(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7649257号
(P7649257)

(45)発行日　令和7年3月19日(2025.3.19)

(24)登録日　令和7年3月11日(2025.3.11)

(51)国際特許分類

C07D 401/14 (2006.01)	C07D 401/14	CSP
A61K 31/501(2006.01)	A61K 31/501	
A61P 25/14 (2006.01)	A61P 25/14	
C07D 413/14 (2006.01)	C07D 413/14	
A61K 31/506(2006.01)	A61K 31/506	

請求項の数　19　（全329頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2021-568200(P2021-568200)
(86)(22)出願日　令和2年5月12日(2020.5.12)
(65)公表番号　特表2022-533120(P2022-533120A)
(43)公表日　令和4年7月21日(2022.7.21)
(86)国際出願番号　PCT/US2020/032446
(87)国際公開番号　WO2020/231977
(87)国際公開日　令和2年11月19日(2020.11.19)
審査請求日　令和5年5月8日(2023.5.8)
(31)優先権主張番号　62/846,896
(32)優先日　令和1年5月13日(2019.5.13)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(73)特許権者　507166346
ピーティーシー セラピューティクス，インコーポレイテッド
アメリカ合衆国 ニュー ジャージー ０７０５９，ウォレン，ウォレン コーポレイト センター ドライブ ５００
(74)代理人　100094569
弁理士　田中 伸一郎
(74)代理人　100103610
弁理士　▲吉▼田 和彦
(74)代理人　100109070
弁理士　須田 洋之
(74)代理人　100119013
弁理士　山崎 一夫
(74)代理人　100123777

最終頁に続く

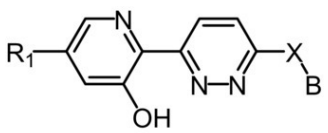
(54)【発明の名称】　ハンチントン病を処置するための化合物

(57)【特許請求の範囲】

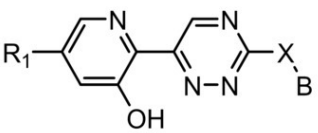
【請求項１】

式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態であって、前記化合物の形態が、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および互変異性体の形態からなる群から選択される、前記化合物またはその形態。

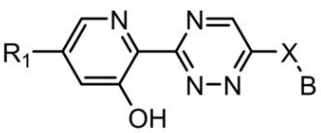
【化１】



（Ｉ）



（ＩＩ）



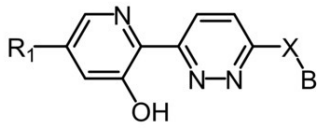
（ＩＩＩ）

（式中、
Ｘは Ｏ、NR_X、および結合からなる群から選択され、
R_Xが、水素およびC_{1-4}アルキルからなる群から選択され、
Ｂは、ヘテロシクリルであり、

ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよく、
R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルからなる群から独立して選択され、
R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノからなる群から選択され、
ヘテロアリールが、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例が、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、
R_{1a}が、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシからなる群から独立して選択される）

【請求項２】
化合物が、式（Ｉ）の化合物である、請求項１に記載の化合物またはその形態。

【化２】



（Ｉ）

【請求項３】
Ｘが、Ｏおよび結合からなる群から選択される、請求項１または２のいずれか１項に記載の化合物またはその形態。

【請求項４】
Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニルからなる群から選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、請求項１または２のいずれか１項に記載の化合物またはその形態。

【請求項５】
R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミ

ダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルからなる群から選択されるヘテロアリールである、請求項１または２のいずれか１項に記載の化合物またはその形態。

【請求項６】

R_1が、１Ｈ－ピラゾリルおよび２Ｈ－インダゾリルからなる群から選択されるヘテロアリールである、請求項５に記載の化合物またはその形態。

【請求項７】

R_{1a}が、ハロゲン、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、および重水素－C_{1-4}アルコキシからなる群から選択される、請求項１または２のいずれか１項に記載の化合物またはその形態。

【請求項８】

R_{1a}が、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、およびC_{1-4}アルコキシからなる群から選択される、請求項７に記載の化合物またはその形態。

【請求項９】

５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；

５－［１－（$^2H_3$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；

５－（１，３－オキサゾール－２－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジ

ン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］

オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジ

ン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；

５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダ

ジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－チアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３

Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（ピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（４－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－（｛６－［３－ヒドロキシ－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル］ピリダジン－３－イル｝オキシ）－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－１－イル］オキシダニル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；

２－｛６－［（３Ｒ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（６，６－ジメチル－２－オキサ－５－アザスピロ［３．５］ノナン－８－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３

Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；

２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（３－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（８－フルオロ－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；

５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；および
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール
からなる群から選択される化合物またはその形態であって、前記化合物の形態が、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および互変異性体の形態からなる群から選択される、化合物またはその形態。

【請求項１０】

５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；

５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－オキサゾール－２－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；

２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジ

ン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オ

キシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３

－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－チアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－

イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（ピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３

－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（４－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－（｛６－［３－ヒドロキシ－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル］ピリダジン－３－イル｝オキシ）－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－１－イル］オキシダニル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（６，６－ジメチル－２－オキサ－５－アザスピロ［３．５］ノナン－８－

イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール

；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；および
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール
からなる群から選択される、化合物またはその形態であって、前記化合物の形態が、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および互変異性体の形態からなる群から選択される、化合物またはその形態。

【請求項１１】
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール二ギ酸塩；

２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－

イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３

Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３

－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二ギ酸塩；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二ギ酸塩；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；

２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（３－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
６－（６－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（８－フルオロ－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；

２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；および
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］ピリジン－３－オール塩酸塩
からなる群から選択される化合物の塩またはその形態であって、前記化合物の塩の形態が、その水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および互変異性体の形態からなる群から選択される、化合物の塩またはその形態。
【請求項１２】
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール二ギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキ

シ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミ

ダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール

二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩
からなる群から選択される化合物の塩またはその形態であって、前記化合物の塩の形態が、その水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および互変異性体の形態からなる群から選択される、化合物の塩またはその形態。
【請求項１３】
請求項１、９、または１０のいずれか１項に記載の化合物またはその形態を含む、ハンチントン病（ＨＤ）の処置または寛解を必要とする対象においてハンチントン病（ＨＤ）を処置または寛解するための医薬組成物。
【請求項１４】
化合物が、０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲で投与される、請求項１３に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
有効量の医薬を対象に投与するステップを含むハンチントン病（ＨＤ）の処置または寛解を必要とする対象においてハンチントン病（ＨＤ）を処置または寛解するための医薬の製造における、請求項１、９、または１０のいずれか１項に記載の化合物またはその形態の使用。
【請求項１６】
医薬における化合物の有効量が、０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、請求項１５に記載の使用。
【請求項１７】
請求項１、９、または１０のいずれか１項に記載の化合物またはその形態の使用であって、１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和した前記化合物、またはその形態の有効量を対象に投与するステップを含むハンチントン病（ＨＤ）の処置または寛解を

必要とする対象においてハンチントン病（ＨＤ）を処置または寛解するための医薬組成物の調製における、前記使用。

【請求項１８】

医薬組成物における化合物の有効量が、０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、請求項１７に記載の使用。

【請求項１９】

１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和した、請求項１、９、または１０のいずれか１項に記載の化合物またはその形態を含む、医薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

関連出願の相互参照

本出願は、２０１９年５月１３日に出願された米国仮出願第６２／８４６，８９６号の優先権を主張し、その内容は、参照により本明細書に組み込まれる。

【０００２】

本明細書の態様は、ハンチントン病を処置または寛解するために有用な化合物、その形態および医薬組成物、ならびにそのような化合物、その形態または組成物を使用する方法に関する。詳細には、本明細書の別の態様は、置換単環式ヘテロアリール化合物、その形態および医薬組成物、ならびにハンチントン病を処置または寛解するための、そのような化合物、その形態または組成物を使用する方法に関する。

【背景技術】

【０００３】

ハンチントン病（ＨＤ）は、不随意運動、認知障害、および精神機能低下を特徴とする症状を有する、脳の進行性常染色体優性神経変性障害である。死亡は、典型的には、肺炎または冠動脈疾患によって引き起こされ、通常、症状が発症してから１３～１５年後に発生する。ＨＤの有病率は、西欧系集団１００，０００人に３～７人である。北米では、３０，０００人がＨＤを有すると見積もられたが、さらに２００，０００人が、罹患した親から疾患を遺伝する危険性がある。疾患は、「変異」ハンチンチン（Ｈｔｔ）遺伝子における連続したトリヌクレオチドＣＡＧ反復の伸張によって引き起こされ、これにより、「ＣＡＧ反復」配列としても公知のポリ－グルタミン（ポリＱ）ストレッチの伸張がみられるＨＴＴ（Ｈｔｔタンパク質）が生成される。現在の小分子治療法には、疾患の根本原因を標的としたものはなく、ＨＤの処置または寛解に使用できる薬物に対する高い必要性は、応えられていないままである。結果として、ＨＤを処置または寛解するための小分子化合物を特定し、提供する必要性は依然ある。

【０００４】

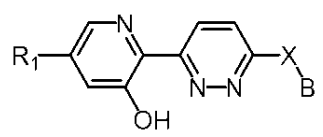
本明細書で言及されている他の文書はすべて、参照により、本明細書に完全に明記されているように本出願に組み込まれる。

【発明の概要】

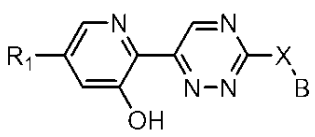
【０００５】

本明細書の態様は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含む化合物を含む。

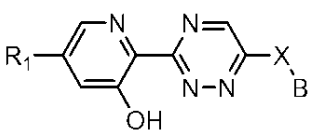
【化１】



（Ｉ）



（ＩＩ）



（ＩＩＩ）

（式中、Ｘ、Ｂ、およびR_1は、本明細書で定義されている）

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための方法を含む。

【０００６】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態または組成物を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態または組成物を使用する方法を含む。

【０００７】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。

【０００８】

本明細書の態様は、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬の製造における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、有効量の医薬を対象に投与することを含む、使用を含む。

【０００９】

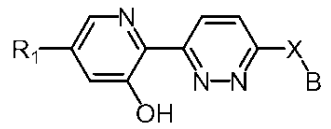
本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の作用剤と組み合わせて対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための、１つまたは複数の治療剤との組合せ製品における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。

【発明を実施するための形態】

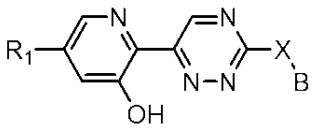
【００１０】

本明細書の態様は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含む化合物であって、化合物の形態は、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、および混合物からなる群から選択される、化合物に関する。

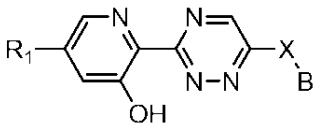
【化２】



（Ｉ）



（ＩＩ）



（ＩＩＩ）

（式中、

ＸはＯ、NR_X、または結合であり、

R_Xは、水素およびC_{1-4}アルキルから選択され、

Ｂは、ヘテロシクリルであり、

ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよく、

R_bは、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$

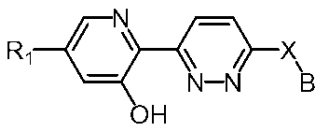
－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから独立して選択され、
R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択され、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、
R_{1a}は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される）

【００１１】

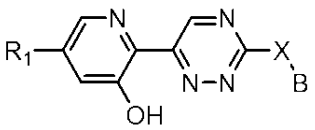
本明細書の態様

本明細書の態様は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含む化合物に関する。

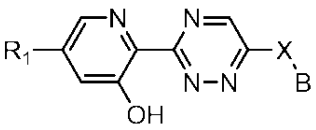
【化３】



（Ｉ）



（ＩＩ）



（ＩＩＩ）

（式中、
ＸはＯ、NR_x、または結合であり、
R_xは、水素およびC_{1-4}アルキルから選択され、
Ｂは、ヘテロシクリルであり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよく、
R_bは、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノおよびC_{3-6}シクロアルキルから独立して選択され、
R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択され、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、
R_{1a}は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハ

ロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される）

【００１２】

一態様は、Ｘが、Ｏ、NR_xおよび結合から選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１３】

別の態様は、ＸがＯである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１４】

別の態様は、ＸがNR_xである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１５】

別の態様は、Ｘが結合である、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１６】

一態様は、R_xが、水素およびC_{1-4}アルキルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１７】

別の態様は、R_xが水素である、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１８】

別の態様は、R_xが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００１９】

別の態様は、R_xがメチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２０】

一態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２１】

別の態様は、Ｂが、非置換ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系である、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２２】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２３】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基でそれぞれ置換されている、式（Ｉ）

、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００２４】
別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００２５】
別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００２６】
別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００２７】
別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキ

サデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００２９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－

アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３０】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジス

ピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３１】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３２】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ

]ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３３】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．

５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００３９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００４０】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４１】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４２】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４３】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４４】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４５】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４６】
別の態様は、Ｂが、ピロリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４７】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４８】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００４９】
別の態様は、Ｂが非置換ピペラジニルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００５０】
別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００５１】
別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、２個の

R_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５２】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５３】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５４】

別の態様は、Ｂが非置換４－アザスピロ［２．５］オクタニルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５５】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５６】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタニルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］

ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン（ｄｅｃ）－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２

－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００５９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］

ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６０】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル

、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６１】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザ

スピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６２】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピ

ロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６３】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカ

ン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００６９】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７０】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７１】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７２】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７３】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７４】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７５】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７６】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００７７】
別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリ

ルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００７８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００７９】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４または５個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８０】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８１】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８２】

別の態様は、Ｂが非置換ピペラジン－１－イルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８３】

別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８４】

別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８５】

別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８６】

別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８７】

別の態様は、Ｂが非置換４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８８】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００８９】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のRb置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【００９０】

別の態様は、Ｂが、（Ｒ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテ

ロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９１】
別の態様は、Ｂが、（Ｓ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９２】
一態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９３】
別の態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルキル－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９４】
別の態様は、R_bが、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９５】
別の態様は、R_bがフルオロである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９６】
別の態様は、R_bが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９７】
別の態様は、R_bが、メチル、エチル、およびイソプロピルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９８】
別の態様は、R_bがメチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【００９９】
別の態様は、R_bがエチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１００】
別の態様は、R_bがイソプロピルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０１】
別の態様は、R_bがC_{1-4}アルキル－アミノである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０２】
別の態様は、R_bが、C_{1-4}アルキル－アミノであり、C_{1-4}アルキルが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０３】
別の態様は、R_bが、メチルアミノおよびｔｅｒｔ－ブチルアミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０４】
別の態様は、R_bがメチルアミノである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０５】
別の態様は、R_bがｔｅｒｔ－ブチルアミノである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１０６】
別の態様は、R_bが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルから選択されるC_{3-6}シクロアルキルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０７】
別の態様は、R_bがシクロプロピルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１０８】
一態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。
【０１０９】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、非置換である。
【０１１０】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。
【０１１１】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原

子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０１１２】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０１１３】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは非置換である。

【０１１４】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０１１５】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０１１６】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ

－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１１７】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［

１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１１８】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１１９】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フ

ロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２０】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２２】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ

－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２３】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２４】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－

イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２５】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラ

ゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テ

トラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２６】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］

ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２７】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル

、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２８】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、

１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１２９】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３０】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３２】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－C_{2-4}アルケニルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０１３３】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－C_{2-4}アルケニルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、
C_{2-4}アルケニルは、エテニル、プロペニル、およびブテニルから選択され、
ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０１３４】

別の態様は、R_1が２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニルであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３５】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－アミノであり、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３６】

別の態様は、R_1が（ピリジン－３－イル）アミノ、（ピラジン－２－イル）アミノ、および（ピリミジン－５－イル）アミノであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３７】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１

，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、
C_{1-4}アルキルは、メチル、エチル、プロピル、およびブチルから選択され、
ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０１３８】

別の態様は、R_1が（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチルアミノ、（ピリジン－３－イル）メチルアミノ、（ピリジン－４－イル）メチルアミノ、（キノリン－３－イル）メチルアミノ、および（キノリン－８－イル）メチルアミノであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１３９】

一態様は、R_{1a}が、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４０】

別の態様は、R_{1a}が、ハロゲン、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、および重水素－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４１】

別の態様は、R_{1a}が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４２】

別の態様は、R_{1a}が、メチルおよびエチルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４３】

別の態様は、R_{1a}がメチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４４】

別の態様は、R_{1a}がエチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４５】

別の態様は、R_{1a}が、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４６】

別の態様は、R_{1a}がフルオロである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４７】

別の態様は、R_{1a}がシアノである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

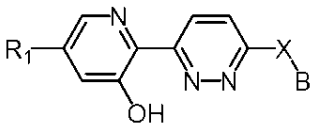
【０１４８】

別の態様は、R_{1a}が、重水素C_{1-4}アルキルであり、C_{1-4}アルキルは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換されるメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１４９】

別の態様は、R_{1a}が（$^2H_3$）メチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０１５０】
別の態様は、R_{1a}が、ハロ－C_{1-4}アルキルであり、C_{1-4}アルキルは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数のハロゲン原子で部分的に、または完全に置換されるメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５１】
別の態様は、R_{1a}がトリフルオロメチルである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５２】
別の態様は、R_{1a}が、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシおよびｔｅｒｔ－ブトキシから選択されるC_{1-4}アルコキシである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５３】
別の態様は、R_{1a}がメトキシである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５４】
別の態様は、R_{1a}が、重水素C_{1-4}アルコキシであり、C_{1-4}アルコキシは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換されるメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシおよびｔｅｒｔ－ブトキシから選択される、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５５】
別の態様は、R_{1a}が（$^{2}H_{3}$）メトキシである、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０１５６】
本明細書の別の態様は、式（Ｉ）の化合物、またはその形態を含む。
【化４】



（Ｉ）

（式中、
ＸはＯ、NR_x、または結合であり、
R_xは、水素およびC_{1-4}アルキルから選択され、
Ｂは、ヘテロシクリルであり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基でそれぞれ置換されていてもよく、
R_bは、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノおよびC_{3-6}シクロアルキルから独立して選択され、
R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択され、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原

子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、
R_{1a}は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される）

【０１５７】

一態様は、Ｘが、Ｏ、NR_x、および結合から選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１５８】

別の態様は、ＸがＯである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１５９】

別の態様は、ＸがNR_xである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６０】

別の態様は、Ｘが結合である、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６１】

一態様は、R_xが、水素およびC_{1-4}アルキルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６２】

別の態様は、R_xが水素である、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６３】

別の態様は、R_xが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６４】

別の態様は、R_xがメチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６５】

一態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６６】

別の態様は、Ｂが、非置換ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系である、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６７】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６８】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基でそれぞれ置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１６９】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲb置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７０】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲb置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７１】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲb置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７２】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲb置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む

。

【０１７３】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７４】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．

３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７５】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７６】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザ

ビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１７９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、

ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８０】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８１】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８２】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８３】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および

４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１８９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９０】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９１】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９２】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、および４－アザスピロ［２．５］オクタニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９３】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９４】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９５】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９６】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９７】

別の態様は、Ｂが非置換ピペラジニルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９８】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０１９９】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２００】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０１】

別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０２】

別の態様は、Ｂが非置換４－アザスピロ［２．５］オクタニルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０３】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０４】

別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタニルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０５】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１

，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０６】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル

、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピ

ロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９

－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２０９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個

のＲb置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２１０】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲb置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２１１】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジ

ン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１２】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル

、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１３】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－

オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２１９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２０】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２１】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２２】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２３】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、ピペラジン－１－イル、および４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２７】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４または５個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２８】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２２９】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３０】
別の態様は、Ｂが非置換ピペラジン－１－イルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３１】
別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３２】
別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３３】
別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３４】
別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３５】
別の態様は、Ｂが非置換４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３６】
別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３７】
別の態様は、Ｂが、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３８】
別の態様は、Ｂが、（Ｒ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２３９】
別の態様は、Ｂが、（Ｓ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４０】
一態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４１】
別の態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルキル－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４２】
別の態様は、R_bが、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４３】
別の態様は、R_bがフルオロである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４４】
別の態様は、R_bが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４５】
別の態様は、R_bが、メチル、エチル、およびイソプロピルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２４６】
別の態様は、R_bがメチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４７】
別の態様は、R_bがエチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４８】
別の態様は、R_bがイソプロピルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２４９】
別の態様は、R_bがC_{1-4}アルキル－アミノである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５０】
別の態様は、R_bが、C_{1-4}アルキル－アミノであり、C_{1-4}アルキルが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５１】
別の態様は、R_bが、メチルアミノおよびｔｅｒｔ－ブチルアミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５２】
別の態様は、R_bがメチルアミノである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５３】
別の態様は、R_bがｔｅｒｔ－ブチルアミノである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５４】
別の態様は、R_bが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルから選択されるC_{3-6}シクロアルキルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５５】
別の態様は、R_bがシクロプロピルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２５６】
一態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。
【０２５７】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、非置換である。
【０２５８】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個の

ヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０２５９】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０２６０】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０２６１】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから独立して選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは非置換である。

【０２６２】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０２６３】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０２６４】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル

、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２６５】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１

Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２６６】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２６７】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チア

ゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２６８】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２６９】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミ

ジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７０】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７２】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、

１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７３】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２

，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－

イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７４】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン

－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７５】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオ

キソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７６】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，

５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７７】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７８】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２７９】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０２８０】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－C_{2-4}アルケニルである、式（Ｉ）の化合物を含み、

ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘ

テロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい。
【０２８１】
別の態様は、Ｒ$_1$がヘテロアリール－Ｃ$_{2-4}$アルケニルである、式（Ｉ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、
Ｃ$_{2-4}$アルケニルは、エテニル、プロペニル、およびブテニルから選択され、
ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい。
【０２８２】
別の態様は、Ｒ$_1$が２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニルであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８３】
別の態様は、Ｒ$_1$がヘテロアリール－アミノであり、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８４】
別の態様は、Ｒ$_1$が（ピリジン－３－イル）アミノ、（ピラジン－２－イル）アミノ、および（ピリミジン－５－イル）アミノであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８５】
別の態様は、Ｒ$_1$がヘテロアリール－Ｃ$_{1-4}$アルキル－アミノである、式（Ｉ）の化合物を含み、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、
Ｃ$_{1-4}$アルキルは、メチル、エチル、プロピル、およびブチルから選択され、
ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよい。

【０２８６】
別の態様は、R_1が（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチルアミノ、（ピリジン－３－イル）メチルアミノ、（ピリジン－４－イル）メチルアミノ、（キノリン－３－イル）メチルアミノ、および（キノリン－８－イル）メチルアミノであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８７】
一態様は、R_{1a}が、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８８】
別の態様は、R_{1a}が、ハロゲン、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、および重水素－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２８９】
別の態様は、R_{1a}が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９０】
別の態様は、R_{1a}が、メチルおよびエチルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９１】
別の態様は、R_{1a}がメチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９２】
別の態様は、R_{1a}がエチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９３】
別の態様は、R_{1a}が、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９４】
別の態様は、R_{1a}がフルオロである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９５】
別の態様は、R_{1a}がシアノである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９６】
別の態様は、R_{1a}が、重水素C_{1-4}アルキルであり、C_{1-4}アルキルは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換されるメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９７】
別の態様は、R_{1a}が（$^2H_3$）メチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９８】
別の態様は、R_{1a}が、ハロ－C_{1-4}アルキルであり、C_{1-4}アルキルは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数のハロゲン原子で部分的に、または完全に置換されるメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０２９９】
別の態様は、R_{1a}がトリフルオロメチルである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０３００】
別の態様は、R_{1a}が、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシおよびｔｅｒｔ－ブトキシから選択されるC_{1-4}アルコキシである、式（Ｉ）の化合物を含む。
【０３０１】

別の態様は、R_{1a}がメトキシである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０３０２】

別の態様は、R_{1a}が、重水素C_{1-4}アルコキシであり、C_{1-4}アルコキシは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換されるメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシおよびｔｅｒｔ－ブトキシから選択される、式（Ｉ）の化合物を含む。

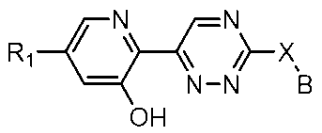
【０３０３】

別の態様は、R_{1a}が（$^2H_3$）メトキシである、式（Ｉ）の化合物を含む。

【０３０４】

本明細書の別の態様は、式（ＩＩ）の化合物、またはその形態を含む。

【化５】



（ＩＩ）

（式中、

ＸはＯ、NR_X、または結合であり、

R_Xは、水素およびC_{1-4}アルキルから選択され、

Ｂは、ヘテロシクリルであり、

ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基でそれぞれ置換されていてもよく、

R_bは、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノおよびC_{3-6}シクロアルキルから独立して選択され、

R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択され、

ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、

ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、

フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、

R_{1a}は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される）

【０３０５】

一態様は、Ｘが、Ｏ、NR_X、および結合から選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３０６】

別の態様は、ＸがＯである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３０７】

別の態様は、ＸがNR_Xである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３０８】

別の態様は、Ｘが結合である、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３０９】

一態様は、R_Xが、水素およびC_{1-4}アルキルから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１０】

別の態様は、R_Xが水素である、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１１】

別の態様は、R_Xが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１２】

別の態様は、R_Xがメチルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１３】

一態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１４】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１５】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１６】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、

３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキ

サデカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３１９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２０】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニ

ル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２１】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２２】
別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３２３】
別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．

３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３２９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、およびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３０】

別の態様は、Ｂが、ピロリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３１】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４または５個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３２】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３３】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、５個の

R_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３３４】
別の態様は、Ｂが、ピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３３５】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、

２、３、４または５個のＲb置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３３６】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３３７】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、

ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジ

ン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３３９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－

１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４０】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－

５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４１】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－

２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４２】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４３】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４４】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４５】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４６】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン

－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４７】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４８】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル、およびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３４９】

別の態様は、Ｂが、ピロリジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５０】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４または５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５１】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５２】

別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５３】

別の態様は、Ｂが、ピペラジン－１－イルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５４】

別の態様は、Ｂが、（Ｒ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５５】

別の態様は、Ｂが、（Ｓ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５６】

一態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、$(C_{1-4}アルキル)_2$－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５７】

別の態様は、R_bが、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルキル－アミノ、およびC_{3-6}シクロアルキルから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５８】

別の態様は、R_bが、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３５９】

別の態様は、R_bがフルオロである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３６０】

別の態様は、R_bが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３６１】

別の態様は、R_bが、メチルおよびイソプロピルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３６２】

別の態様は、R_bがメチルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６３】
別の態様は、R_bがイソプロピルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６４】
別の態様は、R_bがC_{1-4}アルキル－アミノである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６５】
別の態様は、R_bが、C_{1-4}アルキル－アミノであり、C_{1-4}アルキルが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６６】
別の態様は、R_bがｔｅｒｔ－ブチルアミノである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６７】
別の態様は、R_bが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルから選択されるC_{3-6}シクロアルキルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６８】
別の態様は、R_bがシクロプロピルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。
【０３６９】
一態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。
【０３７０】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、非置換である。
【０３７１】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。
【０３７２】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C

$_{1-4}$アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０３７３】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、およびヘテロアリール－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０３７４】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、およびヘテロアリール－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは非置換である。

【０３７５】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、およびヘテロアリール－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０３７６】

別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、およびヘテロアリール－アミノから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている。

【０３７７】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ

－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３７８】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［

１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３７９】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８０】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニ

ル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－インダゾリル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８２】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－インダゾリル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８３】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－インダゾリル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８４】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－インダゾリル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８５】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキ

サジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジ

ン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８６】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ

－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８７】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、

１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８８】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２

，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－

イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３８９】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９０】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９２】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、および２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９３】

別の態様は、R_1がヘテロアリール－アミノである、式（ＩＩ）の化合物を含み、ヘテロアリールは、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択され、

ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。

【０３９４】

別の態様は、R_1が（ピラジン－２－イル）アミノであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩ）の化合物を含む

。

【０３９５】

一態様は、R_{1a}が、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９６】

別の態様は、R_{1a}が、ハロゲン、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、およびC_{1-4}アルコキシから独立して選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９７】

別の態様は、R_{1a}が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９８】

別の態様は、R_{1a}がメチルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０３９９】

別の態様は、R_{1a}が、ブロモ、クロロ、フルオロ、およびヨードから選択されるハロゲンである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４００】

別の態様は、R_{1a}がフルオロである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４０１】

別の態様は、R_{1a}がシアノである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４０２】

別の態様は、R_{1a}が、重水素C_{1-4}アルキルであり、C_{1-4}アルキルは、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換されるメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択される、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４０３】

別の態様は、R_{1a}が（$^2H_3$）メチルである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４０４】

別の態様は、R_{1a}が、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシおよびｔｅｒｔ－ブトキシから選択されるC_{1-4}アルコキシである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

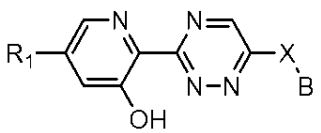
【０４０５】

別の態様は、R_{1a}がメトキシである、式（ＩＩ）の化合物を含む。

【０４０６】

本明細書の別の態様は、式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含む。

【化６】



（ＩＩＩ）

（式中、
ＸはＯ、ＮＲ$_x$、または結合であり、
R_xは、水素およびC_{1-4}アルキルから選択され、
Ｂは、ヘテロシクリルであり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原

子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基でそれぞれ置換されていてもよく、
R_bは、ハロゲン、C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノおよびC_{3-6}シクロアルキルから独立して選択され、
R_1は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択され、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよく、
R_{1a}は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C_{1-4}アルキル、重水素－C_{1-4}アルキル、ハロ－C_{1-4}アルキル、アミノ、C_{1-4}アルキル－アミノ、（C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ、C_{1-4}アルコキシ、重水素－C_{1-4}アルコキシ、およびハロ－C_{1-4}アルコキシから独立して選択される）

【０４０７】

一態様は、Ｘが、Ｏ、NR_x、および結合から選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４０８】

別の態様は、ＸがNR_xである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４０９】

別の態様は、Ｘが結合である、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１０】

一態様は、R_xが、水素およびC_{1-4}アルキルから選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１１】

別の態様は、R_xが水素である、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１２】

別の態様は、R_xが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１３】

別の態様は、R_xがメチルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１４】

一態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１５】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１６】

別の態様は、Ｂが、ヘテロシクリルであり、ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独

立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR$_b$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ

]ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４１９】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジス

ピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２０】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２１】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－

アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２２】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキ

サデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２３】

別の態様は、Ｂが、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、１，４－ジアゼパニル、１，２－ジヒドロピリジニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピロロ［３，４－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタニル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタニル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタニル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナニル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナニル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカニル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカニル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカニル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２４】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２５】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２６】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２７】

別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４２８】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４２９】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４３０】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルおよびピペラジニルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４３１】
別の態様は、Ｂが、ピペリジニルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４３２】
別の態様は、Ｂが、ピペラジニルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４３３】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［

３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^5．3^3］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^8．3^6］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のR_b置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３４】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］

ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３５】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザ

スピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３６】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２

，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３７】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}

］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３８】

別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のＲ$_{b}$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４３９】
別の態様は、Ｂが、アゼチジン－１－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－３－イル、ピペリジン－４－イル、ピペリジン－１－オラート－４－イル、ピペラジン－１－イル、１，４－ジアゼピン－１－イル、１，２－ジヒドロピリジン－２－イル、１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、１，２－ジヒドロピリジン－６－イル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン－５－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル、ヘキサヒドロシクロペンタピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，２－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－１（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－１（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－５（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジン－５－イル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－６（２Ｈ）－オン、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロブタ［１．２－ｃ：１，４－ｃ′］ジピロール－２（３Ｈ）－イル、オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－２（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］［１，４］オキサジン－６（２Ｈ）－イル、５－アザスピロ［２．４］ヘプタン－５－イル、１－アザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２－オキサ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクター２－エン－３－イル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－４－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－３－イル、３，６－ジアザビシクロ［３．２．０］ヘプタン－６－イル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン－２－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－４－イル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノナン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－４－イル、４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプタン－２－イル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－１－イル、１，７，－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，６－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６－イル、１，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－７－イル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナン－８－イル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノナン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，７－ジアザスピロ［４．５］デカン－７－イル、２，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－８－イル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－９－イル、６－オキサ－２，９－ジアザスピロ［４．５］デカン－２－イル、２，９－ジアザスピロ［５．５］ウンデカン－９－イル、４－アザジスピロ［２．１．2^{5}．3^{3}］デカン－９－イル、および７－アザジスピロ［５．１．5^{8}．3^{6}］ヘキサデカン－１５－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR_b置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４０】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個

のR$_b$置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４１】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択される非置換ヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４２】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４３】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４４】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、３個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４５】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４６】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルおよびピペラジン－１－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、５個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４７】
別の態様は、Ｂが、ピペリジン－４－イルであり、利用できる価数により可能であれば、４個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４８】
別の態様は、Ｂが、ピペラジン－４－イルから選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、２個のR$_b$置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４４９】
別の態様は、Ｂが、（Ｒ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４５０】
別の態様は、Ｂが、（Ｓ）配置を有する少なくとも１つの不斉炭素原子を含有するヘテロシクリルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４５１】
一態様は、R$_b$が、ハロゲン、C$_{1-4}$アルキル、アミノ、C$_{1-4}$アルキル－アミノ、（C$_{1-4}$アルキル）$_2$－アミノ、およびC$_{3-6}$シクロアルキルから選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４５２】
別の態様は、R$_b$が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC$_{1-4}$アルキルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４５３】
別の態様は、R$_b$がメチルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４５４】
一態様は、R$_1$が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C$_{1-4}$アルキル、ヘテロアリール－C$_{2-4}$アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C$_{1-4}$アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、

ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。
【０４５５】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、非置換である。
【０４５６】
別の態様は、R_1が、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノから選択される、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、
ヘテロシクリルは、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、
フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例は、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。
【０４５７】
別の態様は、R_1がヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい。
【０４５８】
別の態様は、R_1がヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは非置換である。
【０４５９】
別の態様は、R_1がヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含み、
ヘテロアリールは、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、ヘテロアリールは、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている。
【０４６０】
別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾ

リル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６１】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル

、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６２】

別の態様は、R_1が、チエニル、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，４－チアジアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－イル、１，２，４－トリアジニル、１，３，５－トリアジニル、１Ｈ－インドリル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、インドリジニル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、１Ｈ－ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，２，３－ベンゾトリアゾリル、９Ｈ－プリニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジニル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジニル、キノリニル、イソキノリニル、およびキノキサリニルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６３】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、および２Ｈ－インダゾリルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６４】
別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、および２Ｈ－インダゾリルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４６５】
別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、および２Ｈ－インダゾリルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。
【０４６６】
別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，

３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６７】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，

３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６８】

別の態様は、R_1が、チエン－２－イル、チエン－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１，３－チアゾール－２－イル、１，３－チアゾール－５－イル、１，３－オキサゾール－２－イル、１，３－オキサゾール－４－イル、１，３－オキサゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ

－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－４－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－５－イル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－６－イル、ピラジン－２－イル、ピラジン－３－イル、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－６－イル、ピリダジン－３－イル、ピリダジン－４－イル、ピリダジン－３（２Ｈ）－オン－５－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１Ｈ－インドール－３－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１Ｈ－インドール－５－イル、１Ｈ－インドール－６－イル、１Ｈ－インダゾール－５－イル、１Ｈ－インダゾール－６－イル、２Ｈ－インダゾール－４－イル、２Ｈ－インダゾール－５－イル、２Ｈ－インダゾール－６－イル、インドリジン－２－イル、ベンゾフラン－２－イル、ベンゾフラン－５－イル、ベンゾチエン－２－イル、ベンゾチエン－３－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－２－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－５－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－６－イル、１，３－ベンゾチアゾール－２－イル、１，３－ベンゾチアゾール－５－イル、１，３－ベンゾチアゾール－６－イル、１，３－ベンゾジオキソール－５－イル、１，２，３－ベンゾトリアゾール－５－イル、９Ｈ－プリン－８－イル、フロ［３，２－ｂ］ピリジン－２－イル、フロ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、フロ［２，３－ｃ］ピリジン－２－イル、１，３－オキサゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－５－イル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジン－２－イル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジン－６－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジン－４－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン－７－イル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル、ピロロ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－２－イル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－１－イル、１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｃ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｄ］ピリミジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－ピラゾロ［４，３－ｃ］ピリジン－５－イル、５Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－２－イル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジン－２－イル、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾール－６－イル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル、［１，３］オキサゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－２－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－５－イル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、１Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－５－イル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］

ピリジン－６－イル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イル、テトラゾロ［１，５－ｂ］ピリダジン－７－イル、キノリン－６－イル、イソキノリン－６－イル、およびキノキサリン－２－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４６９】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、および２Ｈ－インダゾール－５－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１または２個のR_{1a}置換基で置換されていてもよい、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４７０】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、および２Ｈ－インダゾール－５－イルから選択される非置換ヘテロアリールである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４７１】

別の態様は、R_1が、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、および２Ｈ－インダゾール－５－イルから選択されるヘテロアリールであり、利用できる価数により可能であれば、１個のR_{1a}置換基で置換されている、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

【０４７２】

別の態様は、R_{1a}が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、およびｔｅｒｔ－ブチルから選択されるC_{1-4}アルキルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

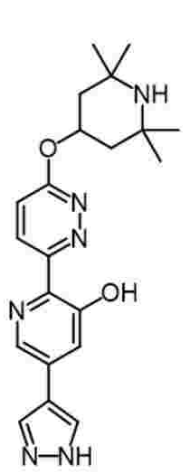
【０４７３】

別の態様は、R_{1a}がメチルである、式（ＩＩＩ）の化合物を含む。

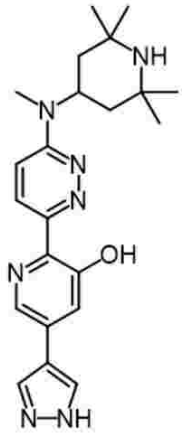
【０４７４】

式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物またはその形態（「$^{\#}$」は、化合物が鏡像異性体ラセミ混合物であることを指し示し、「$^{\&}$」は、化合物がメソ化合物であることを指し示し、「$^{\sim}$」は、化合物が単一の鏡像異性体であるが絶対立体化学は未知であることを指し示す）の態様は、

