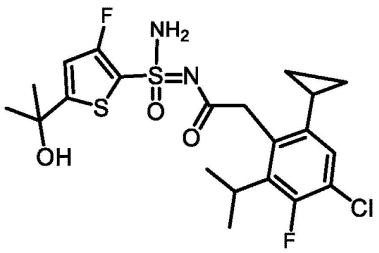
【表１４１】

103	
104	
105	
106	
107	
108	

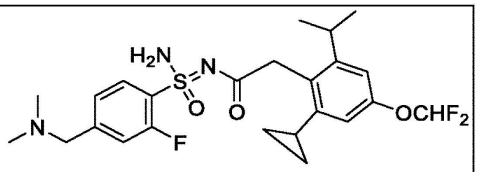
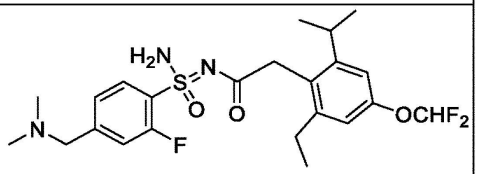
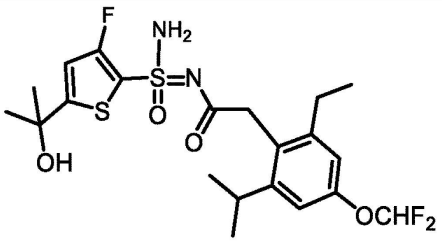
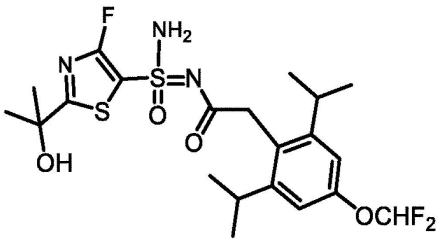
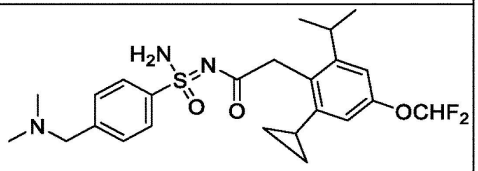
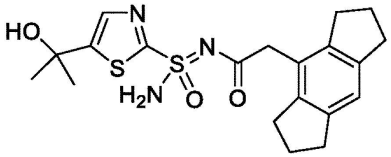
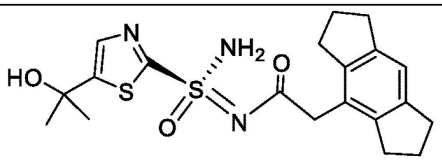
【表１４２】

109	
110	
111	
112	
113	
114	
115	
116	

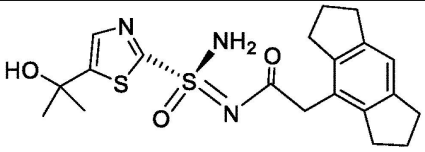
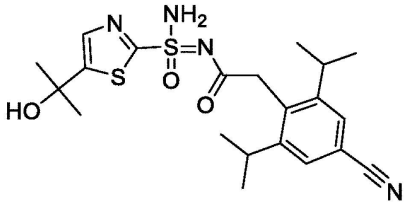
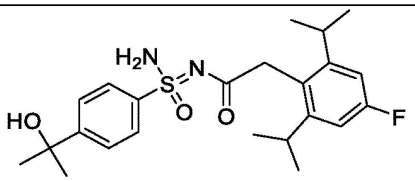
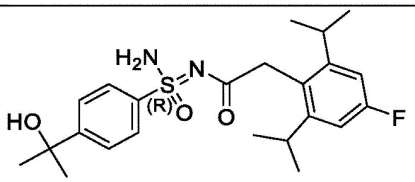
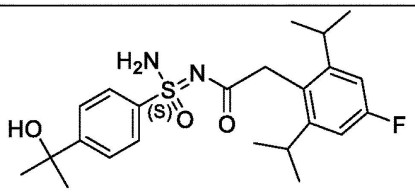
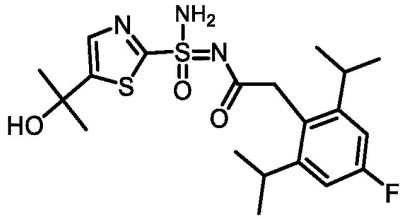
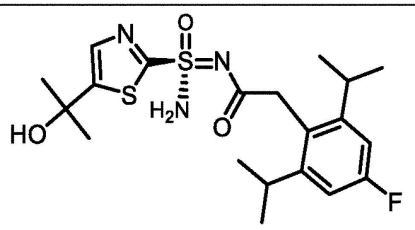
【表１４３】

117	
118	
119	
120	
121	
122	
123	

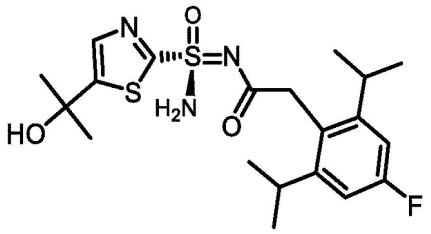
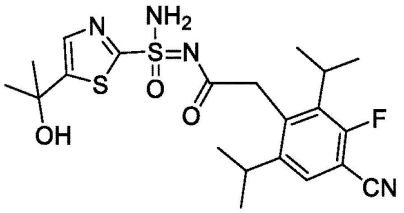
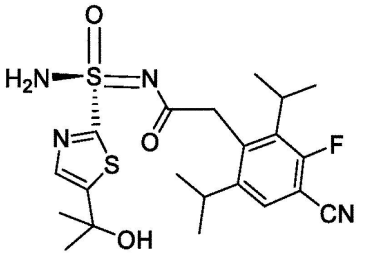
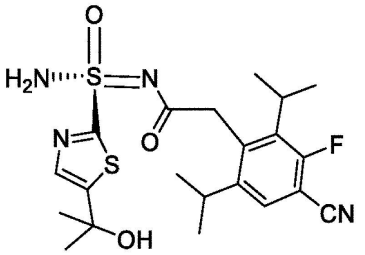
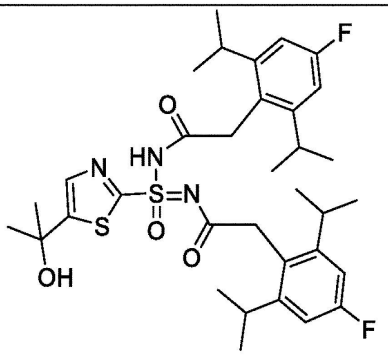
【表１４４】

124	
125	
126	
127	
128	
129	
129a	

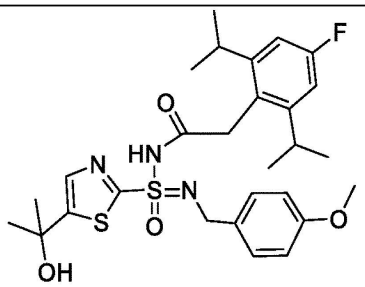
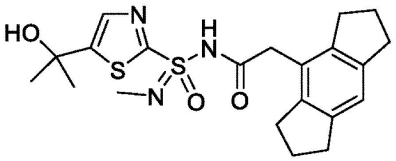
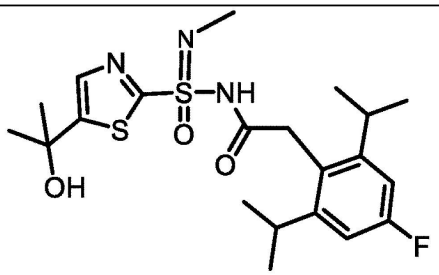
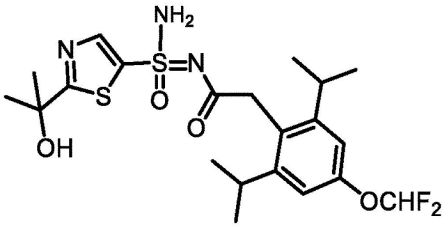
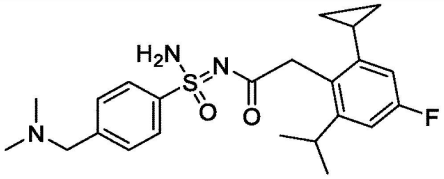
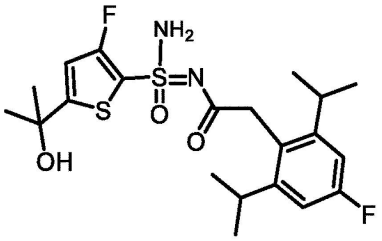
【表１４５】

129b	
130	
131	
131a	
131b	
132	
132a	

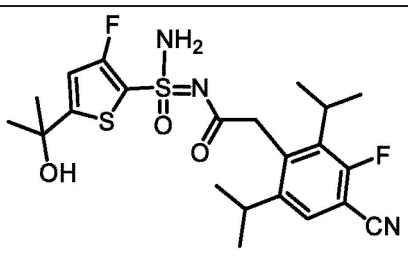
【表１４６】

132b	
133	
133a	
133b	
134	

【表１４７】

135	
136	
137	
138	
139	
140	

【表１４８】

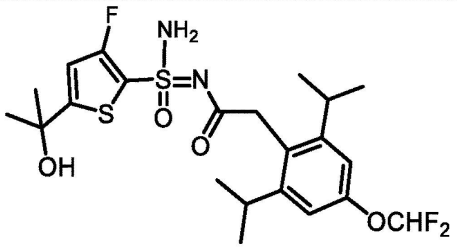
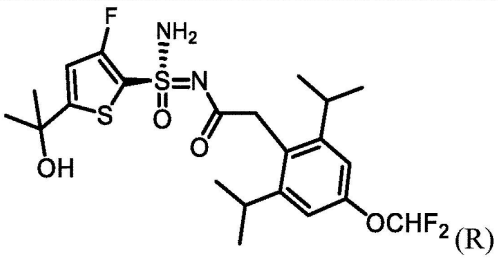
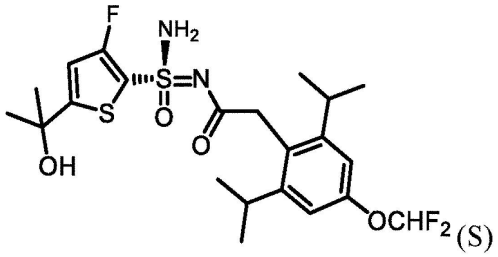
141	

からなる群から選択される化合物及びその薬学的に許容される塩。

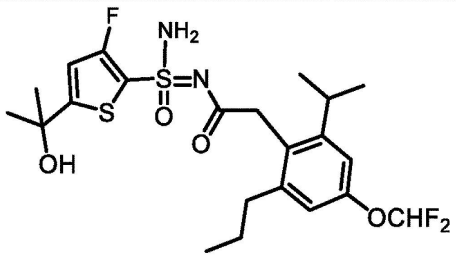
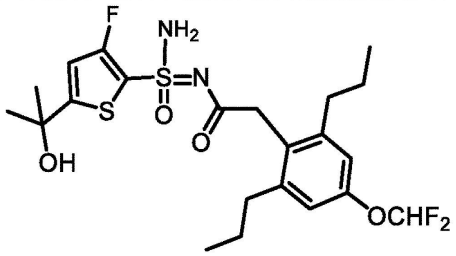
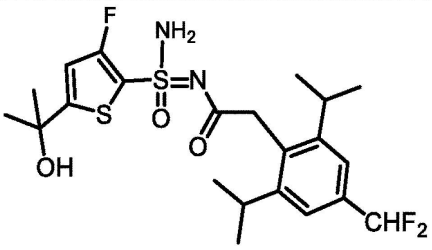
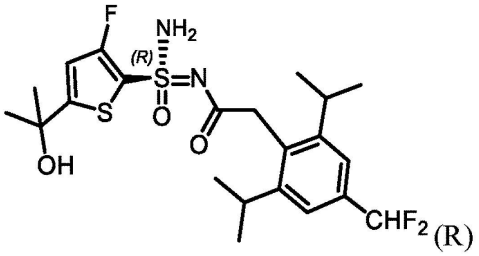
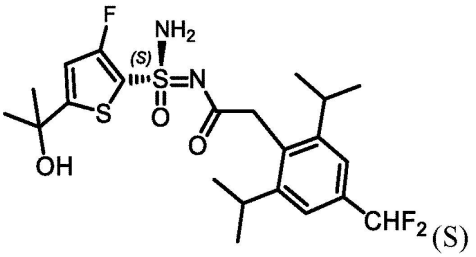
［８４］

以下の化合物：

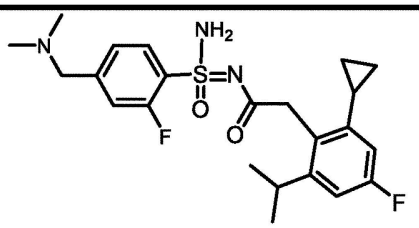
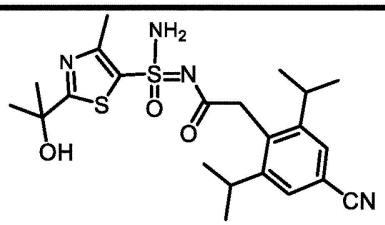
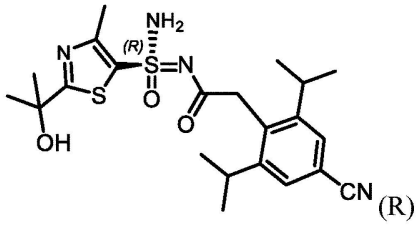
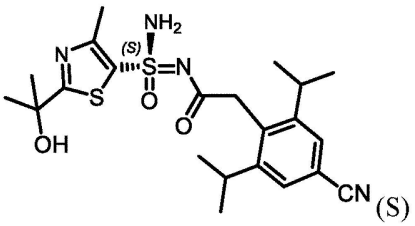
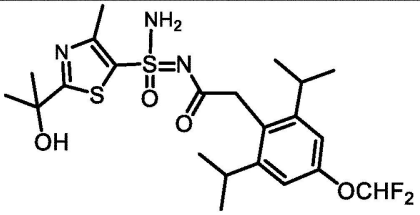
【表１４９】