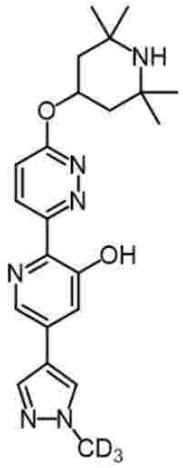
【化７－１】



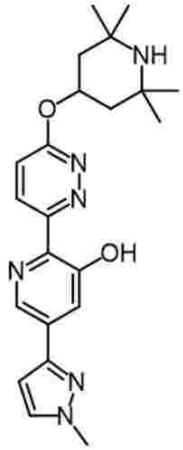
1



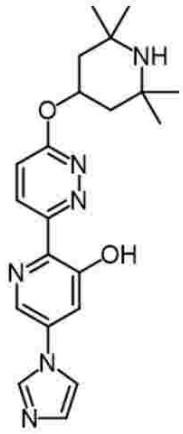
2



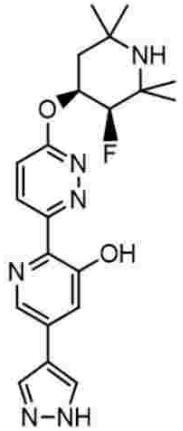
3



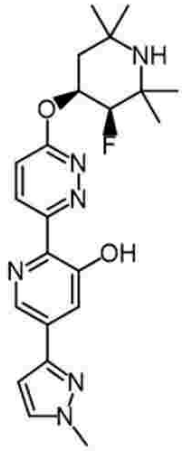
4



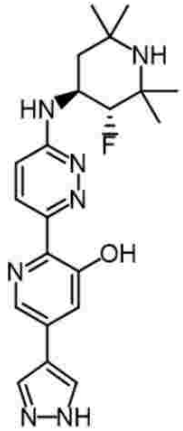
5



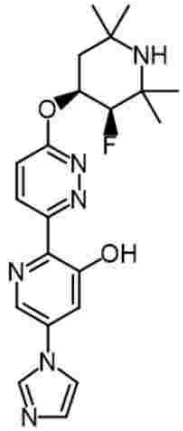
6#



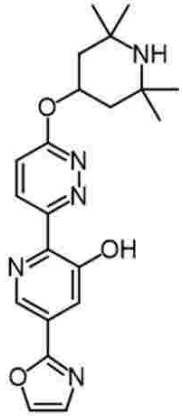
7~



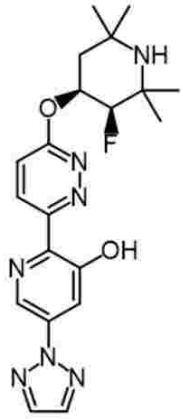
8



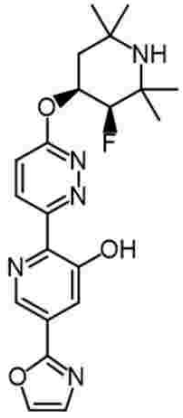
9~



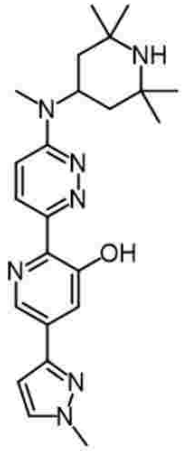
10



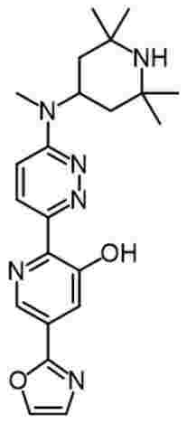
11~



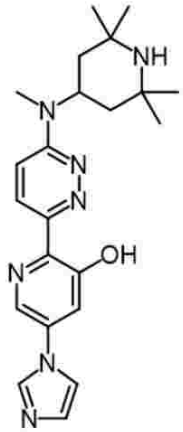
12~



13

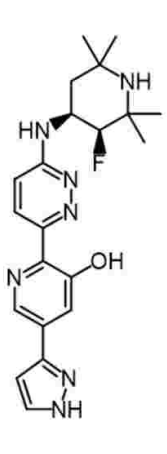


14

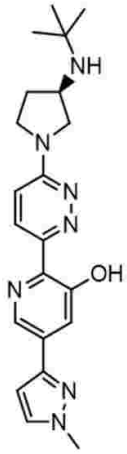


15

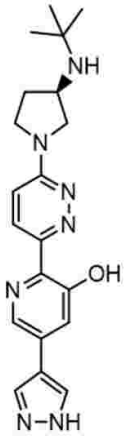
【化７－２】



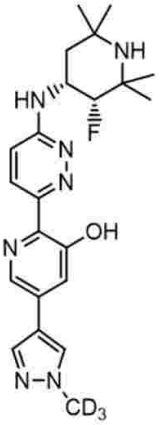
16#



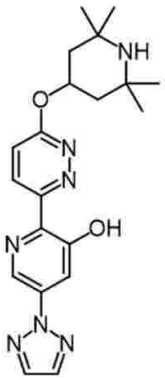
17#



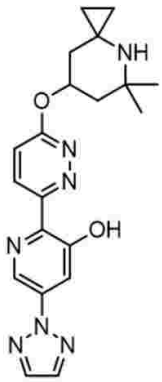
18#



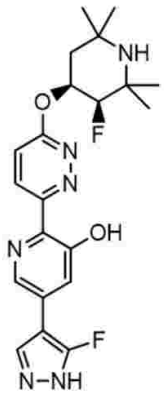
19~



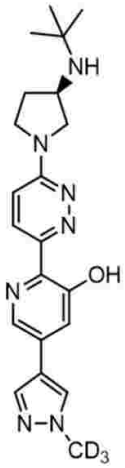
20



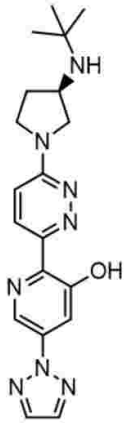
21



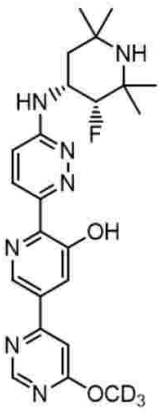
22~



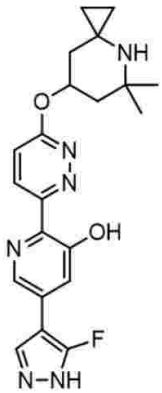
23



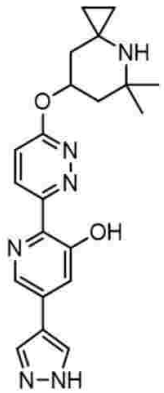
24



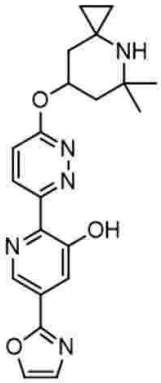
25



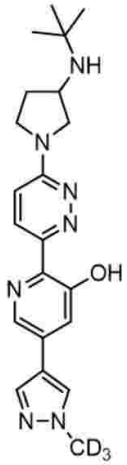
26



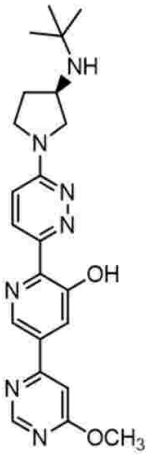
27



28

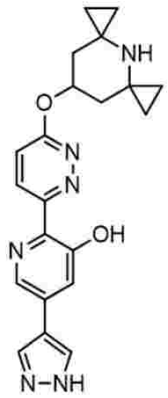


29

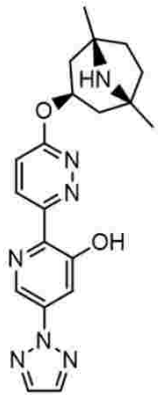


30

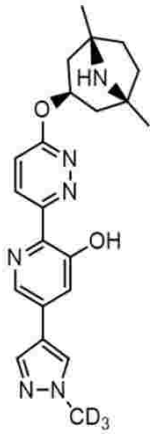
【化７－３】



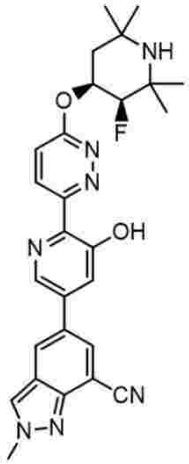
31



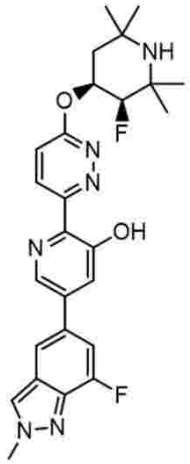
32&



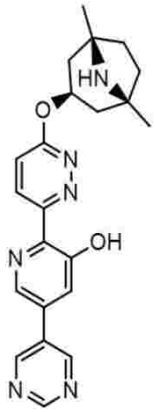
33&



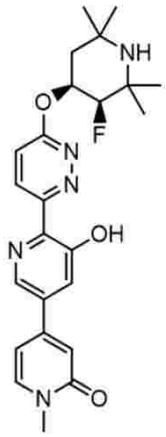
34~



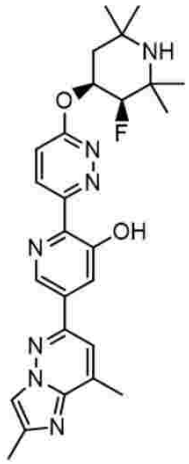
35~



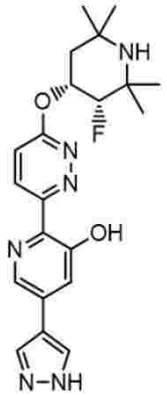
36&



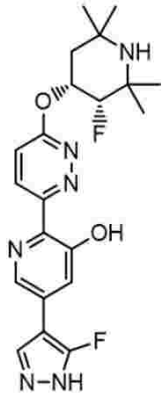
37~



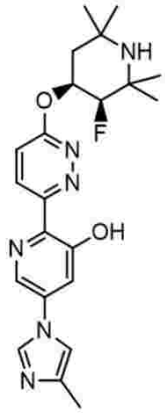
38~



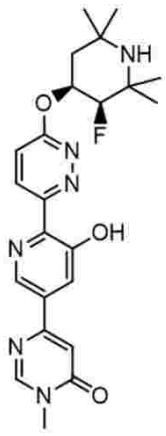
39~



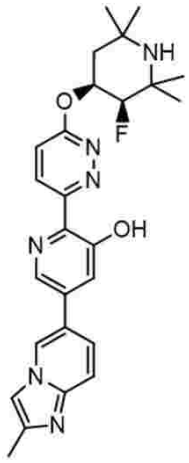
40



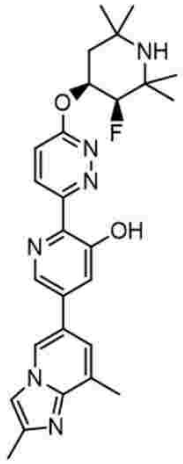
41#



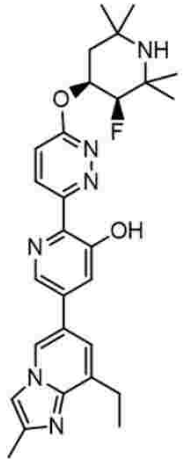
42#



43#

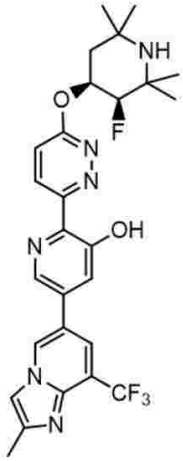


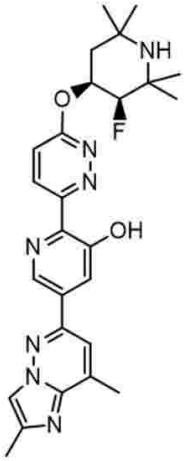
44#

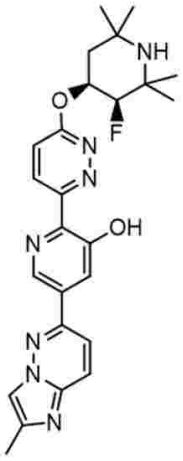


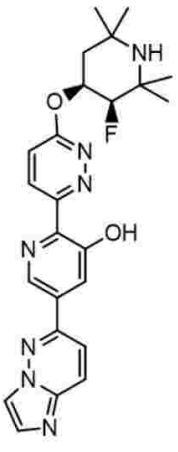
45#

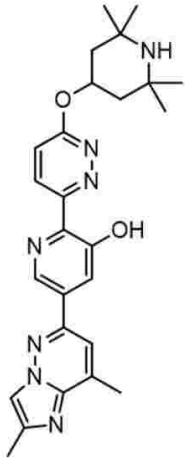
【化７－４】

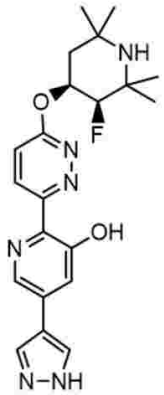

46#

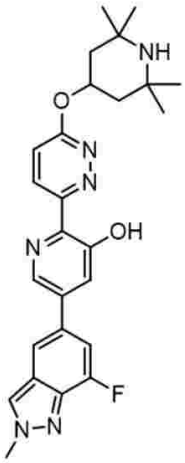

47#

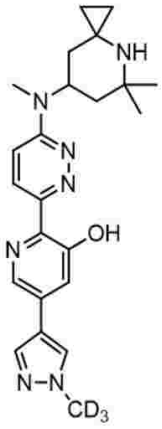

48#

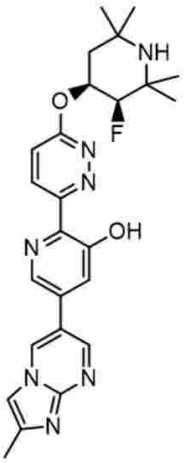

49#

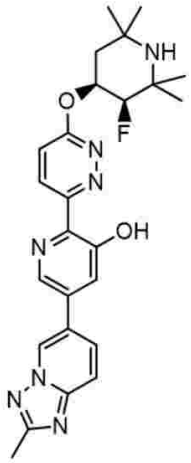

50

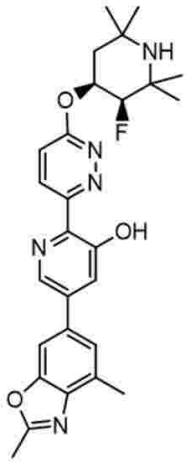

51~

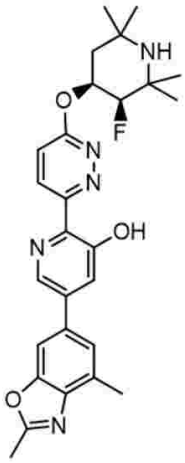

52

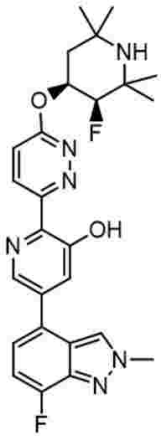

53

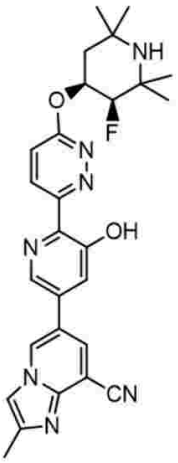

54#

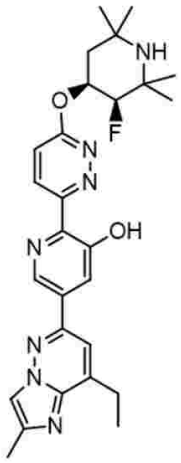

55#


56#

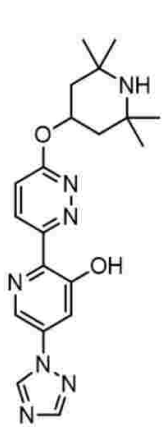

57#


58#

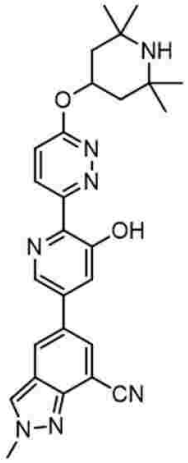

59#


60#

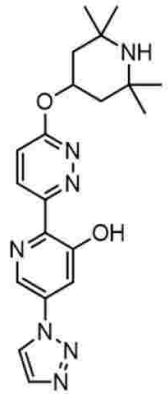
【化７－５】



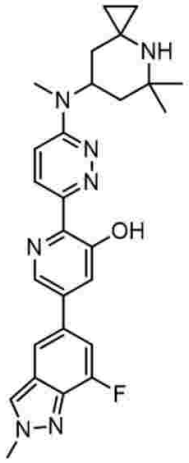
61



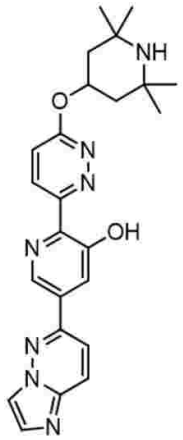
62



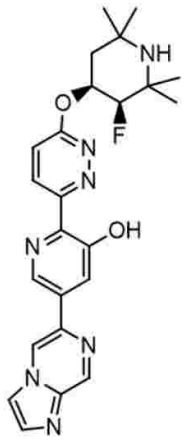
63



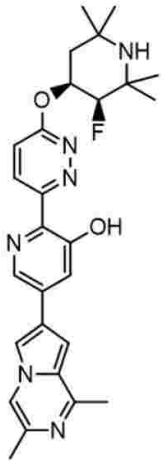
64



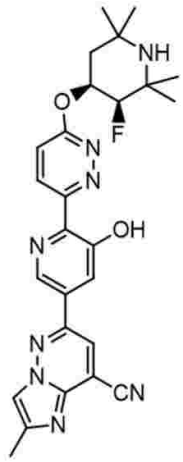
65



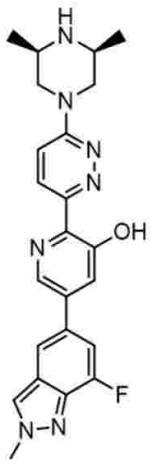
66#



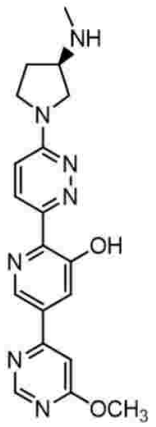
67#



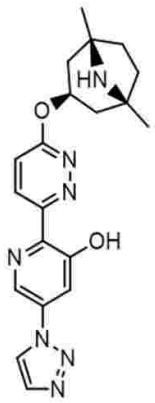
68#



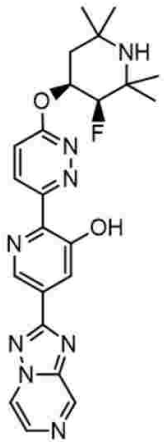
69&



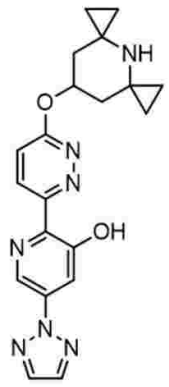
70



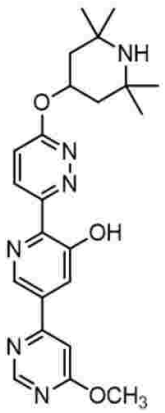
71#



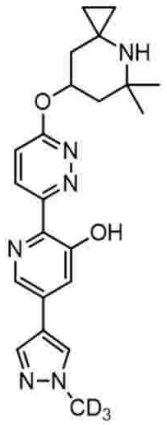
72#



73

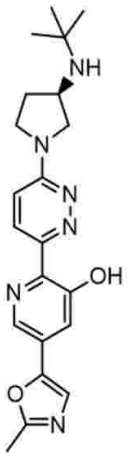


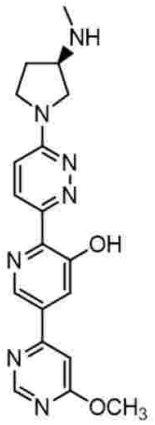
74

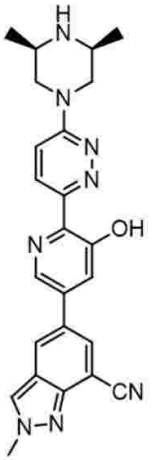


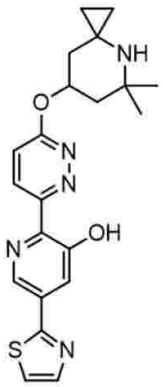
75

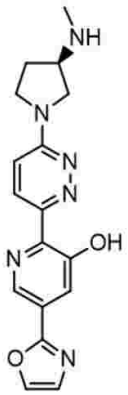
【化７－６】

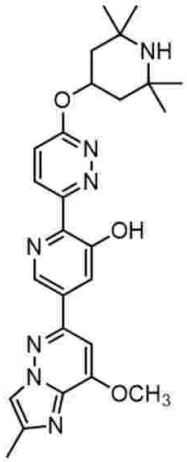

76

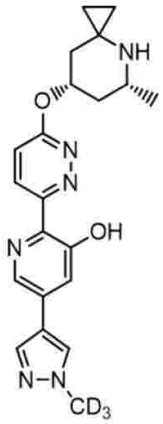

77

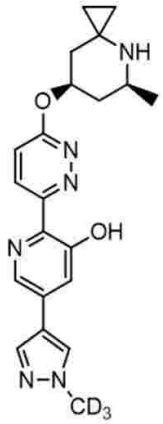

78#

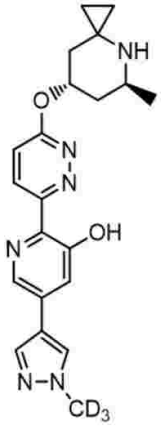

79

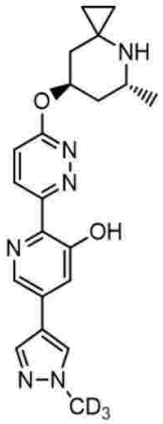

80

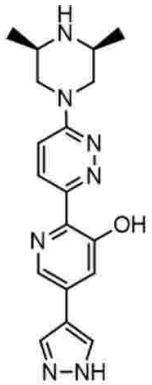

81

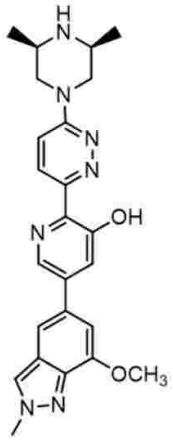

82

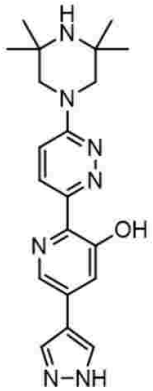

83

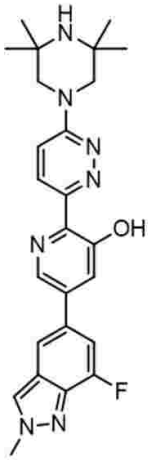

84

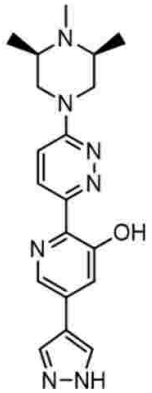

85


86&

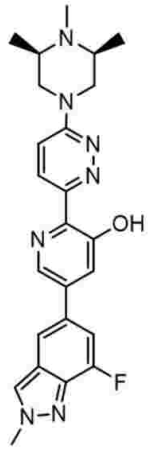

87&

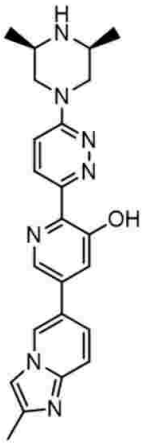

88

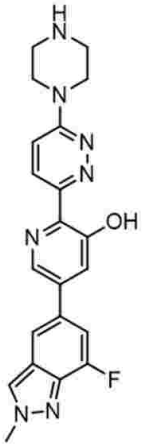

89

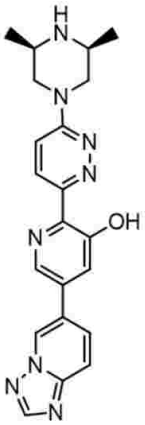

90&

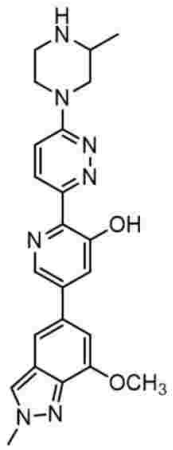
【化７－７】

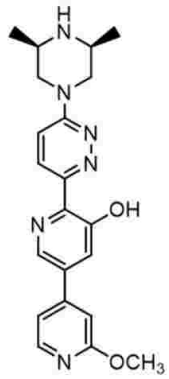

91&

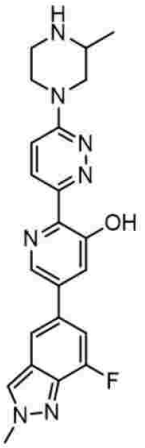

92#

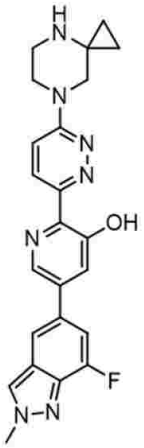

93

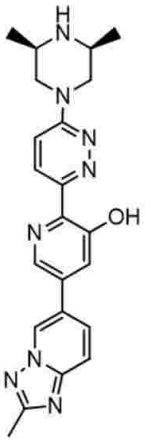

94&

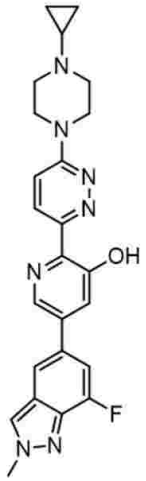

95

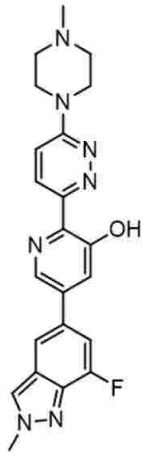

96&

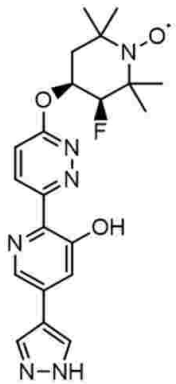

97

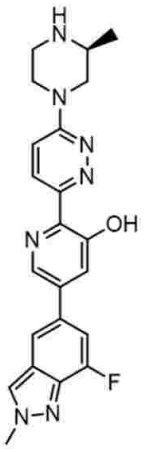

98

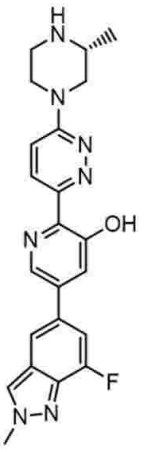

99&

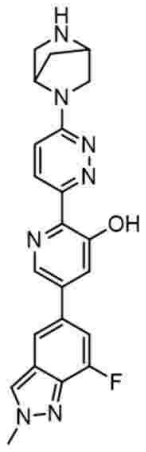

100


101

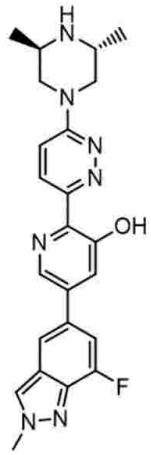

102


103

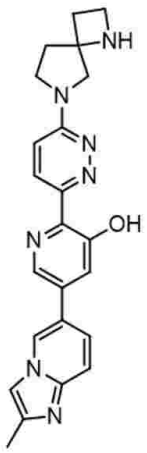

104


105

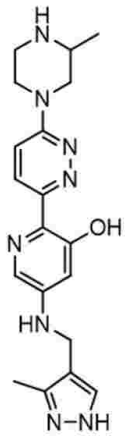
【化７－８】



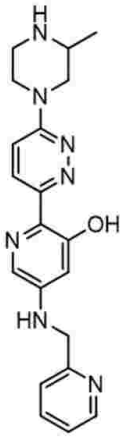
106#



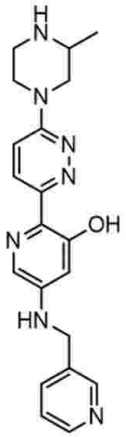
107



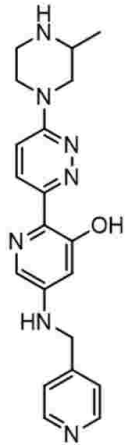
108



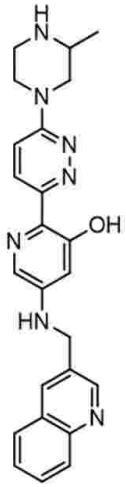
109



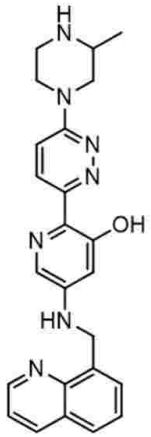
110



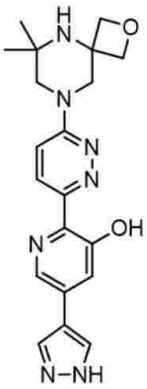
111



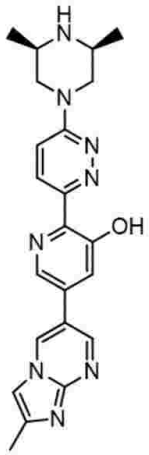
112



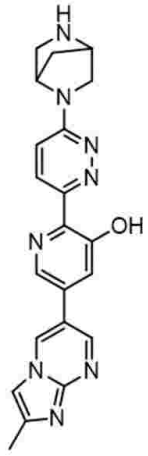
113



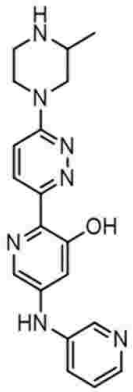
114



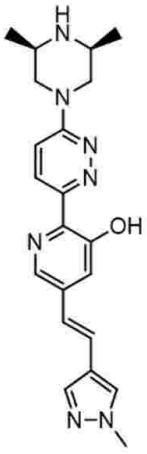
115#



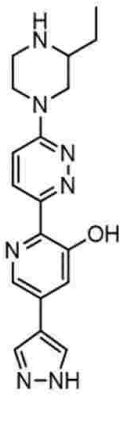
116



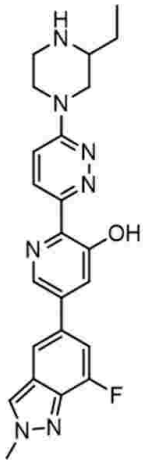
117



118#

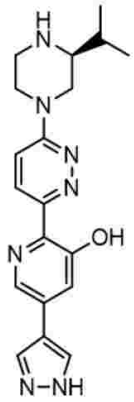


119

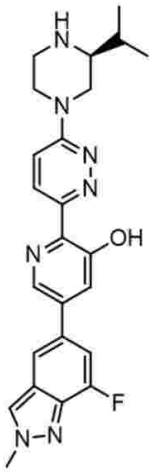


120

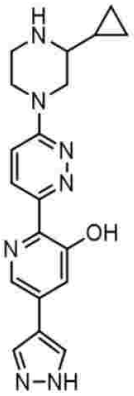
【化７－９】



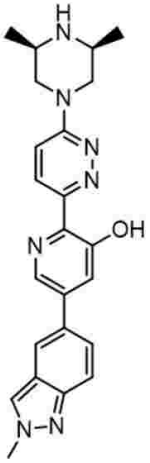
121#



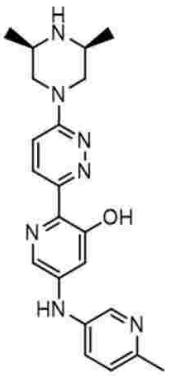
122



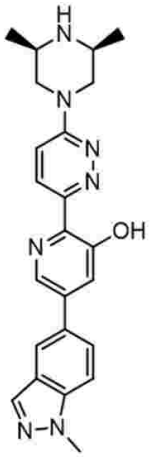
123



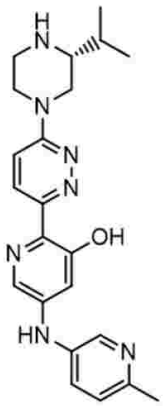
124&



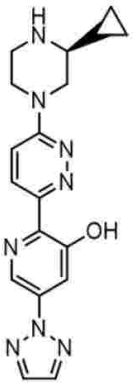
125



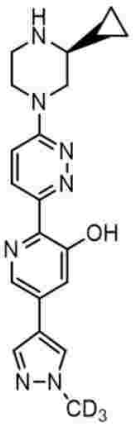
126&



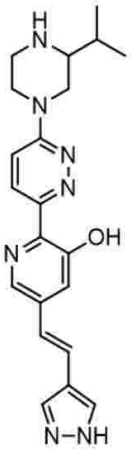
127#



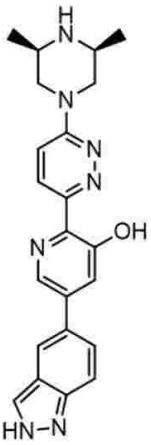
128



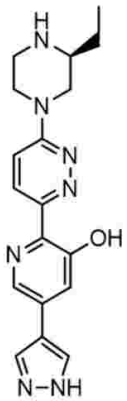
129



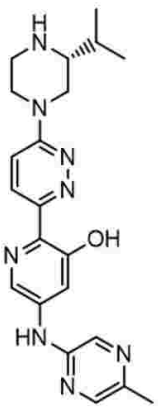
130



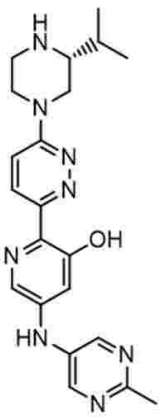
131&



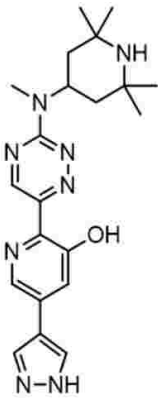
132



133#

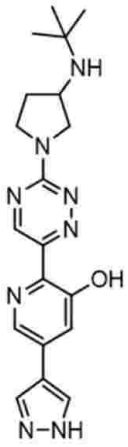


134#

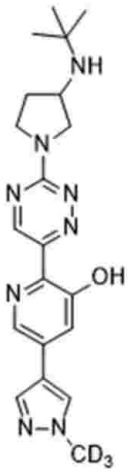


135

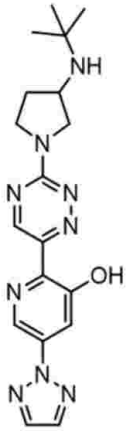
【化７－１０】



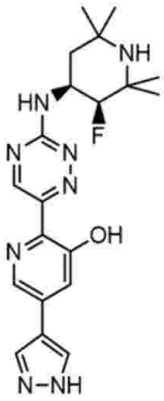
136



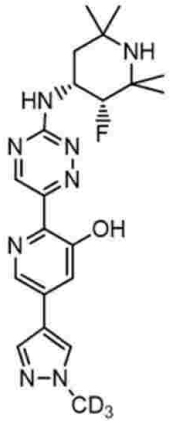
137



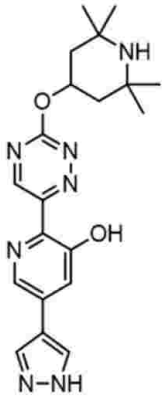
138



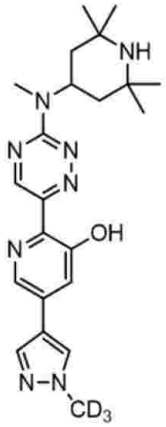
139#



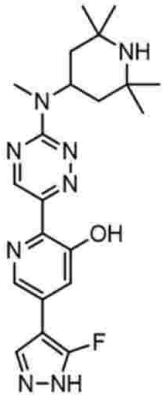
140#



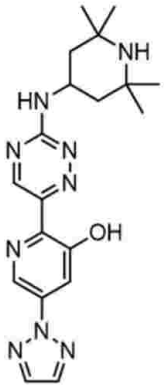
141



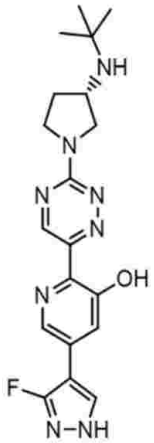
142



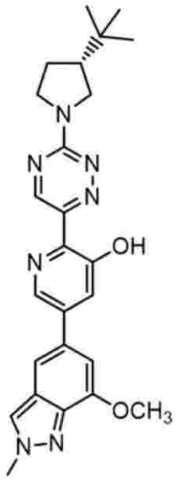
143



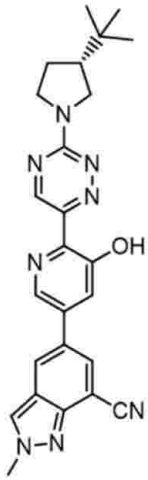
144



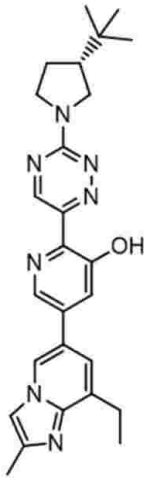
145



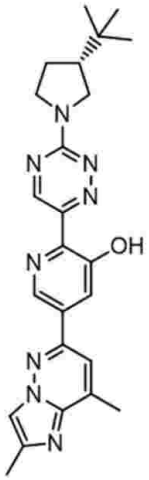
146



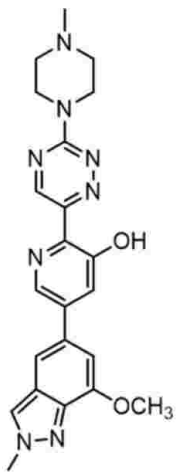
147



148

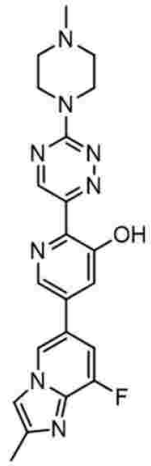


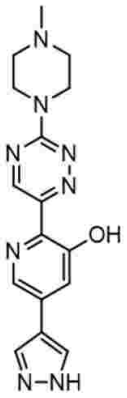
149

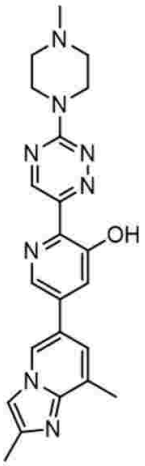


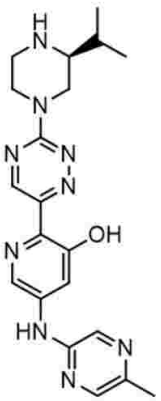
150

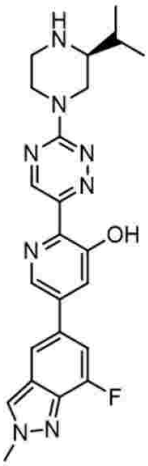
【化７－１１】

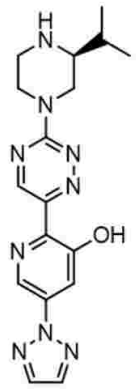

151

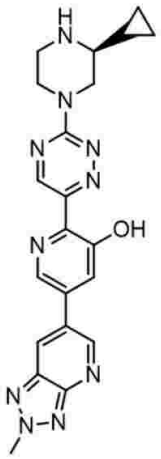

152

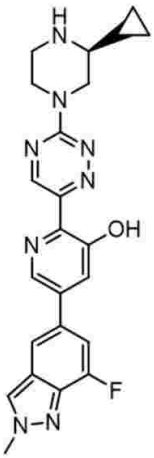

153

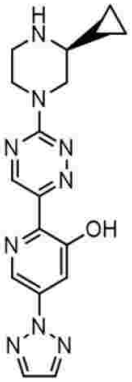

154

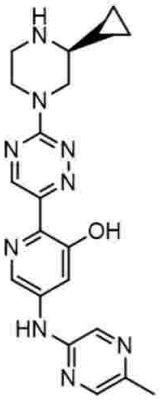

155

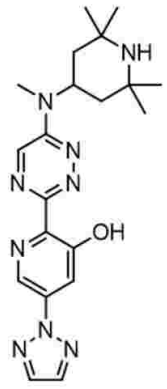

156

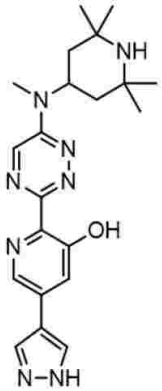

157

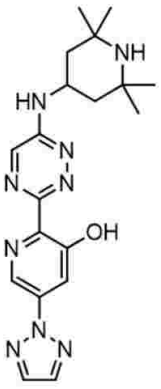

158

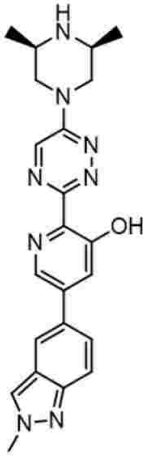

159


160


161


162


163、および


164&

からなる群から選択される化合物を含み、化合物の形態は、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、および混合物からなる群から選択される。

【０４７５】

式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物またはその形態（「^」は、塩形態が単離されたことを指し示す）の態様は、以下からなる群から選択される化合物を含み、化合物の形態は、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、および混合物からなる群から選択される。

【表１－１】

Cpd	名称
1^	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
2^	2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
3^	5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
4	5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
5	5-(1H-イミダゾール-1-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
6	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
7	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オール
8	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
9	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン-3-オール
10	5-(1,3-オキサゾール-2-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール

【表１－２】

Cpd	名称
11	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
12	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
13	5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
14	2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
15	5-(1H-イミダゾール-1-イル)-2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
16	2-(6-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オール
17	2-{6-[(3R)-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S)-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン-3-オール
18	2-{6-[(3R)-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S)-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
19^	2-(6-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
20	2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール

【表１－３】

Cpd	名称
21^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
22^	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールまたは 5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
23	2-{6-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
24	2-{6-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
25^	2-(6-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-{6-[($^2H_3$)メチルオキシ]ピリミジン-4-イル}ピリジン-3-オール
26^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
27^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
28^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
29^	2-{6-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
30	2-{6-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(6-メトキシピリミジン-4-イル)ピリジン-3-オール
31^	2-{6-[(4-アザスピロ[2.1.2^5.3^3]デカン-9-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
32^	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール

【表１－４】

Cpd	名称
33	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
34	5-[6-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリルまたは 5-[6-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリル
35	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールまたは 5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
36^	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(ピリミジン-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(ピリミジン-5-イル)ピリジン-3-オール
37	6-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシ-1′-メチル[3,4′-ビピリジン]-2′(1′H)-オンまたは 6-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシ-1′-メチル[3,4′-ビピリジン]-2′(1′H)-オン
38	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールまたは 5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール

【表１－５】

Cpd	名称
39^	2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
40^	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
41	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)ピリジン-3-オール
42	6-[6-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-3-メチルピリミジン-4(3H)-オンおよび 6-[6-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-3-メチルピリミジン-4(3H)-オン
43^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
44^	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール

【表１－６】

Cpd	名称
45^	5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
46^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[2-メチル-8-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル]ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[2-メチル-8-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル]ピリジン-3-オール
47	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
48^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール
49^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール
50^	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
51^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールまたは 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール

【表１－７】

Cpd	名称
52^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
53^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)(メチル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
54^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オール
55^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
56^	5-(2,4-ジメチル-1,3-ベンゾキサゾール-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(2,4-ジメチル-1,3-ベンゾキサゾール-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
57^	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール
58	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-4-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-4-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール

【表１－８】

Cpd	名称
59	6-[6-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-カルボニトリルおよび 6-[6-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-カルボニトリル
60	5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール
61^	2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール
62^	5-[6-(6-{[2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリル
63	2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール
64^	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)(メチル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
65^	5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
66	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-a]ピラジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-a]ピラジン-6-イル)ピリジン-3-オール
67	5-(1,3-ジメチルピロロ[1,2-a]ピラジン-7-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オールおよび 5-(1,3-ジメチルピロロ[1,2-a]ピラジン-7-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール

【表１－９】

Cpd	名称
68	6-[6-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-8-カルボニトリルおよび 6-[6-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-8-カルボニトリル
69^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
70	5-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-2-{6-[(3R)-3-(メチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
71^	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール
72	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピラジン-2-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピラジン-2-イル)ピリジン-3-オール
73	2-{6-[(4-アザスピロ[2.1.2^{5}3^3]デカン-9-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
74^	5-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
75	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
76^	2-{6-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル-1,3-オキサゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
77	2-{6-[(3R)-3-(メチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル-1,3-オキサゾール-5-イル)ピリジン-3-オール

【表１－１０】

Cpd	名称
78	5-(6-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-ヒドロキシピリジン-3-イル)-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリルおよび 5-(6-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-ヒドロキシピリジン-3-イル)-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリル
79	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1,3-チアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
80	2-{6-[(3R)-3-(メチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
81^	5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
82^	2-(6-{[(5R,7S)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
83	2-(6-{[(5S,7R)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
84^	2-(6-{[(5S,7S)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
85^	2-(6-{[(5R,7R)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
86^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
87^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
88^	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-[6-(3,3,5,5-テトラメチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
89^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(3,3,5,5-テトラメチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
90^	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(3R,5S)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オールおよび 5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(3S,5R)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール

【表１－１１】

Cpd	名称
91^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3R,5S)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オールおよび 5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3S,5R)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
92^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
93	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(ピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
94^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
95^	5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
96	6-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-2′-メトキシ[3,4′-ビピリジン]-5-オールおよび 6-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-2′-メトキシ[3,4′-ビピリジン]-5-オール
97	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
98	2-[6-(4,7-ジアザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
99	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
100	2-[6-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
101^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール
102	[(3R,4S)-3-フルオロ-4-({6-[3-ヒドロキシ-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-2-イル]ピリダジン-3-イル}オキシ)-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-1-イル]オキシダニル

【表１－１２】

Cpd	名称
103	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3S)-3-メチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
104	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3R)-3-メチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
105^	2-[6-(2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
106	2-{6-[(3R,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
107^	2-[6-(1,6-ジアザスピロ[3.4]オクタン-6-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
108^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
109^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-2-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
110^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-3-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
111^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-4-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
112^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(キノリン-3-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
113^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(キノリン-8-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
114	2-{6-[(6,6-ジメチル-2-オキサ-5-アザスピロ[3.5]ノナン-8-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
115^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オール
116^	2-[6-(2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オール
117^	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-[(ピリジン-3-イル)アミノ]ピリジン-3-オール

【表１－１３】

Cpd	名称
118^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オール
119^	2-[6-(3-エチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
120^	2-[6-(3-エチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
121^	2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
122^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
123^	2-[6-(3-シクロプロピルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
124	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
125^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]ピリジン-3-オール
126^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
127^	5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オールおよび 5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
128^	2-{6-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
129^	2-{6-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール

【表１－１４】

Cpd	名称
130^	2-{6-[3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オール
131^	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
132^	2-{6-[(3S)-3-エチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
133^	5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オールおよび 5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
134^	5-[(2-メチルピリミジン-5-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オールおよび 5-[(2-メチルピリミジン-5-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール
135^	2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
136^	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
137^	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール
138^	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
139^	2-(3-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-(3-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
140	2-(3-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オールおよび 2-(3-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール

【表１－１５】

Cpd	名称
141^	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{3-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール
142^	5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール
143^	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール
144^	2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
145^	2-{3-[(3S)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(3-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
146^	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
147^	6-(6-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-ヒドロキシピリジン-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-カルボニトリル
148^	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール
149^	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール
150^	5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール
151^	5-(8-フルオロ-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール
152^	2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
153^	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール
154^	5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール
155^	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール
156^	2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
157^	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2-メチル-2H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-b]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール

【表１－１６】

Cpd	名称
158^	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール
159^	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
160^	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]ピリジン-3-オール
161	2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール
162	2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール
163	2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール、および
164	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オールおよび 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール

【０４７６】
別の態様は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、化合物の形態は、塩酸塩、二塩酸塩、三塩酸塩、臭化水素酸塩、二臭化水素酸塩、三臭化水素酸塩、ギ酸塩、二ギ酸塩、三ギ酸塩、トリフルオロ酢酸塩、およびニトリフルオロ酢酸塩から選択される化合物塩である。
【０４７７】
別の態様は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を含み、化合物の形態は、塩酸塩、二塩酸塩、三塩酸塩、ギ酸塩、二ギ酸塩、およびトリフルオロ酢酸塩から選択される化合物塩である。
【０４７８】
式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物またはその形態の別の態様は、以下からなる群から選択される化合物塩であり、化合物の塩形態は、その水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、および混合物からなる群から選択される。

【表２－１】

Cpd	名称
1	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
2	2-{6-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
3	5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール塩酸塩
19	2-(6-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オールギ酸塩および 2-(6-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オールギ酸塩
21	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
22	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩または 5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
25	2-(6-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}ピリダジン-3-イル)-5-{6-[($^2H_3$)メチルオキシ]ピリミジン-4-イル}ピリジン-3-オール二ギ酸
26	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
27	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
28	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1,3-オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
29	2-{6-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
31	2-{6-[(4-アザスピロ[2.1.2^5.3^3]デカン-9-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－２】

Cpd	名称
32	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
36	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(ピリミジン-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(ピリミジン-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
39	2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩または 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
40	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
43	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩
44	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩

【表２－３】

Cpd	名称
45	5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩
46	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[2-メチル-8-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル]ピリジン-3-オール三塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[2-メチル-8-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル]ピリジン-3-オール三塩酸塩
48	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
49	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
50	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
51	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩または 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
52	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－４】

Cpd	名称
53	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)(メチル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
54	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩
55	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(2-メチル[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩
56	5-(2,4-ジメチル-1,3-ベンゾキサゾール-6-イル)-2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-(2,4-ジメチル-1,3-ベンゾキサゾール-6-イル)-2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
57	2-(6-{[(3R,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-(6-{[(3S,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
61	2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
62	5-[6-(6-{[2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-ヒドロキシピリジン-3-イル]-2-メチル-2H-インダゾール-7-カルボニトリル二塩酸塩
64	2-{6-[(5,5-ジメチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル)(メチル)アミノ]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－５】

Cpd	名称
65	5-(イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
69	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
71	2-(6-{[(1R,3s,5S)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩および 2-(6-{[(1S,3r,5R)-1,5-ジメチル-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-(1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
74	5-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
76	2-{6-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチル-1,3-オキサゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
81	5-(8-メトキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)-2-{6-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
82	2-(6-{[(5R,7S)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
84	2-(6-{[(5S,7S)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
85	2-(6-{[(5R,7R)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-イル]オキシ}ピリダジン-3-イル)-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
86	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－６】

Cpd	名称
87	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
88	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-[6-(3,3,5,5-テトラメチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール塩酸塩
89	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(3,3,5,5-テトラメチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール塩酸塩
90	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(3R,5S)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{6-[(3S,5R)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
91	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3R,5S)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3S,5R)-3,4,5-トリメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
92	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
94	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-([1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
95	5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
101	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
105	2-[6-(2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
107	2-[6-(1,6-ジアザスピロ[3.4]オクタン-6-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－７】

Cpd	名称
108	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール二塩酸塩
109	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-2-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール二塩酸塩
110	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-3-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール二塩酸塩
111	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(ピリジン-4-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール
112	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(キノリン-3-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール二塩酸塩
113	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-{[(キノリン-8-イル)メチル]アミノ}ピリジン-3-オール二塩酸塩
115	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩
116	2-[6-(2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン-6-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩
117	2-[6-(3-メチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-[(ピリジン-3-イル)アミノ]ピリジン-3-オール二塩酸塩
118	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
119	2-[6-(3-エチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
120	2-[6-(3-エチルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－８】

Cpd	名称
121	2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
122	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
123	2-[6-(3-シクロプロピルピペラジン-1-イル)ピリダジン-3-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
125	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]ピリジン-3-オール二塩酸塩
126	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
127	5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-[(6-メチルピリジン-3-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
128	2-{6-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
129	2-{6-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[1-($^{2}H_{3}$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
130	2-{6-[3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-[(E)-2-(1H-ピラゾール-4-イル)エテニル]ピリジン-3-オール二塩酸塩
131	2-{6-[(3R,5S)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩および 2-{6-[(3S,5R)-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
132	2-{6-[(3S)-3-エチルピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二塩酸塩
133	5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩

【表２－９】

Cpd	名称
134	5-[(2-メチルピリミジン-5-イル)アミノ]-2-{6-[(3R)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩および 5-[(2-メチルピリミジン-5-イル)アミノ]-2-{6-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]ピリダジン-3-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
135	2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩
136	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール二ギ酸
137	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-オール二ギ酸
138	2-{3-[3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
139	2-(3-{[(3S,4S)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩および 2-(3-{[(3R,4R)-3-フルオロ-2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル]アミノ}-1,2,4-トリアジン-6-イル)-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール三塩酸塩
141	5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-{3-[(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)オキシ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩
142	5-[1-($^2H_3$)メチル-1H-ピラゾール-4-イル]-2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
143	5-(5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)-2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
144	2-{3-[メチル(2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)アミノ]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール二トリフルオロ酢酸塩
145	2-{3-[(3S)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(3-フルオロ-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩

【表２－１０】

Cpd	名称
146	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
147	6-(6-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-ヒドロキシピリジン-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-カルボニトリル塩酸塩
148	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(8-エチル-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
149	2-{3-[(3R)-3-(tert-ブチルアミノ)ピロリジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
150	5-(7-メトキシ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール塩酸塩
151	5-(8-フルオロ-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール塩酸塩
152	2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]-5-(1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
153	5-(2,8-ジメチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,2,4-トリアジン-6-イル]ピリジン-3-オール塩酸塩
154	5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]-2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール二塩酸塩
155	5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)-2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}ピリジン-3-オール塩酸塩
156	2-{3-[(3S)-3-(プロパン-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
157	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2-メチル-2H-[1,2,3]トリアゾロ[4,5-b]ピリジン-6-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩
158	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(7-フルオロ-2-メチル-2H-インダゾール-5-イル)ピリジン-3-オール塩酸塩
159	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-3-オールトリフルオロ酢酸塩、および
160	2-{3-[(3S)-3-シクロプロピルピペラジン-1-イル]-1,2,4-トリアジン-6-イル}-5-[(5-メチルピラジン-2-イル)アミノ]ピリジン-3-オール塩酸塩

【０４７９】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの防止、処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを防止、処置または寛解するための方法を含む。

【０４８０】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための方法を含む。

【０４８１】

本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための方法を含む。

【０４８２】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、

またはその形態または組成物を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態または組成物を使用する方法を含む。

【０４８３】

本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態または組成物を使用する方法を含む。

【０４８４】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。

【０４８５】

本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態の使用を含む。

【０４８６】

本明細書の態様は、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬の製造における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、有効量の医薬を対象に投与することを含む、使用を含む。

【０４８７】

本明細書の別の態様は、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬の製造における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態の使用であって、有効量の医薬を対象に投与することを含む、使用を含む。

【０４８８】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の作用剤と組み合わせて対象に投与することを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための、１つまたは複数の治療剤との組合せ製品における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。

【０４８９】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の作用剤と組み合わせて対象に投与することを含む、ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための１つまたは複数の治療剤との組合せ製品における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。

【０４９０】

化学的定義

上で、また、本明細書の説明全体で使用される化学用語は、特に定義されていない限り、以下で指し示されている意味を有すると当業者により理解されるものとする。

【０４９１】

本明細書で使用されている、「C_{1-4}アルキル」という用語は、一般に、直鎖または分岐鎖配置に１～４個の炭素原子を有する飽和炭化水素ラジカルを指し、メチル、エチル、ｎ－プロピル（プロピルまたはプロパニルとも呼ばれる）、イソプロピル、ｎ－ブチル（ブチルまたはブタニルとも呼ばれる）、イソブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチルなどを含むが、それらに限定されない。C_{1-4}アルキルラジカルは、利用できる価数により可

能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９２】
本明細書で使用されている、「C_{2-4}アルケニル」という用語は、一般に、直鎖または分岐鎖配置に２～４個の炭素原子、および、そこに１つまたは複数の炭素－炭素二重結合を有する部分的不飽和炭化水素ラジカルを指し、エテニル（ビニルとも呼ばれる）、アリル、プロペニルなどを含むが、それらに限定されない。C_{2-4}アルケニルラジカルは、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９３】
本明細書で使用されている、「C_{2-4}アルキニル」という用語は、一般に、直鎖または分岐鎖配置に２～８個の炭素原子、および、そこに１つまたは複数の炭素－炭素三重結合を有する部分的不飽和炭化水素ラジカルを指し、エチニル、プロピニル、ブチニルなどを含むが、それらに限定されない。ある態様では、C_{2-4}アルキニルは、C_{2-4}アルキニル、C_2アルキニルなどを含むが、それらに限定されない。C_{2-4}アルキニルラジカルは、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９４】
本明細書で使用されている、「C_{1-4}アルコキシ」という用語は、一般に、式－Ｏ－C_{1-4}アルキルの直鎖または分岐鎖配置に１～４個の炭素原子を有する飽和炭化水素ラジカルを指し、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソプロポキシ、ｎ－ブトキシ、イソブトキシ、ｓｅｃ－ブトキシ、ｔｅｒｔ－ブトキシなどを含むが、それらに限定されない。C_{1-44}アルコキシラジカルは、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９５】
本明細書で使用されている、「C_{3-6}シクロアルキル」という用語は、一般に、飽和または部分的不飽和単環式、二環式または多環式炭化水素ラジカルを指し、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、およびシクロヘキセニルなどを含むが、それらに限定されない。C_{3-6}シクロアルキルラジカルは、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９６】
本明細書で使用されている、「アリール」という用語は、一般に、単環式、二環式または多環式芳香族炭素原子環構造ラジカルを指し、フェニル、ナフチル、アントラセニル、フルオレニル、アズレニル、フェナントレニルなどを含むが、それらに限定されない。アリールラジカルは、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。
【０４９７】
本明細書で使用されている、「ヘテロアリール」という用語は、一般に、１個または複数の炭素原子環員が、構造的安定性により可能であれば、１個または複数のヘテロ原子、例えばＯ、ＳまたはＮ原子で置き換えられている単環式、二環式または多環式芳香族炭素原子環構造ラジカルを指し、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、１，３－チアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、インドリル、インダゾリル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダゾリル、１，３－ベンゾチアゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、プリニル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、１，３－ジアジニル、１，２－ジアジニル、１，２－ジアゾリル、１，４－ジアザナフタレニル、アクリジニル、フロ［３，２－ｂ］ピリジニル、フロ［３，２－ｃ］ピリジニル、フロ［２，３－ｃ］ピリジニル、６Ｈ－チエノ［２，３－ｂ］ピロリル、チエノ［３，２－ｃ］ピリジニル、チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジニル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、ピロロ［１

，２－ｂ］ピリダジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、ピラゾロ［１，５－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、３Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｃ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３］チアゾリル、イミダゾ［２，１－ｂ］［１，３，４］チアジアゾリル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニルなどを含むが、それらに限定されない。ヘテロアリールラジカルは、炭素または窒素原子環員上において、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。

【０４９８】

ある態様では、ヘテロアリールラジカルの命名法は、例えば、フラニルが、フリルとも呼ばれ得、チエニルが、チオフェニルとも呼ばれ得、ピリジニルが、ピリジルとも呼ばれ得、ベンゾチエニルが、ベンゾチオフェニルとも呼ばれ得、１，３－ベンゾオキサゾリルが、１，３－ベンゾオキサゾリルとも呼ばれ得る非限定的な例では、異なることがある。

【０４９９】

ある他の態様では、ヘテロアリールラジカルに関する用語は、例えば、ピロリルという用語が、２Ｈ－ピロリル、３Ｈ－ピロリルなども含み得、ピラゾリルという用語が、１Ｈ－ピラゾリルなども含み得、イミダゾリルという用語が、１Ｈ－イミダゾリルなども含み得、トリアゾリルという用語が、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリルなども含み得、オキサジアゾリルという用語が、１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリルなども含み得、テトラゾリルという用語が、１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリルなども含み得、インドリルという用語が、１Ｈ－インドリルなども含み得、インダゾリルという用語が、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリルなども含み得、ベンゾイミダゾリルという用語が、１Ｈ－ベンゾイミダゾリルも含み得、プリニルという用語が、９Ｈ－プリニルなども含み得る非限定的な例では、他の位置異性体も含み得る。

【０５００】

本明細書で使用されている、「ヘテロシクリル」という用語は、一般に、１個または複数の炭素原子環員が、構造的安定性により可能であれば、ヘテロ原子、例えばＯ、ＳまたはＮ原子で置き換えられている、飽和または部分的不飽和単環式、二環式または多環式炭素原子環構造ラジカルを指し、オキシラニル、オキセタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラニル、ピロリニル、ピロリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、イソオキサゾリニル、イソオキサゾリジニル、イソチアゾリニル、イソチアゾリジニル、オキサゾリニル、オキサゾリジニル、チアゾリニル、チアゾリジニル、トリアゾリニル、トリアゾリジニル、オキサジアゾリニル、オキサジアゾリジニル、チアジアゾリニル、チアジアゾリジニル、テトラゾリニル、テトラゾリジニル、ピラニル、ジヒドロ－２Ｈ－ピラニル、チオピラニル、１，３－ジオキサニル、１，２，５，６－テトラヒドロピリジニル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、１，４－ジアゼパニル、１，３－ベンゾジオキソリル、１，４－ベンゾジオキサニル、２，３－ジヒドロ－１，４－ベンゾジオキシニル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（１Ｈ）－イル、（３ａＳ，６ａＳ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（１Ｈ）－イル、（３ａＲ，６ａＲ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、（３ａＳ，６ａＳ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、（３ａＲ，６ａＲ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｂ］ピロール－（２Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－（１Ｈ）－イル、（３ａＲ，６ａＳ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－（１Ｈ）－イル、（３ａＲ，６ａＲ）－ヘキサヒドロピロロ［３，４－ｃ］ピロール－（１Ｈ）－イル、オクタヒドロ－５Ｈ－ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、（４ａＲ，７ａＲ）－オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジニル、（４ａＳ，７ａＳ）－オクタヒドロ－６Ｈ－ピロロ［３，

４－ｂ］ピリジニル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、（７Ｒ，８ａＳ）－ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、（８ａＳ）－ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、（８ａＲ）－ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、（８ａＳ）－オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、（８ａＲ）－オクタヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（１Ｈ）－イル、ヘキサヒドロピロロ［１，２－ａ］ピラジン－（２Ｈ）－オン、オクタヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジニル、３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキシル、（１Ｒ，５Ｓ）－３－アザビシクロ［３．１．０］ヘキシル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクチル、（１Ｒ，５Ｓ）－８－アザビシクロ［３．２．１］オクチル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エニル、（１Ｒ，５Ｓ）－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エニル、９－アザビシクロ［３．３．１］ノニル、（１Ｒ，５Ｓ）－９－アザビシクロ［３．３．１］ノニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプチル、（１Ｓ，４Ｓ）－２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプチル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．２］オクチル、３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクチル、（１Ｒ，５Ｓ）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクチル、１，４－ジアザビシクロ［３．２．２］ノニル、アザスピロ［３．３］ヘプチル、２，６－ジアザスピロ［３．３］ヘプチル、２，６－ジアザスピロ［３．４］オクチル、２，７－ジアザスピロ［３．５］ノニル、５，８－ジアザスピロ［３．５］ノニル、２，７－ジアザスピロ［４．４］ノニル、６，９－ジアザスピロ［４．５］デシル、７－アザジスピロ［５．１．５^{8}．３^{6}］ヘキサデカニルなどを含むが、それらに限定されない。ヘテロシクリルラジカルは、炭素または窒素原子環員上において、利用できる価数により可能であれば、本明細書に記載されている置換基種で置換されていてもよい。

【０５０１】

ある態様では、ヘテロシクリルラジカルの命名法は、例えば１，３－ベンゾジオキソリルが、ベンゾ［ｄ］［１，３］ジオキソリルとも呼ばれ得、２，３－ジヒドロ－１，４－ベンゾジオキシニルが、２，３－ジヒドロベンゾ［ｂ］［１，４］ジオキシニルとも呼ばれ得る非限定的な例では、異なることがある。

【０５０２】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルコキシ－Ｃ$_{1-4}$アルキル」という用語は、式－Ｃ$_{1-4}$アルキル－Ｏ－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０３】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルコキシ－カルボニル」という用語は、式－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０４】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルコキシ－カルボニル－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０５】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルキル－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０６】

本明細書で使用されている、「（Ｃ$_{1-4}$アルキル）$_{2}$－アミノ」という用語は、式－Ｎ（Ｃ$_{1-4}$アルキル）$_{2}$のラジカルを指す。

【０５０７】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルキル－カルボニル」という用語は、式－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０８】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルキル－カルボニル－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_{1-4}$アルキルのラジカルを指す。

【０５０９】

本明細書で使用されている、「Ｃ$_{1-4}$アルキル－チオ」という用語は、式－Ｓ－Ｃ$_{1-4}$ア

ルキルのラジカルを指す。

【０５１０】

本明細書で使用されている、「アミノ」という用語は、式－NH_2のラジカルを指す。

【０５１１】

本明細書で使用されている、「アミノ－C_{1-4}アルキル」という用語は、式－C_{1-4}アルキル－NH_2のラジカルを指す。

【０５１２】

本明細書で使用されている、「重水素－C_{1-4}アルキル」という用語は、式－C_{1-4}アルキルのラジカルを指し、C_{1-4}アルキルが、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換される。

【０５１３】

本明細書で使用されている、「重水素－C_{1-4}アルコキシ」という用語は、式－C_{1-4}アルコキシのラジカルを指し、C_{1-4}アルコキシが、利用できる価数により可能であれば、１個または複数の重水素原子で部分的に、または完全に置換される。

【０５１４】

本明細書で使用されている、「ハロ」または「ハロゲン」という用語は、一般に、フルオロ、クロロ、ブロモおよびヨードを含むハロゲン原子ラジカルを指す。

【０５１５】

本明細書で使用されている、「ハロ－C_{1-4}アルコキシ」という用語は、式－Ｏ－C_{1-4}アルキル－ハロのラジカルを指し、C_{1-4}アルキルが、利用できる価数により可能であれば、１個または複数のハロゲン原子で部分的に、または完全に置換される。

【０５１６】

本明細書で使用されている、「ハロ－C_{1-4}アルキル」という用語は、式－C_{1-4}アルキル－ハロのラジカルを指し、C_{1-4}アルキルが、利用できる価数により可能であれば、１個または複数のハロゲン原子で部分的に、または完全に置換される。

【０５１７】

本明細書で使用されている、「ハロ－C_{1-4}アルキル－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－C_{1-4}アルキル－ハロのラジカルを指す。

【０５１８】

本明細書で使用されている、「（ハロ－C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ」という用語は、式－Ｎ（C_{1-4}アルキル－ハロ）$_2$のラジカルを指す。

【０５１９】

本明細書で使用されている、「ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル」という用語は、式－C_{1-4}アルキル－ヘテロアリールのラジカルを指す。

【０５２０】

本明細書で使用されている、「ヘテロアリール－C_{2-4}アルケニル」という用語は、式－C_{2-4}アルケニル－ヘテロアリールのラジカルを指す。

【０５２１】

本明細書で使用されている、「ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－C_{1-4}アルキル－ヘテロアリールのラジカルを指す。

【０５２２】

本明細書で使用されている、「（ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル）$_2$－アミノ」という用語は、式－Ｎ（C_{1-4}アルキル－ヘテロアリール）$_2$のラジカルを指す。

【０５２３】

本明細書で使用されている、「ヘテロアリール－アミノ」という用語は、式－ＮＨ－ヘテロアリールのラジカルを指す。

【０５２４】

本明細書で使用されている、「ヒドロキシ」という用語は、式－ＯＨのラジカルを指す。

【０５２５】

本明細書で使用されている、「ヒドロキシ－C_{1-4}アルキル」という用語は、式－C_{1-4}

アルキル－ＯＨのラジカルを指し、C_{1-4}アルキルが、利用できる価数により可能であれば、１個または複数のヒドロキシラジカルで部分的に、または完全に置換される。

【０５２６】

本明細書で使用されている、「シアノ」という用語は、式－ＣＮのラジカルを指す。

【０５２７】

本明細書で使用されている「置換基」という用語は、指定された原子上の１つまたは複数の水素に置き換わる、指定された原子位置で置換されるコア分子の原子上における位置可変要素を意味するが、但し、指定された原子の通常の価数を超えず、置換により安定な化合物が生じることを条件とする。置換基および／または可変要素の組合せは、そのような組合せにより安定な化合物が生じる場合にのみ許容される。当業者は、本明細書で記載されている、または示されている、満たされていないと思われる価数を有する任意の炭素ならびにヘテロ原子が、記載されている、または示されている価数を満たすのに十分な水素原子（複数可）を有すると推測されることに留意すべきである。ある例では、付着点として二重結合（例えば、「オキソ」または「＝Ｏ」）を有する１つまたは複数の置換基は、本明細書で置換基内に記載され得、示され得、または列挙され得、構造は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）のコア構造への付着点として単結合のみを示し得る。そのような置換基に対しては、単結合のみが示されていても、二重結合が意図されることを当業者は理解するであろう。

【０５２８】

本明細書で使用されている「など」という用語は、本明細書で示される化学用語の定義に関して、当業者により予想できる化学構造における変形が、以下に限定されないが、異性体（鎖、分岐または位置構造異性体を含む）、環系の水和（単環式、二環式または多環式環構造の飽和または部分的不飽和を含む）、および利用できる価数により可能であれば、安定な化合物を生じる他の変形すべてを含むことを意味する。

【０５２９】

本明細書の目的に関して、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態に対する１つまたは複数の置換基可変要素は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物に組み込まれている官能基を包含する場合、開示されている化合物内の任意の場所に現れる各官能基は、独立して選択され得、必要に応じて、独立して置換され得、かつ／または置換されてもよい。

【０５３０】

本明細書で使用されている、「独立して選択される」または「それぞれ選択される」という用語は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の構造上に１回超発生し得、それぞれの発生における置換パターンは、いずれか他の発生におけるパターンとは関係ない置換基リスト中の官能基可変要素を指す。さらに、本明細書に記載されている化合物に対する任意の式または構造における一般的な置換基可変要素の使用は、特定の属内に含まれる種の置換基を用いた一般的な置換基の置き換えを含み、例えば、アリールは、フェニルまたはナフタレニルなどで置き換えられ得、生じた化合物は、本明細書に記載されている化合物の範囲内に含まれることになると理解される。

【０５３１】

本明細書で使用されている「の各例」または「存在する場合、各例では」という用語は、例えば、「．．．C_{3-14}シクロアルキル、C_{3-14}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル、アリール、アリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール－C_{1-4}アルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル－C_{1-4}アルキル」という語句に先行して使用される場合、それぞれが単体で、または置換基として存在すればC_{3-14}シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル環系を指すよう意図されている。

【０５３２】

本明細書で使用されている「置換されていてもよい」という用語は、特定の置換基可変要素、基、ラジカルまたは部分を用いた任意の置換を意味する。

【０５３３】

化合物形態

本明細書で使用されている「形態」という用語は、その遊離酸、遊離塩基、塩、水和物、溶媒和物、包接化合物、アイソトポログ、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、多形体および互変異性体形態からなる群から選択される形態を有する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を意味する。

【０５３４】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、その遊離酸、遊離塩基または塩である。

【０５３５】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、その塩である。

【０５３６】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、そのラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、または混合物である。

【０５３７】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、ラセミ化合物である。

【０５３８】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、その鏡像異性体または混合物である。

【０５３９】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、そのジアステレオ異性体または混合物である。

【０５４０】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、その互変異性体である。

【０５４１】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態は、医薬として許容できる形態である。

【０５４２】

本明細書に記載されているある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態は、使用するために単離される。

【０５４３】

本明細書で使用されている「単離される」という用語は、合成プロセスから（例えば、反応混合物から）、または、本明細書に記載されている、もしくは当業者に周知の単離もしくは精製プロセス（例えば、クロマトグラフィー、再結晶化など）に従って、天然供給源またはその組合せから、本明細書に記載されている、または当業者に周知の標準的分析技術により特徴付けられるのに十分な純度で、単離および／または精製した後における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の物理的状態を意味する。

【０５４４】

本明細書で使用されている「保護される」という用語は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態における官能基が、化合物に反応を施した際に、保護された部位での望ましくない副反応を除外するように修飾された形態を意味する。適切な保護基は、当業者、ならびに標準的なテキストブック、例えば、Ｔ．Ｗ．　Ｇｒｅｅｎｅ　ｅｔ　ａｌ，　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ　Ｇｒｏｕｐｓ　ｉｎ　ｏｒｇａｎｉｃ　Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　（１９９１），　Ｗｉｌｅｙ，　Ｎｅｗ　Ｙｏｒｋの参照により把握される。そのような官能基は、ヒドロキシ、フェノール、アミノおよびカルボン酸を含む。ヒドロキシまたはフェノールに適切な保護基は、トリアルキルシリルまたはジアリールア

ルキルシリル（例えば、ｔ－ブチルジメチルシリル、ｔ－ブチルジフェニルシリルまたはトリメチルシリル）、テトラヒドロピラニル、ベンジル、置換ベンジル、メチル、メトキシメタノールなどを含む。アミノ、アミジノおよびグアニジノに適切な保護基は、ｔ－ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルなどを含む。カルボン酸に適切な保護基は、アルキル、アリールまたはアリールアルキルエステルを含む。ある例では、保護基は、ポリマー樹脂、例えばＷａｎｇ樹脂または塩化２－クロロトリチル樹脂でもあり得る。保護基は、当業者に周知であり、本明細書に記載されている標準的技術に従って、加えても除去してもよい。本明細書に記載されている化合物のそのような保護誘導体は、それ自体は薬理学的活性を所有しないことがあるが、これらは、対象に投与され、その後体内で代謝されて、薬理学的に活性な、本明細書に記載されている化合物を形成できることも当業者により認識される。そのような誘導体は、したがって、「プロドラッグ」として記載されていることがある。本明細書に記載されている化合物のすべてのプロドラッグは、本明細書に記載されている使用の範囲内に含まれる。

【０５４５】

一例では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態が、カルボン酸官能基を含有する場合、プロドラッグは、酸性基の水素原子を官能基、例えばアルキルなどで置き換えることにより形成されるエステルを含み得る。別の例では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態が、ヒドロキシル官能基を含有する場合、プロドラッグ形態は、ヒドロキシルの水素原子を、別の官能基、例えばアルキル、アルキルカルボニルまたはホスホン酸エステルなどで置き換えることにより調製され得る。別の例では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態が、アミン官能基を含有する場合、プロドラッグ形態は、１個または複数のアミン水素原子を、官能基、例えばアルキルまたは置換カルボニルで置き換えることにより調製され得る。式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の医薬として許容できるプロドラッグは、適切であれば、以下の基、カルボン酸エステル、スルホン酸エステル、アミノ酸エステル、ホスホン酸エステルおよび一、二もしくは三リン酸エステルまたはアルキル置換基の１つまたは複数で置換される化合物を含む。本明細書に記載されているように、そのような置換基の１つまたは複数を使用して、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態をプロドラッグとして得られることは、当業者により理解される。

【０５４６】

本明細書に記載されている１つまたは複数の化合物は、非溶媒和形態、ならびに、医薬として許容できる溶媒、例えば水、エタノールなどとの溶媒和形態に存在し得、本明細書の記載は、溶媒和形態および非溶媒和形態の両方を含むよう意図されている。

【０５４７】

本明細書で使用されている「溶媒和物」という用語は、本明細書に記載されている化合物と、１つまたは複数の溶媒分子の物理的会合を意味する。この物理的会合は、水素結合を含む、様々な程度のイオン結合および共有結合に関与する。ある例では、溶媒和物は、例えば１つまたは複数の溶媒分子が、結晶性固体の結晶格子に組み込まれる場合、単離することが可能である。本明細書で使用されている「溶媒和物」は、溶液相および単離可能な溶媒和物の両方を包含する。適切な溶媒和物の非限定的な例は、エタノレート、メタノレートなどを含む。

【０５４８】

本明細書で使用されている「水和物」という用語は、溶媒分子が水である溶媒和物を意味する。

【０５４９】

式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）は、本明細書の範囲内に含まれるよう意図されている塩を形成できる。本明細書における式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態への言及は、別段指示がない限り、その塩の形態への言及を含むことが理解される。本明細書で用いられる「塩（複数可）」という用語は、無機お

よび／または有機酸で形成される酸性塩、ならびに、無機および／または有機塩基で形成される塩基性塩を表す。さらに、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態が、塩基部分、例えば、以下に限定されないがアミン部分、および酸性部分、例えば、以下に限定されないがカルボン酸の両方を含有する場合、双性イオン（「分子内塩」）が形成され得、本明細書で使用されている「塩（複数可）」という用語内に含まれる。

【０５５０】

本明細書で使用されている「医薬として許容できる塩（複数可）」という用語は、哺乳動物における使用に関して、安全かつ有効な（すなわち、非毒性で生理学的に許容できる）、また、生物学的活性を所有する本明細書に記載されている化合物の塩を意味するが、他の塩も有用である。式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の塩は、例えば媒体中、例として塩が沈殿する媒体中、または水性媒体中で、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態と、一定量、例えば対応量の酸または塩基を反応させ、続いて凍結乾燥させることにより形成され得る。

【０５５１】

医薬として許容できる塩は、本明細書に記載されている化合物に存在する、酸性基または塩基性基の１つまたは複数の塩を含む。酸付加塩の詳細な態様は、酢酸塩、アスコルビン酸塩、安息香酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、重硫酸塩、重酒石酸塩、ホウ酸塩、臭化物塩、臭化水素酸塩、二臭化水素酸塩、酪酸塩、塩酸塩、二塩酸塩、三塩酸塩、四塩酸塩、クエン酸塩、樟脳酸塩、樟脳スルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ギ酸塩、フマル酸塩、ゲンチジン酸塩、グルコン酸塩、グルクロネート（ｇｌｕｃａｒｏｎａｔｅ）、グルタミン酸塩、ヨウ化物塩、イソニコチン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、メタンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、硝酸塩、シュウ酸塩、パモ酸塩、パントテン酸塩、リン酸塩、プロピオン酸塩、糖酸塩、サリチル酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、チオシアン酸塩、トルエンスルホン酸塩（トシル酸塩としても公知）、トリフルオロ酢酸塩、二トリフルオロ酢酸塩などを含み、それらに限定されない。

【０５５２】

一態様は、塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩、ギ酸塩、二塩酸塩、三塩酸塩、四塩酸塩、二臭化水素酸塩、および二トリフルオロ酢酸塩から選択される酸付加塩を含む。

【０５５３】

酸付加塩のある詳細な態様は、トリフルオロ酢酸塩、二トリフルオロ酢酸塩、塩酸塩または二塩酸塩などを含む。

【０５５４】

さらに、塩基性の医薬品化合物から医薬として有用な塩の形成に適している、と一般的に考えられる酸は、例えば、Ｐ．Ｓｔａｈｌ ｅｔ ａｌ，Ｃａｍｉｌｌｅ Ｇ．（ｅｄｓ．）Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓａｌｔｓ．Ｐｒｏｐｅｒｔｉｅｓ，Ｓｅｌｅｃｔｉｏｎ ａｎｄ Ｕｓｅ．（２００２）Ｚｕｒｉｃｈ：Ｗｉｌｅｙ－ＶＣＨ、Ｓ．Ｂｅｒｇｅ ｅｔ ａｌ，Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ（１９７７）６６（１）１－１９、Ｐ．Ｇｏｕｌｄ，Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ Ｊ．ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃｓ（１９８６）３３，２０１－２１７、Ａｎｄｅｒｓｏｎ ｅｔ ａｌ，Ｔｈｅ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ（１９９６），Ａｃａｄｅｍｉｃ Ｐｒｅｓｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋにより、またＴｈｅ Ｏｒａｎｇｅ Ｂｏｏｋ（Ｆｏｏｄ ＆ Ｄｒｕｇ Ａｄｍｉｎｉｓｔｒａｔｉｏｎ，Ｗａｓｈｉｎｇｔｏｎ，Ｄ．Ｃ．ｏｎ ｔｈｅｉｒ ｗｅｂｓｉｔｅ）で論じられている。これらの開示は、それらを参照することにより本明細書に組み込む。