化合物	構造
101	
101a	
101b	

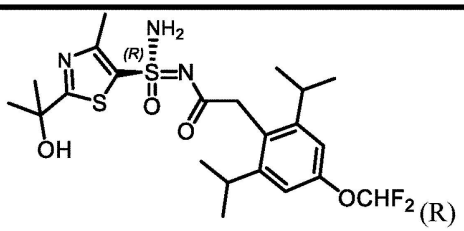
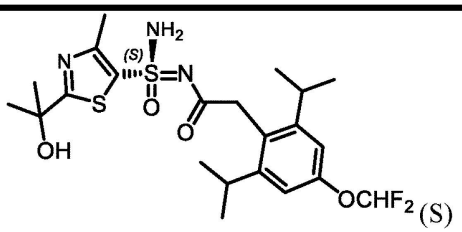
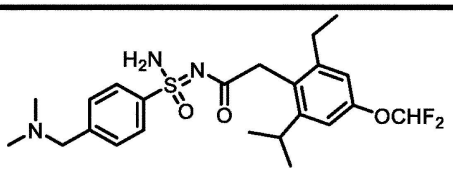
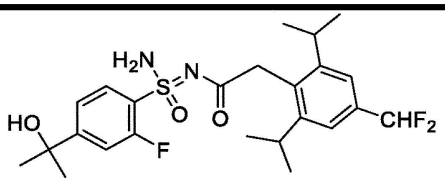
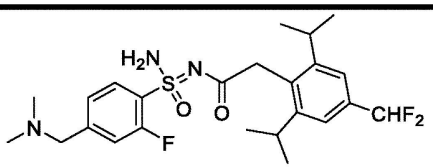
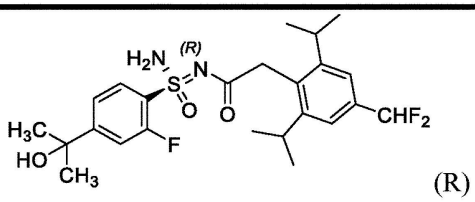
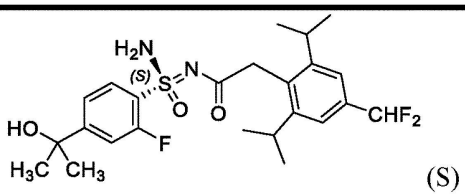
【表１５０】

102	
103	
104	
104a	
104b	

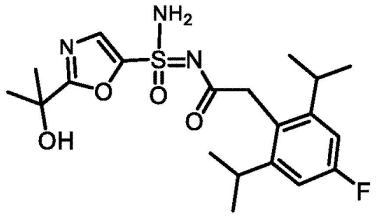
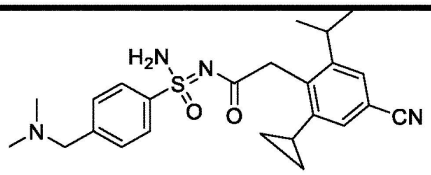
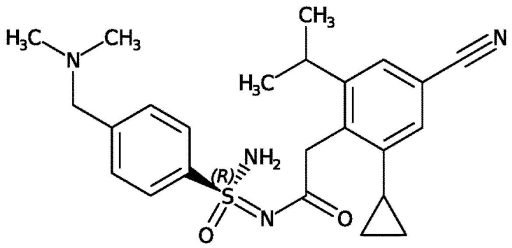
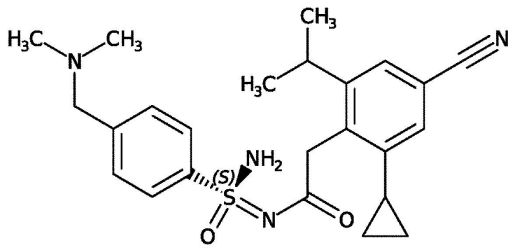
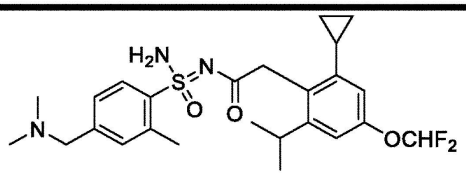
【表１５１】

105	
106	
106a	
106b	
107	

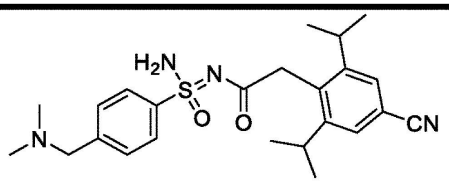
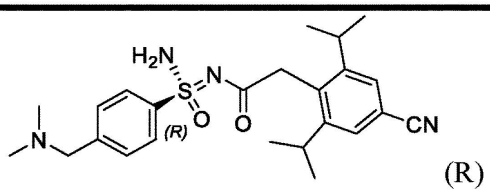
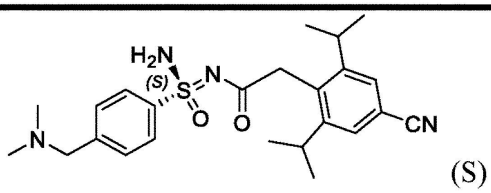
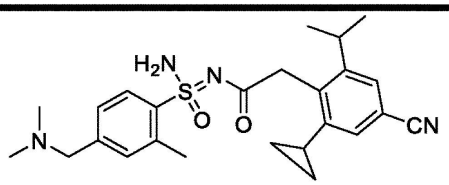
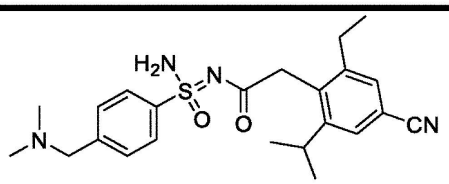
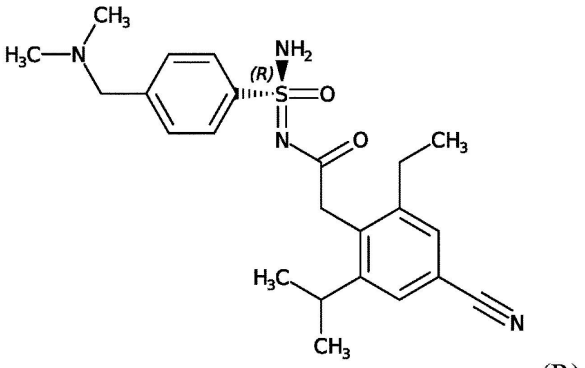
【表１５２】

107a	
107b	
108	
109	
110	
110a	
110b	

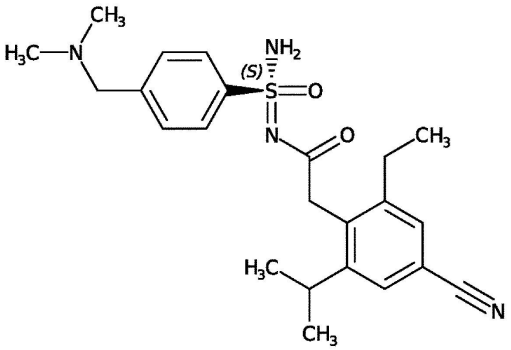
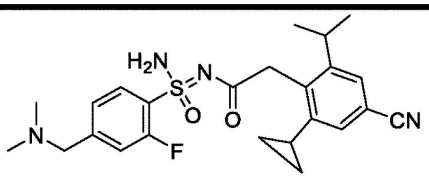
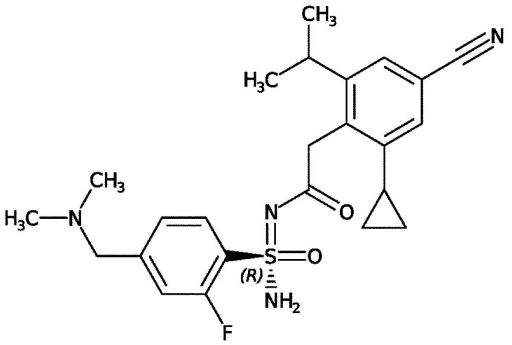
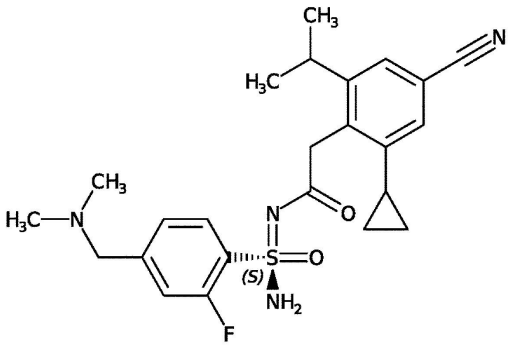
【表１５３】

111	
112	
112a	 (R)
112b	 (S)
113	

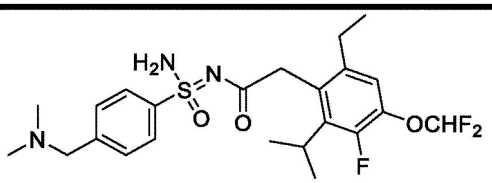
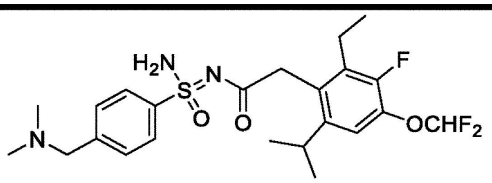
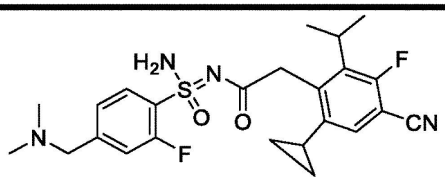
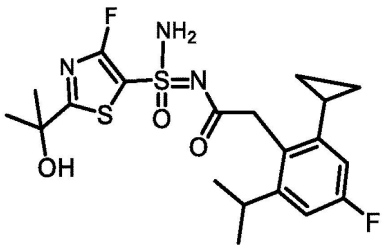
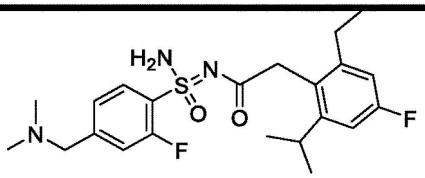
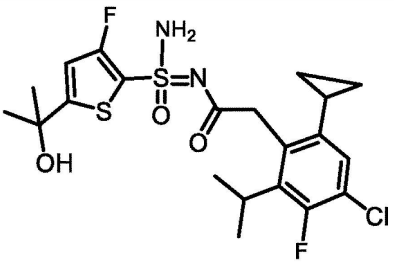
【表１５４】

114	
114a	 (R)
114b	 (S)
115	
116	
116a	 (R)

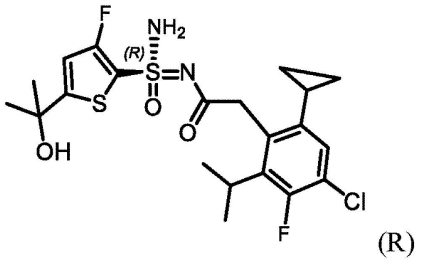
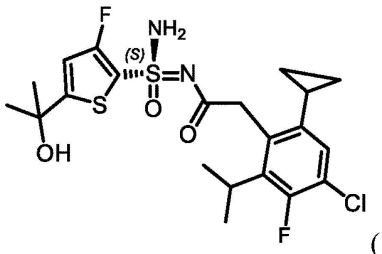
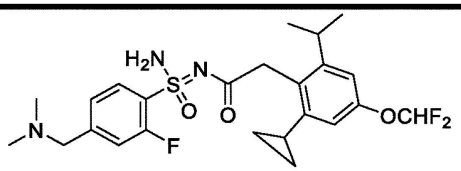
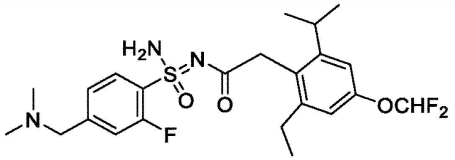
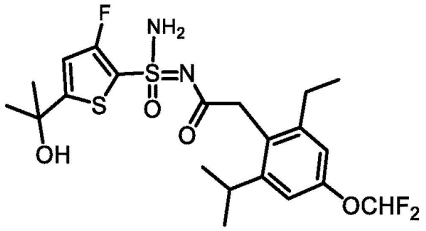
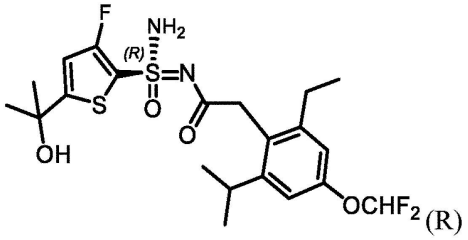
【表１５５】

116b	 (S)
117	
117a	 (R)
117b	 (S)

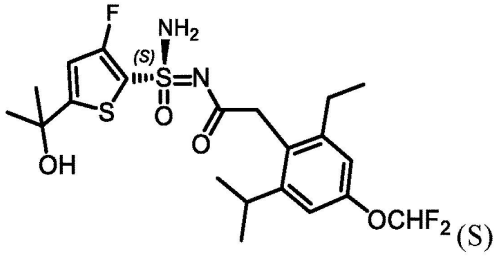
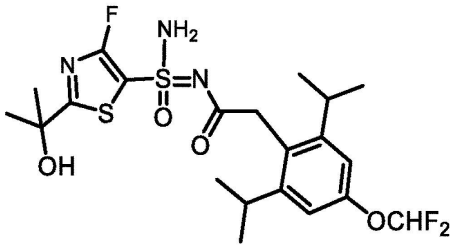
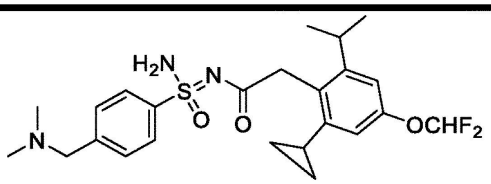
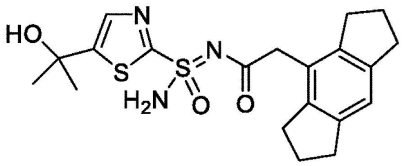
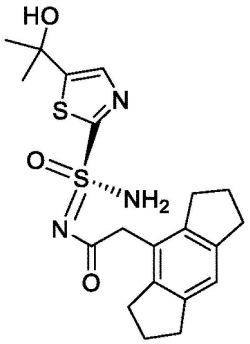
【表１５６】

118	
119	
120	
121	
122	
123	

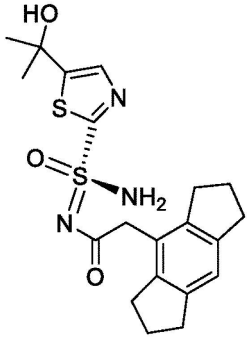
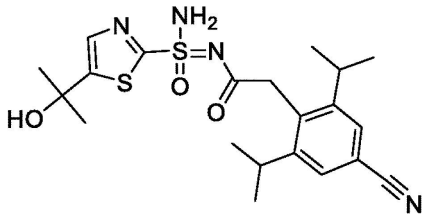
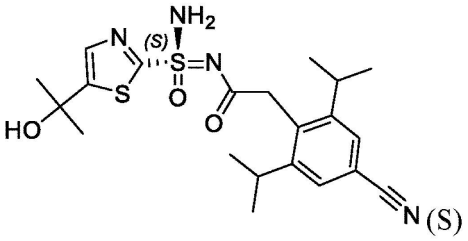
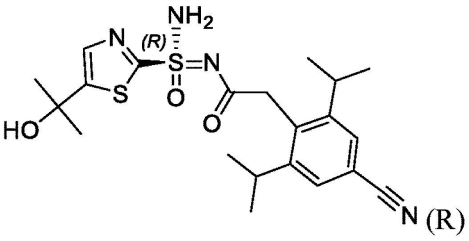
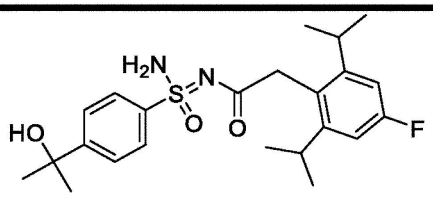
【表１５７】