【０５５５】

適切な塩基性塩は、アルミニウム、アンモニウム、カルシウム、リチウム、マグネシウム、カリウム、ナトリウムおよび亜鉛塩を含むが、それらに限定されない。

【０５５６】
そのような酸性塩および塩基性塩のいずれも、本明細書に記載されている医薬として許容できる塩の範囲内に含まれるよう意図されている。さらに、そのような酸性塩および塩基性塩のいずれも、この説明の目的では、対応する化合物の遊離形態に等しいと考えられる。
【０５５７】
式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物は、さらに互変異性形態で存在し得る。そのような互変異性形態はいずれも、本明細書に記載されている式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の範囲内に含まれることが想定され、意図されている。
【０５５８】
式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物は、不斉またはキラル中心を含有し得、したがって、異なる立体異性形態として存在する。本明細書は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の立体異性形態すべて、ならびに、ラセミ混合物を含むそれらの混合物を含むよう意図されている。
【０５５９】
式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物は、１つまたは複数のキラル中心を含み得、それ自体が、ラセミ混合物（Ｒ／Ｓ）として、または、実質的に純粋な鏡像異性体およびジアステレオ異性体として存在し得る。化合物は、実質的に純粋な（Ｒ）または（Ｓ）鏡像異性体としても存在し得る（キラル中心が１つ存在する場合）。詳細な一態様では、本明細書に記載されている化合物は、（Ｓ）異性体であり、実質的に（Ｓ）異性体のみを含む鏡像異性的に純粋な組成物として存在し得る。別の詳細な態様では、本明細書に記載されている化合物は、（Ｒ）異性体であり、実質的に（Ｒ）異性体のみを含む鏡像異性的に純粋な組成物として存在し得る。当業者が把握するように、１つ超のキラル中心が存在する場合、本明細書に記載されている化合物は、ＩＵＰＡＣ命名法勧告により定義されている（Ｒ，Ｒ）、（Ｒ，Ｓ）、（Ｓ，Ｒ）または（Ｓ，Ｓ）異性体としても存在し得る。
【０５６０】
本明細書で使用されている「キラル」という用語は、同一でない４個の置換基に結合された炭素原子を指す。本明細書で使用されている立体化学的な定義および慣例は、一般的に、Ｓ．Ｐ．Ｐａｒｋｅｒ，Ｅｄ．，ＭｃＧｒａｗ－Ｈｉｌｌ Ｄｉｃｔｉｏｎａｒｙ ｏｆ Ｃｈｅｍｉｃａｌ Ｔｅｒｍｓ（１９８４）ＭｃＧｒａｗ－Ｈｉｌｌ Ｂｏｏｋ Ｃｏｍｐａｎｙ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ、およびＥｌｉｅｌ，Ｅ．ａｎｄ Ｗｉｌｅｎ，Ｓ．，“Ｓｔｅｒｅｏｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｏｍｐｏｕｎｄｓ”，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｉｎｃ．，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ，１９９４に従う。光学活性化合物を説明する際、接頭辞ＤおよびＬ、またはＲおよびＳは、そのキラル中心（複数可）の周りの分子の絶対配置を表すように使用される。考慮されるキラル中心に付着した置換基は、カーン・インゴルド・プレローグ順位則に従って順位付けされる（Ｃａｈｎ ｅｔ ａｌ．Ａｎｇｅｗ．Ｃｈｅｍ．Ｉｎｔｅｒ．Ｅｄｉｔ．１９６６，５，３８５；ｅｒｒａｔａ ５１１）。
【０５６１】
式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物は、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、またはラセミ化合物を含み得る。「鏡像異性体」は、互いに重なり合わない鏡像な一対の立体異性体である。一対の鏡像異性体の１：１混合物が「ラセミ」混合物である。該用語は、適切であれば、ラセミ混合物を示すために用いられる。「ジアステレオ異性体」は、少なくとも２つの不斉原子を有するが、互いに鏡像でない立体異性体である。化合物が純粋な鏡像異性体である場合、各キラル炭素の立体化学は「Ｒ」または「Ｓ」のいずれかによって規定され得る。「メソ化合物」は、１つまたは複数のキラル要素を含むジアステレオ異性体セットのアキラル要素（複数可）である。メソ化合物の擬似不斉中心（複数可）は、「ｒ」または「ｓ」のいずれかによって規定され得る。絶対配置が未知である

分割された化合物は、それらがナトリウムのＤ線の波長における平面偏光を回転させる方向（右旋性または左旋性）に応じて（＋）または（－）と表され得る。「ジアステレオ異性体」も二重結合の立体化学を指し、ｃｉｓまたはｔｒａｎｓ、あるいは、ＥまたはＺとして規定され得る。

【０５６２】

本明細書に記載されているある化合物は、１つまたは複数の不斉中心または不斉軸を含有し、したがって、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、および他の立体異性形態が生じ得る。

【０５６３】

本明細書で使用されている「実質的に純粋」という用語は、単一の異性体が９０％以上の量で、９２％以上の量で、９５％以上の量で、９８％以上の量で、９９％以上の量で、または１００％に等しい量で、実質的に単一の異性体からなる化合物を指す。

【０５６４】

本明細書の一態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態は、９０％以上の量で、９２％以上の量で、９５％以上の量で、９８％以上の量で、９９％以上の量で、または１００％に等しい量で存在する実質的に純粋な（Ｓ）鏡像異性体形態である。

【０５６５】

本明細書の一態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態は、９０％以上の量、９２％以上の量で、９５％以上の量で、９８％以上の量で、９９％以上の量で、または１００％に等しい量で存在する実質的に純粋な（Ｒ）鏡像異性体形態である。

【０５６６】

本明細書で使用されている「ラセミ化合物」は、「鏡像異性的に純粋」ではない任意の等軸形態の混合物であり、例えば、以下に限定されないが、約５０／５０、約６０／４０、約７０／３０または約８０／２０の比の混合物を含む。

【０５６７】

さらに、本明細書は、幾何学および位置異性体すべてを含む。例えば、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態が、二重結合または縮合環を組み込む場合、ｃｉｓ－およびｔｒａｎｓ－形態の両方、ならびに混合物は、本説明の範囲内に含まれる。ジアステレオ異性体混合物は、それらの物理化学的な差異に基づいて、当業者に公知の方法により、例えば、クロマトグラフィーおよび／または分別結晶により、個々のジアステレオ異性体に分離され得る。鏡像異性体は、キラルＨＰＬＣカラム、または当業者に公知の他のクロマトグラフィー法を使用することにより分離され得る。鏡像異性体は、適切な光学活性化合物（例えば、キラル助剤、例としてキラルアルコールまたはモッシャー酸塩化物）との反応、ジアステレオ異性体の分離、および個々のジアステレオ異性体の対応する純粋鏡像異性体への変換（例えば、加水分解）により、鏡像異性体混合物をジアステレオ異性体混合物に変換することによっても分離できる。また、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物のいくつかは、アトロプ異性体（例えば、置換ビアリール）であり得、本明細書の一部と考えられる。

【０５６８】

本化合物のすべての立体異性体（例えば、幾何異性体、光学異性体など）（化合物の塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグ、ならびにプロドラッグの塩、溶媒和物およびエステルのそれらを含む）、例えば、鏡像異性形態（不斉炭素なしでさえも存在し得る）、回転異性形態、アトロプ異性体、およびジアステレオ異性形態を含む、様々な置換基上の不斉炭素により存在し得るものは、位置異性体（例えば、４－ピリジルおよび３－ピリジル）のように、本明細書の範囲内と想定される。本明細書に記載されている化合物の個々の立体異性体は、例えば、実質的に他の異性体を含み得ない、または、上で説明されているラセミ混合物で存在し得る。

【０５６９】

「塩」、「溶媒和物」、「エステル」、「プロドラッグ」などという用語の使用は、本化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、位置異性体、ラセミ化合物またはアイソトポログの塩、溶媒和物、エステルおよびプロドラッグに等しく適用されるよう意図されている。

【０５７０】

本明細書に記載されている同位体濃縮したある化合物（例えば、^{3}Ｈおよび^{14}Ｃで標識されたもの）は、化合物および／または基質組織分布アッセイにおいて有用である。三重水素（すなわち、^{3}Ｈ）および炭素－１４（すなわち、^{14}Ｃ）同位体は、調製の容易さおよび検出可能性で特に好ましい。さらに、より重い同位体、例えば重水素（すなわち、^{2}Ｈ）での置換は、代謝安定性の高さに由来するある治療利点（例えば、ｉｎ　ｖｉｖｏ半減期の増加または必要な投与量の減少）が得られるので、ある状況で好ましくなり得る。

【０５７１】

化合物の使用

本明細書の意図されている範囲によれば、本明細書の態様は、選択的にＨＤを防止、処置または寛解する際に有用と特定され、実証されており、ＨＤを防止、処置または寛解するのに使用するために示されている化合物を含む。

【０５７２】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを防止、処置または寛解するための方法を含む。

【０５７３】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための方法を含む。

【０５７４】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを防止するための方法を含む。

【０５７５】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置するための方法を含む。

【０５７６】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを寛解するための方法を含む。

【０５７７】

本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための方法を含む。

【０５７８】

本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態または組成物を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態または組成物を使用する方法を含む。

【０５７９】

本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態または組成物を使用する方法を含む。

【０５８０】
本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。
【０５８１】
本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態の使用を含む。
【０５８２】
本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬の製造における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、有効量の医薬を対象に投与するステップを含む、使用を含む。
【０５８３】
本明細書の別の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬の製造における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態の使用であって、有効量の医薬を対象に投与するステップを含む、使用を含む。
【０５８４】
本明細書の態様は、ＨＤに対する活性を有する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態のｉｎ ｖｉｔｒｏまたはｉｎ ｖｉｖｏでの使用を含む。
【０５８５】
本明細書の態様は、付加的または相乗的活性を提供することによって、ＨＤを処置または寛解するための組合せ製品の開発を可能にするための、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の併用療法における使用を含む。
【０５８６】
本明細書の別の態様は、本明細書に記載されている化合物を、ＨＤが公知の薬物に反応するか否かに関係なく、ＨＤを処置するために使用され得る１つもしくは複数の公知の薬物、または１つもしくは複数の公知の治療法と組み合わせて含む併用療法を含む。
【０５８７】
本明細書の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の作用剤と組み合わせて対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための、１つまたは複数の治療剤との組合せ製品における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用を含む。
【０５８８】
本明細書の別の態様は、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の作用剤と組み合わせて対象に投与するステップを含む、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための、１つまたは複数の治療剤との組合せ製品における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物塩、またはその形態の使用を含む。
【０５８９】
本明細書で提供される使用または方法のある態様では、１つまたは複数の追加の作用剤と組み合わせて使用される式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態は、対象もしくは患者に投与するステップ、または、細胞と追加の作用剤（複数可）を接触させるステップの前に、それと同時にまたは後で、対象に投与してもよいし、または、対象もしくは患者の細胞（複数可）と接触させてもよい。式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物（複数可）、またはその形態、および追加の作用剤（複数可）は、単一の組成物または別の組成物で対象に投与してもよいし、または細胞と接触させてもよい。特定の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合

物（複数可）、またはその形態は、ＨＴＴ発現を阻害する（例えば、ウイルス送達ベクターを使用する）遺伝子治療と、または、別の小分子ＨＴＴ阻害剤の投与と組み合わせて使用される。別の特定の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物（複数可）、またはその形態は、分化した非変異ＨＴＴ幹細胞を使用する細胞の置き換えと組み合わせて使用される。別の特定の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物（複数可）、またはその形態は、分化したＨＴＴ幹細胞を使用する細胞の置き換えと組み合わせて使用される。

【０５９０】

一態様では、緩和ケアを含むケア療法の支持的標準と組み合わせた、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用が本明細書で提供される。

【０５９１】

本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するためのキットの調製における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、キットは、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態、および有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を投与するための説明書を含む、使用を含む。

【０５９２】

本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するためのキットの調製における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、キットは、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態、および有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を投与するための説明書を含み、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の治療剤との組合せ製品として対象に投与するための説明書を含んでもよい、使用を含む。

【０５９３】

本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するためのキットの調製における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、キットは、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態、および有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を投与するための説明書を含み、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の治療剤との組合せ製品として対象に投与するための説明書を含んでもよく、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、有効量の１つまたは複数の治療剤との組合せ製品として、ケア支持療法の標準との併用療法において、対象に投与するための説明書を含んでもよく、ケア支持療法の標準が緩和ケアである、使用を含む。

【０５９４】

一観点では、そのような態様のそれぞれで、対象は未処置である。別の観点では、そのような態様のそれぞれで、対象は未処置ではない。

【０５９５】

本明細書で使用されている「防止すること」という用語は、疾患、障害および／または病状にかかりやすい素因を有し得るが、まだ疾患、障害および／または病状を有すると診断されていない対象において、疾患、障害または病状が発生しないようにすることを指す。

【０５９６】

本明細書で使用されている「処置すること」という用語は、既に疾患、障害および／または病状の症状を呈する対象において、疾患、障害または病状の進展を阻害すること、すなわち、既に対象に影響を与えている疾患、障害および／または病状の発現を停止することを指す。

【０５９７】

本明細書で使用されている「寛解すること」という用語は、既に疾患、障害および／または病状の症状を呈する対象において、疾患、障害または病状の症状を軽減すること、す

なわち、既に対象に影響を与えている疾患、障害および／または病状の退縮を引き起こすことを指す。

【０５９８】

本明細書で使用されている「対象」という用語は、感覚および随意運動の力を有し、酸素および有機食物を必要とする動物またはある生体を指す。非限定的な例は、ヒト、霊長類、ウマ科、ブタ科、ウシ科、ハツカネズミ属、クマネズミ属、イヌ科およびネコ科種のメンバーを含む。ある態様では、対象は、哺乳動物または温血脊椎動物である。他の態様では、対象はヒトである。本明細書で使用されている「患者」という用語は、「対象」および「ヒト」と互換的に使用され得る。

【０５９９】

本明細書で使用されている、「有効量」または「治療有効量」という用語は、本明細書に記載されているＨＤの処置または寛解に有効な標的血漿中濃度を達成し、その結果望ましい治療、寛解、阻害または防止効果を必要とする対象において、それを生じる、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態、組成物または医薬の量を意味する。一態様では、有効量は、対象または患者、より具体的にはヒトにおけるＨＤの処置に必要とされる量であり得る。

【０６００】

別の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態に関して観察された濃度と生物学的効果の関係は、およそ０．００１μｇ／ｍＬ～およそ５０μｇ／ｍＬ、およそ０．０１μｇ／ｍＬ～およそ２０μｇ／ｍＬ、およそ０．０５μｇ／ｍＬ～およそ１０μｇ／ｍＬまたはおよそ０．１μｇ／ｍＬ～およそ５μｇ／ｍＬに及ぶ標的血漿中濃度を指し示す。そのような血漿中濃度を達成するために、本明細書に記載されている化合物は、例えば、１．０ｎｇ～１０．０００ｍｇで変化する用量で投与され得るが、それに限定されない。

【０６０１】

一態様では、有効な標的血漿中濃度を達成するために投与される用量は、対象または患者に固有の要因に基づいて投与され得、体重ベースで投与される用量は、約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約３５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約３０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約２０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約２００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約７５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約１ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約０．５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約０．１ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約３５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約３０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約２０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約２００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約７５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ

／日～約２５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約１ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約０．５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．０１ｍｇ／ｋｇ／日～約０．１ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約３５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約３０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約２０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約２００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１００ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約７５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約５０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約２５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１０ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約５ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約１ｍｇ／ｋｇ／日、または約０．１ｍｇ／ｋｇ／日～約０．５ｍｇ／ｋｇ／日の範囲になり得る。

【０６０２】

所定の対象に対する有効量は、対象に関連した要因を踏まえ、臨床家または当業者の技術および判断の範囲内である日常的実験により判定され得る。用法用量は、活性剤（複数可）のレベルを十分にするために、または望ましい効果を維持するために調整され得る。考慮され得る要因は、遺伝子スクリーニング、疾患状態の重症度、疾患進展のステータス、対象の全般的健康、民族性、年齢、体重、性、食事、投与の時刻および回数、薬物の組合せ（複数可）、反応感受性、他の治療法の経験、および治療に対する耐性／反応を含む。

【０６０３】

有効な標的血漿中濃度を達成するために投与される用量は、１日に１回（およそ２４時間に１回、すなわち、「ｑ．ｄ．」）、２回（およそ１２時間に１回、すなわち、「ｂ．ｉ．ｄ．」または「ｑ．１２ｈ」）、３回（およそ８時間に１回、すなわち、「ｔ．ｉ．ｄ．」または「ｑ．８ｈ」）または４回（およそ６時間に１回、すなわち、「ｑ．ｄ．ｓ．」、「ｑ．ｉ．ｄ．」または「ｑ．６ｈ」）、経口的に投与され得る。

【０６０４】

ある態様では、有効な標的血漿中濃度を達成するために投与される用量は、約４０～約２００ｋｇの範囲の体重を有する患者または対象（用量は、この範囲を超える、または下回る患者または対象、特に４０ｋｇに達しない小児に調整できる）に対し、単回、分割、または連続投与でも投与され得る。典型的な成人対象は、約７０ｋｇの範囲の体重の中央値を有すると予想される。長時間作用医薬組成物は、特定の製剤の半減期およびクリアランス速度に応じて、２、３または４日間おき、１週おきに１回、または２週おきに１回投与され得る。

【０６０５】

本明細書に記載されている化合物および組成物は、当業界で公知の任意の薬物送達経路を経由して、対象に投与され得る。非限定的な例は、経口、眼、直腸、バッカル、局所、経鼻、舌下、経皮、皮下、筋肉内、静脈内（ボーラスおよび注射）、脳内、および肺経路の投与を含む。

【０６０６】

別の態様では、投与される用量は、本明細書に記載されている剤形に基づいて調整され得、約０．０２、０．０２５、０．０３、０．０５、０．０６、０．０７５、０．０８、０．０９、０．１０、０．２０、０．２５、０．３０、０．５０、０．６０、０．７５、０．８０、０．９０、１．０、１．１０、１．２０、１．２５、１．５０、１．７５、２．０、３．０、５．０、１０、２０、３０、４０、５０、１００、１５０、２００、２５０、３００、４００、５００、１０００、１５００、２０００、２５００、３０００または４０００ｍｇ／日で送達するように製剤化される。

【０６０７】
ある化合物では、有効量は、最初に、細胞培養アッセイまたは関連性がある動物モデル、例えばマウス、モルモット、チンパンジー、マーモセットまたはタマリン動物モデルで評価され得る。関連性がある動物モデルは、適切な濃度範囲および投与経路を判定するためにも使用され得る。そのような情報は、次いで、ヒトにおける有用な用量および投与経路を判定するために使用され得る。治療効能および毒性は、細胞培養または実験動物における標準的な医薬手順、例えば、ED_{50}（集団の５０％において治療的に有効な用量）およびLD_{50}（集団の５０％において致死的な用量）により判定され得る。治療効果と毒性効果との間の用量比が治療指数であり、比LD_{50}／ED_{50}として表現できる。ある態様では、有効量は、高い治療指数が達成されるようにする。さらなる詳細な態様では、投与量は、毒性がほとんどない、またはないED_{50}を含む循環濃度の範囲内である。投与量は、用いられる剤形、患者の感受性、および投与経路に応じて、この範囲内で変化することがある。

【０６０８】
一態様では、ヒト細胞と式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を接触させるステップを含む、ＨＴＴ（ハンチンチンタンパク質）の量を調節するための方法が本明細書で提供される。特定の態様では、ヒト細胞と、ＨＴＴの発現を調節する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を接触させるステップを含む、ＨＴＴの量を調節するための方法が本明細書で提供される。ヒト細胞は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態と、ｉｎ　ｖｉｔｒｏ、またはｉｎ　ｖｉｖｏで、例えば、ヒト以外の動物またはヒトにおいて接触させることができる。特定の態様では、ヒト細胞は、ヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、Ｈｔｔ遺伝子におけるＣＡＧ反復によって引き起こされ、ＨＴＴ発現および／または機能の欠失が生じたＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒト内のものである。一態様では、化合物は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態である。

【０６０９】
特定の態様では、ヒト細胞と式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を接触させるステップを含む、Ｈｔｔ遺伝子から転写される変異ＨＴＴの阻害を向上させるための方法が、本明細書で提供される。ヒト細胞は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態と、ｉｎ　ｖｉｔｒｏ、またはｉｎ　ｖｉｖｏで、例えば、ヒト以外の動物またはヒトにおいて接触させることができる。特定の態様では、ヒト細胞は、ヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、Ｈｔｔ遺伝子におけるＣＡＧ反復によって引き起こされ、野生型の「通常」ＨＴＴ発現および／または機能の欠失が生じたＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒト内のものである。一態様では、化合物は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態である。

【０６１０】
別の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、ＨＤに対するヒト以外の動物モデルに投与するステップを含む、Ｈｔｔ遺伝子から転写される変異ＨＴＴの阻害を調節するための方法が、本明細書で提供される。特定の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、ＨＤに対するヒト以外の動物モデルに投与するステップを含む、Ｈｔｔ遺伝子から転写される変異ＨＴＴの阻害を調節するための方法が本明細書で提供される。特定の態様では、化

合物は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態である。
【０６１１】
別の態様では、ヒト細胞と、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を接触させるステップを含む、変異ＨＴＴの量を減少させるための方法が本明細書で提供される。特定の態様では、ヒト細胞と、Ｈｔｔ遺伝子から変異ＨＴＴ（ハンチンチンｍＲＮＡ）の転写を阻害する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を接触させるステップを含む、変異ＨＴＴの量を減少させるための方法が本明細書で提供される。別の特定の態様では、ヒト細胞と、Ｈｔｔ遺伝子から転写される変異ＨＴＴの発現を阻害する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物を接触させるステップを含む、ＨＴＴの量を減少させるための方法が本明細書で提供される。ヒト細胞は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態と、ｉｎ ｖｉｔｒｏ、またはｉｎ ｖｉｖｏで、例えば、ヒト以外の動物またはヒトにおいて接触させることができる。特定の態様では、ヒト細胞は、ヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の特定の態様では、ヒト細胞は、Ｈｔｔ遺伝子におけるＣＡＧ反復によって引き起こされ、ＨＴＴ発現および／または機能の欠失が生じたＨＤを有するヒトに由来するもの、またはヒト内のものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒトに由来するものである。別の態様では、ヒト細胞は、ＨＤを有するヒト内のものである。一態様では、化合物は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物の形態である。
【０６１２】
ある態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態（単体で、または、追加の作用剤と組み合わせて）でＨＤを処置または寛解することは、治療効果および／または有益な効果を有する。特定の態様では、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態（単体で、または、追加の作用剤と組み合わせて）でＨＤを処置することは、以下、（ｉ）ＨＤの重症度を低下または寛解する、（ｉｉ）ＨＤの発症を遅延させる、（ｉｉｉ）ＨＤの進展を阻害する、（ｉｖ）対象の入院を減少させる、（ｖ）対象の入院の長さを短縮する、（ｖｉ）対象の生存を増加させる、（ｖｉｉ）対象のクオリティオブライフを改善する、（ｖｉｉｉ）ＨＤに関連する症状の数を減少させる、（ｉｘ）ＨＤに関連する症状（複数可）の重症度を低下または寛解する、（ｘ）ＨＤに関連する症状の持続時間を低下させる、（ｘｉ）ＨＤに関連する症状の再発を防止する、（ｘｉｉ）ＨＤの症状が発現または発症するのを阻害する、かつ／または（ｘｉｉｉ）ＨＤに関連する症状の進展を阻害する効果の１つ、２つまたはそれ超を生じる。
【０６１３】
代謝産物
本明細書の範囲内に含まれる別の態様は、本明細書に記載されている化合物のｉｎ ｖｉｖｏ代謝産物の使用である。そのような生成物は、例えば、投与される化合物の酸化、還元、加水分解、アミド化、エステル化などから、主に酵素的プロセスにより生じ得る。したがって、本明細書は、本明細書に記載されている化合物と、哺乳類の組織または哺乳動物を、その代謝産物を得るのに十分な期間接触させるステップを含むプロセスにより生成された化合物の使用を含む。
【０６１４】
そのような生成物は、典型的には、本明細書に記載されている化合物を放射性標識（例えば、^{14}Ｃまたは^{3}Ｈ）して調製すること、放射性標識された化合物を、検出可能な用量（例えば、約０．５ｍｇ／ｋｇ超）で、哺乳動物、例えばラット、マウス、モルモット、イヌ、サルまたはヒトに投与すること、代謝が発生するのに十分な時間（典型的には約３０秒～約３０時間）をもたせること、および、尿、胆汁、血液または他の生体試料からの代謝変換生成物を同定することにより、同定される。変換生成物は、同位体濃縮されることによって「放射性標識されている」ので、容易に単離される（代謝産物に残存する抗原

決定基に結合することが可能な抗体の使用により単離されるものもある）。代謝産物構造は、従来の手法で、例えば、ＭＳまたはＮＭＲ分析により判定される。一般に、代謝産物の分析は、当業者に周知の従来の薬物代謝研究と同じようになされる。変換生成物は、ｉｎ　ｖｉｖｏで特に見出されない限り、それ自体が生物学的活性を所有していないとしても、本明細書に記載されている化合物の治療投薬に対する診断アッセイに有用である。

【０６１５】

医薬組成物

本明細書の意図されている範囲によれば、本明細書の態様は、選択的にＨＤを防止、処置または寛解する際に有用と特定され、実証されており、ＨＤを防止、処置または寛解するための１つまたは複数の医薬組成物として使用するために示されている化合物を含む。

【０６１６】

本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するための医薬組成物の調製における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の使用であって、１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和した式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の有効量を対象に投与するステップを含む、使用を含む。

【０６１７】

本明細書の態様は、それを必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するためのキットの調製における、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の医薬組成物の使用であって、キットは、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態の医薬組成物、および医薬組成物を投与するための説明書を含む、使用を含む。

【０６１８】

本明細書で使用されている「組成物」という用語は、規定の原料を規定の量で含む生成物、ならびに、直接的または間接的に、規定の原料の規定の量での組合せから生じる任意の生成物を意味する。

【０６１９】

医薬組成物は、約ｐＨ３～約ｐＨ１１に及ぶ生理学的に適合可能なｐＨを達成するように製剤化され得る。ある態様では、医薬組成物は、ｐＨ約３～ｐＨ約７のｐＨを達成するように製剤化される。他の態様では、医薬組成物は、ｐＨ約５～ｐＨ約８のｐＨを達成するように製剤化される。

【０６２０】

「医薬として許容できる賦形剤」という用語は、医薬品、例えば本明細書に記載されている化合物を投与するための賦形剤を指す。この用語は、過度の毒性なしで投与され得る任意の医薬品賦形剤を指す。医薬として許容できる賦形剤は、投与される特定の組成物により、ならびに、特定の投与様式および／または剤形により、ある程度決定できる。医薬として許容できる賦形剤の非限定的な例は、担体、溶媒、安定剤、アジュバント、希釈剤等を含む。したがって、本明細書に記載されている本化合物に適切な医薬組成物の製剤は、幅広く存在する（例えば、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ’ｓ　Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　Ｓｃｉｅｎｃｅｓを参照されたい）。

【０６２１】

適切な賦形剤は、ゆっくり代謝される大きい高分子、例えばタンパク質、ポリサッカリド、ポリ乳酸、ポリグリコール酸、重合アミノ酸、アミノ酸コポリマー、および不活性抗体を含む担体分子であり得る。他の模範的な賦形剤は、アスコルビン酸のような抗酸化剤、ＥＤＴＡのようなキレート剤、デキストリン、ヒドロキシアルキルセルロース、ヒドロキシアルキルメチルセルロース（例えば、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ＨＰＭＣとしても公知）、ステアリン酸のような炭水化物、油、水、生理食塩水、グリセロールおよびエタノールのような液体、湿潤剤または乳化剤、ｐＨ緩衝物質などを含む。リポソームも、医薬として許容できる賦形剤の定義内に含まれる。

【０６２２】

本明細書に記載されている医薬組成物は、本明細書に記載されている使用目的に適している任意の形態で製剤化され得る。経口投与に適切な製剤は、固体、液体溶液、エマルションおよび懸濁液を含むが、肺投与に適切な吸入用製剤は、液体および粉末を含む。代替製剤は、シロップ、クリーム、軟膏、錠剤、および、投与前に生理学的に適合可能な溶媒で再調製できる凍結乾燥固体を含む。

【０６２３】

経口使用が意図されている場合、例えば、錠剤、トローチ剤、ロゼンジ剤、水性または油性懸濁液剤、非水性液剤、分散性散剤または粒剤（微細化粒子またはナノ粒子を含む）、エマルション剤、ハードまたはソフトカプセル剤、シロップ剤またはエリキシル剤が調製され得る。経口使用が意図されている組成物は、当技術分野に公知の、医薬組成物を製造する任意の方法に従って調製され得、そのような組成物は、嗜好される調製物を得るために、甘味剤、香味剤、着色剤、および保存剤を含む１つまたは複数の作用剤を含有し得る。

【０６２４】

錠剤と共に使用するのに適している、医薬として許容できる賦形剤は、例えば、不活性希釈剤、例としてセルロース、炭酸カルシウムまたはナトリウム、ラクトース、リン酸カルシウムまたはナトリウム、崩壊剤、例としてクロスカルメロースナトリウム、架橋ポビドン、トウモロコシデンプンまたはアルギン酸、結合剤、例えばポビドン、デンプン、ゼラチンまたはアカシア、および潤滑剤、例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸または滑石を含む。錠剤は、コーティングしなくてもよく、マイクロカプセル化を含む公知の技術によりコーティングして、胃腸管における崩壊および吸着を遅延させ、それにより、さらに長期間にわたり作用を持続させてもよい。例えば、時間遅延材料、例としてモノステアリン酸グリセリンまたはジステアリン酸グリセリルは、単体で、またはワックスと共に用いられ得る。

【０６２５】

経口使用のための製剤は、活性成分が、不活性固体希釈剤、例えばセルロース、ラクトース、リン酸カルシウムもしくはカオリンと混合されるハードゼラチンカプセル剤として、または、活性成分が、非水性または油性媒体、例えばグリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ラッカセイ油、流動パラフィンもしくはオリーブ油と混合されるソフトゼラチンカプセル剤としても提示され得る。

【０６２６】

他の態様では、本明細書に記載されている医薬組成物は、式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を、懸濁液の製造に適している１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和して含む懸濁液剤として製剤化され得る。さらに他の態様では、本明細書に記載されている医薬組成物は、１つまたは複数の賦形剤を添加することにより懸濁液剤の調製に適している分散性散剤および粒剤として製剤化され得る。

【０６２７】

懸濁液剤に関連した使用に適している賦形剤は、懸濁剤、例えばカルボキシメチルセルロースナトリウム、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、アルギン酸ナトリウム、ポリビニルピロリドン、トラガカントガム、アカシアガム、分散剤または湿潤剤、例えば天然に存在するリン脂質（例えば、レシチン）、アルキレンオキシドと脂肪酸の縮合生成物（例えば、ステアリン酸ポリオキシエチレン）、エチレンオキシドと長鎖脂肪族アルコールの縮合生成物（例えば、ヘプタデカエチレンオキシセタノール）、エチレンオキシドと、脂肪酸およびヘキシトール無水物に由来する部分エステルの縮合生成物（例えば、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート）、ならびに増粘剤、例えばカルボマー、ミツロウ、固形パラフィンまたはセチルアルコールを含む。懸濁液は、１つまたは複数の防腐剤、例えば酢酸、メチルおよび／またはｎ－プロピルｐ－ヒドロキシ－ベンゾエート、１つまたは複数の着色剤、１つまたは複数の香味剤、ならびに１つまたは複数の甘味剤、例えばスクロースまたはサッカリンも含有し得る。

【０６２８】

本明細書に記載されている医薬組成物は、水中油エマルションの形態でもあり得る。油相は、植物油、例えばオリーブ油もしくはラッカセイ油、鉱油、例えば流動パラフィン、またはこれらの混合物であり得る。適切な乳化剤は、天然に存在するガム、例えばアカシアガムおよびトラガカントガム、天然に存在するリン脂質、例えばダイズレシチン、脂肪酸に由来するエステルまたは部分エステル、ヘキシトール無水物、例えばソルビタンモノオレエート、およびこれらの部分エステルとエチレンオキシドの縮合生成物、例えばポリオキシエチレンソルビタンモノオレエートを含む。エマルションは、甘味剤および香味剤も含有し得る。シロップ剤およびエリキシル剤は、甘味剤、例えばグリセロール、ソルビトールまたはスクロースと製剤化され得る。そのような製剤は、鎮痛剤、防腐剤、香味剤または着色剤も含有し得る。

【０６２９】

さらに、本明細書に記載されている医薬組成物は、滅菌された注入可能な調製物、例えば滅菌された注入可能な水性エマルション剤または油性懸濁液剤の形態であり得る。そのようなエマルション剤または懸濁液剤は、上で言及されている適切な分散剤または湿潤剤、および懸濁剤を使用する公知の技術に従って製剤化され得る。滅菌された注入可能な調製物は、非毒性の非経口的に許容できる希釈剤または溶媒中における、滅菌された注入可能な液剤または懸濁液剤、例えば１，２－プロパンジオール中の溶液でもあり得る。滅菌の注射可能な調製物はまた、凍結乾燥された粉末としても調製することができる。許容できるビヒクルおよび溶媒の中でも、水、リンガー溶液および等張塩化ナトリウム溶液が用いられ得る。加えて、滅菌の固定油は、溶媒または懸濁媒体として用いることができる。この目的のために、合成モノ－またはジ－グリセリドを含む任意の無菌固定油も用いることができる。さらに、注入物質の調製において、脂肪酸、例えばオレイン酸も同じく使用できる。

【０６３０】

本明細書に記載されている化合物は、水中に実質的に不溶性であり得、大半の医薬として許容できるプロトン性溶媒および植物油中で難溶性であり得るが、一般的に、中鎖脂肪酸（例えば、カプリル酸およびカプリン酸）またはトリグリセリド中で、また、中鎖脂肪酸のプロピレングリコールエステル中で可溶性である。したがって、例えばエステル化、グリコシル化、ＰＥＧ化等により、化合物を送達により適しているようにする（例えば、溶解度、生物活性、嗜好性の向上、副作用の低下）、化学もしくは生化学部分の置換または付加により修飾されている化合物が本明細書で想定される。

【０６３１】

ある態様では、本明細書に記載されている化合物は、低溶解度化合物に適している脂質ベース組成物として経口投与用に製剤化される。脂質ベース製剤は、一般的に、そのような化合物の経口バイオアベイラビリティを向上させることができる。したがって、本明細書に記載されている医薬組成物は、中鎖脂肪酸またはそのプロピレングリコールエステル（例えば食用脂肪酸プロピレングリコールエステル、例としてカプリルおよびカプリン脂肪酸）、および医薬として許容できる界面活性剤、例えばポリソルベート２０もしくは８０（それぞれＴｗｅｅｎ（登録商標）２０またはＴｗｅｅｎ（登録商標）８０とも呼ばれる）またはポリオキシル４０水素化ヒマシ油から選択される少なくとも１つの医薬として許容できる賦形剤と共に、有効量の式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含み得る。

【０６３２】

他の態様では、低溶解度化合物のバイオアベイラビリティは、当業者に公知の技術を使用したナノ粒子またはナノ懸濁液の調製を含む、粒径の最適化技術を使用して向上できる。化合物形態は、非晶質、部分的に非晶質、部分的に結晶性または結晶形態を含むそのような調製物に存在する。

【０６３３】

代替態様では、医薬組成物は、１つまたは複数の水溶解度向上剤（複数可）、例えばシクロデキストリンをさらに含み得る。シクロデキストリンの非限定的な例は、α－、β－

およびγ－シクロデキストリンのヒドロキシプロピル、ヒドロキシエチル、グリコシル、マルトシルおよびマルトトリオシル誘導体、ならびにヒドロキシプロピル－β－シクロデキストリン（ＨＰＢＣ）を含む。ある態様では、医薬組成物は、約０．１％～約２０％、約１％～約１５％、または約２．５％～約１０％の範囲でＨＰＢＣをさらに含む。用いられる溶解度向上剤の量は、組成物中の化合物の量によって決められる。

【０６３４】

化合物の調製

一般的合成例

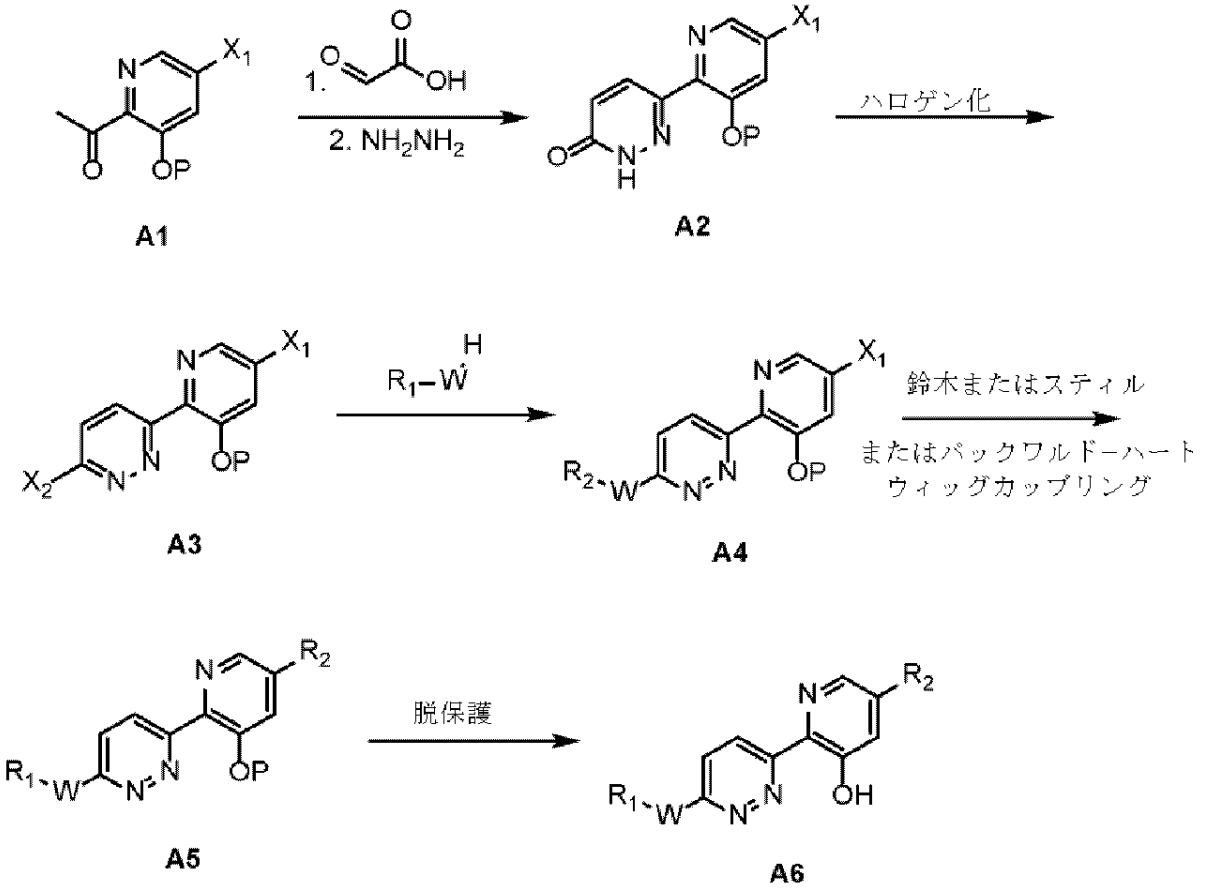
本明細書で開示されているように、本明細書に記載されている式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を調製するための一般的方法は、周知の標準的な合成方法論によって利用できる。出発材料の多くは、市販されている、または入手できない場合は、当業者に公知の技術を使用した以下に記載されている経路を使用して調製できる。本明細書で示されている合成スキームは、複数の反応ステップを含み、そのそれぞれは独立し、いずれかの先行または後続するステップ（複数可）の有無を問わず実行できるよう意図されている。言い換えれば、単離に関して、本明細書で示されている合成スキームの個々の反応ステップそれぞれが想定される。

【０６３５】

スキームＡ

R_1がアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールであり、R_2が、単環式もしくは二環式ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環系であり、Ｗが、ＯもしくはＮＨまたはNR_3であり、R_3が、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである式（Ｉ）の化合物は、以下のスキームＡに記載されているように調製され得る。

【化８】



【０６３６】

化合物Ａ１（X_1は、臭素、塩素などであり、Ｐは、例えばＭＯＭなどの保護基である）

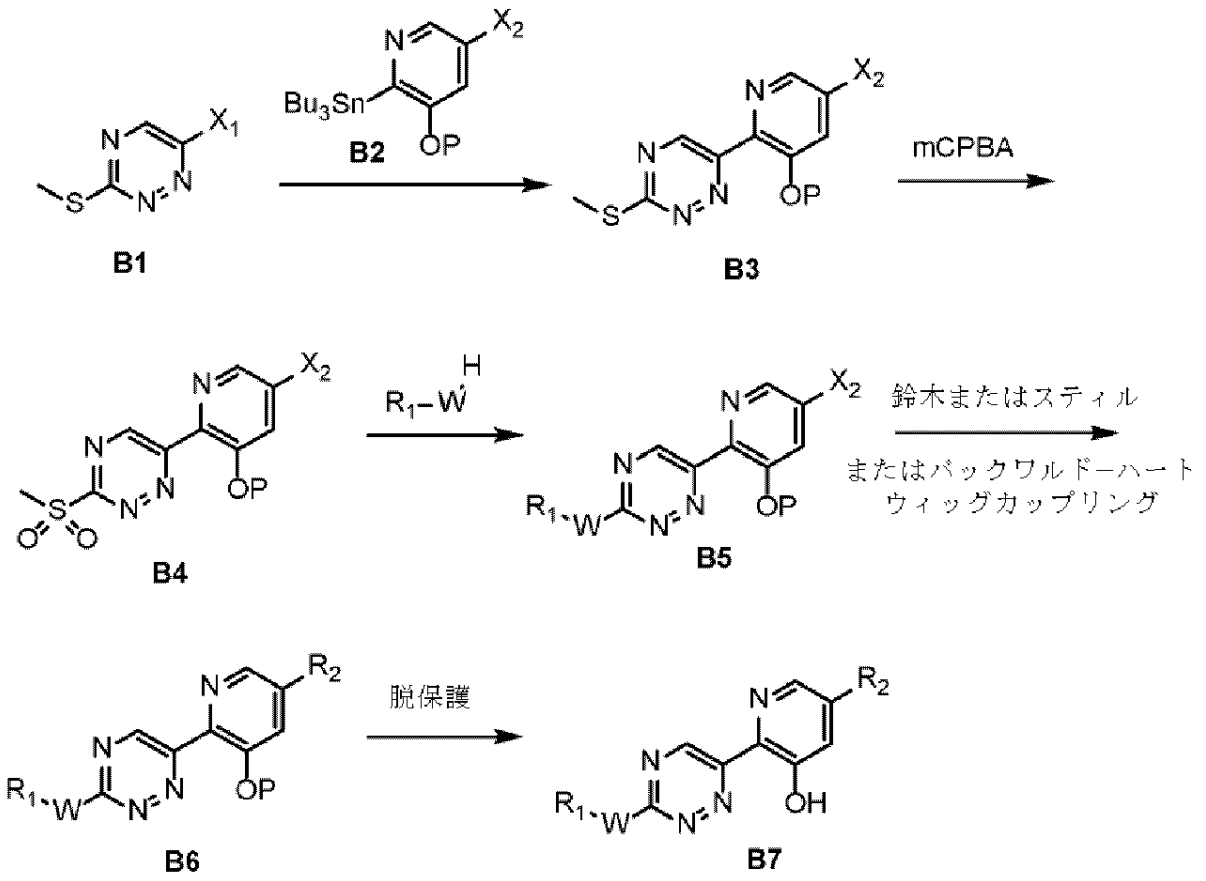
は、適切な溶媒（例えばＭｅＯＨなど）中において、適切な塩基（例えばａｑ．K_2CO_3など）の存在下で、オキサルアルデヒド酸水和物での処理、続いて適切な溶媒（例えばＡｃＯＨなど）中において、ヒドラジンでの処理により化合物Ａ２に変換される。化合物Ａ２は、脱水ハロゲン化剤（例えば$POCl_3$など）での処理により化合物Ａ３（X_2は、臭素、塩素などである）に変換される。化合物Ａ３は、適切な溶媒（例えばＤＭＦなど）中において、適切な塩基（例えばEt_3Nなど）の存在下で、第一級もしくは第二級アミン、またはアルコール（R_1WH）との求核性置換により化合物Ａ４に変換される。あるいは、化合物Ａ３は、適切な溶媒、例えば１，４－ジオキサンなど）中において、適切な触媒（例えばＲｕＰｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ２など）および塩基（例えばナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなど）の存在下で、第一級または第二級アミンとのクロスカップリングを経由して、化合物Ａ４に変換される。化合物Ａ４は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）および塩基（例えばK_2CO_3水溶液など）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－ボロン酸（またはピナコールホウ素エステル）との鈴木カップリングにより化合物Ａ５に変換される。あるいは、化合物Ａ４は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えば$Pd_2(dba)_3$など）、リガンド（例えばＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばＣｓＦなど）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－スタンナンとのスティルカップリングにより化合物Ａ５に変換される。あるいは、化合物Ａ４は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）の存在下で、ピナコラートジボロンおよび塩基（例えばＫＯＡｃなど）での処理、続いてアリール－またはヘテロアリール－ハロゲン化物の添加により、化合物Ａ５に変換される。あるいは、化合物Ａ４は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えば$Pd_2(dba)_3$など）、リガンド（例えばｔＢｕＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばK_3PO_4など）の存在下で、ヘテロアリールまたはアミンとのバックワルド－ハートウィッグカップリングにより化合物Ａ５に変換される。化合物Ａ５は、適切な溶媒（例えばジオキサンなど）中において、保護基の除去に適切な条件（例えば、ＭＯＭ保護基では、ジオキサン中のＨＣｌ）での処理の際に、化合物Ａ６に変換される。

【０６３７】

スキームＢ

R_1がアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールであり、R_2が、単環式もしくは二環式ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環系であり、Ｗが、ＯもしくはＮＨまたはNR_3であり、R_3が、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである式（ＩＩ）の化合物は、以下のスキームＢに記載されているように調製され得る。

【化９】



【０６３８】

化合物Ｂ１（X_1は、臭素、塩素などである）は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（PPh_3）$_2Cl_2$など）および添加剤（例えばＣｕＩなど）の存在下で、アリール－スタンナンＢ２（X_2は、臭素、塩素などであり、Ｐは、例えばＭＯＭなどの保護基である）とのスティルカップリングにより化合物Ｂ３に変換される。化合物Ｂ３は、適切な溶媒（例えばジクロロメタンなど）中において、酸化剤（例えばｍＣＰＢＡまたはオキソンなど）での処理により化合物Ｂ４に変換される。化合物Ｂ４は、適切な溶媒（例えばＤＭＦなど）中において、適切な塩基（例えばEt_3Nなど）の存在下で、第一級もしくは第二級アミン、またはアルコール（R_1WH、Ｗは、ＯもしくはＮＨまたはNR_3であり、R_3は、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）との求核性置換により化合物Ｂ５に変換される。化合物Ｂ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）および塩基（例えばK_2CO_3水溶液など）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－ボロン酸（またはピナコールホウ素エステル）との鈴木カップリングにより化合物Ｂ６に変換される。あるいは、化合物Ｂ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばPd_2（ｄｂａ）$_3$など）、リガンド（例えばＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばＣｓＦなど）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－スタンナンとのスティルカップリングにより化合物Ｂ６に変換される。あるいは、化合物Ｂ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）の存在下で、ピナコラートジボロンおよび塩基（例えばＫＯＡｃなど）での処理、続いてアリール－またはヘテロアリール－ハロゲン化物の添加により、化合物Ｂ６に変換される。あるいは、化合物Ｂ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばPd_2（ｄｂａ）$_3$など）、リガンド（例えばｔＢｕＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばK_3PO_4など）の存在下で、ヘテロアリールまたはアミンとのバックワルド－ハートウィッグカップリングにより化合

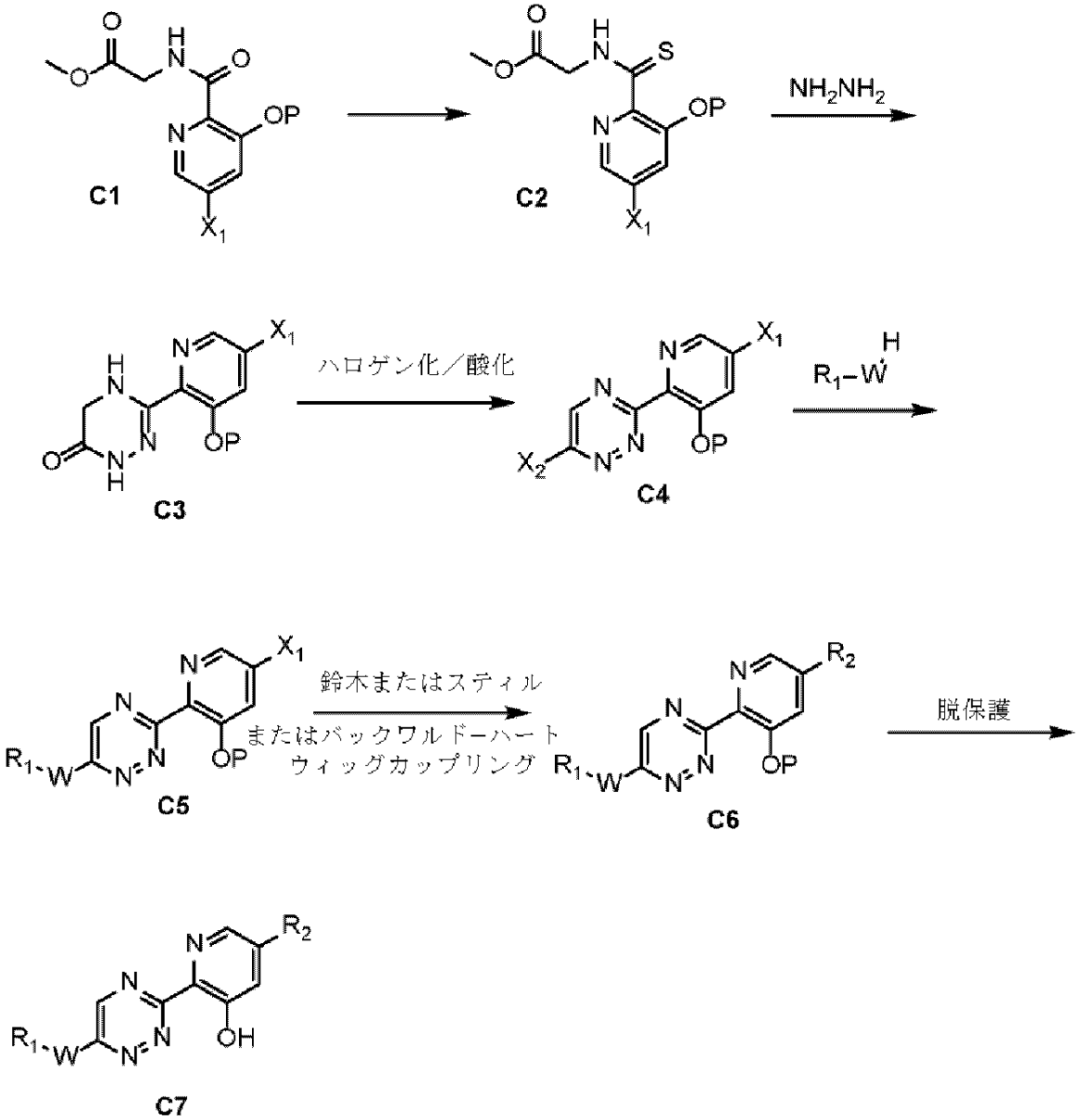
物Ｂ６に変換される。化合物Ｂ６は、適切な溶媒（例えばジオキサンなど）中において、保護基の除去に適切な条件（例えば、ＭＯＭ保護基では、ジオキサン中のＨＣｌ）での処理の際に、化合物Ｂ７に変換される。

【０６３９】

スキームＣ

R_1がアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールであり、R_2が、単環式もしくは二環式ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環系であり、Ｗが、ＯもしくはＮＨまたはNR_3であり、R_3が、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである式（ＩＩＩ）の化合物は、以下のスキームＣに記載されているように調製され得る。

【化１０】



【０６４０】

化合物Ｃ１（X_1は、臭素、塩素などであり、Ｐは、例えばＭＯＭなどの保護基である）は、適切な溶媒（例えばトルエンなど）中において、適切な硫化剤（例えばラヴェッソン試薬など）での処理により化合物Ｃ２に変換される。化合物Ｃ２は、適切な溶媒（例えばエタノールなど）中において、ヒドラジンの存在下で、縮合／環化シーケンスにより化合物Ｃ３に変換される。化合物Ｃ３は、脱水ハロゲン化剤（例えば$POCl_3$など）での処理、続いて酸化剤（例えば二酸化マンガンなど）での処理により、化合物Ｃ４に変換される

。化合物Ｃ４は、適切な溶媒（例えばＤＭＦなど）中において、適切な塩基（例えばEt_3Nなど）の存在下で、第一級もしくは第二級アミン、またはアルコール（R_1WH、Ｗは、ＯもしくはＮＨまたはNR_3であり、R_3は、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）との求核性置換により化合物Ｃ５に変換される。あるいは、化合物Ｃ４は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、適切な触媒（例えばＲｕＰｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ２など）および塩基（例えばナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなど）の存在下で、第一級もしくは第二級アミンまたはアルコールとのクロスカップリングを経由して、化合物Ｃ５に変換される。化合物Ｃ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）および塩基（例えばK_2CO_3水溶液など）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－ボロン酸（またはピナコールホウ素エステル）との鈴木カップリングにより化合物Ｃ６に変換される。あるいは、化合物Ｃ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えば$Pd_2(dba)_3$など）、リガンド（例えばＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばＣｓＦなど）の存在下で、アリール－またはヘテロアリール－スタンナンとのスティルカップリングにより化合物Ｃ６に変換される。あるいは、化合物Ｃ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えばＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2など）の存在下で、ピナコラートジボロンおよび塩基（例えばＫＯＡｃなど）での処理、続いてアリール－またはヘテロアリール－ハロゲン化物の添加により、化合物Ｃ６に変換される。あるいは、化合物Ｃ５は、適切な溶媒（例えば１，４－ジオキサンなど）中において、触媒（例えば$Pd_2(dba)_3$など）、リガンド（例えばｔＢｕＸ－Ｐｈｏｓなど）および塩基（例えばK_3PO_4など）の存在下で、ヘテロアリールまたはアミンとのバックワルド－ハートウィッグカップリングにより化合物Ｃ６に変換される。化合物Ｃ６は、適切な溶媒（例えばジオキサンなど）中において、保護基の除去に適切な条件（例えば、ＭＯＭ保護基では、ジオキサン中のＨＣｌ）での処理の際に、化合物Ｃ７に変換される。

【０６４１】

特定の合成例

より詳細に説明し、理解を補助するために、以下の非限定的な例は、本明細書に記載されている化合物の範囲をより詳しく例証するべく設けられており、その範囲を具体的に限定すると解釈されない。当業者が確認できる範囲内の現在公知であり得る、または後に開発され得る、本明細書に記載されている化合物のそのような変化は、本明細書に記載されている化合物の範囲内にあると考えられ、請求されている。当業者が確認できる範囲内の現在公知であり得る、または後に開発され得る、本明細書に記載されている化合物のそのような変化は、本明細書に記載されている化合物の範囲内にあると考えられ、以下に請求されている。当業者は、当業者により説明されるように、これらの例に記載されている技術が、合成の実践において正しく機能し、したがってその実践に好ましい様式を構成する技術を表すことを理解する。しかし、当業者は、本開示を踏まえ、開示されている具体的な方法において多くの変化を施すことができ、本明細書の精神および範囲から逸脱することなく、同様のまたは類似した結果をさらに得られると認識するものであると、認識されるべきである。

【０６４２】

具体化されている化合物の以下の例以外では、そうではないと指し示されていない限り、本明細書および特許請求の範囲で使用される原料の量、反応条件、実験データなどを表現するすべての数は、「約」という用語により修飾されると理解される。したがって、そのような数はすべて、反応により、または、様々な実験条件の結果として得ることが求められる、望ましい性質に応じて変化し得る近似値を表す。得ることが求められる、望ましい性質に応じて変化し得る近似値を表す。したがって、実験再現性の予想される範囲内で、生じたデータに関して「約」という用語は、データの範囲を指すが、但し、平均からの標準偏差に従って変化し得ることを条件とする。同様に、得られた実験結果について、生じたデータは、有効数字の損失なしで、当データに対する切り上げまたは切り下げを一貫

して行ってよい。最低限でも、特許請求の範囲の範囲に対する等価物の原則の適用を限定するように企図せず、各数字パラメータは、当業者により使用される有効桁数および切り上げ技術を踏まえて、解釈されるべきである。

【０６４３】

本明細書の広い範囲を明記する数字の範囲およびパラメータ設定は近似値であるが、以下に明記されている例に明記されている数値は、できるだけ正確に報告されている。しかし、いずれの数値も、それぞれのテスト測定で見出される標準偏差から必ず生じる一定の誤差を本質的に含有する。

【０６４４】

示されている例に使用される出発材料は、市販されている、または、当業者に公知の方法に従って調製できる、または、本明細書で開示されている手順により調製できる。

【０６４５】

化合物例

上で使用されているように、また、本明細書を通じて、以下の略語は、別段指示がない限り、以下の意味を有すると理解されるものとする。

【表３－１】

略語	意味
Δ	加熱(化学)または欠失(生物学)
AcOHまたはHOAc	酢酸
ACN	アセトニトリル
aq.	水溶液
atm	気圧(複数可)
Boc	tert-ブトキシ-カルボニル
Boc_2O	二炭酸ジ-tert-ブチル
BrettPhos Pd G3	[(2-ジ-シクロヘキシルフォスフィノ-3,6-ジメトキシ-2′,4′,6′-トリイソプロピル-1,1′-ビフェニル)-2-(2′-アミノ-1,1′-ビフェニル)]パラジウム(II)メタンスルホナートメタンスルホン酸塩
t-Bu	tert-ブチル
t-BuOKまたはKOtBu	カリウムtert-ブトキシド
BuOHまたはn-BuOH	n-ブタノール
℃	セ氏温度
Cbz	カルボキシベンジル
Celite(登録商標)またはCelite	珪藻土
d/h/hr/hrs/min/s	日(d)/時間(h, hrまたはhrs)/分(min)/秒(s)
DBU	1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン
DCM	ジクロロメタン
DMAPまたは4-DMAP	4-(ジメチルアミノ)ピリジン
DMF	ジメチルホルムアミド
DMSO	ジメチルスルホキシド
EtOAc	酢酸エチル
EtOH	エタノール
Et_2O	ジエチルエーテル
equiv	当量
e.r.	鏡像異性体比
LC/MS、LCMSまたはLC-MS	液体クロマトグラフィー質量分析法
LiHMDS	リチウムビス(トリメチルシリル)アミド
mCPBA	メタ-クロロ過安息香酸
Me4tBuXPhos	2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3,4,5,6-テトラメチル-2′,4′,6′-トリイソプロピル-1,1′-ビフェニル
MeOH	メタノール
$MeSO_3H$	メタンスルホン酸
mL	ミリリットル

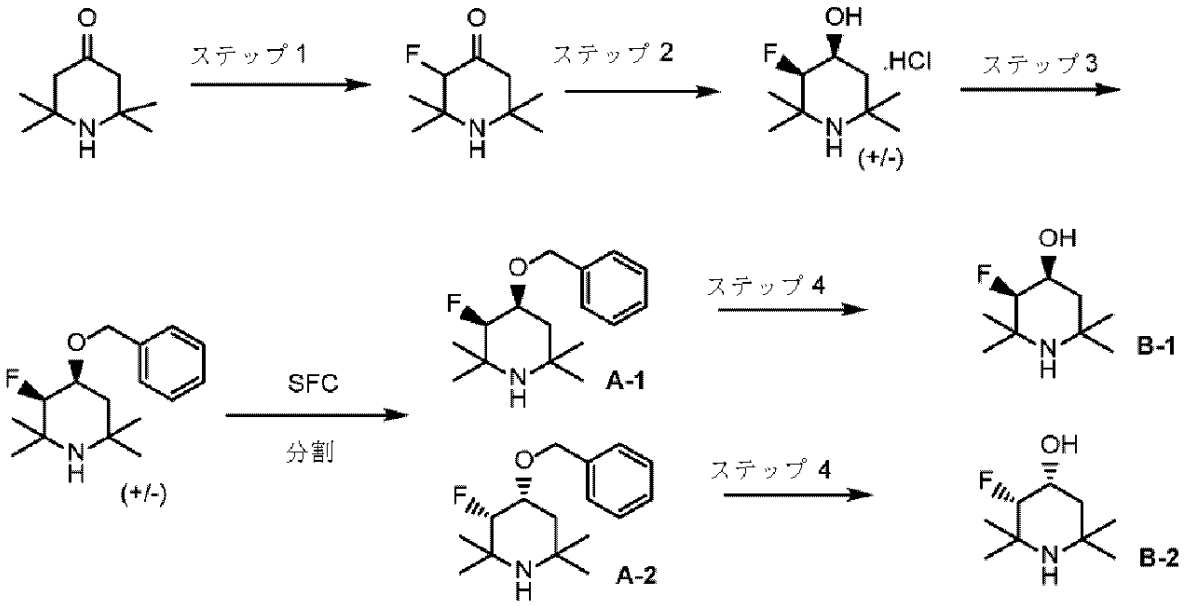
【表３－２】

MOM	メトキシメチル
MS	質量分析法
NFSI	N-フルオロベンゼンスルホンイミド
NMP	N-メチルピロリドン
NMR	核磁気共鳴
Pd/C	パラジウム炭素
$Pd_2(dba)_3$	トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)
$Pd(dppf)Cl_2$ または $Pd(dppf)Cl_2$-CH_2Cl_2	[1,1′-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)、ジクロロメタン複合体
$Pd(PPh_3)_2Cl_2$	ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド
PhMe	トルエン
i-PrOAc	酢酸イソプロピル
RTまたはRtまたはrt	室温(およそ25℃)
L-Selectride(登録商標)	リチウムトリ-sec-ブチルボロヒドリド
SFC	超臨界流体クロマトグラフィー
TBAF	フッ化テトラブチルアンモニウム
TBS	tert-ブチルジメチルシリル
TEA	トリエチルアミン
Tf	トリフルオロメタンスルホニルまたはトリフレート
TFA	トリフルオロ酢酸
THF	テトラヒドロフラン
THP	テトラヒドロピラニル
TLC	薄層クロマトグラフィー
UPLC	超高速液体クロマトグラフィー
XPhos Pd G3	(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-1,1′-ビフェニル)[2-(2′-アミノ-1,1′-ビフェニル)]パラジウム(II)メタンスルホン酸塩

【０６４６】

出発材料の調製：（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オールおよび（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール

【化１１】



【０６４７】

ステップ１：ＴＨＦ２００ｍＬ中の２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オン（８．０ｇ、５２．０ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下－７８℃にて、ＴＨＦ中（１Ｍ、６７ｍＬ、６７ｍｍｏｌ）のＬｉＨＭＤＳを、－６５℃未満の温度に維持しながら４０ｍｉｎにわたり滴下添加した。添加後、上記溶液にＮＦＳＩ（２０ｇ、６２．４ｍｍｏｌ）を３０ｍｉｎにわたり少しずつ加えた。得られた混合物を室温まで徐々に温め、終夜撹拌した。完了後、反応を水でクエンチし、溶媒を蒸発させた。残留物をＤＣＭ２００ｍＬ中に溶解させ、１Ｎ　ＨＣｌ１００ｍＬで抽出した。水層を分離し、ａｑ．K_2CO_3で塩基性にしてｐＨ＝１０にし、次いでＤＣＭ（２００ｍＬ×２）で抽出した。有機相をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、勾配０～１５％ＭｅＯＨ／ＤＣＭで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製される粗生成物を得た。得られた生成物を石油エーテルで粉砕することによりさらに精製して、３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オン（４．５ｇ、５０％収率）を白色固体として得た。ＭＳ　ｍ／ｚ　１７５．２　［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６４８】

ステップ２：ＴＨＦ４００ｍＬ中の３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オン（３０．０ｇ、１７０ｍｍｏｌ）の溶液に、０℃にて、Ｌ－Ｓｅｌｅｃｔｒｉｄｅ（４３．０ｇ、２２６ｍｍｏｌ）を添加した。混合物を室温まで温め、終夜撹拌した。混合物を濃縮し、勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、粗生成物を得た。ＤＣＭ２００ｍＬ中の上記生成物の溶液に、１，４－ジオキサン中の４Ｍ　ＨＣｌ６０ｍＬを加えた。沈殿物を濾過し、乾燥させ、ａｑ．ＮａＯＨ（水１００ｍＬ中に溶解したＮａＯＨ６ｇ）中に溶解させた。混合物をＤＣＭ中５％ｉ－ＰｒＯＨ（２００ｍＬ×３）で抽出した。有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、（ｒａｃ）－ｃｉｓ－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール（１６．５ｇ、５５％収率）を得た。

【０６４９】

ステップ３：ＴＨＦ６０ｍＬ中の（ｒａｃ）－ｃｉｓ－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール（８．０ｇ、４５．７ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素雰囲気下室温にて、油中の６０％ＮａＨ（２．７ｇ、６８．５ｍｍｏｌ）を添加した。混合物を６５℃にて２ｈ撹拌し、次いで室温まで冷却し、ＢｎＢｒ（７．８ｇ、４５．７ｍｍｏｌ）を混合物に加えた。得られた混合物を５０℃にて１６ｈ撹拌した。混合物を水（１００ｍＬ）中に注ぎ、ＥｔＯＡｃ（２５０ｍＬ）で抽出した。有機相を分離し、１Ｎ

ＨＣｌ（１００ｍＬ）で洗浄した。水層を分離し、ａｑ．K_2CO_3で塩基性にしてｐＨ＝１０にし、次いでＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ×２）で抽出した。有機相を分離し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。残留物を分取ＨＰＬＣにより精製して、（ｒａｃ）－ｃｉｓ－４－（ベンジルオキシ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン（９．６ｇ、７３％）を、薄黄色油状物として得た。ラセミ化合物８ｇをＳＦＣにより分割して、化合物Ａ－１（３．５ｇ）およびＡ－２（３．６ｇ）を得た。

【０６５０】

ＳＦＣ条件：

１．機器：ＳＦＣ－２００（Ｔｈａｒ、Ｗａｔｅｒｓ）
２．カラム：ＯＪ　２０*２５０ｍｍ、１０μｍ（Ｄａｉｃｅｌ）
３．カラム温度：３５℃
４．移動相：CO_2／ＭｅＯＨ（０．２％メタノール　アンモニア）＝８０／２０
５．流速：１３０ｇ／ｍｉｎ
６．背圧：１００ｂａｒ
７．検出波長：２１４ｎｍ
８．サイクルタイム：５ｍｉｎ
９．試料溶液：８ｇをメタノール５０ｍＬ中に溶解

【０６５１】

ステップ４：ＭｅＯＨ５０ｍＬ中のＡ－１（３．５ｇ、８．７ｍｍｏｌ）の溶液に、窒素フロー下、Ｐｄ／Ｃ（０．７ｇ、１０質量％）を添加した。フラスコを真空にし、水素を３回再充填した。反応混合物を、５０℃にて１６ｈ撹拌した。次いで、室温まで冷却し、触媒を濾過し、溶媒を蒸発させて、Ｂ－１（２．２ｇ、９５％）を白色固体として得た。

【０６５２】

^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－d_4） δ： ４．３６ （ｄ， Ｊ＝２．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．２３ （ｄ， Ｊ＝１．８ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．１５ （ｄｄｄ， Ｊ＝１２．１， ５．１， １．８ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．０７ （ｄｄｄ， Ｊ＝１２．０， ５．１， ２．０ Ｈｚ， １Ｈ）， １．６６ （ｄｄ， Ｊ＝１２．５， ５．０ Ｈｚ， ２Ｈ）， １．５８ （ｔ， Ｊ＝１２．５ Ｈｚ， ２Ｈ）， １．１７－１．２４ （ｍ， ２５Ｈ）

【０６５３】

同一の条件を使用して、Ａ－２をＢ－２（２．０ｇ、８４％）に変換した。

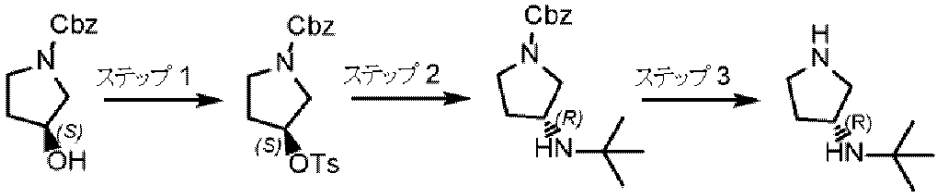
【０６５４】

^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－d_4） δ： ４．６５ （ｄ， Ｊ＝２．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．５３ （ｄ， Ｊ＝２．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．３６ （ｔｄ， Ｊ＝８．５， １．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．２９ （ｔｄ， Ｊ＝８．５， ２．０ Ｈｚ， １Ｈ）， １．９３ （ｄ， Ｊ＝８．５ Ｈｚ， １Ｈ）， １．４９－１．５７ （ｍ， ６Ｈ）．

【０６５５】

出発材料の調製：（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オールおよび（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール

【化１２】



【０６５６】

ステップ１：（３Ｓ）－３－ヒドロキシピロリジン－１－カルボン酸ベンジル（５ｇ、２２．６ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（４０ｍＬ）およびＴＥＡ（５ｍＬ、３５．９ｍｍｏｌ）の混合物に、０℃にてＤＣＭ（１０ｍＬ）中の４－メチルベンゼンスルホニルクロリド（７

ｇ、３６．７１６ｍｍｏｌ）を添加し、続いてＤＭＡＰ（３０ｍｇ、０．２４５５６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた混合物を室温にて１６ｈ撹拌した。混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画し、有機相をブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、次いで溶媒を蒸発させた。粗油状物を勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｓ）－３－（ｐ－トリルスルホニルオキシ）ピロリジン－１－カルボン酸ベンジルを油状物として得、これをヘキサン中の１０％エーテルで粉砕し、白色固体（７．２ｇ、８５％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３７６．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６５７】

ステップ２：密閉した管に、（３Ｓ）－３－（ｐ－トリルスルホニルオキシ）ピロリジン－１－カルボン酸ベンジル（６．８ｇ、１８ｍｍｏｌ）、２－メチルプロパン－２－アミン（２６ｇ、３５５．５ｍｍｏｌ）、およびＤＭＳＯ（２０ｍＬ）を添加した。混合物を７０℃にて４８ｈ加熱した。混合物を室温まで冷却し、ＥｔＯＡｃと水との間で分画した。有機相をブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濃縮した。粗生成物を勾配０～８０％ＥｔＯＡｃ／ＤＣＭ、次いで５－１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－カルボン酸ベンジル（４．０ｇ、９０％収率）を油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２５９．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

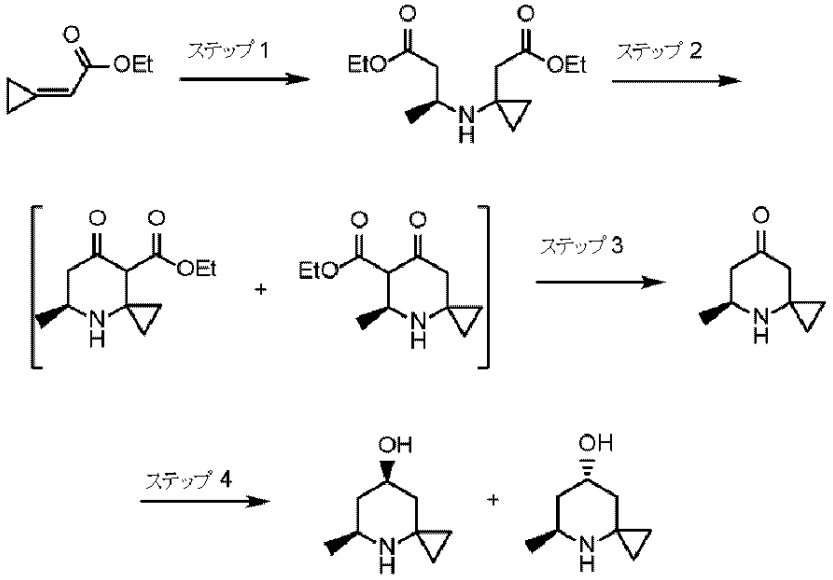
【０６５８】

ステップ３：（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－カルボン酸ベンジル（４．０ｇ、１４．４７ｍｍｏｌ）、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）、ＥｔＯＨ（３０ｍＬ）の混合物に、Ｐｄ／Ｃ（８００ｍｇ、２０％ｗ）を添加し、次いで混合物を真空にし、水素を３回再充填した。混合物をH_2（１ａｔｍ）下室温にて、１４ｈ撹拌した。触媒を濾過し、溶媒を蒸発させて、（３Ｒ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチルピロリジン－３－アミン（２．０ｇ、９７％収率）を透明油状物として得た。キラルＨＰＬＣ分析により、ｅ．ｒ．９９％が示された。

【０６５９】

出発材料の調製：（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オールおよび（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オール

【化１３】



【０６６０】

ステップ１：密閉した反応容器に、２－シクロプロピリデン酢酸エチル（純度約９０％、２０．０ｇ、１４３．０ｍｍｏｌ）、［（１Ｓ）－３－エトキシ－１－メチル－３－オキソ－プロピル］塩化アンモニウム（２４．０ｇ、１４３．０ｍｍｏｌ）、ＤＩＰＥＡ（

３４ｍＬ、１９５．０ｍｍｏｌ）、およびクロロホルム（７０ｍＬ）を添加した。反応物を７５℃にて１６ｈ加熱し、次いでｒｔまで冷却し、水（２０ｍＬ）で洗浄した。有機相を分離し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮し、勾配１０～１００％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｓ）－３－［［１－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）シクロプロピル］アミノ］ブタン酸エチル（２７．０ｇ、７３％収率）を、透明油状物として得た。

【０６６１】

ステップ２：ＴＨＦ（２００．０ｍＬ）中の（３Ｓ）－３－［［１－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）シクロプロピル］アミノ］ブタン酸エチル（２７．０ｇ、１０５．０ｍｍｏｌ）の溶液に、０℃にて、ｔＢｕＯＫ（ＴＨＦ中１．０Ｍ、１５７．０ｍＬ）を添加した。反応物を０℃にて１ｈ撹拌し、次いで混合物を氷冷水（１００ｍＬ）中に注いだ。水相を分離し、ＤＣＭで抽出した。有機相を合わせ、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、次のステップにてそのまま使用する（５Ｓ）－５－メチル－７－オキソ－４－アザスピロ［２．５］オクタン－６－カルボン酸エチルおよび（５Ｓ）－５－メチル－７－オキソ－４－アザスピロ［２．５］オクタン－８－カルボン酸エチル（２０．２ｇ、９１％）の粗混合物を得た。

【０６６２】

ステップ３：H_2SO_4（６０．０ｇ　５０％ｗ／ｗ）に、上記の（５Ｓ）－５－メチル－７－オキソ－４－アザスピロ［２．５］オクタン－６－カルボン酸エチルおよび（５Ｓ）－５－メチル－７－オキソ－４－アザスピロ［２．５］オクタン－８－カルボン酸エチル（２０．２ｇ、９６．０ｍｍｏｌ）の混合物を添加した。混合物を１２０℃まで加熱し、この温度にて１ｈ撹拌した。完了後、混合物を水（２００ｍＬ）上に注ぎ、ＤＣＭで洗浄した。水相を固体ＮａＯＨで塩基性にしてｐＨ１１～１２にし、ＤＣＭ（１００ｍＬ×５）で抽出した。有機相を合わせ、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、（５Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オン（１２．７ｇ、９５％）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ １４０．２ $[M+H]^+$.

【０６６３】

ステップ４：ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）中の（５Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オン（５．５ｇ、４０ｍｍｏｌ）の溶液に、$NaBH_4$（４．５ｇ、１２０．０ｍｍｏｌ）を少しずつ添加した。混合物を室温にて１ｈ撹拌し、ＴＬＣでモニターした。完了と同時に混合物を水（１０ｍＬ）でクエンチし、濃縮した。残留物を、勾配０～１０％ＭｅＯＨ（２．５％NH_4OH）／ＤＣＭで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オール（２．１ｇ、３８％）および（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オール（１．１ｇ、２０％）の両方を、白色固体として得た。

【０６６４】

（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オール、^1H ＮＭＲ（$CDCl_3$）δ：３．８８－３．８１（ｍ，１Ｈ），２．８３－２．７４（ｍ，１Ｈ），２．０８－２．０３（ｍ，１Ｈ），１．６６（ｔ，Ｊ＝１０．９Ｈｚ，１Ｈ），１．３４－１．２９（ｍ，１Ｈ），１．０９（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，３Ｈ），０．９５（ｑ，Ｊ＝１１．３Ｈｚ，１Ｈ），０．６６－０．６０（ｍ，１Ｈ），０．５２－０．４２（ｍ，２Ｈ），０．３７－０．３１（ｍ，１Ｈ）；２Ｈｓは観察されなかった（ＮＨおよびＯＨ）．

【０６６５】

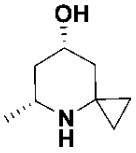
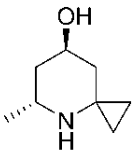
（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－オール、^1H ＮＭＲ（$CDCl_3$）δ：４．２３－４．１７（ｍ，１Ｈ），３．２３－３．１２（ｍ，１Ｈ），２．０８－１．９９（ｍ，１Ｈ），１．８６－１．７７（ｍ，１Ｈ），１．３７－１．２７（ｍ，１Ｈ），１．２４－１．１８（ｍ，１Ｈ），１．０６（ｄ，Ｊ＝２．５Ｈｚ，３Ｈ），０．６６－０．５９（ｍ，１Ｈ），０．５９－０．

４７（ｍ，２Ｈ），０．３９－０．３２（ｍ，１Ｈ）；２Ｈｓは観察されなかった（ＮＨおよびＯＨ）．

【０６６６】

上記手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより、以下を調製した。

【表４】

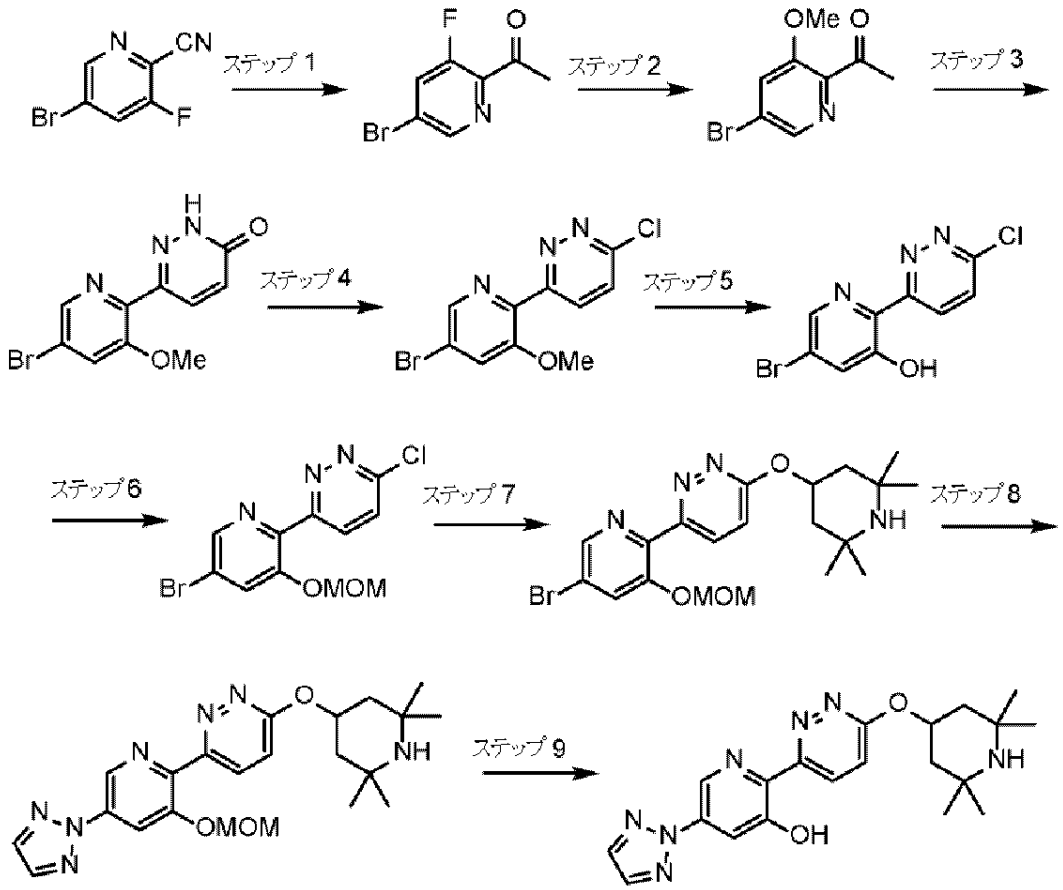
出発材料	データ
(5R,7S)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-オール 	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 4.53 (s, 1H), 3.62-3.48 (m, 1H), 2.60-2.51 (m, 1H), 1.85-1.76 (m, 1H), 1.50 (t, J = 11.4 Hz, 1H), 1.14-1.06 (m, 1H), 0.93 (d, J = 6.4 Hz, 3H), 0.81 (q, J = 11.4 Hz, 1H), 0.49-0.41 (m, 1H), 0.35-0.23 (m, 2H), 0.22-0.15 (m, 1H); 1H は観察されなかった (NH または OH).
(5R,7R)-5-メチル-4-アザスピロ[2.5]オクタン-7-オール 	^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 4.22 (s, 1H), 4.02-3.92 (m, 1H), 3.10-2.99 (m, 1H), 1.74 (dd, J = 13.2, 2.7 Hz, 1H), 1.58-1.49 (m, 1H), 1.25-1.14 (m, 1H), 1.10-1.02 (m, 1H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.42-0.32 (m, 2H), 0.31-0.24 (m, 1H), 0.20-0.12 (m, 1H); 1H は観察されなかった (NH または OH).