123a	 (R)
123b	 (S)
124	
125	
126	
126a	 (R)

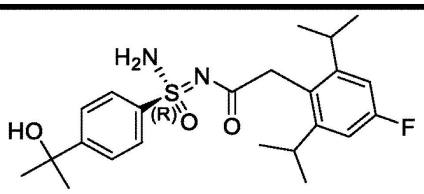
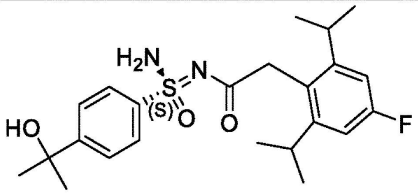
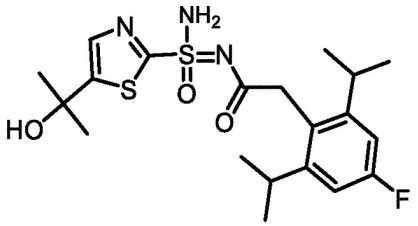
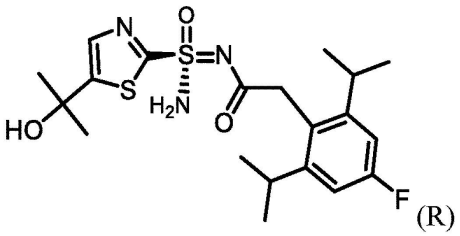
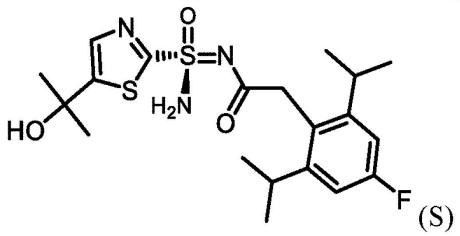
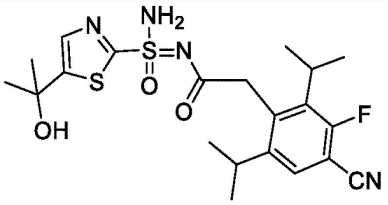
【表１５８】

126b	
127	
128	
129	
129a	

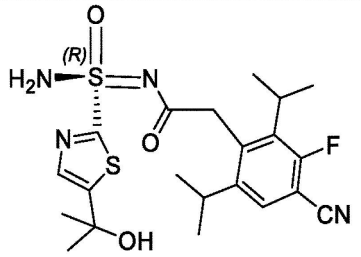
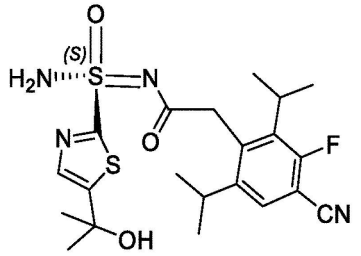
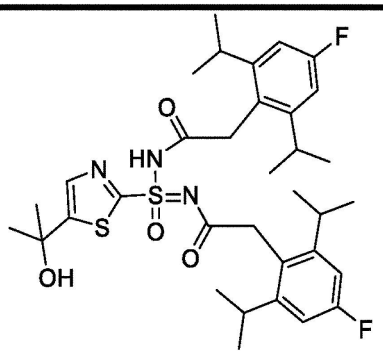
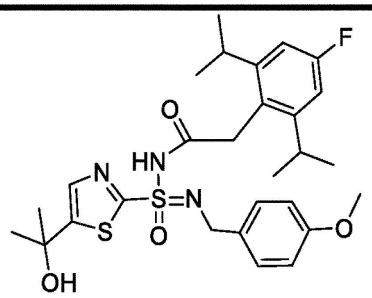
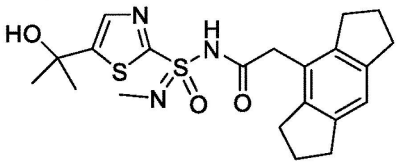
【表１５９】

129b	
130	
130a	
130b	
131	

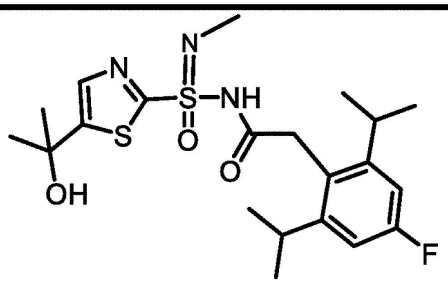
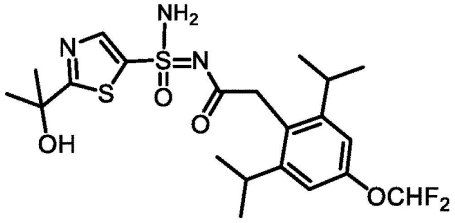
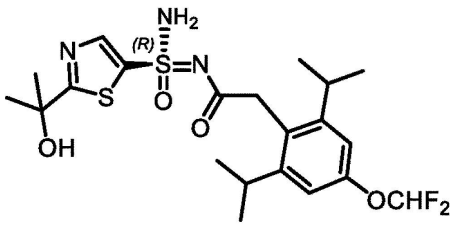
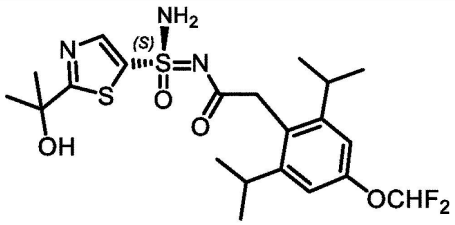
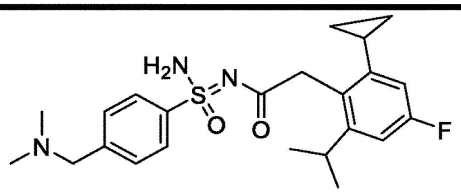
【表１６０】

131a	
131b	
132	
132a	
132b	
133	

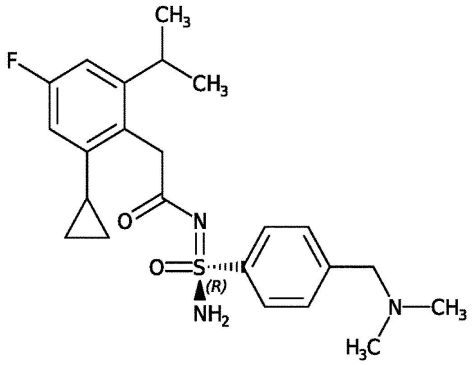
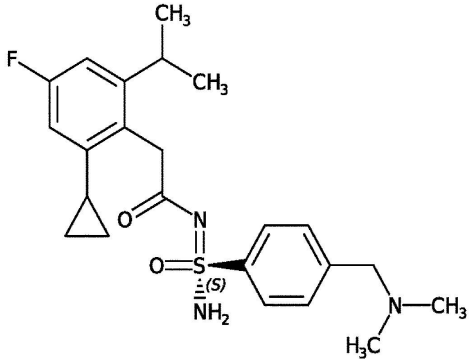
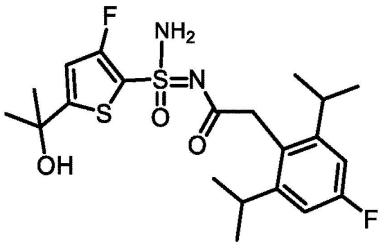
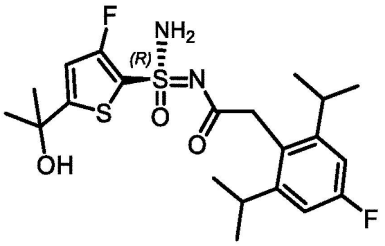
【表１６１】

133a	
133b	
134	
135	
136	

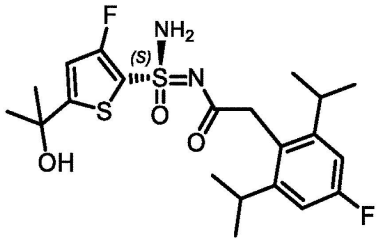
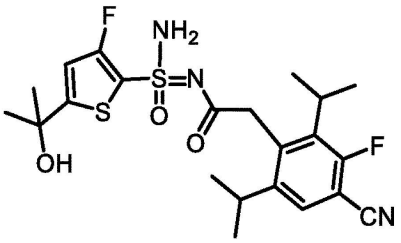
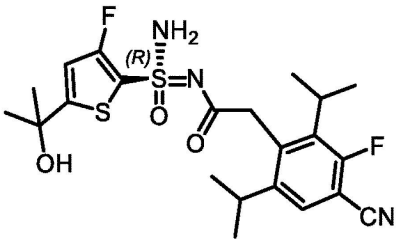
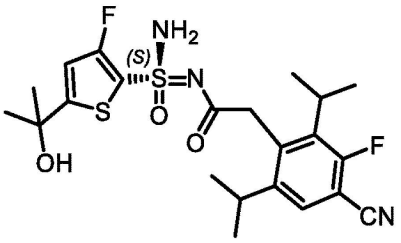
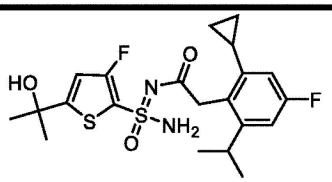
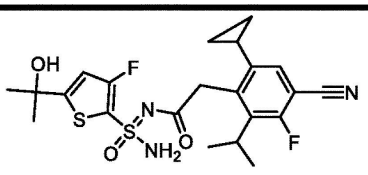
【表１６２】

137	
138	
138a	
138b	
139	

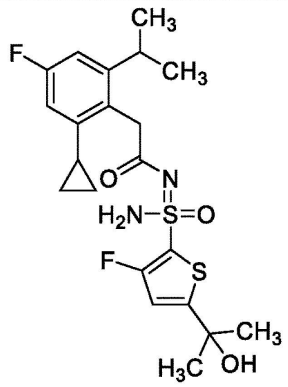
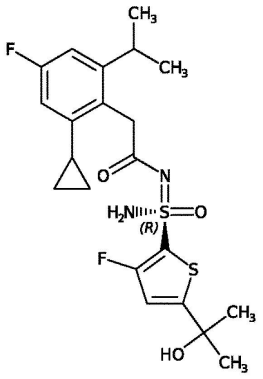
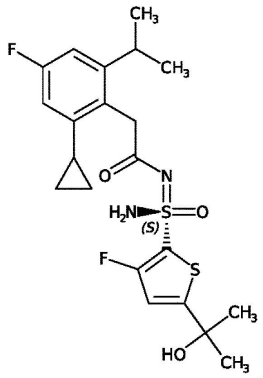
【表１６３】

139a	
139b	
140	
140a	

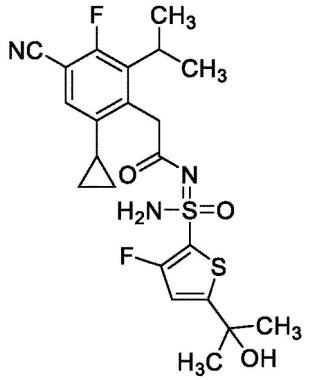
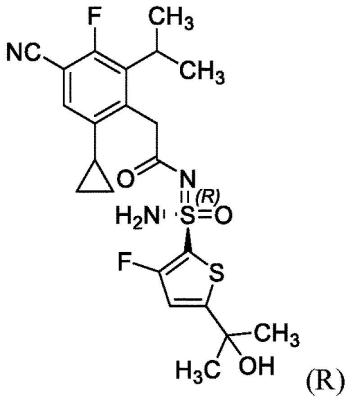
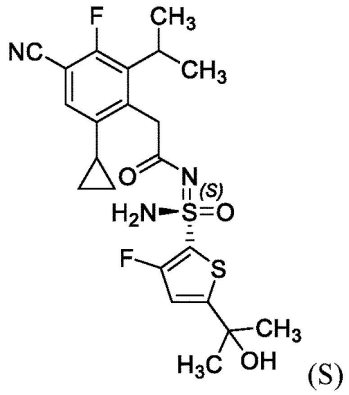
【表１６４】

140b	
141	
141a	
141b	
142	
143	

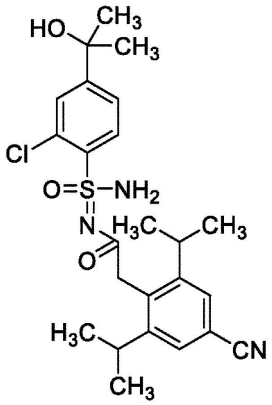
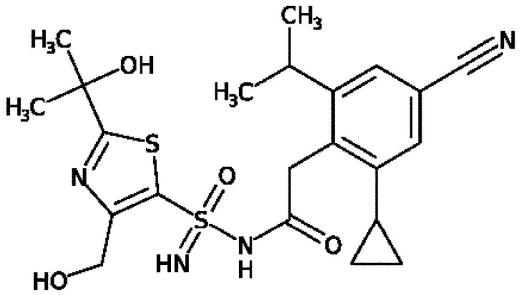
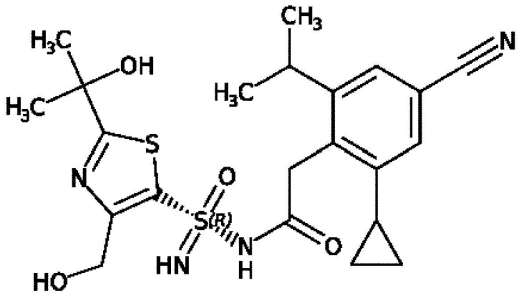
【表１６５】

144	
144a	 (R)
144b	 (S)

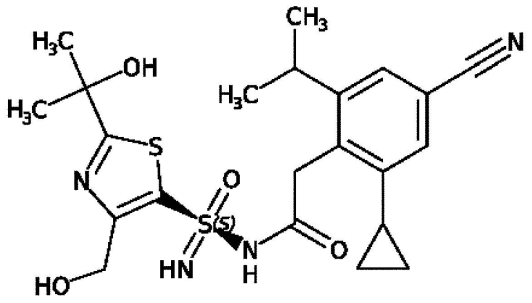
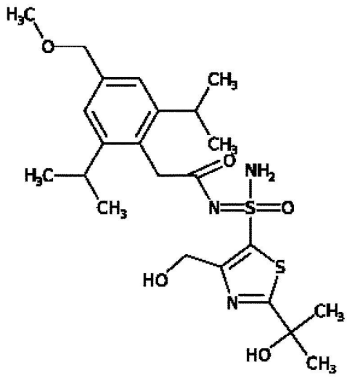
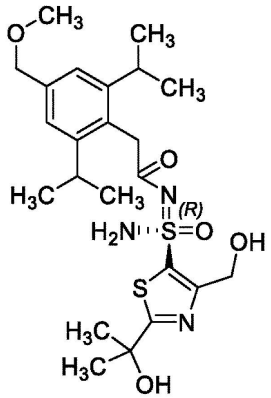
【表１６６】

145	
145a	 (R)
145b	 (S)

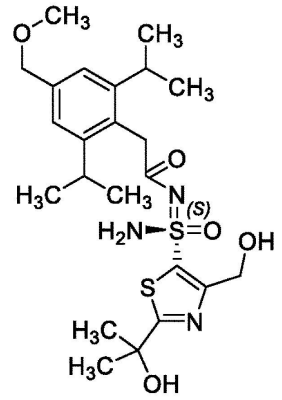
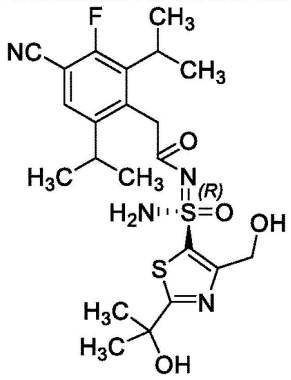
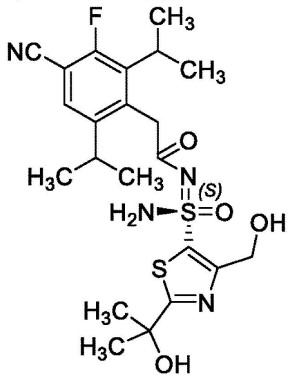
【表１６７】

146	
147	
147a	

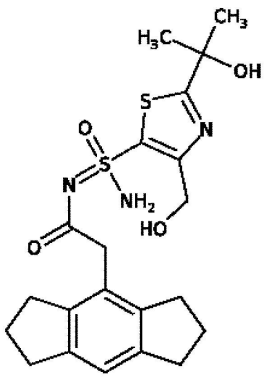
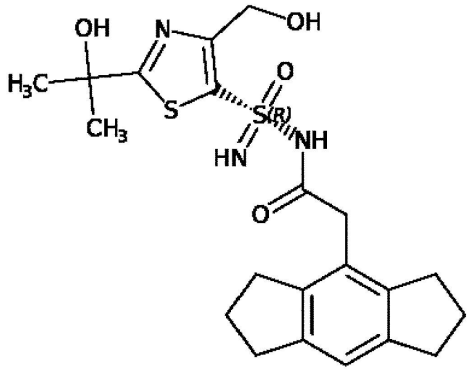
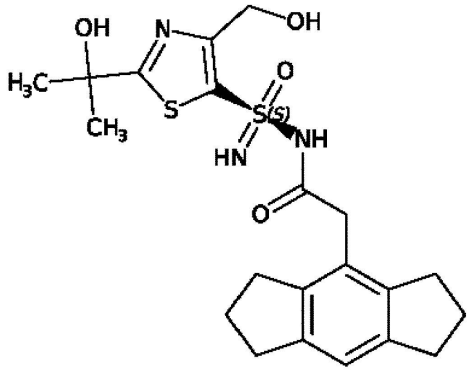
【表１６８】

147b	
148	
148a	

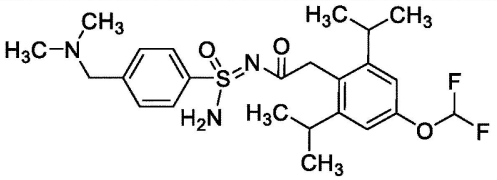
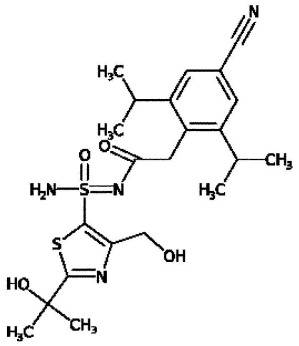
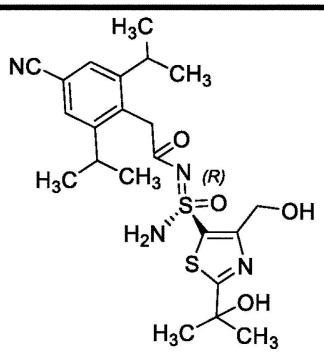
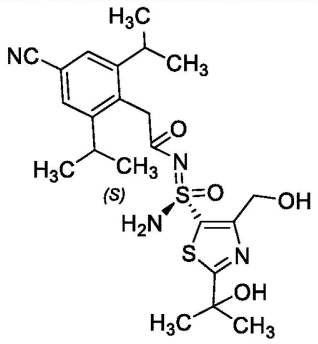
【表１６９】

148b	
149a	
149b	

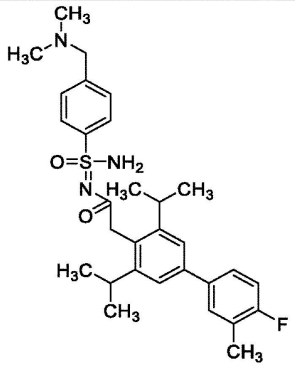
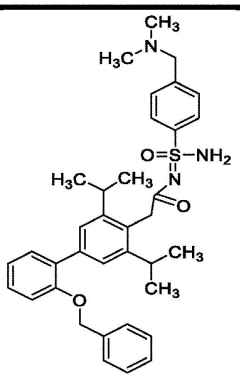
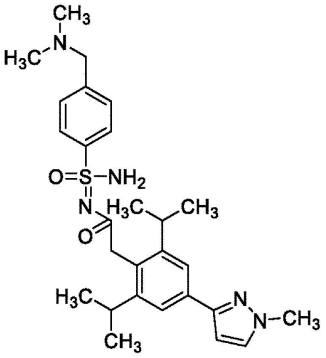
【表１７０】

150	
150a	
150b	

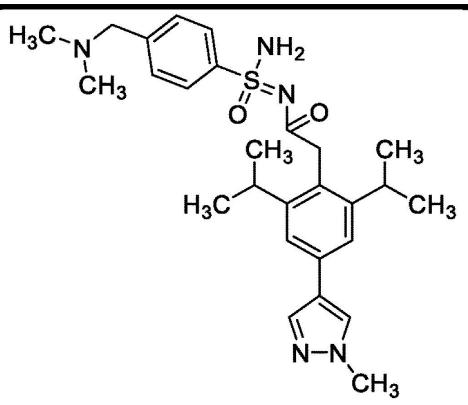
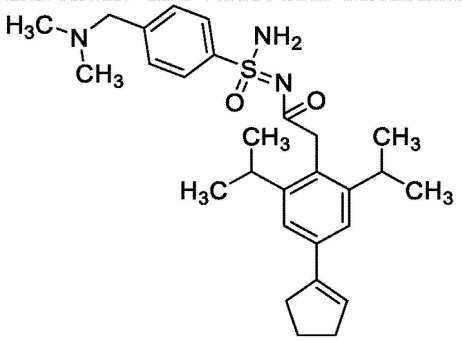
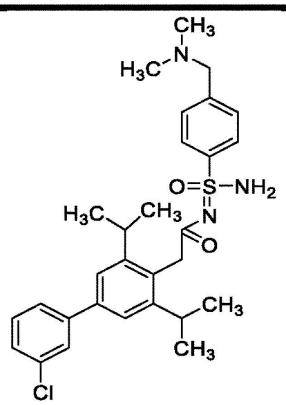
【表１７１】

151	
152	
152a	
152b	

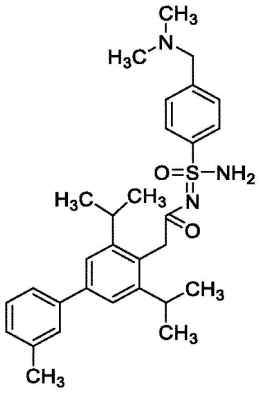
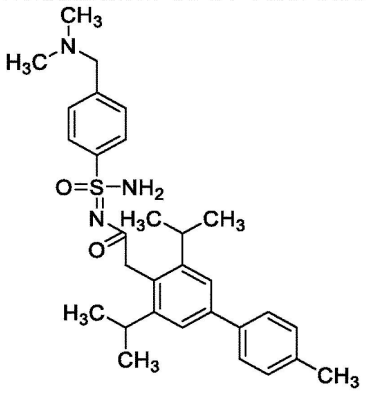
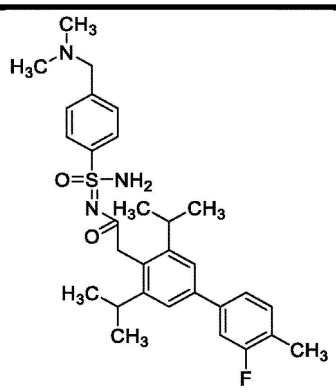
【表１７２】

153	
154	
155	

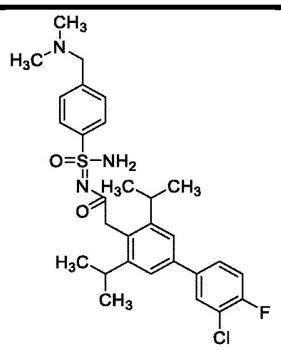
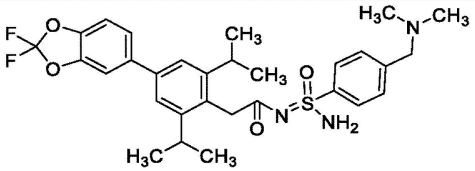
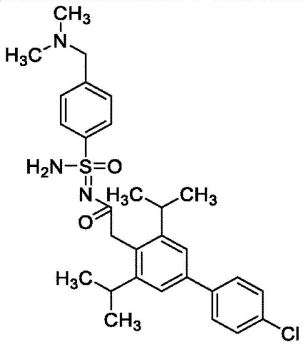
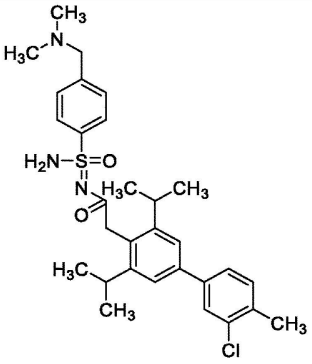
【表１７３】

158	
159	
160	

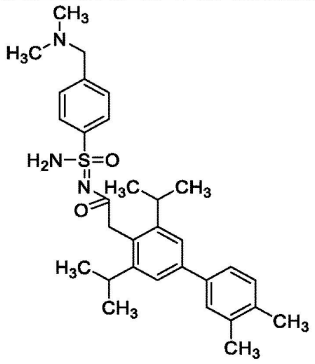
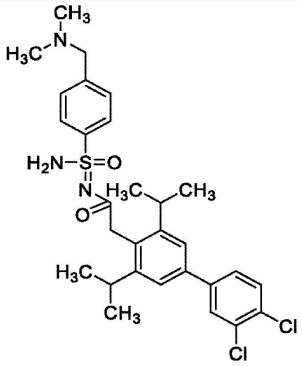
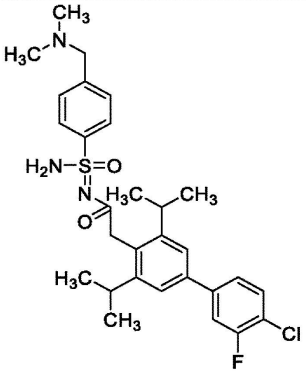
【表１７４】

161	
162	
163	

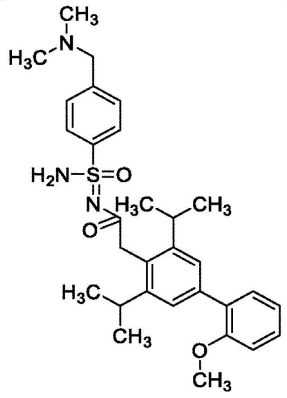
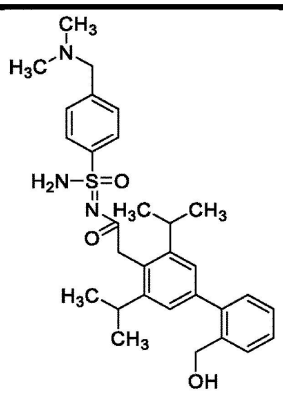
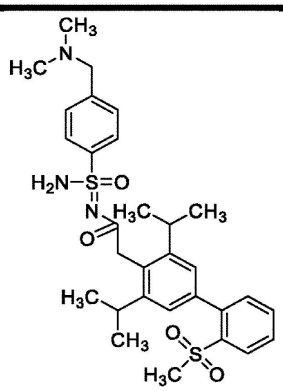
【表１７５】

164	
165	
168	
169	

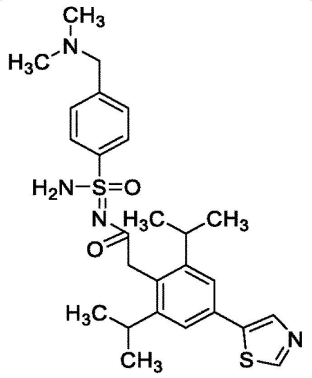
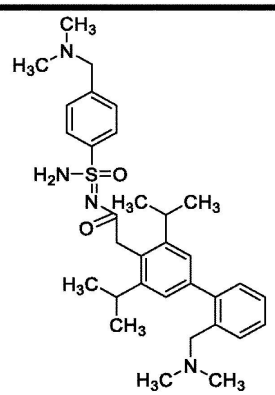
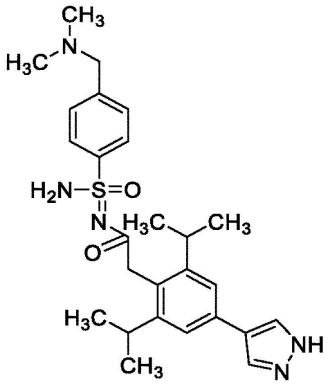
【表１７６】

170	
171	
172	

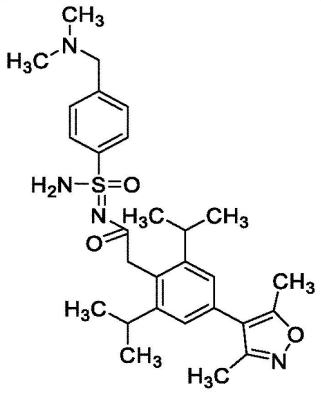
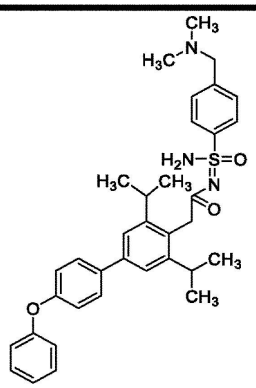
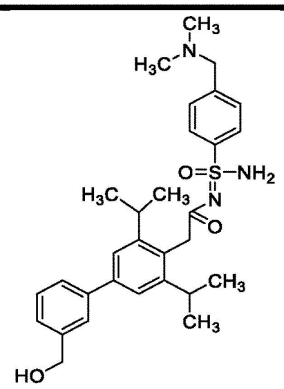
【表１７７】

173	
176	
177	

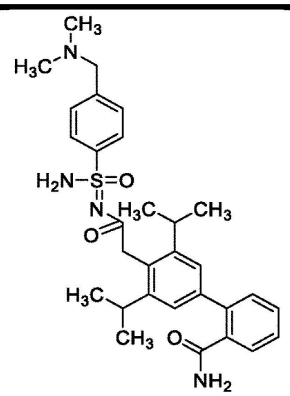
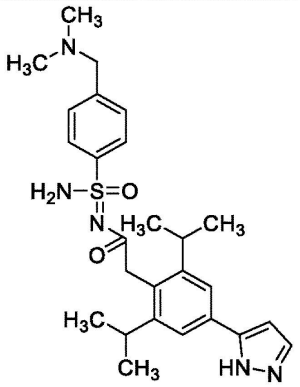
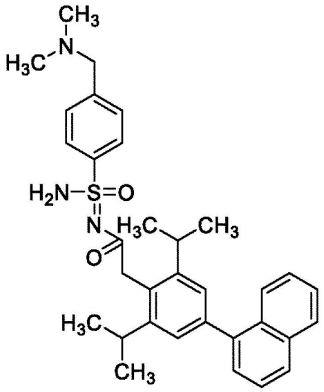
【表１７８】