【０６６７】

（例１）

化合物２０の調製

【化１４】



【０６６８】

ステップ１：オーブンで乾燥させた丸底フラスコに、５－ブロモ－３－フルオロ－ピリジン－２－カルボニトリル（１０．１ｇ、５０．０ｍｍｏｌ）を添加し、これを窒素下で循環させた。ＴＨＦ（２５０ｍＬ）を加え、撹拌した溶液を０℃まで冷却した。ＭｅＭｇＣｌ（３．０Ｍ、１６．７５ｍＬ）を滴下添加し、混合物を０℃にて１５分間撹拌した。冷却した反応混合物を、同じく０℃にて、撹拌しているＨＣｌ溶液（水溶液、３Ｍ、５００ｍＬ）中にカニューレ挿入した。添加後、混合物を室温まで温め、１６時間撹拌した。次いで、０℃にて飽和炭酸ナトリウム水溶液に添加することにより、溶液をリバースクエンチした。水層を酢酸エチル（２×５００ｍＬ）で抽出した。有機層を合わせ、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮して、１－（５－ブロモ－３－フルオロ－２－ピリジル）エタノン（１０．１ｇ、９３％）を固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２１９．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６６９】

ステップ２：１－（５－ブロモ－３－フルオロ－２－ピリジル）エタノン（１０．１ｇ、４６．４ｍｍｏｌ）をメタノール（１２ｍＬ）中に懸濁させ、０℃まで冷却した。ナトリウムメトキシド（メタノール中３０％質量、１６ｍＬ）を撹拌しながら滴下添加した。添加完了後、混合物を室温まで温め、１０分間撹拌した。反応物をＤＣＭとH_2Oとの間で分画し、層を分離した。水層をＤＣＭで１回抽出し、合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。０～１００％ヘキサン中ＥｔＯＡｃで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製することで、１－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）エタノン（６．２ｇ、５８％）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２３０．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７０】

ステップ３：１－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）エタノン（６．２４ｇ、２５．６ｍｍｏｌ）をメタノール（５０ｍＬ）中に溶解させた。オキサルアルデヒド酸水和物（２．４５ｇ、２６．６ｍｍｏｌ）およびK_2CO_3（６．９２ｇ、５０．１ｍｍｏｌ）をH_2O（５０ｍＬ）中に溶解させ、溶液を０℃まで冷却した。撹拌している水溶液に

、定量的に移すためのメタノール（５ｍＬ）を使用して、メタノール溶液を滴下添加した。混合物をゆっくりと室温まで温め、１２時間撹拌した。次いで、反応物を０℃まで冷却し、ＡｃＯＨ（１０．５ｍＬ）を撹拌しながら滴下添加した。混合物を濃縮して橙色油状物を得、これを密閉可能な管に移した。エタノール／H_2O混合物（３：１、４０ｍＬ）を加え、続いてヒドラジン水和物（２．３ｍＬ、３０．４ｍｍｏｌ）およびＡｃＯＨ（０．７５ｍＬ）を加えた。反応管を密閉し、マイクロ波放射下で８時間１００℃まで加熱した。H_2O（１００ｍＬ）を加え、懸濁液を撹拌および濾過して粗固体を得、これを真空下で乾燥させて３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－１Ｈ－ピリダジン－６－オン（６．３ｇ、８５％）を、濃褐色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２８２．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７１】

ステップ４：丸底フラスコに$POCl_3$（３２ｍｌ）を添加した。３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－１Ｈ－ピリダジン－６－オン（６．３２ｇ、２２．４ｍｍｏｌ）を、固体として撹拌しながら少しずつ加えた。完全に添加した後、還流凝縮器を丸底フラスコに取り付け、反応物を２０分間１００℃まで温め、次いで室温まで冷却した。反応混合物をＤＣＭ（２００ｍＬ）で希釈し、次いで氷水中に注いだ。この二層を０℃まで冷却し、次いで飽和Na_2CO_3水溶液（１００ｍＬ）を添加した。有機層を集め、水層をＤＣＭ（４ｘ１００ｍＬ）で抽出した。有機層を合わせ、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。０～１００％ヘキサン中ＥｔＯＡｃで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製することで、３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－６－クロロ－ピリダジン（３．６ｇ、５３％）をオフホワイト固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３００．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７２】

ステップ５：オーブンで乾燥させた丸底フラスコに、３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－６－クロロ－ピリダジン（８．０ｇ、２７ｍｍｏｌ）を添加した。フラスコを－１０℃まで冷却し、BBr_3（ＤＣＭ中１．０Ｍ、６０ｍＬ）を加え、混合物を－１０℃にて１０分間撹拌した。次いで、混合物を１６時間５０℃まで加熱した。反応物を室温まで冷却し、氷水中にゆっくりと注いだ。飽和$NaHCO_3$水溶液を使用してｐＨを８に調整し、水層をＥｔＯＡｃ（２×１５０ｍＬ）で抽出した。有機層を合わせ、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。残留物を、２０％石油エーテル中ＥｔＯＡｃで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製して、５－ブロモ－２－（６－クロロピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール（４．０ｇ、５２％）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２８５．９ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７３】

ステップ６：オーブンで乾燥させた丸底フラスコに、０℃にて、鉱油中のＮａＨ（６０質量％、１．７ｇ、４３ｍｍｏｌ）およびＴＨＦ（５０ｍＬ）を添加した。５－ブロモ－２－（６－クロロピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール（３．９５ｇ、１３．８ｍｍｏｌ）を加え、混合物を０℃にて３０分間撹拌した。クロロ（メトキシ）メタン（２．６２ｍＬ、３４．５ｍｍｏｌ）を添加し、反応物を０℃にて３０分間撹拌した。反応をH_2Oでクエンチし、飽和$NaHCO_3$水溶液の添加によりｐＨを８に調整した。水層をＤＣＭ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残留物を、２０％石油エーテル中ＥｔＯＡｃで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製して、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（４．１ｇ、９０％）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３３０．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７４】

ステップ７：３－（５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－６－クロロピリダジン（１０．７ｇ、３２．４ｍｍｏｌ）および２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール（６．１ｇ、３９ｍｍｏｌ、１．２ｅｑｕｉｖ．）の混合物をＤＭＦ（６５ｍＬ）中に溶解させた。溶液を０℃まで冷却し、ＮａＯｔ－Ｂｕ（３３ｍ

Ｌ、ＴＨＦ中２Ｍ）を５分間にわたって加えた。氷浴を除去し、反応物を３０分間撹拌した。反応混合物を、ＥｔＯＡｃ（４００ｍＬ）とブライン（２００ｍＬ）との間で分画した。水（１００ｍＬ）を加えて残留する不溶性固体を溶解し、透明な二層を観察した。有機層を集め、水層をＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）でもう一度抽出した。有機層を合わせ、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮し、５～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲルで精製して、３－（５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－６－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（９．２ｇ、６３％）を、白色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４５１．１ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７５】

ステップ８：Pd_2dba_3（２９０ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）および$Me_4tBuXPhos$（３９０ｍｇ、０．７８ｍｍｏｌ）をトルエン（１０ｍＬ）中に懸濁させた。溶液をアルゴンでスパージし、次いでアルゴン雰囲気下で５分間１１５℃まで加熱した。別のフラスコにおいて、３－（５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－６－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（２．８ｇ、６．２ｍｍｏｌ）、１，２，３－トリアゾール（４３０μＬ、５１０ｍｇ、７．４ｍｍｏｌ）およびK_3PO_4（２．７ｇ、１２．４ｍｍｏｌ）をトルエン中に懸濁させ、アルゴンで５分間スパージした。あらかじめ調製しておいた触媒溶液を室温まで冷却し、半分（５ｍＬ）を添加した。得られた混合物をアルゴンで短時間スパージし、次いで１５分間１１５℃まで加熱した。残っている触媒溶液を加え、混合物をアルゴンで短時間スパージし、次いで１５分間１１５℃まで加熱した。反応混合物を室温まで冷却し、Ｃｅｌｉｔｅを通して濾過し、ＤＣＭで洗浄した。有機相を濃縮し、粗生成物を５～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製して、３－（３－（メトキシメトキシ）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－６－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（２．５ｇ、９２％）を、薄黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４４０．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０６７６】

ステップ９：３－（３－（メトキシメトキシ）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－６－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（２．５ｇ、５．７ｍｍｏｌ）をＭｅＯＨ（２５ｍＬ）中に懸濁させ、ＨＣｌ（３０ｍＬ、ジオキサン中４Ｍ）を加えた。反応物を室温にて３時間撹拌し、次いで揮発物を除去し、粗固体を高真空下で乾燥させた。次いで、粗固体を２０％１Ｍ NH_3／ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２０ｍＬ）中に懸濁させた。混合物を、０～３０％１Ｍ NH_3／ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製して、２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール（１．２ｇ、５３％）を、白色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９６．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$. ^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－d_6） δ： ８．９６ （ｓ， １Ｈ）， ８．６６ （ｄ， Ｊ ＝ ９．２ Ｈｚ， １Ｈ）， ８．２７ （ｓ， ２Ｈ）， ７．９７ （ｓ， １Ｈ）， ７．５４ （ｄ， Ｊ ＝ ８．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．７０ － ５．７４ （ｍ， １Ｈ）， ２．０７ － ２．１５ （ｍ， ２Ｈ）， １．２２ － １．３５ （ｍ， ８Ｈ）， １．１１ （ｓ， ６Ｈ）； ２Ｈｓは観察されなかった （ＯＨおよびＮＨ）.

【０６７７】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表５】

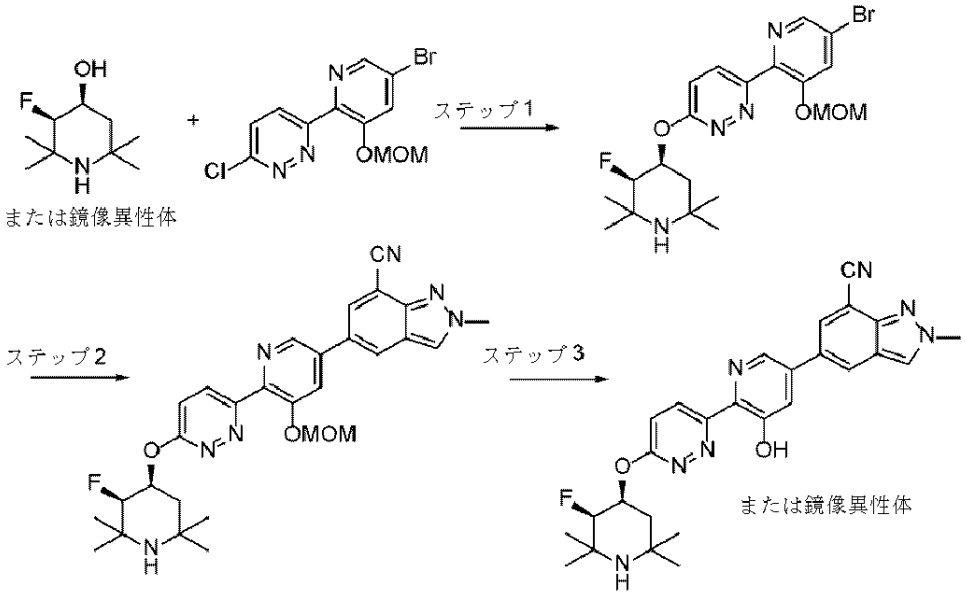
Cpd	データ
11	MS m/z 414.0 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 9.00 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.46 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 5.93-6.08 (m, 1H), 4.88 (d, J = 52.7 Hz, 1H), 2.14 (m, 1H), 2.01 (t, J = 12.3 Hz, 1H), 1.49 (d, J = 3.7 Hz, 6H), 1.36 (s, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
21	MS m/z 394.4 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4): δ: 8.91 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.05 (s, 3H), 7.37 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.71-5.82 (m, 1H), 2.29-2.40 (m, 1H), 2.02-2.14 (m, 1H), 1.88-1.98 (m, 1H), 1.68-1.79 (m, 1H), 1.46 (s, 3H), 1.35 (s, 3H), 0.90-0.94 (m, 2H), 0.73-0.82 (m, 1H), 0.63-0.70 ppm (m, 1H). 2Hs は観察されなかった.
32	MS m/z 394.4 [M+H]+ ; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 9.00 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.75 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.10 - 7.98 (m, 3H), 7.41 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.78 - 5.67 (m, 1H), 2.63 - 2.51 (m, 2H), 2.36 - 2.23 (m, 2H), 2.02 - 1.91 (m, 2H), 1.89 - 1.75 (m, 2H), 1.52 (s, 6H); 2H (OH および 2NH)は観察されなかった.
73	MS m/z 392.4 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 8.96 (s, 1H), 8.72 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.00 (s, 3H), 7.40 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.72 (br s, 1H), 2.31-2.18 (m, 4H), 1.32-1.23 (m, 1H), 1.07-0.82 (m, 7H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).

【０６７８】

（例２）

化合物３４の調製

【化１５】



【０６７９】

ステップ１：テトラヒドロフラン（５ｍＬ）中の３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（４５０ｍｇ、１．３６ｍｍｏｌ）および（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－ピペリジン－４－オール（２８６ｍｇ、１．６３ｍｍｏｌ）の溶液に、０℃にて、ＴＨＦ中のナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（２ｍＬ、４ｍｍｏｌ、２ｍｏｌ／Ｌ）を添加した。添加後、氷浴を除去し、反応物を室温にて１ｈ撹拌した。次いで、混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画した。水層をＥｔＯＡｃで抽出し、有機層を合わせ、ブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。勾配０～１０％ＭｅＯＨ／ＤＣＭで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによる精製で、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジ

ル］－６－［［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペリジル］オキシ］ピリダジン（５２８ｍｇ、８３％収率）をオフホワイト固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４６９．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０６８０】

ステップ２：Ｃ３－（５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（５０．９ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、２－メチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）インダゾール－７－カルボニトリル（４２．９ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）、ＸＰｈｏｓ Ｐｄ Ｇ３（１１．３ｍｇ、０．０１３ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（０．７ｍＬ）、および炭酸カリウム水溶液（１．０Ｍ、０．３５ｍＬ）を合わせ、１ｈ、１００℃まで加熱した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、５－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル（７５．７ｍｇ、１２８％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５４６．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０６８１】

ステップ３：５－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル（７５．７ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）およびトリフルオロ酢酸（４ｍＬ）を合わせ、２３℃にて４０分間撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ ３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤）で溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、５－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル（２６．０ｍｇ、４９％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５０２．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（１：４ メタノール－d_4：ＣＤＣｌ$_3$）δ：８．７９（ｂｒｓ，１Ｈ），８．５７（ｂｒｓ，１Ｈ），８．５０（ｂｒｓ，１Ｈ），８．３８（ｂｒｓ，１Ｈ），８．１５（ｂｒｓ，１Ｈ），７．７０（ｂｒｓ，１Ｈ），７．４５（ｂｒｓ，１Ｈ），５．９８－６．１１（ｍ，１Ｈ），５．０１－５．１９（ｍ，１Ｈ），４．３３（ｂｒｓ，３Ｈ），２．１６－２．４１（ｍ，２Ｈ），１．６８（ｓ，６Ｈ），１．５８（ｓ，３Ｈ），１．５６（ｓ，３Ｈ）；２Ｈは観察されなかった（１ＯＨ，１ＮＨ）.

【０６８２】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例２に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表６－１】

Cpd	データ
1	MS m/z 395.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.75 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.19 (s, 2H), 7.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.82-5.91 (m, 1H), 2.52 (dd, J = 13.7, 4.0 Hz, 2H), 1.89 (dd, J = 13.4, 11.0 Hz, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.58 (s, 6H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
3	MS m/z 412.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.72 (d, J=9.2 Hz, 1H), 8.49 (br s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.98 (br s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.39 (d, J=9.2 Hz, 1H), 5.81-5.93 (m, 1H), 2.52 (d, J=12.2 Hz, 2H), 1.86 (t, J=12.2 Hz, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.56 (s, 6H); 2 Hs は観察されなかった (NH および OH).
4	MS m/z 409.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.34 (s, 1H), 8.72 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 5.64-5.73 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 2.11 (dd, J = 11.8, 3.6 Hz, 2H), 1.27-1.34 (m, 2H), 1.25 (s, 6H), 1.12 (s, 6H); 1H は観察されなかった (OH または NH).
6	MS m/z 413.2 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO- d_6) δ: 13.22 (s, 1H), 13.17 (s, 1H), 8.64 (d, J = 9.1 Hz, 2H), 8.62 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 5.76-5.94 (m, 1H), 4.71 (d, J = 52.6 Hz, 1H), 1.90 (m, 1H), 1.70 (t, J = 11.6 Hz, 1H), 1.26 (s, 6H), 1.13 (d, J = 7.6 Hz, 6H).
7	MS m/z 427.0 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO- d_6) δ: 13.25 (s, 1H), 8.73 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 5.78-5.94 (m, 1H), 4.71 (d, J = 52.0 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.90 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.26 (s, 6H), 1.13 (d, J = 8.4 Hz, 6H); 1H は観察されなかった (OH または NH).
22	MS m/z 431.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.20 (br s, 1H), 9.34 (d, J=12.2 Hz, 1H), 8.60-8.80 (m, 2H), 8.36 (d, J=12.5 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.67 (br d, J=9.2 Hz, 1H), 6.73 (br d, J=5.2 Hz, 1H), 5.99 (dd, J=28.8, 11.9 Hz, 1H), 5.18 (d, J=49.1 Hz, 1H), 2.32 (dd, J=12.8, 3.5 Hz, 1H), 2.05 (t, J=12.8 Hz, 1H), 1.59 (br d, J=7.3 Hz, 6H), 1.50 (br d, J=9.5 Hz, 6H).
26	MS m/z 411.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.24 (br s, 1H), 12.88 (s, 1H), 9.18 (d, J=11.6 Hz, 1H), 8.67 (br d, J=8.9 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.43 (br s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.55 (br d, J=9.5 Hz, 1H), 5.58-5.78 (m, 1H), 2.38 (d, J=13.4 Hz, 2H), 2.11-2.20 (m, 1H), 2.05 (dd, J=13.4, 2.5 Hz, 1H), 1.87 (t, J=11.9 Hz, 1H), 1.48 (s, 3H), 1.43 (s, 3H), 0.93-1.11 (m, 3H), 0.74-0.89 (m, 1H)
27	MS m/z 393.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.87 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.39 (s, 2H), 8.03 (s, 1H), 7.58 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.82-5.86 (m, 1H), 2.50-2.53 (m, 1H), 2.28-2.33 (m, 1H), 2.18-2.21 (m, 1H), 2.03-2.07 (m, 1H), 1.57 (d, J = 6.0 Hz, 6H), 0.98-1.22 (m, 4H); 3Hs は観察されなかった (OH および NHs).

【表６－２】

Cpd	データ
31	MS m/z 391.4 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.84 (d, J=9.5 Hz, 1H) 8.65 (s, 1H) 8.31 (s, 2H) 7.94 (s, 1H) 7.55 (d, J=9.5 Hz, 1H) 5.78 (dt, J=7.4, 3.7 Hz, 1H) 2.31 - 2.38 (m, 2H) 2.25 - 2.30 (m, 2H) 1.10 - 1.16 (m, 4H) 0.93 - 1.02 (m, 4H); 3 Hs は観察されなかった (2 NHs および OH).
33	MS m/z 410.5 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.99 - 8.85 (m, 1H), 8.69 (brs, 1H), 8.40 (brs, 1H), 8.14 (brs, 1H), 8.04 (brs, 1H), 7.72 - 7.57 (m, 1H), 5.90 - 5.71 (m, 1H), 2.73 - 2.52 (m, 2H), 2.42 - 2.27 (m, 2H), 2.20 - 1.96 (m, 4H), 1.60 (brs, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
35	MS m/z 495.3 [M+H]+; 1H NMR (1:1 メタノール-d4: CDCl3) δ: 8.77 (brs, 1H), 8.52 (brs, 1H), 8.26 (brs, 1H), 7.80 (brs, 1H), 7.63 (brs, 1H), 7.39 (brs, 1H), 7.31 (brs, 1H), 5.89-6.11 (m, 1H), 4.96-5.14 (m, 1H), 4.27 (brs, 3H), 2.30 (brs, 2H), 1.71 (brs, 6H), 1.60 (brs, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
36	MS m/z 405.3 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 9.38 - 9.34 (m, 1H), 9.01 - 8.92 (m, 1H), 8.79 - 8.73 (m, 1H), 8.65 (brs, 1H), 8.05 - 7.93 (m, 1H), 7.74 - 7.67 (m, 2H), 5.81 - 5.71 (m, 1H), 2.65 - 2.60 (m, 2H), 2.35 - 2.27 (m, 2H), 2.10 - 1.96 (m, 4H), 1.60 (brs, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
37	MS m/z 454.4 [M+H]+; 1H NMR (1:1 メタノール-d4: CDCl3) δ: 8.76 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.67 (dd, J = 7.0, 1.8 Hz, 1H), 5.91-6.04 (m, 1H), 4.84-5.02 (m, 1H), 3.64 (s, 3H), 2.06-2.25 (m, 2H), 1.59 (brd, J = 5.5 Hz, 6H), 1.46 (brs, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
39	MS m/z 413.5 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 13.24 (s, 1H), 13.18 (s, 1H), 8.62-8.65 (m, 2H), 8.46 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.74 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.81-5.90 (m, 1H), 4.71 (d, J = 52.0 Hz, 1H), 1.89-1.92 (m, 1H), 1.66-1.72 (m, 1H), 1.25 (d, J = 3.5 Hz, 6H), 1.12 (d, J = 10.5 Hz, 6H); 1H は観察されなかった (OH または NH).
40	MS m/z 431.5 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.87 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.59 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.06-6.14 (m, 1H), 5.17 (d, J = 49.0 Hz, 1H), 2.41-2.43 (m, 1H), 2.25-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J = 3.5 Hz, 6H), 1.62 (d, J = 10.5 Hz, 6H); 3Hs は観察されなかった (OH および NHs).

【表６－３】

Cpd	データ
43	MS m/z 477.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.28 (s, 1H), 8.92 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 8.72 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 8.34-8.36 (m, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.02 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 7.95 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.62 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 6.06-6.15 (m, 1H), 5.18 (d, J＝49.5 Hz, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.41-2.43 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.71 (d, J＝3.5 Hz, 6H), 1.61 (d, J＝10.5 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
44	MS m/z 491.6 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.07 (s, 1H), 8.86 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 8.66 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.85 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 6.06-6.15 (m, 1H), 5.18 (d, J＝49.5 Hz, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 2.40-2.44 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J＝7.5 Hz, 6H), 1.61 (d, J＝15.0 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
45	MS m/z 505.6 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.09 (s, 1H), 8.88 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 8.69 (d, J＝1.5 Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.89 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 6.07-6.14 (m, 1H), 5.18 (d, J＝49.0 Hz, 1H), 3.12 (q, J＝7.0 Hz, 2H), 2.64 (s, 3H), 2.41-2.44 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J＝7.0 Hz, 6H), 1.61 (d, J＝15.0 Hz, 6H), 1.50 (t, J＝7.5 Hz, 3H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
46	MS m/z 545.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.51 (s, 1H), 8.89 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 8.72-8.75 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 7.95 (d, J＝1.5 Hz, 1H), 7.58 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 6.07-6.14 (m, 1H), 5.18 (d, J＝49.5 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 2.41-2.44 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J＝7.0 Hz, 6H), 1.61 (d, J＝14.0 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
51	MS m/z 413.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.77 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.17 (s, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.47 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 6.04-6.12 (m, 1H), 5.17 (d, J＝49.0 Hz, 1H), 2.39-2.43 (m, 1H), 2.01-2.09 (m, 1H), 1.71 (d, J＝7.5 Hz, 6H), 1.60 (d, J＝14.0 Hz, 6H); 3Hs は観察されなかった (2NHs および OH).
52	MS m/z 477.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.95-8.93 (m, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.56 (br s, 1H), 8.17(s, 1H), 8.10 (br s, 1H), 7.765 - 7.63 (m, 1H), 7.53 - 7.49 (m, 1H), 6.00 - 5.89 (m, 1H), 4.31 (br s, 3H), 2.55 - 2.42 (m, 2H), 2.10 - 1.89 (m, 2H), 1.67 (br s, 6H), 1.62 (s, 6H) ; 2H (OH および NH)は観察されなかった.
54	MS m/z 478.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.64 (d, J＝2.5 Hz, 1H), 9.40 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 8.89 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 8.72 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.94 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 6.07-6.15 (m, 1H), 5.18 (d, J＝48.5 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H), 2.41-2.44 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J＝7.0 Hz, 6H), 1.61 (d, J＝14.0 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).

【表６－４】

Cpd	データ
55	MS m/z 478.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.59 (s, 1H), 8.89 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.60-8.62 (m, 1H), 8.17 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.07-6.15 (m, 1H), 5.18 (d, J = 48.5 Hz, 1H), 2.80 (s, 3H), 2.41-2.43 (m, 1H), 2.24-2.29 (m, 1H), 1.72 (d, J = 7.0 Hz, 6H), 1.61 (d, J = 14.5 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
56	MS m/z 492.6 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.90 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.60-7.62 (m, 2H), 6.00-6.18 (m, 1H), 5.18 (d, J = 49.0 Hz, 1H), 2.72 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 2.41-2.45 (m, 1H), 2.25-2.30 (m, 1H), 1.72 (d, J = 6.0 Hz, 6H), 1.62 (d, J = 16.0 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
62	MS m/z 485.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.90 (br d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.54 - 7.53 (m, 1H), 5.91 - 5.85 (m, 1H), 4.35 (s, 3H), 2.55 - 2.49 (m, 2H), 2.00 - 1.95 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.61 (s, 6H) ; 2H (OH および NH)は観察されなかった.
75	MS m/z 410.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.63 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.29 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.69 (br s, 1H), 2.30-2.25 (m, 1H), 2.00 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 1.87-1.83 (m, 1H), 1.67-1.60 (m, 1H), 1.38 (s, 3H), 1.28 (s, 3H), 0.89-0.79 (m, 2H), 0.73-0.68 (m, 1H), 0.60-0.55 (m, 1); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
82	MS m/z 396.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.56 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.94-8.04 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.21 (d, J=9.2 Hz, 1H), 5.47-5.56 (m, 1H), 2.97-3.06 (m, 1H), 2.41 (br d, J=12.5 Hz, 1H), 2.05 (br t, J=11.7 Hz, 1H), 1.72 (br dd, J=12.4, 4.1 Hz, 1H), 1.38 (q, J=11.9 Hz, 1H), 1.11-1.23 (m, 3H), 0.70-0.77 (m, 1H), 0.53-0.69 (m, 3H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
83	MS m/z 396.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.56 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.94-8.04 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.21 (d, J=9.2 Hz, 1H), 5.47-5.56 (m, 1H), 2.97-3.06 (m, 1H), 2.41 (br d, J=12.5 Hz, 1H), 2.05 (br t, J=11.7 Hz, 1H), 1.72 (br dd, J=12.4, 4.1 Hz, 1H), 1.38 (q, J=11.9 Hz, 1H), 1.11-1.23 (m, 3H), 0.70-0.77 (m, 1H), 0.53-0.69 (m, 3H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
84	MS m/z 396.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.86 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.62 (d, J=9.5 Hz, 1H), 5.81 (br s, 1H), 3.79-3.92 (m, 1H), 2.56 (br t, J=17.2 Hz, 2H), 1.87-2.05 (m, 2H), 1.40 (br d, J=6.4 Hz, 3H), 1.16-1.33 (m, 1H), 0.98-1.12 (m, 1H), 0.79-0.97 (m, 2H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).

【表６－５】

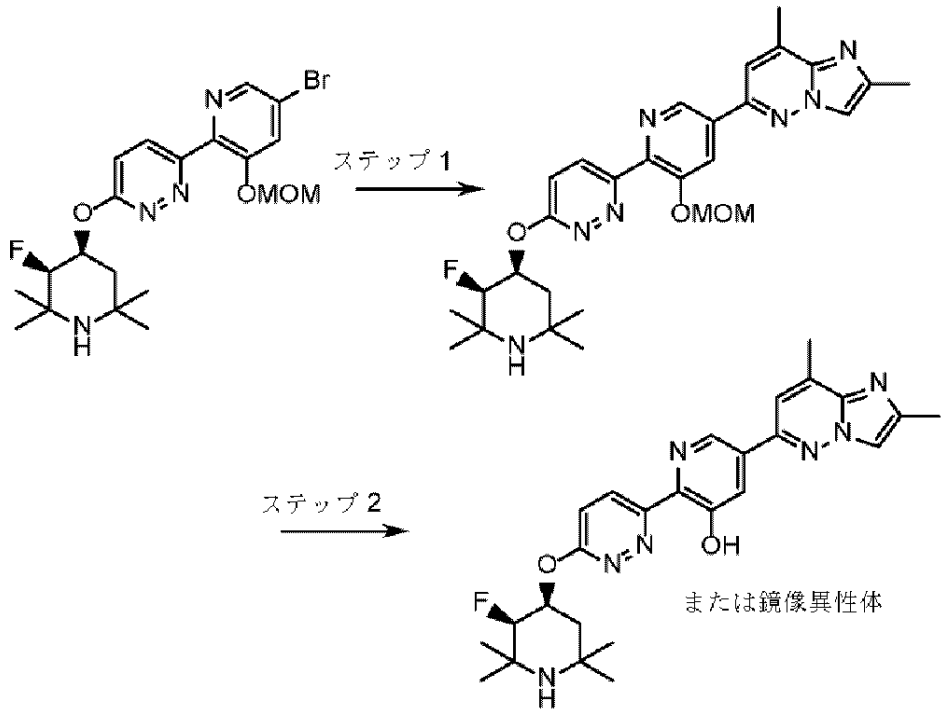
Cpd	データ
85	MS m/z 396.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.83 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.54-8.67 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.78-7.89 (m, 1H), 7.58 (d, J=9.5 Hz, 1H), 5.80 (br s, 1H), 3.78-3.92 (m, 1H), 3.34-3.54 (m, 1H), 2.56 (br t, J=14.8 Hz, 2H), 1.87-2.05 (m, 2H), 1.40 (br d, J=6.7 Hz, 3H), 1.13-1.32 (m, 1H), 0.97-1.09 (m, 1H), 0.77-0.97 (m, 1H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
114	MS m/z 409.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.69 (d, J=8.5 Hz, 1H), 8.49 (d, J=2.6 Hz, 1H), 8.10 (br s, 2H), 7.58 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.33 (d, J=9.2 Hz, 1H), 5.64-5.72 (m, 1H), 4.67-4.78 (m, 3H), 4.46 (d, J=6.6 Hz, 1H), 2.90-2.98 (m, 1H), 2.12-2.21 (m, 1H), 1.88-1.96 (m, 1H), 1.59-1.68 (m, 1H), 1.29 (s, 3H), 1.21 (s, 3H), 3 Hs は観察されなかった (2 NHs および OH).

【０６８３】

（例３）

化合物３８の調製

【化１６】



【０６８４】

ステップ１：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－［［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペリジル］オキシ］ピリダジン（４６．８ｍｇ、０．０９９ｍｍｏｌ）、ビス（ピナコラート）ジボロン（３４．０ｍｇ、０．１３４ｍｍｏｌ）、酢酸カリウム（使用直前に真空下２５０℃にて乾燥、３０．９ｍｇ、０．３１５ｍｍｏｌ）、ＸＰｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ３（１５．９ｍｇ、０．０１７８ｍｍｏｌ）、および１，４－ジオキサン（１．０ｍＬ）を合わせ、アルゴンで脱気し、１１０℃にて２ｈ撹拌した。６－クロロ－２，８－ジメチル－イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン（２５．０ｍｇ、０．１３８ｍｍｏｌ）、Ｘ　Ｐｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ３（７．３ｍｇ、０．００８２ｍｍｏｌ）、および炭酸カリウム水溶液（１．０Ｍ、０．３５ｍＬ）を加え、溶液をアルゴンで脱気し、８０℃にて１ｈ撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、６－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジンを、次のステップに直接持ち越す粗混合物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４９２．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０６８５】

ステップ２：６－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジンの粗混合物をトリフルオロ酢酸（４ｍＬ）と合わせ、２３℃にて、１ｈ３０ｍｉｎ撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を、０～１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ　３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤）で溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール（２．８ｍｇ、２ステップにわたり５％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４９２．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （１：１ メタノール－ｄ$_{4}$：クロロホルム－ｄ） δ： ８．８１ （ｄ， Ｊ ＝ １．８ Ｈｚ， １Ｈ），８．７５ （ｄ， Ｊ ＝ ９．２ Ｈｚ， １Ｈ），７．９６ （ｄ， Ｊ ＝ １．８ Ｈｚ， １

Ｈ），７．８５（ｓ，１Ｈ），７．４４（ｓ，１Ｈ），７．３６（ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），５．８８－６．０１（ｍ，１Ｈ），４．７３－４．９０（ｍ，１Ｈ），２．７０（ｓ，３Ｈ），２．５１（ｓ，３Ｈ），２．０６－２．１５（ｍ，１Ｈ），１．９３－２．０５（ｍ，１Ｈ），１．４８（ｂｒｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，６Ｈ），１．３６（ｂｒｓ，６Ｈ）；２Ｈは観察されなかった（１ＯＨ，１ＮＨ）．

【０６８６】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例３に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表７－１】

Cpd	データ
10	MS m/z 395.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.45 (s, 1H), 8.85 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 5.71-5.82 (m, 1H), 2.38 (dd, J = 13.3, 3.9 Hz, 2H), 1.74-1.86 (m, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.49 (s, 6H); 1H は観察されなかった (OH または NH).
12	MS m/z 414.0 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.89 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.81 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 5.99-6.08 (m, 1H), 4.99 (s, 1H), 4.87 (s, 1H), 2.14-2.21 (m, 1H), 2.05 (t, J = 12.6 Hz, 1H), 1.52 (d, J = 4.3 Hz, 6H), 1.40 (s, 6H); 1H は観察されなかった (OH または NH).
28	MS m/z 394.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.82 (s, 1H), 8.73 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.29 - 7.24 (m, 1H), 5.71 - 5.61 (m, 1H), 2.34 - 2.23 (m, 2H), 2.05 - 1.97 (m, 2H), 1.55 (m, 3H), 1.51 (s, 3H), 1.29 - 1.22 (m, 1H), 1.00 - 0.92 (m, 1H), 0.83 - 0.71 (m, 2H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
42	MS m/z 455.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.73 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.90 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 5.81-5.94 (m, 1H), 4.65-4.82 (m, 1H), 3.25-3.30 (m, 3H), 1.97-2.05 (m, 1H), 1.86-1.95 (m, 1H), 1.39 (br d, J = 8.9 Hz, 6H), 1.27 (br d, J = 2.7 Hz, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
66	MS m/z 464.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 9.15 (s, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.88 (s, 1H), 8.79-8.83 (m, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.43 (br d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.96-6.08 (m, 1H), 5.00-5.15 (m, 1H), 2.33 (br d, J = 4.3 Hz, 1H), 2.24-2.31 (m, 1H), 1.71 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.61 (br s, 3H), 1.58 (s, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
67	MS m/z 491.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4 : $CDCl_3$) δ: 8.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.42 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.95-6.07 (m, 1H), 4.97-5.13 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 2.30 (br s, 2H), 1.71 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.61 (s, 3H), 1.58 (s, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
68	MS m/z 503.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.87 (s, 1H), 8.81 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.42 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.96-6.08 (m, 1H), 4.98-5.13 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.31 (br s, 2H), 1.72 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 1.61 (s, 3H), 1.59 (s, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
72	MS m/z 465.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.37 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.96-8.98 (m, 1H), 8.85 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.30-8.32 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.45-7.48 (m, 1H), 5.94-6.09 (m, 1H), 5.08 (d, J = 49.0 Hz, 1H), 2.22-2.26 (m, 1H), 2.06-2.10 (m, 1H), 1.23-1.56 (m, 12H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).

【表７－２】

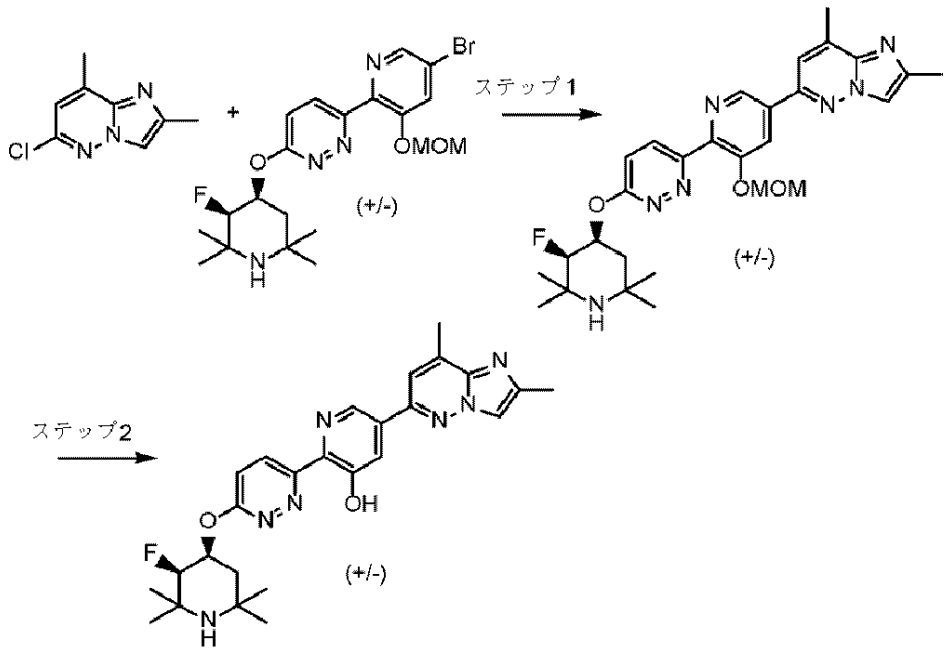
Cpd	データ
74	MS m/z 437.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4): δ: 8.93 (br s, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.77 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.08 (br s, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.42 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.79-5.93 (m, 1H), 4.08 (s, 3H), 2.41 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 1.75-1.87 (m, 2H), 1.61 (br s, 6H), 1.52 ppm (br s, 6H); 2Hs は観察されなかった.
79	MS m/z 410.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.78 (s, 1H), 8.70 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.33 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 5.71 (br, s, 1H), 2.30-2.24 (m, 1H), 2.04-1.98 (m, 1H), 1.86-1.80 (m, 1H), 1.66-1.57 (m, 1H), 1.37 (s, 3H), 1.25 (s, 3H), 0.88-0.77 (m, 2H), 0.71-0.61 (m, 1H), 0.58-0.48 (m, 1); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).