178	
180	
181	

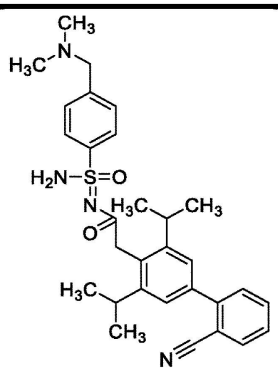
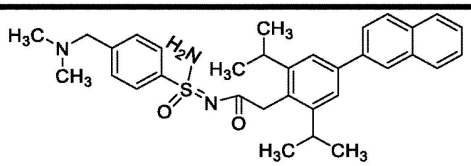
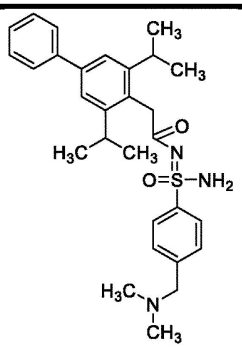
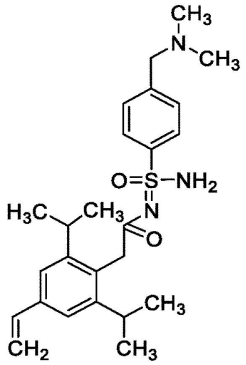
【表１７９】

182	
183	
184	

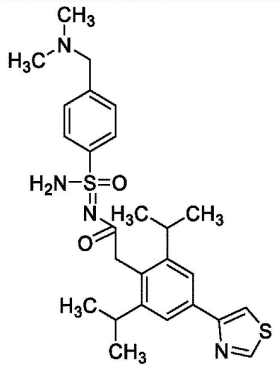
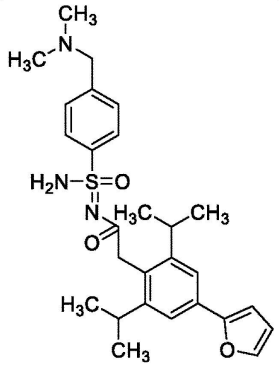
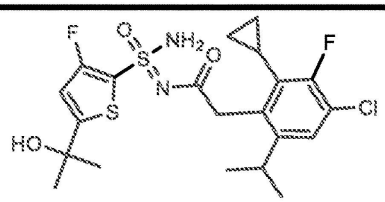
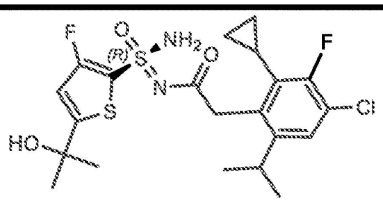
【表１８０】

185	
186	
189	

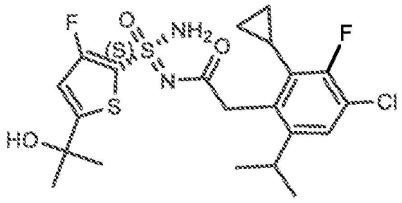
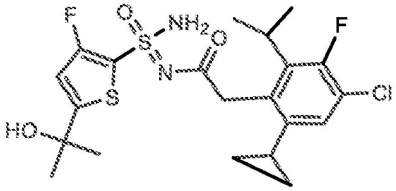
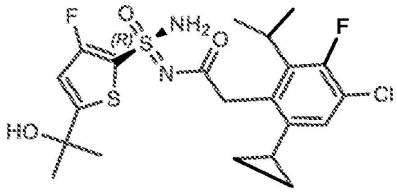
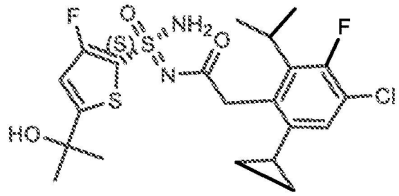
【表１８１】

190	
191	
192	
194	

【表１８２】

195	
196	
197	
197a	 (R)

【表１８３】

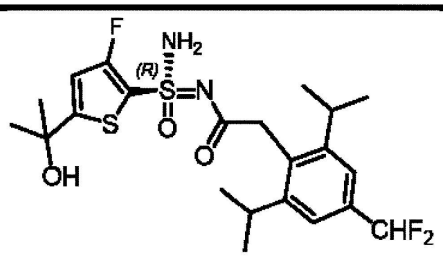
197b	 (S)
198	
198a	 (R)
198b	 (S)

からなる群から選択される化合物及びその薬学的に許容される塩。

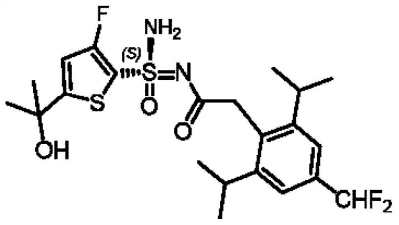
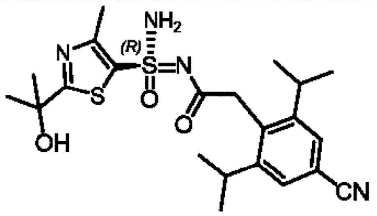
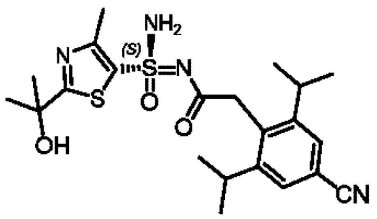
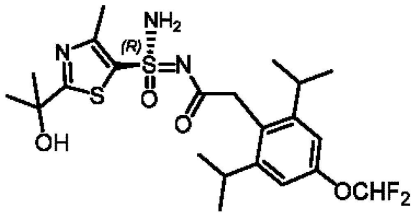
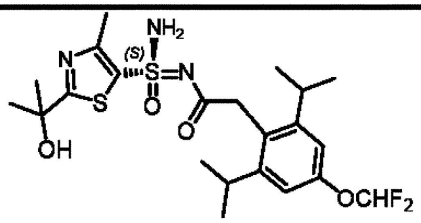
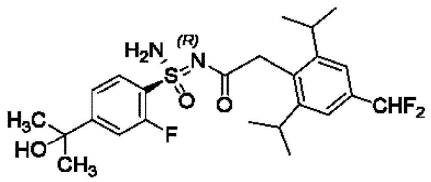
［８５］

以下の化合物：

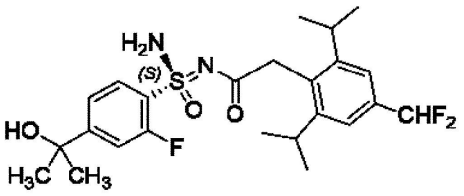
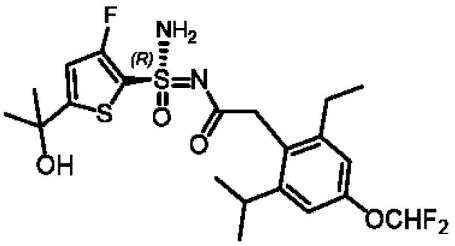
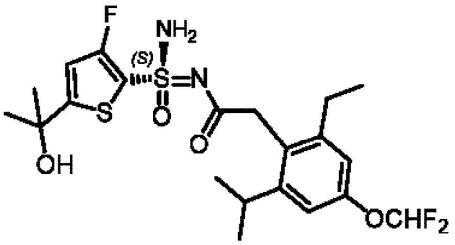
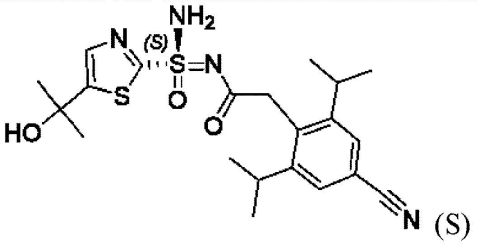
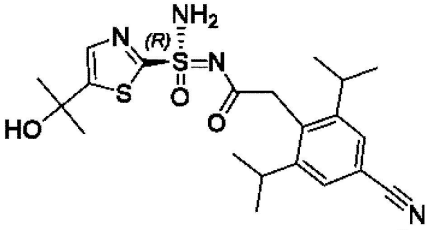
【表１８４】

化合物	構造
104a	

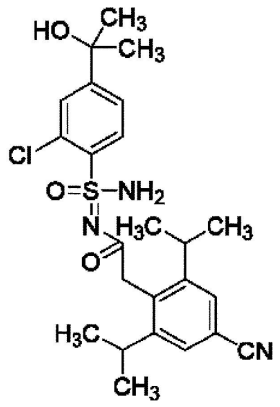
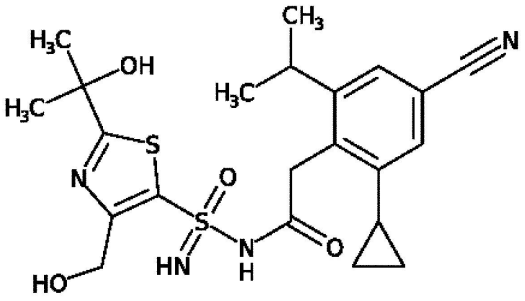
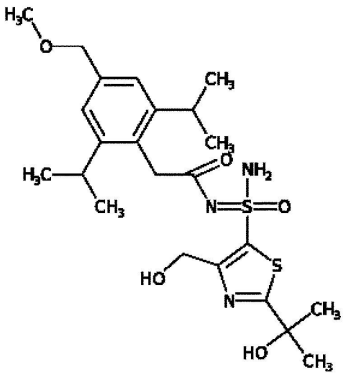
【表１８５】

104b	
106a	
106b	
107a	
107b	
110a	 (R)

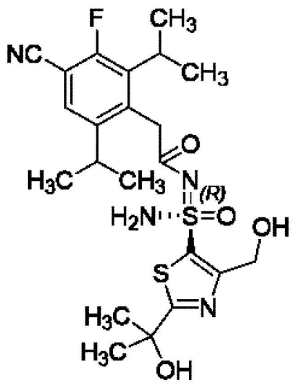
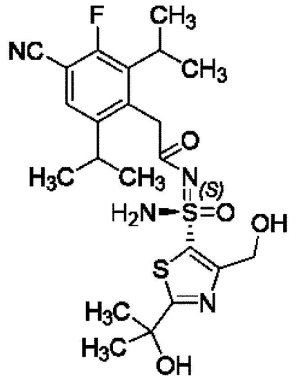
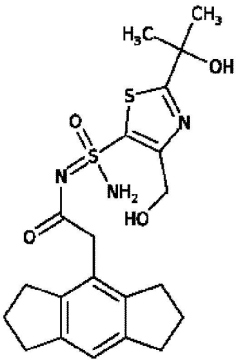
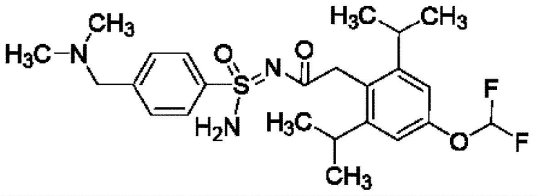
【表１８６】

110b	
126a	
126b	
130a	
130b	

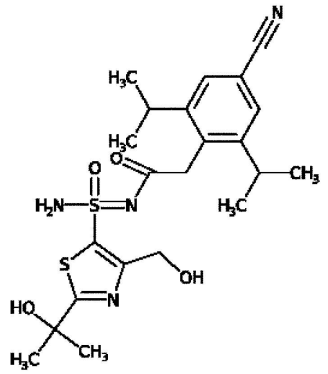
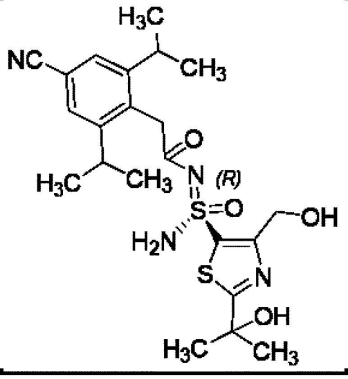
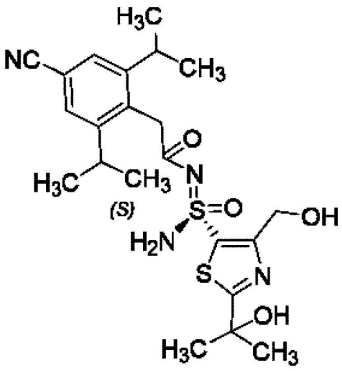
【表１８７】

146	
147	
148	

【表１８８】

149a	
149b	
150	
151	

【表１８９】

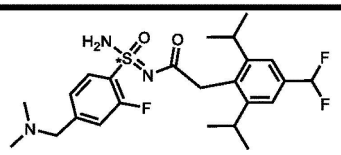
152	
152a	
152b	

からなる群から選択される化合物及びその薬学的に許容される塩。

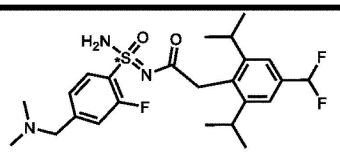
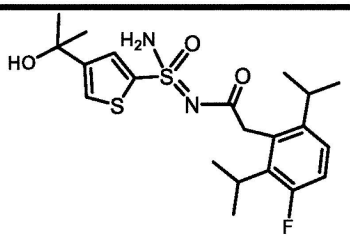
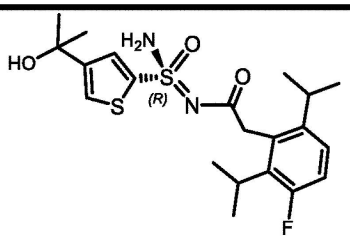
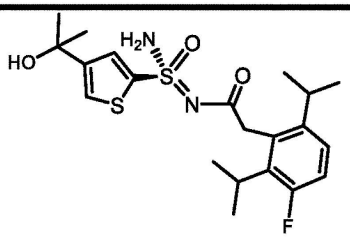
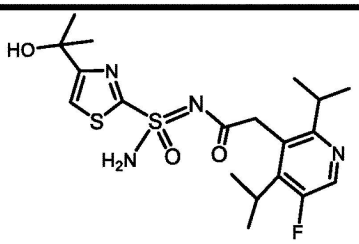
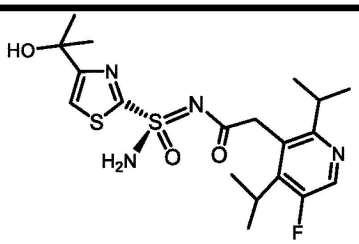
［８６］

以下の化合物：

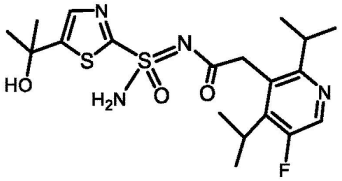
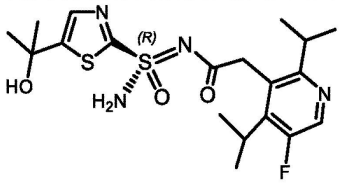
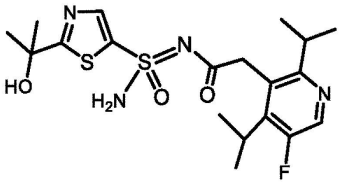
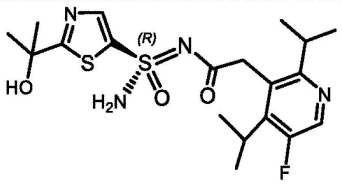
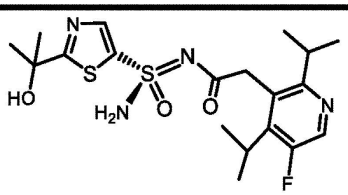
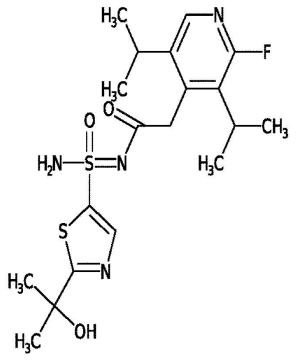
【表１９０】

110a’	

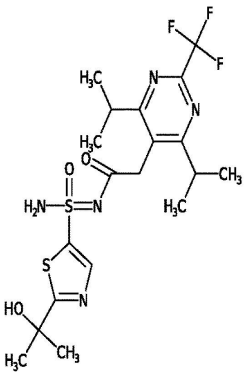
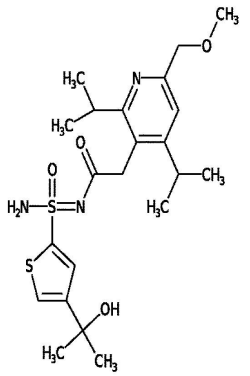
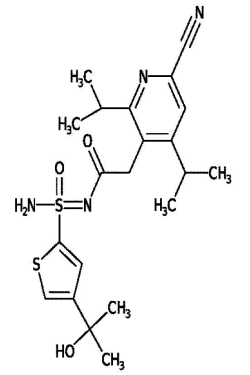
【表１９１】

110b’	
201	
201b	
201a	
202	
202a	

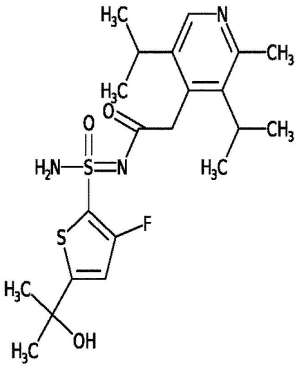
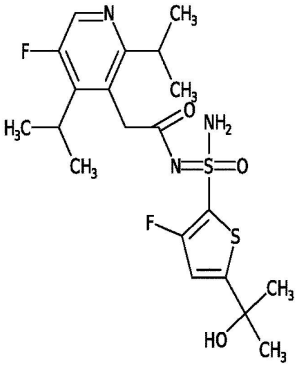
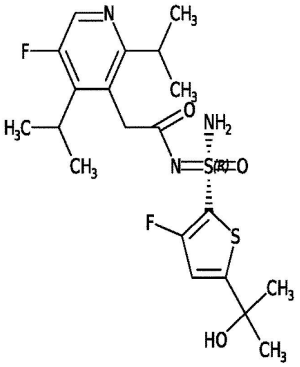
【表１９２】

203	
203b	
204	
204b	
204a	
205	

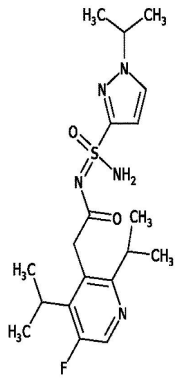
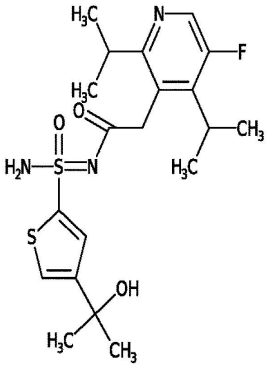
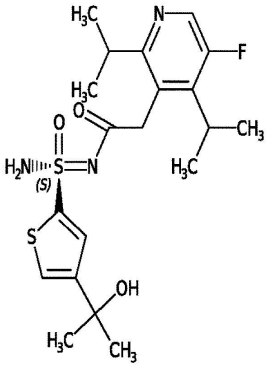
【表１９３】

206	
207	
208	

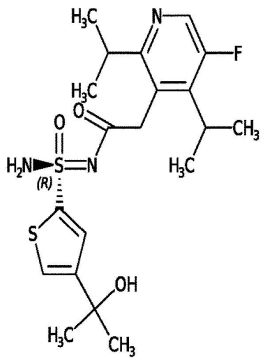
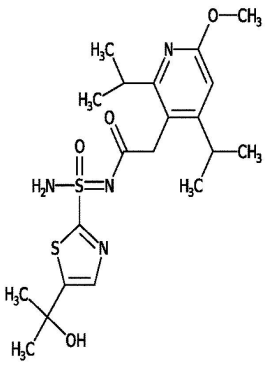
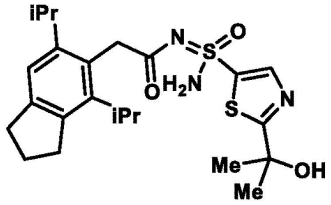
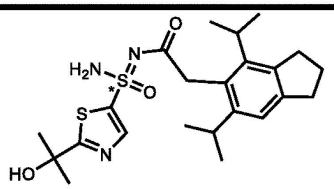
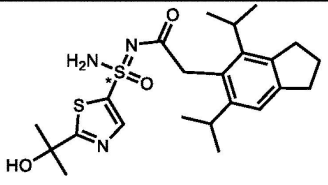
【表１９４】

209	
210	
210b	

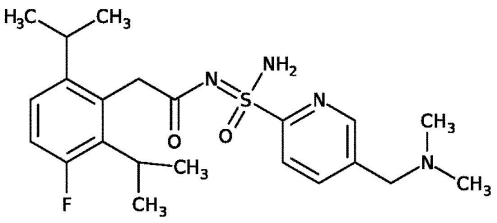
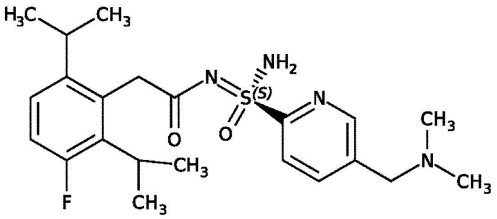
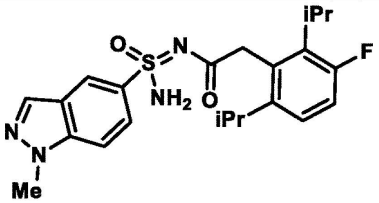
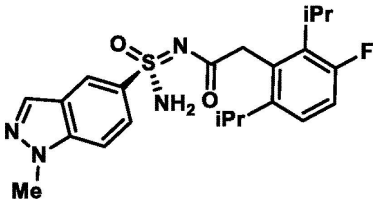
【表１９５】

211	
213	
213a	

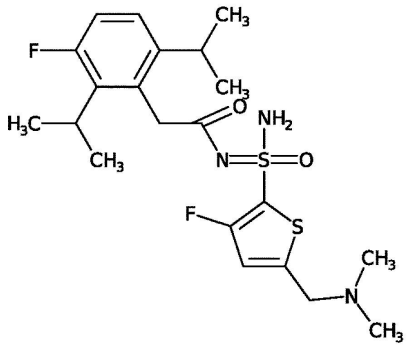
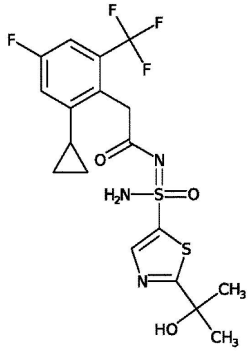
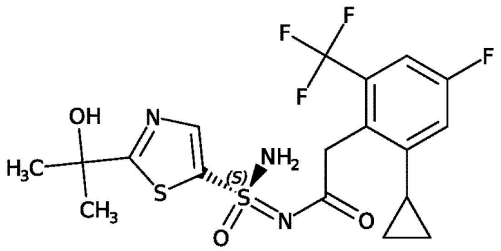
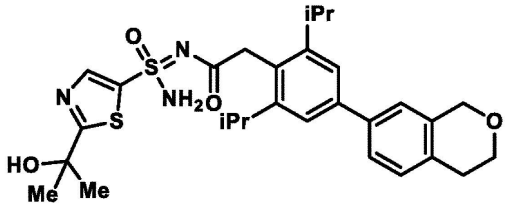
【表１９６】

213b	
215	
216	
216a	
216b	

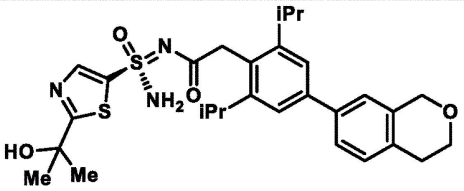
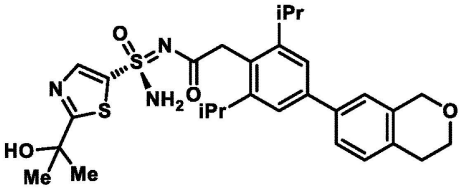
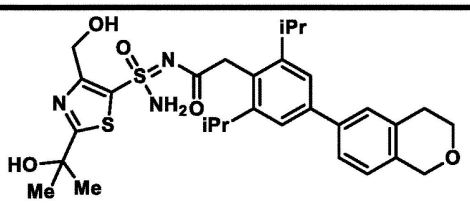
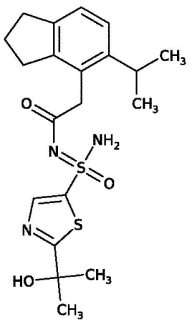
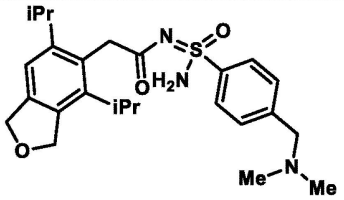
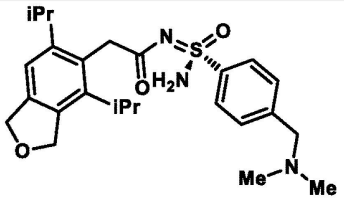
【表１９７】

217	
217a	
218	
218a	

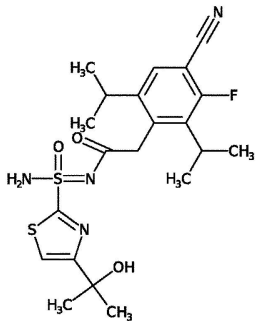
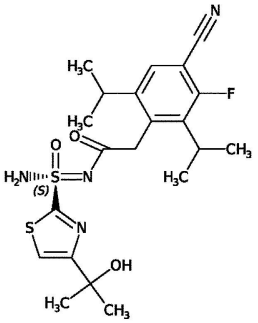
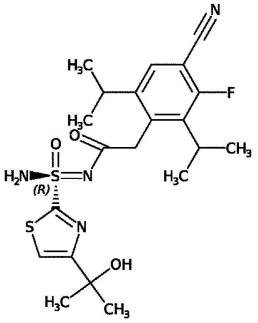
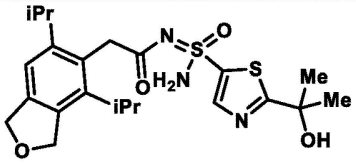
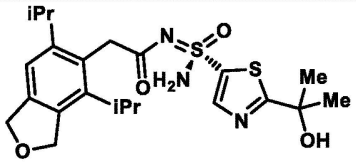
【表１９８】

219	
220	
220a	
221	

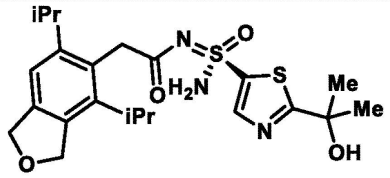
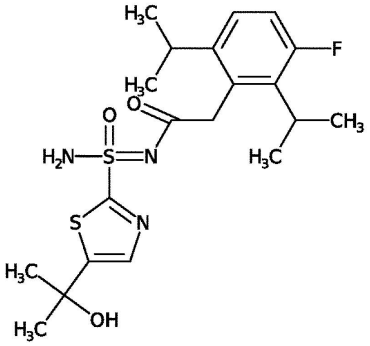
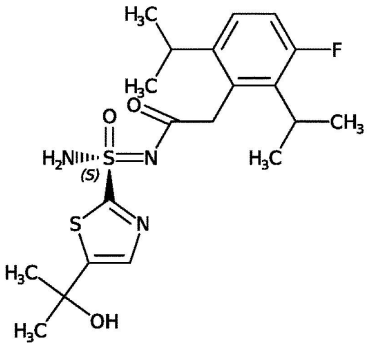
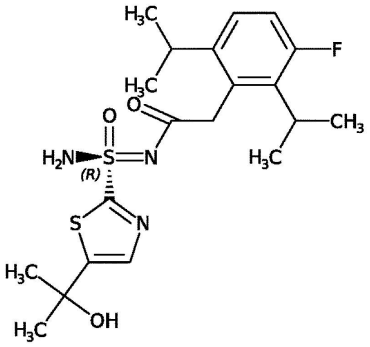
【表１９９】

221a	
221b	
222	
224	
225	
225a	

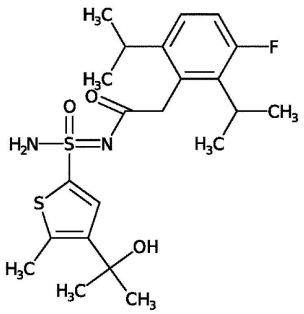
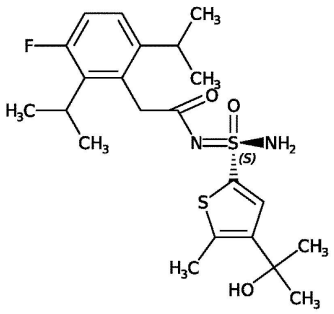
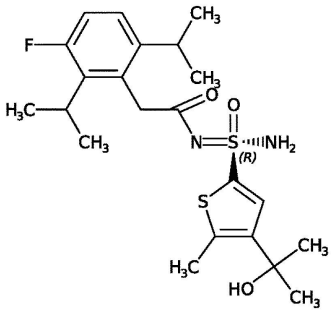
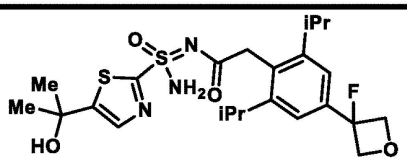
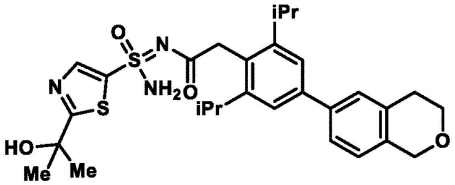
【表２００】