【０６８７】

（例４）

化合物４７の調製

【化１７】



【０６８８】

ステップ１：クロロ－２，８－ジメチル－イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン、ＰｄｄｐｐｆCl_2（１８．８ｍｇ、０．０２３ｍｍｏｌ）、ビス（ピナコラート）ジボロン（７３．４ｍｇ、０．２８９ｍｍｏｌ）、酢酸カリウム（使用直前に真空下２５０℃にて乾燥、７６．１ｍｇ、０．７７５ｍｍｏｌ）、および１，４－ジオキサン（１．５ｍＬ）を合わせ、アルゴンで脱気し、２ｈ３０ｍｉｎ、１００℃まで加熱した。ｒａｃ－３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－［［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペリジル］オキシ］ピリダジン（４７．１ｍｇ、０．１００ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（８．１ｍｇ、０．０９９ｍｍｏｌ）、および炭酸カリウム水溶液（１．０Ｍ、０．７５ｍＬ）を加え、反応物を１ｈ、８０℃まで加熱した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、ｒａｃ－６－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン（５６．８ｍｇ、９９％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５３

６．３　［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０６８９】

ステップ２：ｒａｃ－６－（６－（６－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン（５６．８ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）およびトリフルオロ酢酸（４ｍＬ）を合わせ、２３℃にて４５ｍｉｎ撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を、０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ　３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤）で溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、ｒａｃ－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール（２４．３ｍｇ、４８％収率）を得た。ＭＳ　ｍ／ｚ　４９２．４　［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（１：１　メタノール－ｄ$_{4}$：　ＣＤＣｌ$_{3}$）　δ：　８．７８（ｓ，１Ｈ），８．７０（ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），７．９２（ｓ，１Ｈ），７．８３（ｓ，１Ｈ），７．４３（ｓ，１Ｈ），７．３４（ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），５．８５－６．００（ｍ，１Ｈ），４．８３（ｓ，１Ｈ），２．６８（ｓ，３Ｈ），２．５０（ｓ，３Ｈ），２．０１－２．１１（ｍ，１Ｈ），１．９０－２．００（ｍ，１Ｈ），１．４４（ｂｒ　ｄ，Ｊ＝９．２Ｈｚ，６Ｈ），１．３２（ｂｒ　ｓ，６Ｈ）；２Ｈは観察されなかった（１　ＯＨ，１　ＮＨ）．

【０６９０】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例４に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表８】

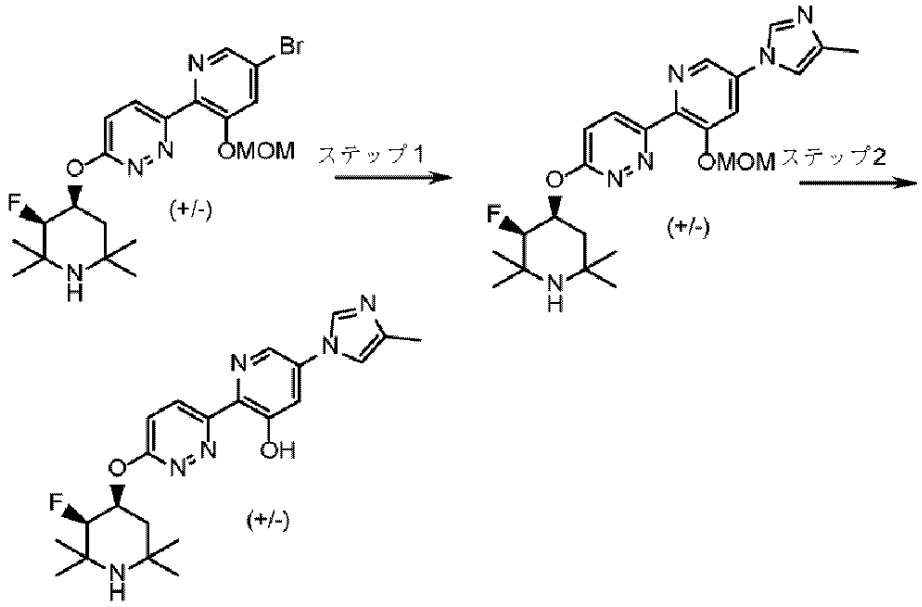
Cpd	データ
48	MS m/z 478.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:3 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.99 (s, 1H), 8.89 (br d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.49-8.54 (m, 1H), 8.42-8.48 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.99-6.11 (m, 1H), 5.04-5.17 (m, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.34-2.40 (m, 1H), 2.29 (br d, J = 12.8 Hz, 1H), 1.72 (s, 3H), 1.71 (s, 3H), 1.62 (s, 3H), 1.59 (s, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1NH).
49	MS m/z 464.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:3 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.83 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.08 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.64 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.86-5.99 (m, 1H), 4.69-4.88 (m, 1H), 2.02-2.10 (m, 1H), 1.99 (br d, J = 11.6 Hz, 1H), 1.41-1.55 (m, 6H), 1.35 (br s, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
50	MS m/z 474.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.01 - 8.89 (m, 2H), 8.34 - 8.28 (m, 2H), 8.22 (s, 1H), 7.50(s, 1H), 5.87 - 5.77 (m, 1H), 2.86 (s, 3H), 2.70 (s, 3H) 2.49 - 2.40 (m, 2H), 2.00 - 1.85 (m, 2H), 1.67 (m, 6 H), 1.61 (s, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
57	MS m/z 508.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.91 (br s, 1H), 8.83 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.05-8.10 (m, 2H), 7.46-7.51 (m, 1H), 7.41-7.46 (m, 1H), 5.95-6.07 (m, 1H), 4.96-5.12 (m, 1H), 4.31 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 2.31 (br s, 2H), 1.72 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 1.62 (br s, 3H), 1.59 (s, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
58	MS m/z 495.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.78 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (br d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.40 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.22 (br dd, J = 7.8, 3.5 Hz, 1H), 7.09 (br dd, J = 10.8, 7.8 Hz, 1H), 5.93-6.06 (m, 1H), 4.92-5.07 (m, 1H), 4.29 (s, 3H), 2.14-2.32 (m, 2H), 1.60-1.77 (m, 6H), 1.52 (br s, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
59	MS m/z 502.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 9.19-9.30 (m, 1H), 8.82 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.37-8.52 (m, 1H), 7.95-8.04 (m, 1H), 7.75 (br d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.97-6.09 (m, 1H), 5.01-5.15 (m, 1H), 2.58 (br d, J = 4.3 Hz, 3H), 2.33-2.39 (m, 1H), 2.23-2.32 (m, 1H), 1.71 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 1.61 (d, J = 1.8 Hz, 3H), 1.58 (s, 3H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
60	MS m/z 506.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (1:1 メタノール-d_4: $CDCl_3$) δ: 8.85 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.80 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.41 (br d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.94-6.05 (m, 1H), 4.90-5.10 (m, 1H), 3.08-3.16 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.14-2.30 (m, 2H), 1.64 (br d, J = 3.7 Hz, 6H), 1.52 (br s, 6H), 1.44-1.49 (m, 3H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).no
65	MS m/z 446.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.12-9.06 (m, 2H), 8.71-8.59 (m, 3H), 8.38-8.35 (m, 2H), 7.75 (br d, J = 9.3 Hz, 1H), 5.93 - 5.85 (m, 1H), 2.56 - 2.53 (m, 2H), 1.99-1.94 (m, 2H), 1.67 (br s, 6H), 1.61 (s, 6H) ; 2H (OH および NH)は観察されなかった.
81	MS m/z 490.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4): δ: 8.82 (s, 1H), 8.66 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.62 (s, 2H), 7.23 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 5.68-5.86 (m, 1H), 4.20 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 2.23 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 1.46-1.55 (m, 2H), 1.43 (br s, 6H), 1.31 ppm (br s, 6H). 1 H は観察されなかった.

【０６９１】

（例５）

化合物４１の調製

【化１８】



【０６９２】

ステップ１：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－［［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペジル］オキシ］ピリダジン（４６．６ｍｇ、０．０９９３ｍｍｏｌ）、４－メチル－１Ｈ－イミダゾール（２０．５ｍｇ、０．２５０ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（３５．４ｍｇ、０．２５６ｍｍｏｌ）、ヨウ化第一銅（２．８ｍｇ、０．０１５ｍｍｏｌ）、ｔｒａｎｓ－Ｎ，Ｎ′－ジメチルシクロヘキサン－１，２－ジアミン（４．０μＬ、０．０２５ｍｍｏｌ）、およびＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．３ｍＬ）を合わせ、アルゴンで脱気し、１８ｈ、１１０℃まで加熱した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、ｒａｃ－３－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－２－イル）ピリダジン（５４．７ｍｇ、１０９％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４９３．３ ［Ｍ＋Ｎａ］$^{+}$.

【０６９３】

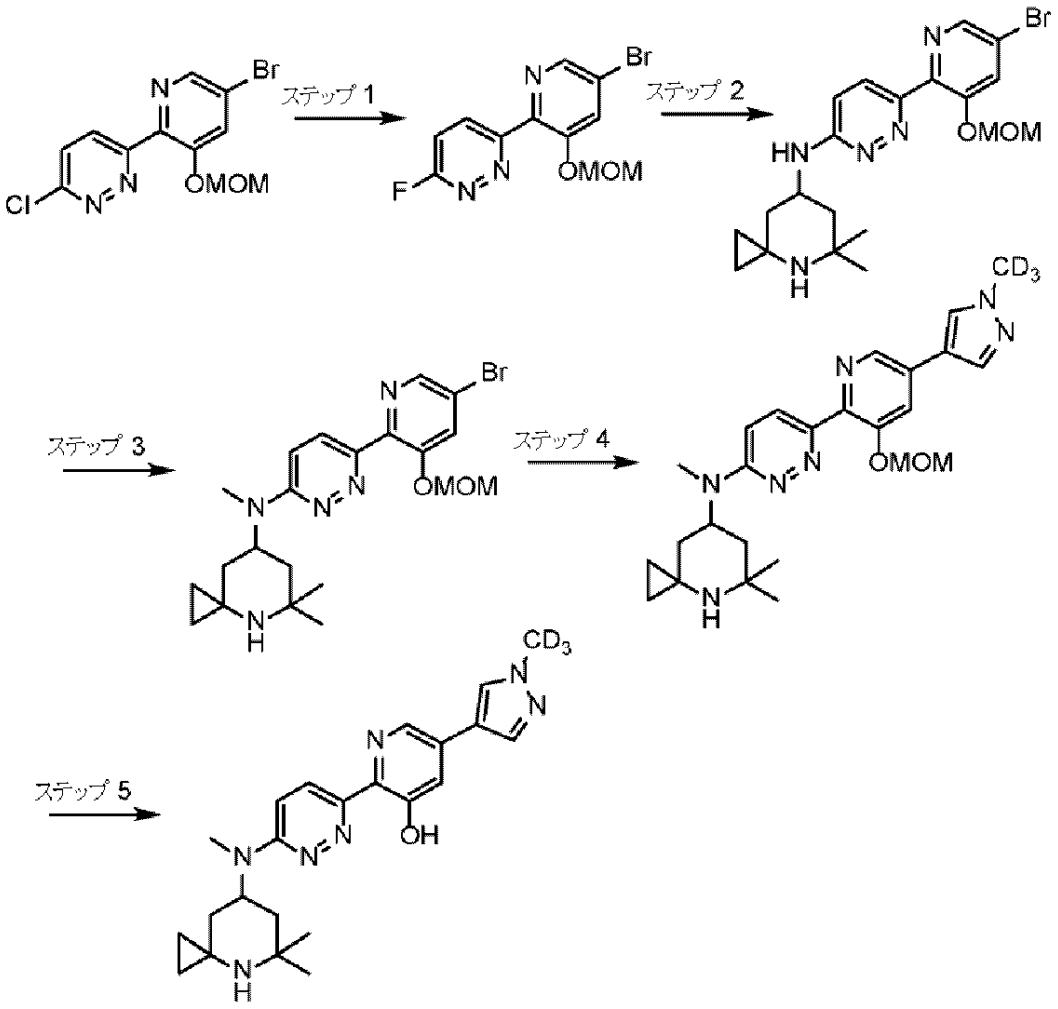
ステップ２：ｒａｃ－３－（（（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－２－イル）ピリダジン（５４．７ｍｇ、０．１０８ｍｍｏｌ）およびトリフルオロ酢酸（４ｍＬ）を合わせ、室温にて１５分間撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤）で溶出するシリカゲルクロマトグラフで処理して、ｒａｃ－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール（１５．６ｍｇ、３４％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２７．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （１：１ メタノール－d_4：ＣＤＣｌ$_3$） δ：８．５９ （ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），８．３２ （ｄ，Ｊ＝２．１Ｈｚ，１Ｈ），７．９４ （ｓ，１Ｈ），７．４１ （ｄ，Ｊ＝２．４Ｈｚ，１Ｈ），７．２７ （ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），７．１７ （ｓ，１Ｈ），５．７７－５．９１ （ｍ，１Ｈ），４．６３－４．７６ （ｍ，１Ｈ），２．２０ （ｓ，３Ｈ），１．９２－２．００ （ｍ，１Ｈ），１．８１－１．９１ （ｍ，１Ｈ），１．３０－１．４０ （ｍ，６Ｈ），１．１９－１．２６ （ｍ，６Ｈ）；２Ｈは観察されなかった （１ ＯＨ，２ ＮＨ）．

【０６９４】
本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例５に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。
【表９】

Cpd	データ
5	MS m/z 394.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.72 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.92 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 5.64-5.74 (m, 1H), 2.11 (dd, J = 11.8, 3.4 Hz, 2H), 1.27-1.34 (m, 2H), 1.25 (s, 6H), 1.12 (s, 6H); 1H は観察されなかった (NH または OH).
9	MS m/z 413.0 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.58 (s, 1H), 8.72 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.92 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 5.80-5.94 (m, 1H), 4.74 (d, J = 52.7 Hz, 1H), 1.93 (dd, J = 12.0, 4.5 Hz, 1H), 1.72 (t, J = 12.3 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 2.4 Hz, 6H), 1.09-1.20 (m, 6H).
61	MS m/z 396.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4): δ: 9.20 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.97 (d, J = 12.4 Hz, 1H), 7.50-7.53 (m, 1H), 7.44 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 5.72-5.84 (m, 1H), 2.22-2.30 (m, 2H), 1.42-1.50 (m, 2H), 1.40 (s, 6H), 1.28 ppm (s, 6H); 1 H は観察されなかった.
63	MS m/z 396.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.03 (s, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.67 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 2H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.76 - 5.68 (m, 1H), 2.26 - 2.14 (m, 2H), 1.53 - 1.41 (m, 2H), 1.34 (s, 6H), 1.24 (s, 6H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
71	MS m/z 394.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ 9.04 (s, 1H), 8.92 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 1.7 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 5.66 - 5.57 (m, 1H), 2.46-2.38 (m, 2H), 2.16 - 2.09 (m, 2H), 1.89 - 1.79 (m, 4H), 1.44 (s, 6H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).

【０６９５】
（例６）
化合物５３の調製

【化１９】



【０６９６】

ステップ１：オーブンで乾燥させた２０ｍＬシンチレーションバイアルに、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（１．８ｇ、５．４ｍｍｏｌ）を添加し、続いてフッ化銀（１．５ｇ、１２ｍｍｏｌ）を加えた。アセトニトリル（１０ｍＬ）を添加し、バイアルをアルゴン下で密閉し、１ｈ、１００℃まで加熱した。粗反応混合物を室温まで冷却し、次いでＣｅｌｉｔｅに通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮した後、粗残留物を、勾配０～２０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－フルオロ－ピリダジン（４００ｍｇ、２３％収率）をベージュ色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３１４．０，３１６．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（ＣＤＣｌ$_{3}$）δ：８．４９（ｄ，Ｊ＝１．５ Ｈｚ，１Ｈ），８．１２（ｄｄ，Ｊ＝８．８，７．３ Ｈｚ，１Ｈ），７．８６（ｄ，Ｊ＝１．５ Ｈｚ，１Ｈ），７．３２（ｄｄ，Ｊ＝９．２，１．８ Ｈｚ，１Ｈ），５．２７（ｓ，２Ｈ），３．５０（ｓ，３Ｈ）．

【０６９７】

ステップ２：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－フルオロ－ピリダジン（２１５ｍｇ、０．７ｍｍｏｌ）、５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン二塩酸塩（２３０ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）、ＤＭＳＯ（１．５ｍＬ）、およびトリエチルアミン（０．６ｍＬ、４ｍｍｏｌ）の混合物を、アルゴン下６０℃にて１２ｈ加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、水（２０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（３ｘ２５ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相を飽和ブラインで洗浄し、ＭｇＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濃縮した。粗残留物を、勾配０～１０％ＭｅＯＨ／ＤＣＭで溶

出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、Ｎ－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（１８６ｍｇ、６１％収率）を、薄褐色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４４８．４，４５０．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－ｄ$_{4}$） δ： ８．３９ （ｓ，１Ｈ），７．９２ （ｓ，１Ｈ），７．６８ （ｂｒｄ，Ｊ＝９．２ Ｈｚ，１Ｈ），６．９２ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝９．２ Ｈｚ，１Ｈ），５．２９ （ｓ，２Ｈ），４．５５ （ｂｒ ｔ，Ｊ＝１１．３ Ｈｚ，１Ｈ），３．４４ （ｓ，３Ｈ），２．１６ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝１２．５ Ｈｚ，１Ｈ），１．８９ （ｂｒ ｔ，Ｊ＝１２．１ Ｈｚ，１Ｈ），１．６７ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝１２．５ Ｈｚ，１Ｈ），１．４０－１．４７ （ｍ，３Ｈ），１．３７ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝６．１ Ｈｚ，２Ｈ），１．２８ （ｓ，３Ｈ），０．８６－０．９５ （ｍ，２Ｈ），０．６７－０．７３ （ｍ，１Ｈ），０．５３－０．５９ （ｍ，１Ｈ）．

【０６９８】

ステップ３：ＤＭＦ（２ｍＬ）中のＮ－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（１８６ｍｇ、０．４ｍｍｏｌ）の溶液に、炭酸セシウム（１８０ｍｇ、０．５６ｍｍｏｌ）を添加した。室温にて１０ｍｉｎ撹拌した後、ヨウ化メチル（４０μＬ、０．５６ｍｍｏｌ）を加え、反応混合物を室温にて２ｈ撹拌した。次いで、混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃ（２×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機相をブラインで洗浄し、ＭｇＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗残留物を勾配０～５％ＭｅＯＨ／ＤＣＭで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、Ｎ－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ，５，５－トリメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（１６４ｍｇ、８６％収率）を、ベージュ色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４６２．４，４６４．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－ｄ$_{4}$） δ： ８．３８ （ｓ，１Ｈ），７．９２ （ｓ，１Ｈ），７．６７ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝９．５ Ｈｚ，１Ｈ），６．８９ （ｂｒ ｄ，Ｊ＝９．５ Ｈｚ，１Ｈ），５．２９ （ｓ，２Ｈ），４．５２ （ｂｒ ｔ，Ｊ＝１１．３ Ｈｚ，１Ｈ），３．４４ （ｓ，３Ｈ），２．５０ （ｂｒ ｓ，３Ｈ），２．００－２．０６ （ｍ，１Ｈ），１．７０－１．８０ （ｍ，２Ｈ），１．４４ （ｓ，３Ｈ），１．１４－１．３０ （ｍ，５Ｈ），０．８８－０．９７ （ｍ，２Ｈ），０．６０ （ｓ，１Ｈ），０．３７－０．４２ （ｍ，１Ｈ）．

【０６９９】

ステップ４：４－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１－（トリジュウテリオメチル）ピラゾール（５５ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）およびＰｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_{2}$*ＣＨ$_{2}$Ｃｌ$_{2}$（１０ｍｇ、０．０１ｍｍｏｌ）の混合物、Ｎ－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ，５，５－トリメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（８０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）、１，４－ジオキサン（２ｍＬ）ならびに２Ｍ炭酸カリウム（０．３ｍＬ、０．６ｍｍｏｌ）をアルゴンで脱気し、８０℃にて３ｈ撹拌した。粗反応混合物を室温まで冷却し、勾配０～１０％ＭｅＯＨ／ＤＣＭで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、Ｎ－［６－［３－（メトキシメトキシ）－５－［１－（トリジュウテリオメチル）ピラゾール－４－イル］－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ，５，５－トリメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（５２ｍｇ、６４％収率）を、黄色フォームとして得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４６７．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－ｄ$_{4}$） δ： ８．４９－８．５３ （ｍ，１Ｈ），８．１６ （ｓ，１Ｈ），７．９６ （ｓ，１Ｈ），７．８５ （ｄ，Ｊ＝１．８ Ｈｚ，１Ｈ），７．６８ （ｄ，Ｊ＝９．２ Ｈｚ，１Ｈ），６．９２ （ｄ，Ｊ＝９．５ Ｈｚ，１Ｈ），５．３３ （ｓ，２Ｈ），４．５１－４．６０ （ｍ，１Ｈ），３．４４ （ｓ，３Ｈ），２．６０ （ｂｒ ｓ，３Ｈ），２．０８ （ｂｒ ｔ，Ｊ＝１２．５ Ｈｚ，１Ｈ），１．７３－１．８９ （ｍ，２Ｈ），１．５０ （ｓ，３Ｈ），１．３２－１．４３ （

ｍ，１Ｈ），１．２５（ｓ，３Ｈ），０．８８－１．１０（ｍ，２Ｈ），０．６８（ｂｒ ｓ，１Ｈ），０．４２－０．５２（ｍ，１Ｈ）．

【０７００】

ステップ５：ＨＣｌ（ジオキサン中４Ｍ）（１ｍＬ、４ｍｍｏｌ、４ｍｏｌ／Ｌ）中のＮ－［６－［３－（メトキシメトキシ）－５－［１－（トリジュウテリオメチル）ピラゾール－４－イル］－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ，５，５－トリメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－アミン（５２ｍｇ、０．１１１４ｍｍｏｌ）の混合物を、室温にて１６ｈ撹拌した。粗反応混合物を濃縮し、次いでジエチルエーテルで粉砕した。形成された固体を濾過し、ジエチルエーテルですすぎ、高真空下で乾燥させて、２－［６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）－メチル－アミノ］ピリダジン－３－イル］－５－［１－（トリジュウテリオメチル）ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩（３４ｍｇ、６２％収率）を、黄色粉末として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２３．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（メタノール－d_4）δ：８．７３－８．８１（ｍ，１Ｈ），８．６３－８．７２（ｍ，１Ｈ），８．３０－８．４２（ｍ，１Ｈ），８．０７－８．１６（ｍ，１Ｈ），７．９０－８．００（ｍ，１Ｈ），７．６３－７．８１（ｍ，１Ｈ），４．６０－４．７５（ｍ，１Ｈ），３．０８（ｓ，３Ｈ），２．４０－２．５１（ｍ，１Ｈ），２．１１－２．３０（ｍ，２Ｈ），１．８０（ｓ，３Ｈ），１．６９－１．７６（ｍ，１Ｈ），１．５３－１．６０（ｍ，２Ｈ），１．４９（ｓ，３Ｈ），１．０４－１．１１（ｍ，１Ｈ），０．８２－０．９８（ｍ，１Ｈ）．

【０７０１】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例６に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１０】

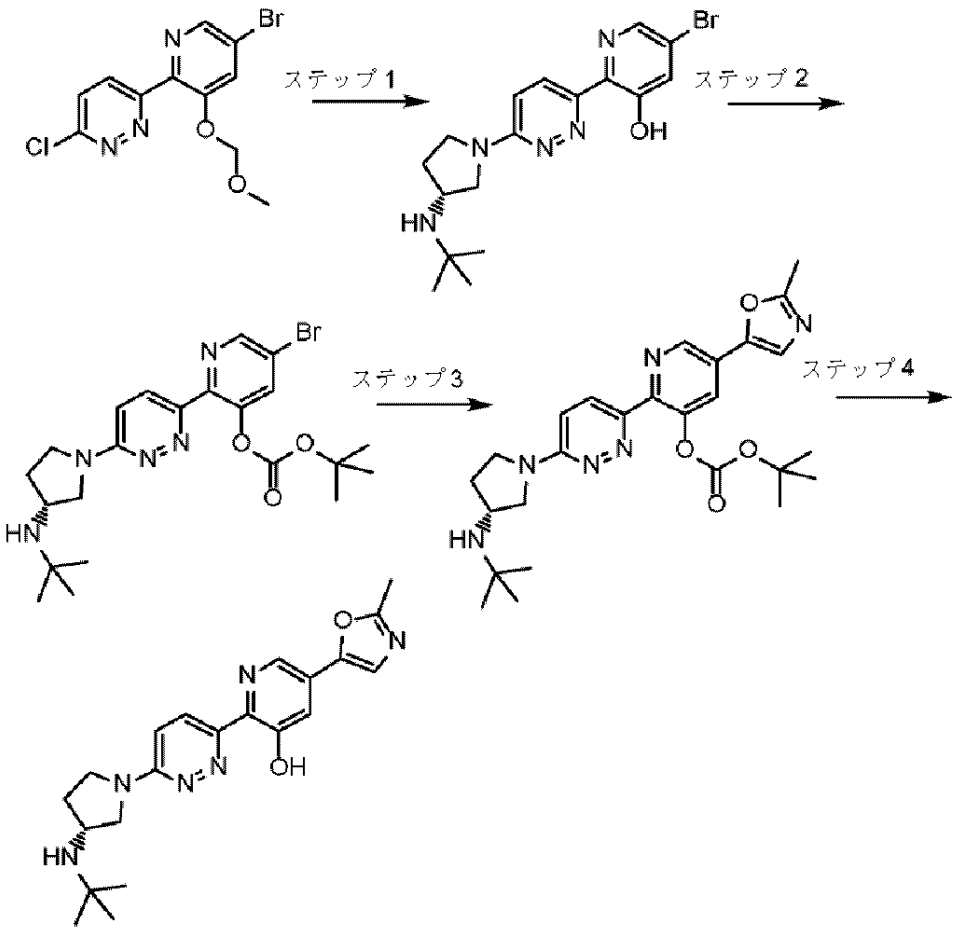
Cpd	データ
64	MS m/z 488.4 [M+H]$^{+}$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.81-8.90 (m, 1H), 8.72-8.78 (m, 1H), 8.45-8.55 (m, 1H), 8.02-8.09 (m, 1H), 7.93-8.02 (m, 1H), 7.68-7.81 (m, 1H), 7.42-7.53 (m, 1H), 4.60-4.79 (m, 1H), 4.30 (s, 3H), 3.10 (s, 3H), 2.40-2.51 (m, 1H), 2.08-2.33 (m, 2H), 1.82 (s, 3H), 1.71-1.79 (m, 1H), 1.55-1.65 (m, 2H), 1.52 (s, 3H), 1.09-1.17 (m, 1H), 0.90-0.98 (m, 1H); 2Hsは観察されなかった(NHおよびOH).

【０７０２】

（例７）

化合物７６の調製

【化２０】



【０７０３】

ステップ１：ＤＩＰＥＡ（０．２６ｍＬ、３．０ｅｑ．）中の３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（１６５ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）および（３Ｒ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチルピロリジン－３－アミン（７８．２ｍｇ、０．５５ｍｍｏｌ）の混合物ならびにＤＭＳＯ（１．０ｍＬ）を、９０℃にて１６ｈｒ撹拌した。冷却後、反応物を飽和$NaHCO_3$で希釈し、CH_2Cl_2で抽出した。合わせた有機層を水、続いてブラインで洗浄し、次いで、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗物質を０～１０％CH_2Cl_2中ＭｅＯＨで溶出するフラッシュカラムクロマトグラフィーによりシリカゲル上で精製して、５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール（１３６ｍｇ、６９％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９２．２，３９４．２，［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７０４】

ステップ２：CH_2Cl_2（１．２ｍＬ）中の５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール（１３６ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、４－ＤＭＡＰ（４．３ｍｇ、０．０３５ｍｍｏｌ）および二炭酸ジ－ｔｅｒｔ－ブチル（８５．８ｍｇ、０．３８ｍｍｏｌ）の混合物を、室温にて２ｈ撹拌し、次いで、CH_2Cl_2および飽和$NaHCO_3$で希釈した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗物質を勾配０～１０％CH_2Cl_2中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、［５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（９３ｍｇ、５４％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４９２．３／４９４．３，［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７０５】

ステップ３：ジオキサン（１．０ｍＬ）中の［５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（９３ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）、２－メチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）オキサゾール（５９ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）および２．０Ｍ ａｑ．K_2CO_3（０．２８ｍＬ、０．５７ｍｍｏｌ）中Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（１５．６ｍｇ、０．１ｅｑ．）の混合物を、アルゴン雰囲気下９０℃にて３ｈ撹拌し、次いで冷却し、酢酸エチルで希釈した。混合物を水およびブラインで洗浄し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮した。粗物質を勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、［２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルオキサゾール－５－イル）－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（６９ｍｇ、７４％収率）を、薄褐色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４９５．４，［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７０６】

ステップ４：ＭｅＯＨ（０．２５ｍＬ）中に懸濁させた［２－［６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルオキサゾール－５－イル）－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（６９ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＣｌ（ジオキサン中４．０Ｍ、１．０ｍＬ）を加えた。反応物を室温にて３ｈ撹拌し、次いでジエチルエーテルで希釈した。固体を濾過し、エーテルで洗浄し、固体を高真空下で乾燥させて、２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール（５５ｍｇ、８５％収率）を、二塩酸塩として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９５．４，［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（メタノール－d_4）δ：８．９６（ｄ，Ｊ＝１０．１Ｈｚ，１Ｈ），８．７３（ｓ，１Ｈ），７．９０（ｄ，Ｊ＝９．８Ｈｚ，１Ｈ），７．８１（ｄ，Ｊ＝１０．４Ｈｚ，２Ｈ），４．３３－４．４３（ｍ，１Ｈ），４．２６（ｄｄ，Ｊ＝１１．６，７．０Ｈｚ，１Ｈ），３．８８－４．０５（ｍ，２Ｈ），３．８２（ｄ，Ｊ＝１０．４Ｈｚ，１Ｈ），２．６９－２．７８（ｍ，１Ｈ），２．６５（ｓ，３Ｈ），２．４４（ｄｄ，Ｊ＝１２．５，７．６Ｈｚ，１Ｈ），１．５３（ｓ，９Ｈ）；２Ｈｓは観察されなかった（ＯＨおよびＮＨ）．

【０７０７】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例７に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１１】

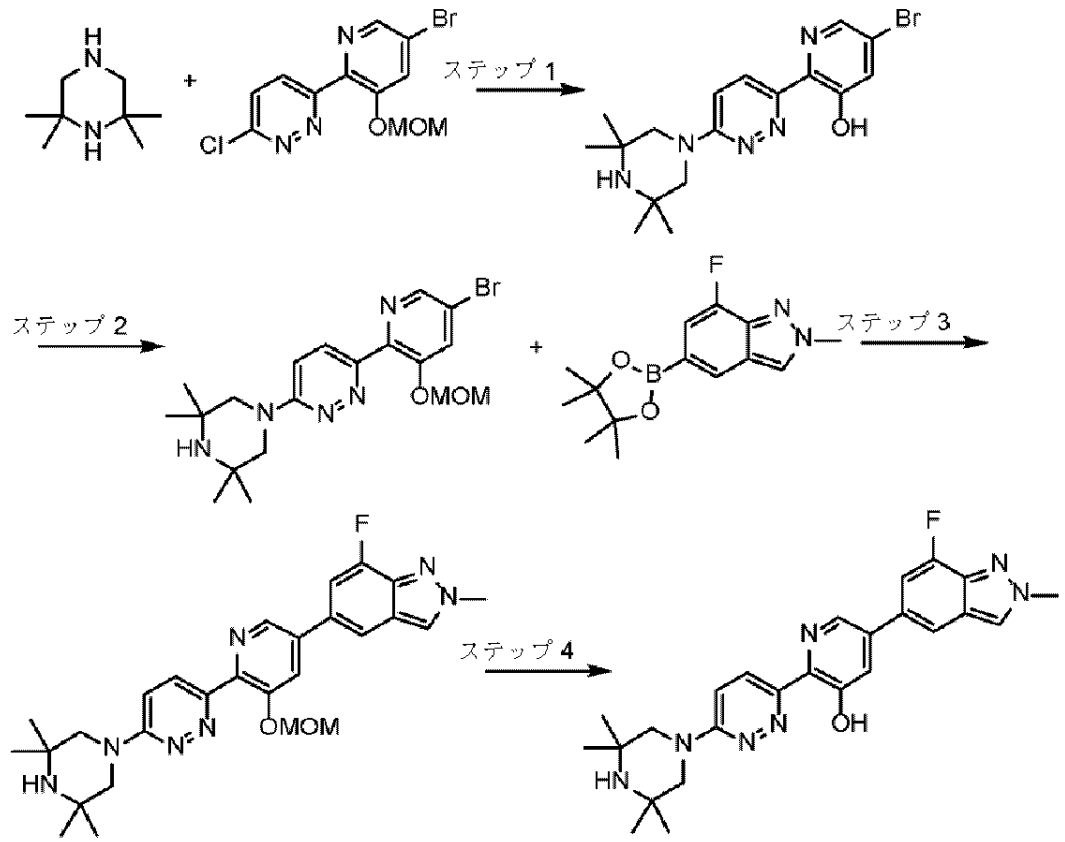
Cpd	データ
17	MS m/z 394.0 $[M+H]^-$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.60 (s, 1H), 8.47 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.20 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 6.76 (s, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.85-3.95 (m, 1H), 3.66-3.82 (m, 2H), 3.48-3.58 (m, 1H), 3.22-3.32 (m, 1H), 2.32-2.44 (m, 1H), 1.87-2.01 (m, 1H), 1.24 (s, 9H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
18	MS m/z 380.2 $[M+H]^-$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.53 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.13 (s, 2H), 7.57 (s, 1H), 7.29 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.18-4.28 (m, 1H), 4.08-4.16 (m, 1H) 3.80-3.90 (m, 1H), 3.60-3.72 (m, 2H), 2.58-2.70 (m, 1H), 2.20-2.34 (m, 1H), 1.48 (s, 9H); 3Hs は観察されなかった (OH および NHs).
23	MS m/z 397.5 $[M+H]^-$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.45 (d, J=9.46 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.20 (d, J=9.46 Hz, 1H), 3.80 - 3.95 (m, 1H), 3.73-3.79 (m, 2H), 3.42 - 3.60 (m, 1H), 2.41 (m, 1H), 1.95 - 2.03 (m, 1 H), 1.34 (m, 1H), 1.27 (s, 9H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
29	MS m/z 397.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.51 (d, J=9.8 Hz, 1H) 8.10 (s, 1H) 7.93 (s, 1H) 7.82 (d, J=9.5 Hz, 1H) 7.70 (d, J=8.2 Hz, 1H) 7.29 (br d, J=7.9 Hz, 1H) 4.31 - 4.36 (m, 1H) 4.20 (m, J=11.0, 7.0 Hz, 1H) 3.92 - 3.98 (m, 1H) 3.82 - 3.87 (m, 1H) 3.72 - 3.79 (m, 1H) 2.67 - 2.73 (m, 1H) 2.37 - 2.44 (m, 1H) 1.51 (s, 9H); 2 Hs は観察されなかった (NH および OH).
88	MS m/z 380.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.58 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.14 (s, 2H), 7.75 - 7.63 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 3.94 (s, 4H), 1.55 (s, 12H); 3 Hs は観察されなかった (2NHs および OH).
107	MS m/z 414.5 $[M+H]^-$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.65 (s, 1H), 9.51 (s, 1H), 9.45 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.52 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.03 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.37 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 4.56 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 3.66-3.92 (m, 6H), 2.89-2.95 (m, 1H), 2.68-2.75 (m, 1H), 2.30-2.39 (m, 1H), 2.55 (s, 3H).

【０７０８】

（例８）

化合物８９の調製

【化２１】



【０７０９】

ステップ１：２，２，６，６－テトラメチルピペラジン（０．１３ｇ、０．９１ｍｍｏｌ）、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（０．１５ｇ、０．４５ｍｍｏｌ）およびＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３．０ｍＬ、３８．８ｍｍｏｌ）を窒素下でスクリューキャップバイアルに加えた。次いで、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（０．２０４ｍＬ、１．３６ｍｍｏｌ）をバイアルに加えた。反応混合物を１００℃にて終夜撹拌した。溶媒を除去し、残留物を勾配０～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、５－ブロモ－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール（０．１２ｇ、６７％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９２．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７１０】

ステップ２：５－ブロモ－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール（０．１ｇ、０．３ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（５．０ｍＬ）中に溶解させ、クロロメチルメチルエーテル（０．０３ｍＬ、０．４ｍｍｏｌ）を加え、続いてトリエチルアミン（０．１ｍＬ、０．７ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を室温にて２ｈ撹拌した。溶媒を除去し、粗物質を次のステップで直接使用した。ＭＳ ｍ／ｚ ４３６．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７１１】

ステップ３：７－フルオロ－２－メチル－５－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）インダゾール（０．０７４ｇ、０．２７ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（０．０７４ｇ、０．５４ｍｍｏｌ）、ＸＰｈｏｓ Ｐｄ Ｇ３（０．０３１ｇ、０．０３５ｍｍｏｌ）、および水（２．０ｍＬ、１１１．０２０ｍｍｏｌ）を、窒素下でスクリューキャップバイアルに加えた。次いで、１，４－ジオキサン（２．０ｍＬ、２３．４３ｍｍｏｌ）中の３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン（０．

０７８ｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を反応混合物に加えた。反応混合物を９０℃にて２ｈ撹拌した。溶媒を除去し、残留物を勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、７－フルオロ－５－［５－（メトキシメトキシ）－６－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］－２－メチル－インダゾール（０．０６ｇ、６６％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５０６．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７１２】

ステップ４：７－フルオロ－５－［５－（メトキシメトキシ）－６－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］－２－メチル－インダゾール（０．０６ｇ、０．１２ｍｍｏｌ）をメタノール（２．０ｍＬ、４９．４ｍｍｏｌ）中に溶解させ、ジオキサン中のＨＣｌ（２．０ｍＬ、８．０ｍｍｏｌ、４ｍｏｌ／Ｌ）を加えた。反応混合物を室温にて２ｈ撹拌した。溶媒を除去し、残留物を勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、５－（７－フルオロ－２－メチル－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール（０．０３ｇ、５０％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４６２．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$） δ ８．６３ （ｄ，Ｊ ＝ ２．０ Ｈｚ，１Ｈ），８．５９ （ｄ，Ｊ ＝ ２．８ Ｈｚ，１Ｈ），８．５０ （ｄ，Ｊ ＝ ９．７ Ｈｚ，１Ｈ），８．０４ （ｓ，１Ｈ），７．８１ （ｄ，Ｊ ＝ ９．８ Ｈｚ，１Ｈ），７．７６ （ｄ，Ｊ ＝ ２．０ Ｈｚ，１Ｈ），７．５５ （ｄ，Ｊ ＝ １３．１ Ｈｚ，１Ｈ），４．２４ （ｓ，３Ｈ），３．９４ （ｓ，４Ｈ），１．４９ （ｓ，１２Ｈ）．

【０７１３】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例８に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１２－１】

Cpd	データ
69	MS m/z 434.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.95 (br d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.50 (br s, 1H), 8.07 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.46 - 7.43 (m, 1H), 4.80 (d, J = 13.6 Hz, 2H), 4.31 (s, 3H), 3.64 - 3.55 (m, 2H), 3.23 - 3.18 (m, 2H), 1.50 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
78	MS m/z 441.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 - 8.94 (m, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.14 - 8.12 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 4.81 - 4.78 (m, 2H), 4.35 (s, 3H), 3.67 - 3.59 (m, 2H), 3.28-3.25 (m, 2H), 1.51 (br d, J = 5.5 Hz, 6H) ; 2H (OH および NH)は観察されなかった.
86	MS m/z 352.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.82 (br d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.29 (s, 2H), 7.97 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 4.67 (d, J = 14.0 Hz, 2H), 3.47 (br s, 2H), 3.11 (br t, J = 13.0 Hz, 2H), 1.38 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 3Hs は観察されなかった (2NHs および OH).
87	MS m/z 446.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.94 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.79 (s, 2H), 8.14 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 4.80 (d, J = 13.6 Hz, 2H), 4.40 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 3.63 (br s, 2H), 3.31-3.26 (m, 2H), 1.52 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
90	MS m/z 366.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.76 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.67 (s, 2H), 8.20 - 8.18 (m, 1H), 7.98 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 14.6 Hz, 2H), 3.67 - 3.59 (m, 2H), 3.59 - 3.49 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 1.61 (d, J = 6.3 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
91	MS m/z 448.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.95 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.50 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.46 - 7.43 (m, 1H), 4.79 (d, J = 14.6 Hz, 2H), 4.31 (s, 3H), 3.58 (br s, 2H), 3.46 - 3.41 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 1.60 (d, J = 6.3 Hz, 6H); 1H (OH)は観察されなかった.
92	MS m/z 416.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.26 (s, 1H), 8.94 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.24 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.94 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 4.68 (d, J = 14.0 Hz, 2H), 3.58 - 3.47 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 4Hs は観察されなかった (NH, OH および 2 CHs はメタノールシグナルとオーバーラップしている).
93	MS m/z 406.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 8.64 (s, 1H), 8.58 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.52 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.73 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.57 - 7.53 (m, 1H), 4.24 (s, 3H), 4.00 - 3.96 (m, 4H), 3.27 - 3.24 (m, 4H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.