226	
226a	
226b	
227	
227a	

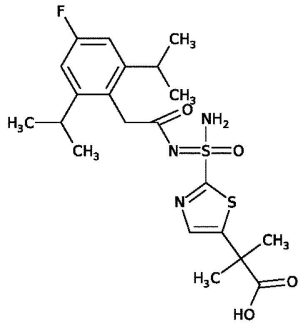
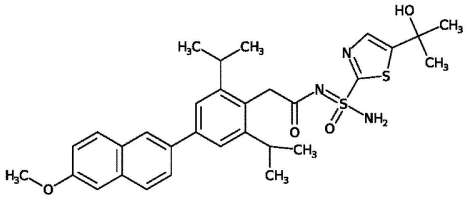
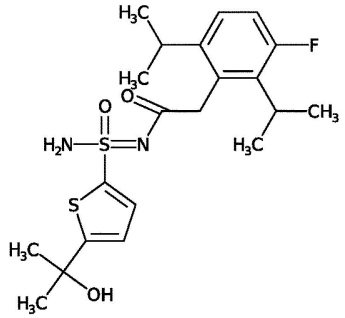
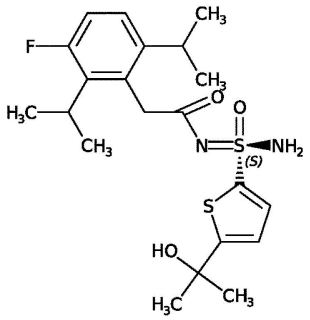
【表２０１】

227b	
228	
228a	
228b	

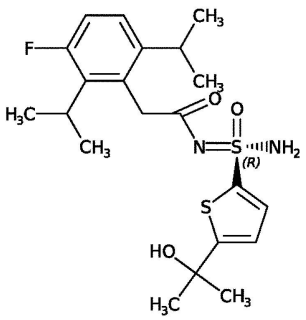
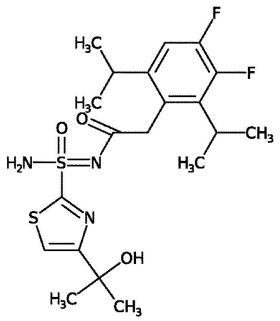
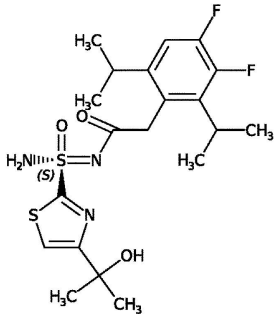
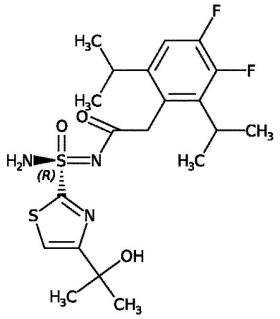
【表２０２】

229	
229a	
229b	
230	
231	

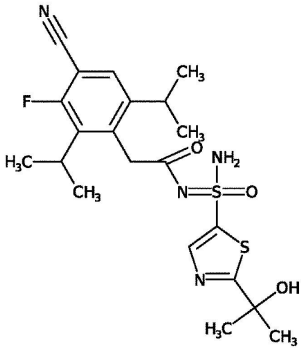
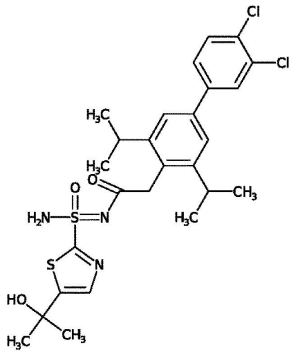
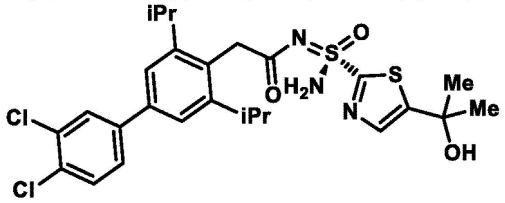
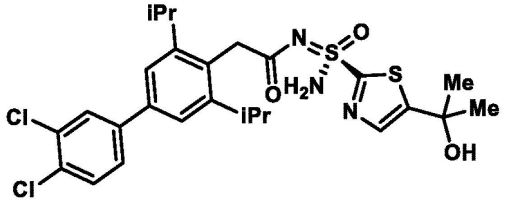
【表２０３】

232	
233	
234	
234a	

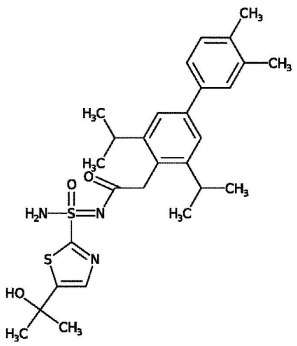
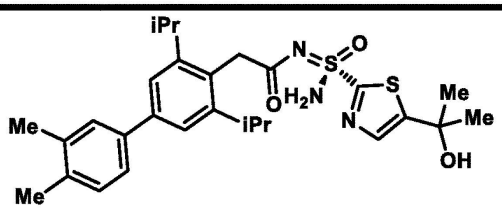
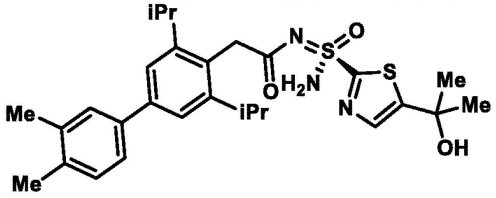
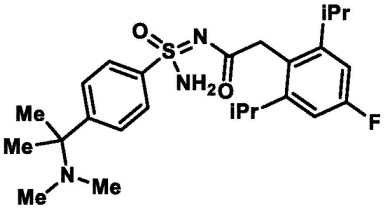
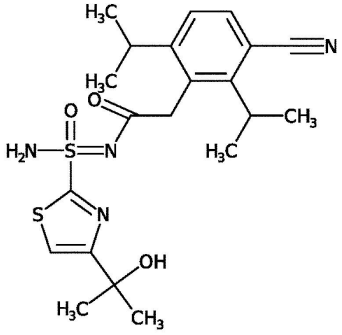
【表２０４】

234b	
236	
236a	
236b	

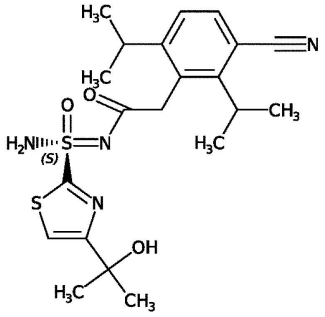
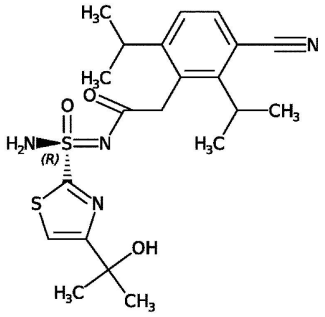
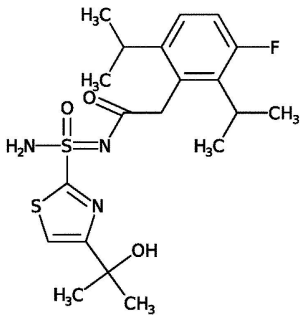
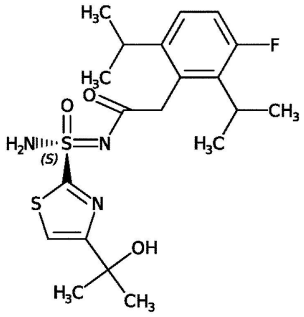
【表２０５】

237	
238	
238a	
238b	

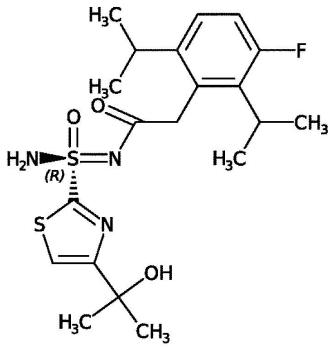
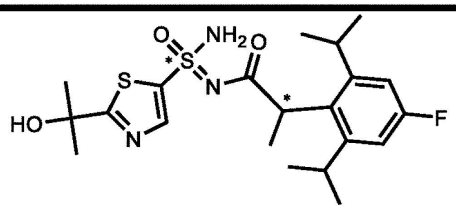
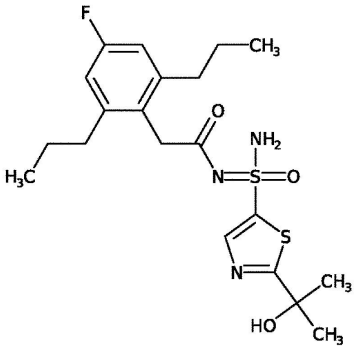
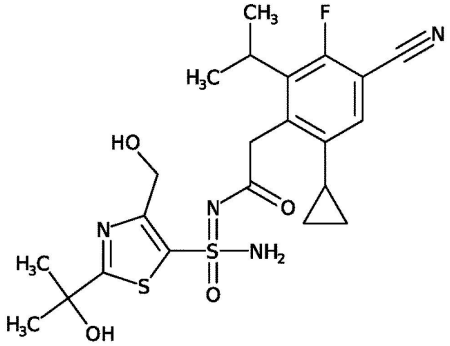
【表２０６】

239	
239a	
239b	
241	
242	

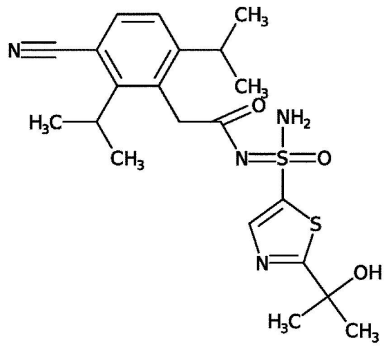
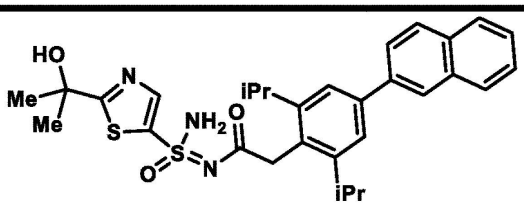
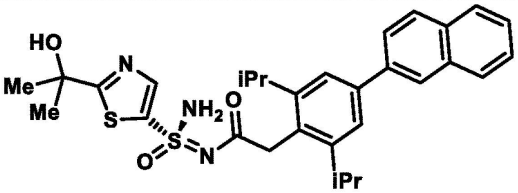
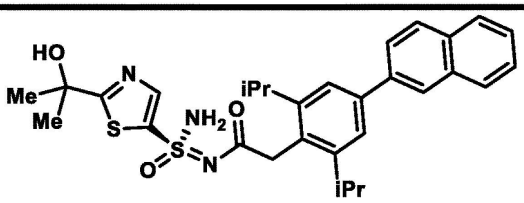
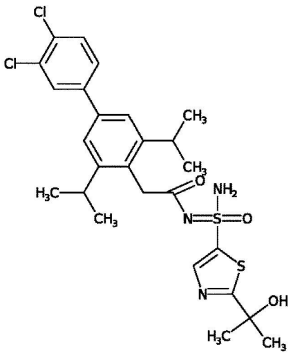
【表２０７】

242a	
242b	
243	
243a	

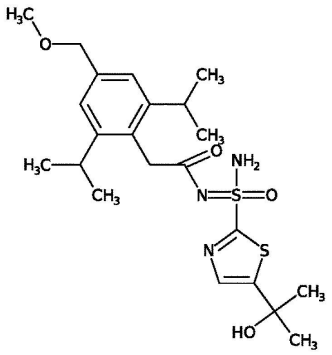
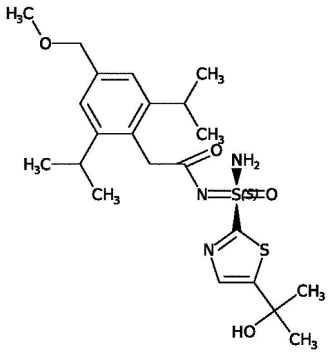
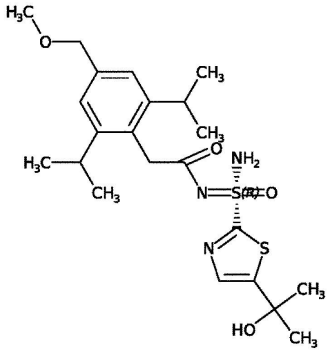
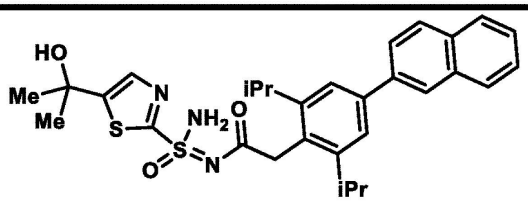
【表２０８】

243b	
244ba	
245	
247	

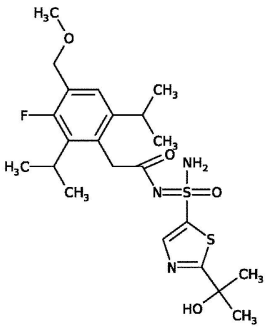
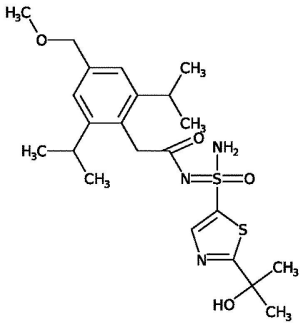
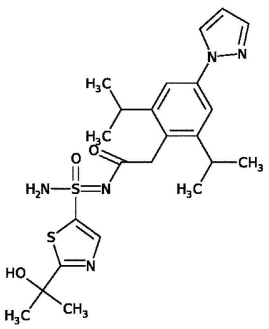
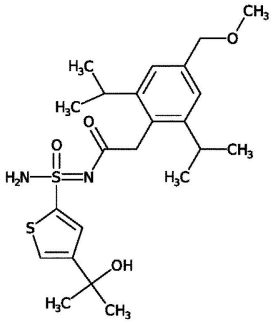
【表２０９】

248	
249	
249a	
249b	
250	

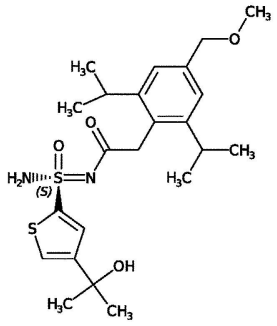
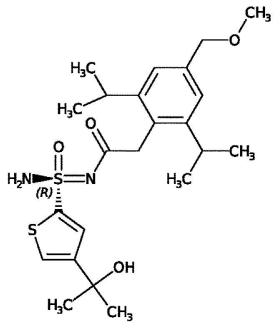
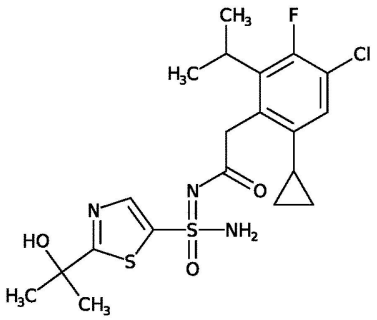
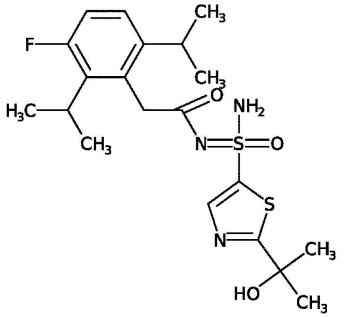
【表２１０】

251	
251a	
251b	
252	

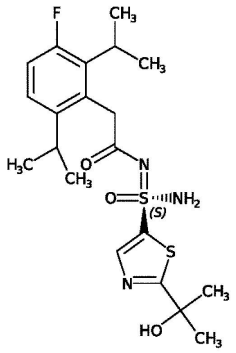
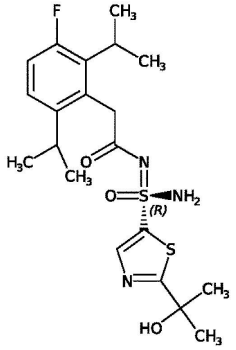
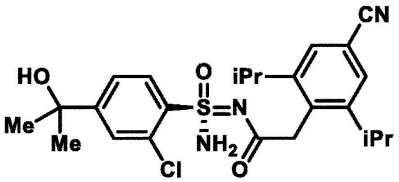
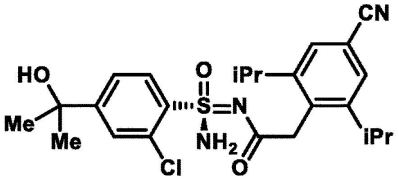
【表２１１】

253	
254	
255	
256	

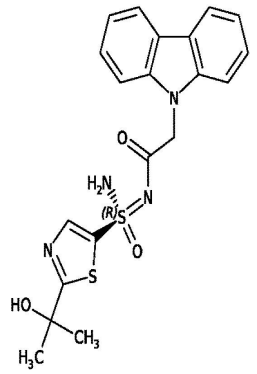
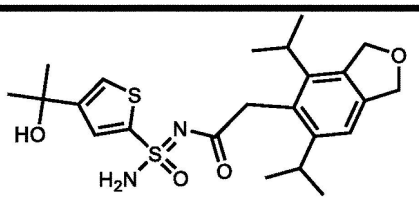
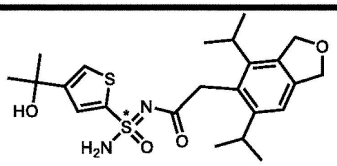
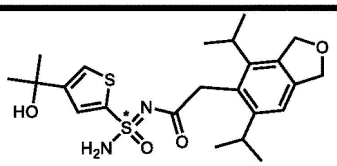
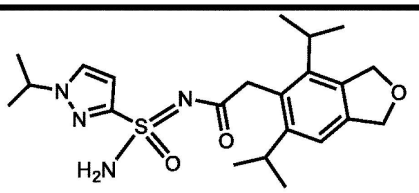
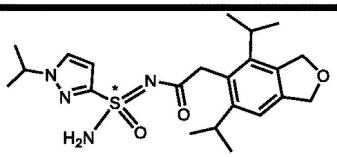
【表２１２】

256a	
256b	
257	
258	

【表２１３】

258a	
258b	
261a	
261b	

【表２１４】

262b	
263	
263a	
263b	
264	
264a	

からなる群から選択される化合物及びその薬学的に許容される塩。

［８７］

前記部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ^{3}）＝Ｎ－中の硫黄は、（Ｓ）立体化学を有する、［１］～［８２］のいずれか一項に記載の化合物。

［８８］

前記部分Ｓ（＝Ｏ）（ＮＨＲ^{3}）＝Ｎ－中の硫黄は、（Ｒ）立体化学を有する、［１］～［８２］のいずれか一項に記載の化合物。

［８９］

［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は塩と、１つ以上の薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

［９０］

ＮＬＲＰ３活性を調節する方法であって、ＮＬＲＰ３を、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物と接触させる工程を含む方法。

［９１］

前記調節は、ＮＬＲＰ３に拮抗する工程を含む、［９０］に記載の方法。

［９２］

インビトロで行われる、［９０］又は［９１］に記載の方法。

［９３］

ＮＬＲＰ３を含む１つ以上の細胞を含む試料を、前記化合物と接触させる工程を含む、［９０］、［９１］又は［９２］のいずれか一項に記載の方法。

［９４］

インビボで行われる、［９０］、［９１］又は［９２］のいずれか一項に記載の方法。

［９５］

ＮＬＲＰ３シグナル伝達が疾患の病変及び／又は症状及び／又は進行の一因である疾患に罹患した対象に前記化合物を投与する工程を含む、［９４］に記載の方法。

［９６］

前記対象はヒトである、［９５］に記載の方法。

［９７］

代謝障害である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。

［９８］

前記代謝障害は、２型糖尿病、アテローム性動脈硬化症、肥満又は痛風である、［９７］に記載の方法。

［９９］

中枢神経系の疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。

［１００］

前記中枢神経系の疾患は、アルツハイマー病、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症又はパーキンソン病である、［９９］に記載の方法。

［１０１］

肺疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。

［１０２］

前記肺疾患は、喘息、ＣＯＰＤ又は突発性肺線維症である、［１０１］に記載の方法。

［１０３］

肝疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。

［１０４］

前記肝疾患は、ＮＡＳＨ症候群、ウイルス性肝炎又は肝硬変である、［１０３］に記載の方法。

［１０５］

膵疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。

［１０６］

前記膵疾患は、急性膵炎若しくは慢性膵炎である、［１０５］に記載の方法。

［１０７］
腎疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１０８］
前記腎疾患は、急性腎障害若しくは慢性腎障害である、［１０７］に記載の方法。
［１０９］
腸疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１１０］
前記腸疾患は、クローン病又は潰瘍性大腸炎である、［１０９］に記載の方法。
［１１１］
皮膚疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１１２］
前記皮膚疾患は乾癬である、［１１１］に記載の方法。
［１１３］
筋骨格疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１１４］
前記筋骨格疾患は強皮症である、［１１３］に記載の方法。
［１１５］
血管疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１１６］
前記血管疾患は巨細胞性動脈炎である、［１１５］に記載の方法。
［１１７］
骨の疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１１８］
前記骨の疾患は、変形性関節症、骨粗鬆症又は大理石骨病である、［１１７］に記載の方法。
［１１９］
眼疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１２０］
前記眼疾患は、緑内障又は黄斑変性症である、［１１９］に記載の方法。
［１２１］
ウイルス感染に起因する疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１２２］
前記ウイルス感染に起因する疾患は、ＨＩＶ又はＡＩＤＳである、［１２１］に記載の方法。

［１２３］
自己免疫疾患である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１２４］
前記自己免疫疾患は、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎である、［１２３］に記載の方法。
［１２５］
癌又は老化である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１２６］
骨髄異形成症候群（ＭＤＳ）；非小細胞肺癌、例えばＮＬＲＰ３の突然変異又は過剰発現を有する患者の非小細胞肺癌；急性リンパ芽球性白血病（ＡＬＬ）、例えば糖質コルチコイド治療に対して耐性がある患者のＡＬＬ；ランゲルハンス細胞組織球症（ＬＣＨ）；多発性骨髄腫；前骨髄球性白血病；急性骨髄性白血病（ＡＭＬ）；慢性骨髄性白血病（ＣＭＬ）；胃癌；及び肺癌転移から選択される癌である疾患、障害又は病態を治療する方法であって、このような治療を必要とする対象に、有効量の［１］～［８８］のいずれか一項に記載の化合物又は［８９］に記載の医薬組成物を投与する工程を含む方法。
［１２７］
前記癌はＭＤＳである、［１２６］に記載の方法。
［１２８］
前記癌は非小細胞肺癌である、［１２６］に記載の方法。
［１２９］
前記癌は急性リンパ芽球性白血病である、［１２６］に記載の方法。
［１３０］
前記癌はＬＣＨである、［１２６］に記載の方法。
［１３１］
前記癌は多発性骨髄腫である、［１２６］に記載の方法。
［１３２］
前記癌は前骨髄球性白血病である、［１２６］に記載の方法。
［１３３］
前記癌は急性骨髄性白血病（ＡＭＬ）である、［１２６］に記載の方法。
［１３４］
前記癌は慢性骨髄性白血病（ＣＭＬ）である、［１２６］に記載の方法。
［１３５］
前記癌は胃癌である、［１２６］に記載の方法。
［１３６］
前記癌は肺癌転移である、［１２６］に記載の方法。
［１３７］
治療有効量の抗ＴＮＦα剤を前記対象に投与する工程をさらに含む、［９５］～［１３６］のいずれか一項に記載の方法。
［１３８］
前記ＮＬＲＰ３アンタゴニストは、前記対象への前記抗ＴＮＦα剤の投与の前に、前記対象に投与される、［１３７］に記載の方法。
［１３９］
前記抗ＴＮＦα剤は、前記対象への前記ＮＬＲＰ３アンタゴニストの投与の前に、前記対象に投与される、［１３７］に記載の方法。
［１４０］
前記ＮＬＲＰ３アンタゴニスト及び前記抗ＴＮＦα剤は、ほぼ同時に前記対象に投与さ

れる、［１３７］に記載の方法。
［１４１］
前記ＮＬＲＰ３アンタゴニスト及び前記抗ＴＮＦα剤は、単一剤形中で一緒に製剤化される、［１３７］に記載の方法。
【図面】
【図１】

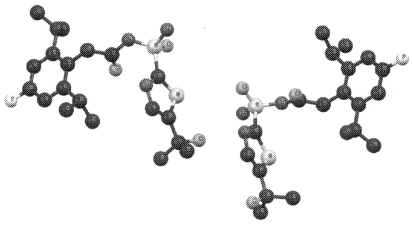


FIG. 1

【配列表】
0007349981000001.app

フロントページの続き

(51)国際特許分類			FI			
A61K	*31/427*	*(2006.01)*	A61K	31/427		
A61K	*31/44*	*(2006.01)*	A61K	31/44		
A61K	*31/506*	*(2006.01)*	A61K	31/506		
A61K	*45/00*	*(2006.01)*	A61K	45/00		
A61P	*1/04*	*(2006.01)*	A61P	1/04		
A61P	*1/16*	*(2006.01)*	A61P	1/16		
A61P	*1/18*	*(2006.01)*	A61P	1/18		
A61P	*3/04*	*(2006.01)*	A61P	3/04		
A61P	*3/10*	*(2006.01)*	A61P	3/10		ZNA
A61P	*9/00*	*(2006.01)*	A61P	9/00		
A61P	*9/10*	*(2006.01)*	A61P	9/10		
A61P	*11/00*	*(2006.01)*	A61P	11/00		
A61P	*11/06*	*(2006.01)*	A61P	11/06		
A61P	*13/12*	*(2006.01)*	A61P	13/12		
A61P	*17/00*	*(2006.01)*	A61P	17/00		
A61P	*17/06*	*(2006.01)*	A61P	17/06		
A61P	*19/02*	*(2006.01)*	A61P	19/02		
A61P	*19/06*	*(2006.01)*	A61P	19/06		
A61P	*19/10*	*(2006.01)*	A61P	19/10		
A61P	*21/00*	*(2006.01)*	A61P	21/00		
A61P	*25/00*	*(2006.01)*	A61P	25/00		
A61P	*25/16*	*(2006.01)*	A61P	25/16		
A61P	*25/28*	*(2006.01)*	A61P	25/28		
A61P	*27/02*	*(2006.01)*	A61P	27/02		
A61P	*27/06*	*(2006.01)*	A61P	27/06		
A61P	*31/12*	*(2006.01)*	A61P	31/12		
A61P	*31/18*	*(2006.01)*	A61P	31/18		
A61P	*35/00*	*(2006.01)*	A61P	35/00		
A61P	*35/02*	*(2006.01)*	A61P	35/02		
A61P	*35/04*	*(2006.01)*	A61P	35/04		
A61P	*37/00*	*(2006.01)*	A61P	37/00		
A61P	*43/00*	*(2006.01)*	A61P	43/00	107	
C07D	*213/71*	*(2006.01)*	A61P	43/00	111	
C07D	*231/12*	*(2006.01)*	A61P	43/00	121	
C07D	*231/56*	*(2006.01)*	C07D	213/71		
C07D	*261/08*	*(2006.01)*	C07D	231/12	B	
C07D	*277/36*	*(2006.01)*	C07D	231/56	Z	
C07D	*307/16*	*(2006.01)*	C07D	261/08		
C07D	*307/87*	*(2006.01)*	C07D	277/36		
C07D	*317/46*	*(2006.01)*	C07D	307/16		
C07D	*333/34*	*(2006.01)*	C07D	307/87		
C07D	*401/12*	*(2006.01)*	C07D	317/46		
C07D	*409/12*	*(2006.01)*	C07D	333/34		
C07D	*417/12*	*(2006.01)*	C07D	401/12		
C12N	*15/12*	*(2006.01)*	C07D	409/12		
			C07D	417/12		
			C12N	15/12		

(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)
アメリカ合衆国 ４８１０３ ミシガン州，アナーバー，スノーベリー リッジ ロード １６６３
(72)発明者 ルーシュ，ウィリアム アール．
アメリカ合衆国 ３３４５８ フロリダ州，ジュピター，タウン ホール アベニュー １０１３
(72)発明者 ヴェンカトラマン，シャンカー
アメリカ合衆国 １９４４６ ペンシルベニア州，ランズデール，カントリー レーン １１４
(72)発明者 シェン，ドン－ミン

アメリカ合衆国 ０２１１６ マサチューセッツ州，ボストン，ボイルストン ストリート ８５５
(72)発明者 ゴーシュ，ショミアー
アメリカ合衆国 ０２４４６ マサチューセッツ州，ブルックライン，シュワール アベニュー １３４，ユニット シー
(72)発明者 カッツ，ジェイソン
アメリカ合衆国 ０２４６１ マサチューセッツ州，ニュートン，ウッドクリフ ロード ２１６
(72)発明者 ザイデル，ハンス マーティン
アメリカ合衆国 ０１７４２ マサチューセッツ州，コンコルド，レボリューショナリー ロード ２６
(72)発明者 フランキ，ルイージ
アメリカ合衆国 ４８１０５ ミシガン州，アナーバー，バリスター ロード １２６０
(72)発明者 ウィンクラー，デイビッド グウェンザー
アメリカ合衆国 ０２４７６ マサチューセッツ州，アーリントン，ジョージ ストリート １２７
(72)発明者 オピパリ ジュニアー，アンソニー ウィリアム
アメリカ合衆国 ４８１３０ ミシガン州，デクスター，ワイリー ロード ２８１６

審査官 土橋 敬介
(56)参考文献 国際公開第２０１６／１３１０９８（WO，A１）
特開平０５－３４５７５６（ＪＰ，Ａ）
(58)調査した分野 (Int.Cl.，ＤＢ名)
Ｃ０７Ｃ
Ｃ０７Ｄ
Ａ６１Ｋ
Ｃ１２Ｎ １５／１２
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）