【表１２－２】

Cpd	データ
94	MS m/z 403.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.60 (s, 1H), 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.90 (s, 1H), 4.68 (d, J = 14.2 Hz, 2H), 3.50 (br s, 2H), 3.20 - 3.13 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
95	MS m/z 432.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.94 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.04 - 7.99 (m, 2H), 7.82 - 7.77 (m, 1H), 7.13 (s, 1H), 4.69 (br d, J = 14.3 Hz, 2H), 4.33 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 3.67 - 3.55 (m, 3H), 3.44 - 3.35 (m, 2H), 1.50 (d, J = 6.4 Hz, 3H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
96	MS m/z 393.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.57 - 8.49 (m, 2H), 8.25 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 4.49 - 4.45 (m, 2H), 3.99 (s, 3H), 3.11 - 3.00 (m, 2H), 2.73-2.68 (m, 2H), 1.26 (d, J = 6.4 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
97	MS m/z 420.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.49 - 8.46 (m, 2H), 8.38 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.53 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 4.41 (br d, J = 13.1 Hz, 2H), 4.27 (s, 3H), 3.30 - 3.25 (m, 1H), 3.20 - 3.14 (m, 1H), 3.13 - 3.00 (m, 2H), 2.90 - 2.84 (m, 1H), 1.28 (d, J = 6.4 Hz, 3H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
98	MS m/z 432.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.77 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.39 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 4.29 (s, 3H), 4.23 - 4.15 (m, 2H), 4.04 (s, 2H), 3.59 - 3.51 (m, 2H), 1.25 - 1.10 (m, 4H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
99	MS m/z 417.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.61 (s, 1H), 9.03 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 8.24 - 8.17 (m, 2H), 7.99 - 7.97 (m, 1H), 4.79 (br d, J = 13.4 Hz, 2H), 3.65 - 3.56 (m, 2H), 3.31 - 3.23 (m, 2H), 2.81 (s, 3H), 1.51 (d, J = 6.6 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
100	MS m/z 446.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 8.61 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.43 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.65 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 7.56 - 7.53 (m, 1H), 4.24 (s, 3H), 3.69-3.66 (m, 4H), 2.69-2.66 (m, 4H), 1.71 - 1.67 (m, 1H), 0.47 - 0.39 (m, 4H); 1H (OH)は観察されなかった.
101	MS m/z 420.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.06 - 7.99 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.42 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 4.77 (br d, J = 14.8 Hz, 2H), 4.31 (s, 3H), 3.74 (br d, J = 12.5 Hz, 2H), 3.71 - 3.60 (m, 2H), 3.39-3.35 (m, 2H), 3.03 (s, 3H); 1H は観察されなかった (OH).

【表１２－３】

Cpd	データ
103	MS m/z 420.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.64 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.69 - 7.65 (m, 1H), 7.36 (d, J = 12.4 Hz, 1H), 4.66 - 4.61 (m, 2H), 4.29 (s, 3H), 3.57 - 3.46 (m, 3H), 3.31 - 3.16 (m, 2H), 1.47 (d, J = 6.4 Hz, 3H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
104	MS m/z 420.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 8.63 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.52 - 8.50 (m, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.76-7.74 (br s, 2H), 7.55 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 4.56 - 4.52 (m, 2H), 4.24 (s, 3H), 3.45 - 3.40 (m, 3H), 3.22-3.11 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.4 Hz, 3H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
105	MS m/z 418.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.84 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.64 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 4.69 (s, 1H), 4.29 (s, 3H), 3.93 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 2.40 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 2.21 (d, J = 12.5 Hz, 1H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
106	MS m/z 434.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.54 - 8.52 (m, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.53 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 4.28 (s, 3H), 3.97 (d, J = 10.7 Hz, 2H), 3.67 - 3.49 (m, 4H), 1.37 - 1.29 (m, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
115	MS m/z 417.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.43 (s, 1H), 9.18 (s, 1H), 8.65 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.82 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.78 (dd, J = 14.5, 2.5 Hz, 1H), 3.57-3.50 (m, 2H), 3.46 (五重線, J = 1.5 Hz, 1H), 3.18 (五重線, J = 1.5 Hz, 1H), 3.07 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 2.59 (s, 3H), 1.46 (d, J = 6.5 Hz, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
116	MS m/z 401.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.41 (d, J=2.1 Hz, 1H), 9.20 (d, J=2.1 Hz, 1H), 8.54 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.72 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.28 (d, J=9.5 Hz, 1H), 5.10 (br s, 1H), 4.55 (s, 1H), 3.81 (dd, J=11.4, 2.3 Hz, 1H), 3.67 (br d, J=11.3 Hz, 1H), 3.40 (s, 2H), 2.51 (s, 3H), 2.28 (br d, J=11.0 Hz, 1H), 1.97-2.14 (m, 1H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
119	MS m/z 352.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.95 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.50 (s, 2H), 8.10 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.74 - 4.64 (m, 2H), 3.68 - 3.59 (m, 2H), 3.47 - 3.35 (m, 3H), 1.90 - 1.82 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H); 3H (OH および 2 NH)は観察されなかった.

【表１２－４】

Cpd	データ
120	MS m/z 434.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.71 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 8.47 (d, J＝2.4 Hz, 1H), 8.04 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.01 - 7.99 (m, 1H), 7.92 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.44 - 7.38 (m, 1H), 4.75 - 4.65 (m, 2H), 4.31 (s, 3H), 3.68 - 3.57 (m, 2H), 3.44 - 3.35 (m, 3H), 1.86 (五重線, J＝7.2 Hz, 2H), 1.19 (t, J＝7.6 Hz, 3H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
121	MS m/z 366.2 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 8.59 (s, 1H), 8.53 - 8.50 (m, 2H), 8.32 (s, 2H), 7.86 - 7.80 (m, 2H), 4.62 (br d, J＝13.6 Hz, 1H), 4.54 - 4.51 (m, 1H), 3.56 - 3.49 (m, 1H), 3.39 - 3.36 (m, 1H), 3.30 - 3.22 (m, 1H), 3.20 - 3.07 (m, 2H), 2.13 - 2.03 (m, 1H), 1.10 - 1.08 (m, 6H); 3H (OH および 2 NH)は観察されなかった.
122	MS m/z 448.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.51 (d, J＝2.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.46 (d, J＝12.2 Hz, 1H), 4.82 (br d, J＝14.0 Hz, 1H), 4.73 - 4.66 (m, 1H), 4.31 (s, 3H), 3.71 - 3.53 (m, 2H), 3.46 - 3.35 (m, 2H), 2.16 - 2.07 (m, 1H), 1.21 (d, J＝6.9 Hz, 6H); 3Hs は観察されなかった (OH, NH および 1 つの CH は溶媒残留物ピークとオーバーラップした)
123	MS m/z 364.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.94 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.59 (s, 2H), 8.15 (d, J＝10.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 4.73 (br d, J＝13.4 Hz, 1H), 4.64 (d, J＝12.0 Hz, 1H), 3.79 - 3.63 (m, 4H), 2.87 - 2.83 (m, 1H), 1.19-1.13 (m, 1H), 0.88 - 0.81 (m, 2H), 0.71 - 0.63 (m, 2H); 3Hs (OH および 2 NH)は観察されなかった.
124	MS m/z 416.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.49 - 8.44 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.72 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.48 (d, J＝9.8 Hz, 1H), 4.46 - 4.34 (m, 2H), 4.25 (s, 3H), 3.09 - 3.00 (m, 2H), 2.69 (dd, J＝11.4, 12.7 Hz, 2H), 1.25 (d, J＝6.4 Hz, 6H); 2H (OH および NH)は観察されなかった.
126	MS m/z 416.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.95 (d, J＝9.8 Hz, 1H), 8.75 (d, J＝1.8 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.06 (d, J＝10.1 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.84-7.88 (m, 1H), 7.77-7.81 (m, 1H), 4.81 (br dd, J＝14.2, 2.0 Hz, 2H), 4.16 (s, 3H), 3.55-3.63 (m, 2H), 3.22 (dd, J＝14.3, 11.9 Hz, 2H), 1.50 (d, J＝6.4 Hz, 6H); 2H は観察されなかった (1 OH, 1 NH).
129	MS m/z 381.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4): δ: 8.52 (d, J＝9.5 Hz, 1H), 8.42 (d, J＝3.1 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.66 (d, J＝9.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J＝1.7 Hz, 1H), 4.64 (d, J＝14.3 Hz, 1H), 4.49 (d, J＝14.3 Hz, 1H), 3.55-3.60 (m, 1H), 3.47-3.54 (m, 1H), 3.39-3.46 (m, 1H), 3.23-3.31 (m, 1H), 2.67-2.77 (m, 1H), 1.05-1.16 (m, 1H), 0.77-0.89 (m, 2H), 0.58-0.67 ppm (m, 2H); 2Hs は観察されなかった.

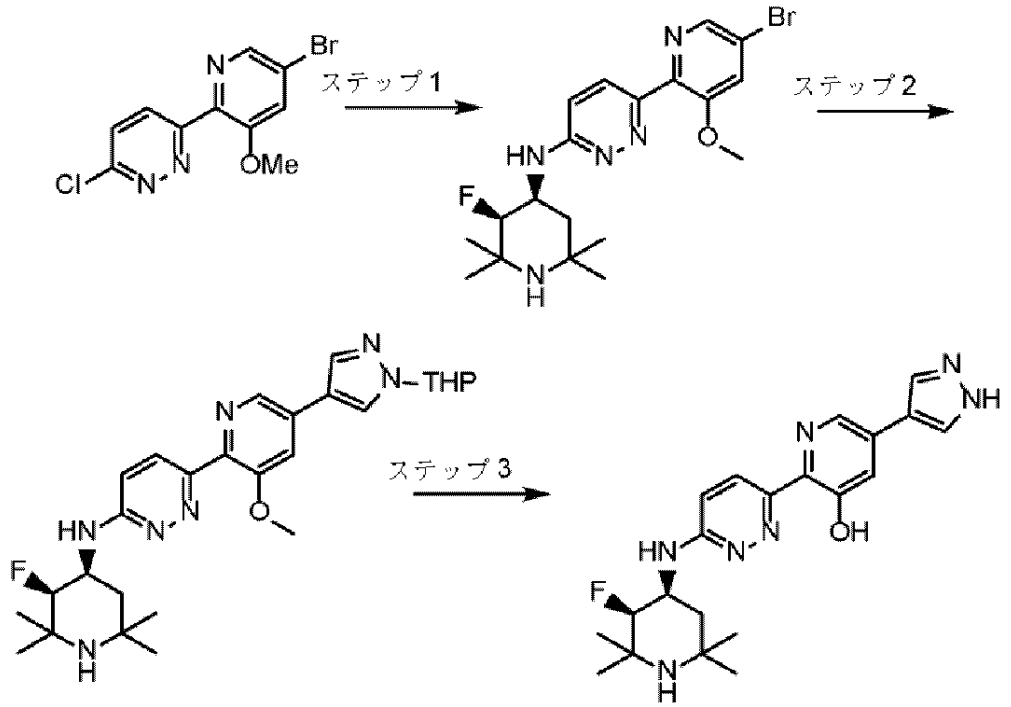
【表１２－５】

Cpd	データ
131	MS m/z 402.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.51 - 8.47 (m, 2H), 8.14 (s, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.73 (d, J＝9.0 Hz, 1H), 7.69 - 7.66 (m, 1H), 7.62 (d, J＝2.0 Hz, 1H), 7.50 (d, J＝9.8 Hz, 1H), 4.42 (br d, J＝11.4 Hz, 2H), 3.11 - 3.01 (m, 2H), 2.70 (t, J＝12.1 Hz, 2H), 1.26 (d, J＝6.4 Hz, 6H); 3H (OH および 2 NH)は観察されなかった.
132	MS m/z 352.2 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.54 (s, 2H), 8.12 (d, J＝9.9 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 4.74 - 4.65 (m, 2H), 3.69 - 3.59 (m, 2H), 3.47 - 3.36 (m, 3H), 1.86 (五重線, J＝7.2 Hz, 2H), 1.19 (t, J＝7.6 Hz, 3H); 3H (OH および 2 NH)は観察されなかった.

【０７１４】
（例９）

化合物８の調製

【化２２】



【０７１５】

ステップ１：３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－６－クロロ－ピリダジン（５９０ｍｇ、１．９７ｍｍｏｌ）、（±）－ｃｉｓ－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－アミン（５．０ｇ、２８．７ｍｍｏｌ）およびＮａＩ（３８３ｇ、２．５６ｍｍｏｌ）の混合物を、窒素雰囲気下８０℃にて終夜撹拌した。室温まで冷却した後、混合物を勾配０～１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、６－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）ピリダジン－３－アミン（１５０ｍｇ、１７％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４３８．０，４４０．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７１６】

ステップ２：ＤＭＦ／H_2O（４ｍＬ／１ｍＬ）中の６－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）ピリダジン－３－アミン（１５０ｍｇ、０．３４ｍｍｏｌ）、１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－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）－１Ｈ－ピラゾール（１２１ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）およびK_2CO_3（１１８ｍｇ、０．８６ｍｍｏｌ）の混合物に、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（２５ｍｇ、０．０３４ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を、窒素雰囲気下９５℃にて８ｈ撹拌した。混合物を氷水上に注ぎ、ＥｔＯＡｃで抽出した。合わせた有機層を水およびブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。残留物を勾配０～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（±）Ｎ－（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－６－（３－メトキシ－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）ピリダジン－３－アミン（９０ｍｇ、５２％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５１０．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７１７】

ステップ３：ＤＣＭ（１．０ｍＬ）中のＮ－（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－６－（３－メトキシ－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）ピリダジン

－３－アミン（９０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）の溶液に、BBr_3（ＤＣＭ中１．０Ｍ、５ｍＬ）を加えた。反応混合物を５０℃にて終夜撹拌した。混合物を室温まで冷却し、濃縮し、残留物を氷水と混合させ、ａｑ．Na_2CO_3で中和し、ＤＣＭで抽出した。合わせた有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮し、分取ＨＰＬＣにより精製して、２－（６－（（（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ）ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール（３０ｍｇ、４１％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４１２．９ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}ＨＮＭＲ（ＤＭＳＯ－d_6）δ：１３．２０（ｓ，１Ｈ），１３．１６（ｓ，１Ｈ），８．６４（ｄ，Ｊ＝９．４Ｈｚ，１Ｈ），８．６１（ｄ，Ｊ＝１．８Ｈｚ，１Ｈ），８．４５（ｓ，１Ｈ），８．１５（ｓ，１Ｈ），７．７３（ｄ，Ｊ＝１．８Ｈｚ，１Ｈ），７．５５（ｄ，Ｊ＝９．４Ｈｚ，１Ｈ），５．８０－５．９２（ｍ，１Ｈ），４．３９（ｄｄ，Ｊ＝５２．３，９．３Ｈｚ，１Ｈ），２．２４－２．３５（ｍ，１Ｈ），２．０３（ｂｒｓ，１Ｈ），１．５４（ｔ，Ｊ＝１２．３Ｈｚ，１Ｈ），１．３１（ｓ，３Ｈ），１．２４（ｓ，３Ｈ），１．１６（ｓ，３Ｈ），１．０９（ｓ，３Ｈ）；１Ｈは観察されなかった（ＯＨまたはＮＨ）

【０７１８】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例９に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１３】

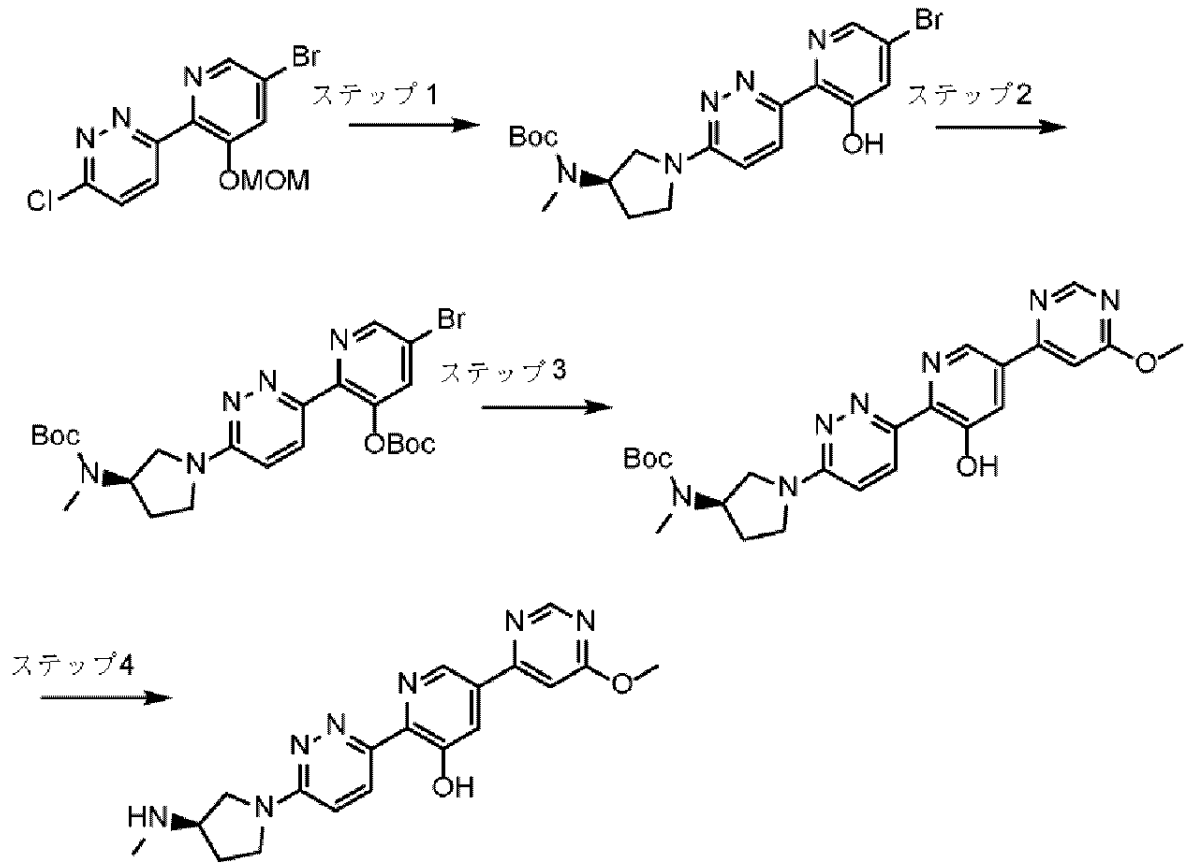
Cpd	データ
2	MS m/z 408.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.91 (br d, J=9.2 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.31 (s, 2H), 7.96 (br d, J=8.9 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 5.20 (br s, 1H), 3.21 (s, 3H), 2.09-2.18 (m, 2H), 2.00-2.04 (m, 2H), 1.68 (s, 6H), 1.60 (s, 6H); 3Hは観察されなかった (1 OH, 2 NH).
13	MS m/z 422.6 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.71 (s, 1H), 8.65 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.42 (d, J=9.8 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.81 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.70 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J=9.8 Hz, 1H), 6.88 (d, J=2.0 Hz, 1H), 5.00-5.16 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 1.74 (t, J=12.4 Hz, 2H), 1.63 (dd, J=12.4, 3.0 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H), 1.26 (s, 6H).
16	MS m/z 412.3 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.45 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.39 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.12 (s, 2H), 7.56 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J=9.5 Hz, 1H), 4.79 (dd, J=12.1, 3.8 Hz, 1H), 4.51 (d, J=50.8 Hz, 1H), 1.64-1.81 (m, 2H), 1.33-1.43 (m, 6H), 1.25 (s, 6H); 4Hsは観察されなかった (OH および NHs).
19	MS m/z 429.7 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (アセトン-d_6) δ: 13.74 (br s, 1H), 8.37-8.50 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.28 (br d, J=9.5 Hz, 1H), 6.55 (br d, J=8.2 Hz, 1H), 4.83-5.03 (m, 1H), 4.53 (d, J=51.6 Hz, 1H), 2.67-2.90 (m, 1H), 1.78 (br dd, J=12.4, 3.2 Hz, 1H), 1.58 (br t, J=12.5 Hz, 1H), 1.33 (br d, J=7.6 Hz, 6H), 1.16 (br s, 6H).

【０７１９】

（例１０）

化合物７０の調製

【化２３】



【０７２０】

ステップ１：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（１６０ｍｇ、０．４８ｍｍｏｌ）、Ｎ－メチル－Ｎ－［（３Ｒ）－ピロリジン－３－イル］カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１２０ｍｇ、０．６ｍｍｏｌ）、ＤＭＳＯ（１．２ｍＬ）、およびＤＩＰＥＡ（０．３２ｍＬ、１．８ｍｍｏｌ）を１００℃にて終夜加熱した。反応混合物をH_2OとＥｔＯＡｃとの間で分画した。有機層をH_2O、次いでブラインで逆洗浄した。有機層を$MgSO_4$で乾燥させ、真空下にて濃縮した。残留物を、勾配１０～３０％ＤＣＭ中ＥｔＯＡＣで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、Ｎ－［（３Ｒ）－１－［６－（５－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ピリジル）ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－イル］－Ｎ－メチル－カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１４９ｍｇ、６８％収率）を、白色固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（アセトン－d_6）δ：１４．１４（ｓ，１Ｈ），８．４２（ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），８．２５（ｓ，１Ｈ），７．５７（ｓ，１Ｈ），７．２５（ｄ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），４．９５（ｍ，１Ｈ），３．８０－３．９５（ｍ，２Ｈ），３．５０－３．７０（ｍ，２Ｈ），２．８５（ｓ，３Ｈ），２．２８（ｍ，２Ｈ），１．４９（ｓ，９Ｈ）．

【０７２１】

ステップ２：Ｎ－［（３Ｒ）－１－［６－（５－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ピリジル）ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－イル］－Ｎ－メチル－カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１１５ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）、Boc_2O（１３０ｍｇ、０．５８ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（１．５ｍＬ）、およびＤＭＡＰ結晶を、室温にて１ｈ撹拌した。反応混合物を濃縮し、勾配１０～４０％ＤＣＭ中ＥｔＯＡｃで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、［５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－［ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル（メチル）アミノ］ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（１４２ｍｇ、１００％収率）を、白色固体として

得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ （アセトン－ｄ$_{6}$） δ： ８．６８ （ｓ， １Ｈ）， ８．１０ （ｄ， Ｊ ＝ ９．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ８．００ （ｓ， １Ｈ）， ６．９８ （ｄ， Ｊ ＝ ９．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．９０－５．００ （ｍ， １Ｈ）， ３．８０－３．９５ （ｍ， ２Ｈ）， ３．５０－３．７０ （ｍ， ２Ｈ）， ２．８８ （ｓ， ３Ｈ）， ２．２８ （ｍ， ２Ｈ）， １．５５ （ｓ， ９Ｈ）， １．４８ （ｓ， ９Ｈ）．

【０７２２】

ステップ３：酢酸カリウム（１００ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）をアルゴン下１８０℃にて１０ｍｉｎ乾燥させ、次いで室温まで冷却した。［５－ブロモ－２－［６－［（３Ｒ）－３－［ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル（メチル）アミノ］ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル］－３－ピリジル］炭酸ｔｅｒｔ－ブチル（６０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、ビス（ピナコラート）ジボロン（３８ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_{2}$－ＤＣＭ錯体（１０ｍｇ、０．０１２ｍｍｏｌ）、および１，４－ジオキサン（１ｍＬ）を加えた。これを１００℃にて終夜加熱した。４－クロロ－６－メトキシピリミジン（２２ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）、追加のＰｄ（ｄｐｐｆ）Ｃｌ$_{2}$－ＤＣＭ錯体（１０ｍｇ、０．０１２ｍｍｏｌ）、および$K_{2}CO_{3}$（$H_{2}O$中２Ｍ、０．５ｍＬ、１ｍｍｏｌ）を加えた。これを９０℃にて終夜加熱した。次いで、反応混合物をＤＣＭと水との間で分画した。有機層を$MgSO_{4}$で乾燥させ、濃縮し、勾配１０～２０％ＤＣＭ中アセトンで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、続いてエーテルで粉砕して、Ｎ－［（３Ｒ）－１－［６－［３－ヒドロキシ－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－イル］－Ｎ－メチル－カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１７ｍｇ、３２％収率）を、オフホワイト固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４８０．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７２３】

ステップ４：Ｎ－［（３Ｒ）－１－［６－［３－ヒドロキシ－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－イル］－Ｎ－メチル－カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１７ｍｇ、０．０３５ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（０．５ｍＬ）、およびトリフルオロ酢酸（０．５ｍＬ、７ｍｍｏｌ）を室温にて１時間撹拌した。溶媒を窒素流により除去した。次いで、混合物を$NaHCO_{3}$水溶液とＤＣＭとの間で分画した。有機層を$MgSO_{4}$で乾燥させ、濃縮して、５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール（１４ｍｇ、１００％収率）を、オフホワイト固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３８０．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－ｄ$_{4}$） δ： ８．８４ （ｍ， ２Ｈ）， ８．５２ （ｄ， Ｊ ＝ １０ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．９９ （ｓ， １Ｈ）， ７．４２ （ｓ， １Ｈ）， ７．２３ （ｄ， Ｊ ＝ １０ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．０７ （ｓ， ３Ｈ）， ３．８２ （ｍ， １Ｈ）， ３．７５ （ｍ， １Ｈ）， ３．６４ （ｍ， １Ｈ）， ３．４０－３．５０ （ｍ， ２Ｈ）， ２．４８ （ｓ， ３Ｈ）， ２．３４ （ｍ， １Ｈ）， ２．０３ （ｍ， １Ｈ）．

【０７２４】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１０に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１４】

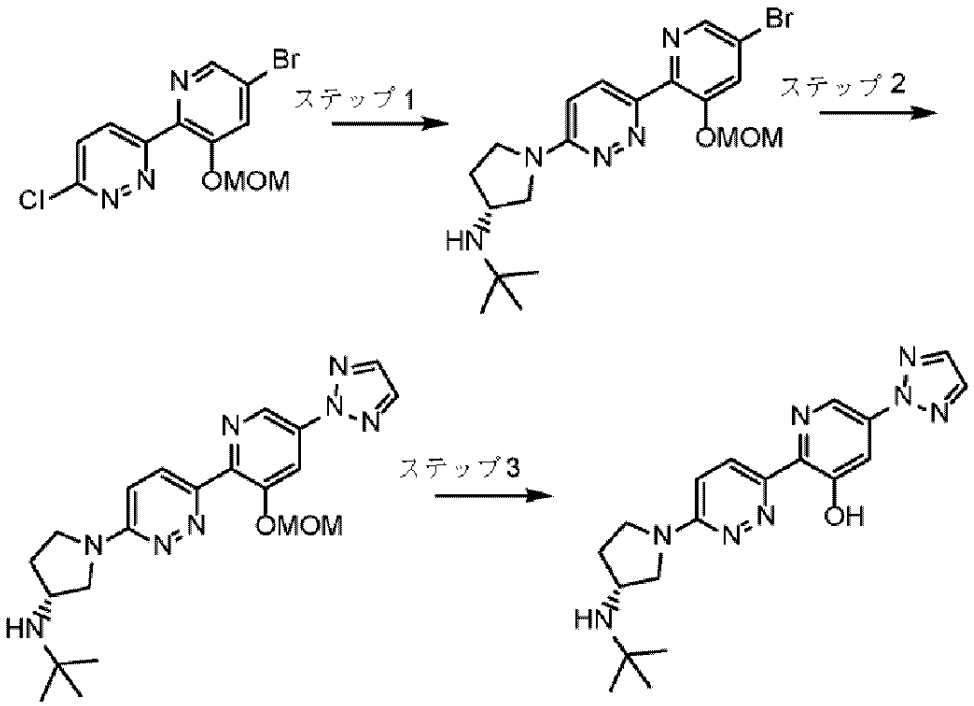
Cpd	データ
14	MS m/z 409.3 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.84 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.91 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 5.45-5.56 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 1.96-2.05 (m, 4H), 1.69 (s, 6H), 1.55 (s, 6H); 2Hs は観察されなかった (OH および NH).
25	MS m/z 457.4 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.88 (s, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.52 (br d, J=9.2 Hz, 1H), 8.27 (br s, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.23 (br d, J=9.8 Hz, 1H), 4.97-5.12 (m, 1H), 4.91-4.97 (m, 1H), 1.97-2.16 (m, 2H), 1.68 (br d, J=12.8 Hz, 6H), 1.57 (br d, J=14.0 Hz, 6H), 2 NHs および 1 OH は観察されなかった, HCOOH からの 2H は観察された.
30	MS m/z 422.5 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.87 (s, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.56 - 8.58 (d, J=9.46 Hz, 1H), 8.01 (d, J=1.53 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.27 (d, J=9.77 Hz, 1H), 4.10 - 4.30 (m, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.82 - 3.95 (m, 1H), 3.76 - 3.77 (m, 1H), 3.51 - 3.54 (m, 1H), 3.49 - 3.50 (m, 1H), 2.49 - 2.52 (m, 1H), 2.05 - 2.25 (m, 1H), 1.35 (s, 9H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
77	MS m/z 353.3 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ 8.45-8.57 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.24 (d, J = 9.5, 1H), 3.84-380 (m, 1H), 3.76-3-71 (m, 1H), 3.68-3.63 (m, 1H), 3.40-3.50 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.36-2.30 (m, 1H), 2.08-2.02 (m, 1H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
80	MS m/z 339.3 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ 8.79 (s, 1H), 8.51 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.43 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.85-3.81 (m, 1H), 3.76 - 3.72 (m, 1H), 3.68 - 3.60 (m, 1H), 3.40-3.50 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.38 - 2.33 (m, 1H), 2.06 -2.04 (m, 1H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).

【０７２５】

（例１１）

化合物２４の調製

【化２４】



【０７２６】

ステップ１：ＤＭＦ（１．２ｍｌ）中の（３Ｒ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチルピロリジン－３－アミン二塩酸塩（２００ｍｇ、０．９２ｍｍｏｌ）の懸濁液に、ＤＢＵ（５６０ｍｇ、３．６８ｍｍｏｌ）を加えた。透明な溶液が形成されるまで、反応混合物を４０°にて１０ｍｉｎ撹拌した。次いで、ＴＨＦ（１．０ｍＬ）中の３－［５－ブロモ－３－（メト

キシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（２００ｍｇ、０．６０ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を４０℃にて２４ｈ撹拌した。混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画した。有機層をブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、次いで濃縮した。粗生成物を、勾配０～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｒ）－１－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－ピロリジン－３－アミン（１９０ｍｇ、７３％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４３６．１，４３８．１ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７２７】

ステップ２：乾燥させたスクリュートップのドラムバイアルに、Me_4tBu－ＸＰｈｏｓ（２２ｍｇ、０．００４５ｍｍｏｌ）およびPd_2dba_3（２６ｍｇ、０．０２９ｍｍｏｌ）を入れ、続いて無水トルエン（１．０ｍＬ）および１，４－ジオキサン（０．２ｍＬ）を入れた。バイアルを排気し、アルゴンを３回再充填し、次いで予熱したアルミニウムブロック（１１０℃）に置き、５ｍｉｎ穏やかに撹拌した。これとは別に、第２のスクリュートップにセプタムキャップを取り付け、アルゴンで一掃し、（３Ｒ）－１－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－ピロリジン－３－アミン（１９０ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）、２Ｈ－トリアゾール（４５ｍｇ、０．６５ｍｍｏｌ）、およびK_3PO_4（２２０ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）を入れた。第２のバイアル中の反応混合物をアルゴンで１分間スパージし、その後、第１のバイアルからの触媒溶液を第２のバイアルにシリンジを介して加えた。反応容器を予熱したアルミニウムブロック（１１０℃）に置き、反応混合物を３ｈ撹拌した。粗反応混合物を室温まで冷却し、分液漏斗に移し、１：１飽和ａｑ．Na_2CO_3／ブライン（１．５ｍＬ）で希釈し、ＥｔＯＡｃで抽出した。合わせた抽出物を$MgSO_4$で乾燥させ、濃縮した。粗生成物を、勾配０～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｒ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－［６－［３－（メトキシメトキシ）－５－（トリアゾール－２－イル）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－アミン（１３０ｍｇ、７０％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２５．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７２８】

ステップ３：（３Ｒ）－Ｎ－ｔｅｒｔ－ブチル－１－［６－［３－（メトキシメトキシ）－５－（トリアゾール－２－イル）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］ピロリジン－３－アミン（１３０ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）およびジオキサン中ＨＣｌ（４Ｎ、１．０ｍｌ）の混合物を、３５℃にて２ｈ撹拌した。粗混合物を濃縮し、勾配０～１００％CH_3CN／水（０．１％ＴＦＡ）で溶出する逆相カラムクロマトグラフィーにより精製して、所望の生成物を得た。合わせた固体をＭｅＯＨ中の１．５Ｍ ＨＣｌ（５ｍＬ）で処理し、溶媒を蒸発させて、２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール（９５ｍｇ、６８％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３８１．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（メタノール－d_4）δ：ｐｐｍ １．５１（ｓ，９Ｈ），２．３０－２．３７（ｍ，１Ｈ），２．６５－２．７２（ｍ，１Ｈ），３．７５－３．７７（ｍ，２Ｈ），３．８６－３．９４（ｍ，１Ｈ），４．１７－４．２１（ｍ，１Ｈ）．４．２５－４．３９（ｍ，１Ｈ），７．４０－７．４２（ｄ，Ｊ＝９．７７Ｈｚ，１Ｈ），８．０１－８．０４（ｍ，３Ｈ），８．６３－８．６５（ｄ，Ｊ＝９．４６Ｈｚ，１Ｈ），８．９７（ｓ，１Ｈ）．

【０７２９】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１１に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１５】

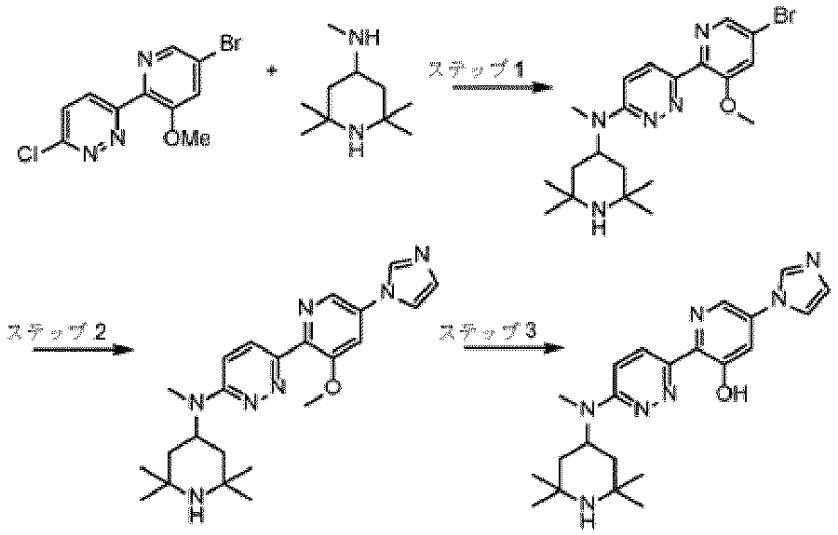
Cpd	データ
128	MS m/z 365.3 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 8.88 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 8.02 (s, 2H), 7.98 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.42 (d, J = 12.8 Hz, 1H), 4.34 (br d, J = 13.3 Hz, 1H), 3.11-3.21 (m, 1H), 2.94 (t, J = 11.4 Hz, 1H), 2.87-2.90 (m, 1H), 2.81-2.92 (m, 1H), 1.98 (dd, J = 11.0, 7.3 Hz, 1H), 0.82-0.94 (m, 1H), 0.56-0.66 (m, 2H), 0.32-0.45 ppm (m, 2H); 2Hs は観察されなかった.

【０７３０】

（例１２）

化合物１５の調製

【化２５】



【０７３１】

ステップ１：ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－６－クロロ－ピリダジン（１．６ｇ、５．３３ｍｍｏｌ）の溶液に、Ｎ，２，２，６，６－ペンタメチルピペリジン－４－アミン（８ｇ、４７．１ｍｍｏｌ）およびＮａＩ（１．３ｇ、８．６ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を、窒素雰囲気下７０℃にて１６ｈ撹拌し、次いで室温まで冷却し、窒素流下で濃縮した。残留物を勾配０～２０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、６－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）ピリダジン－３－アミン（０．９ｇ、３９％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４３４．２，４３６．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７３２】

ステップ２：密閉したチューブ内で、ＤＭＦ１０ｍＬ中の３－（５－ブロモ－３－メトキシ－２－ピリジル）－６－［（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペリジル）オキシ］ピリダジン（３００ｍｇ、０．６９ｍｍｏｌ）、イミダゾール（１０３ｍｇ、１．５２ｍｍｏｌ）、鉄（ＩＩＩ）アセチルアセトネート（７３ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）、ＣｕＩ（１３ｍｇ、０．０７ｍｍｏｌ）、およびCS_2CO_3（５６３ｍｇ、１．７３ｍｍｏｌ）の混合物を、１００℃にて２４ｈ撹拌した。室温まで冷却した後、混合物を濾過し、濾液を氷水と混合させ、ＥｔＯＡｃで抽出した。合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濃縮し、勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、３－（５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－３－メトキシピリジン－２－イル）－６－（（３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル

ピペリジン－４－イル）オキシ）ピリダジン（９０ｍｇ、３１％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２２．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７３３】

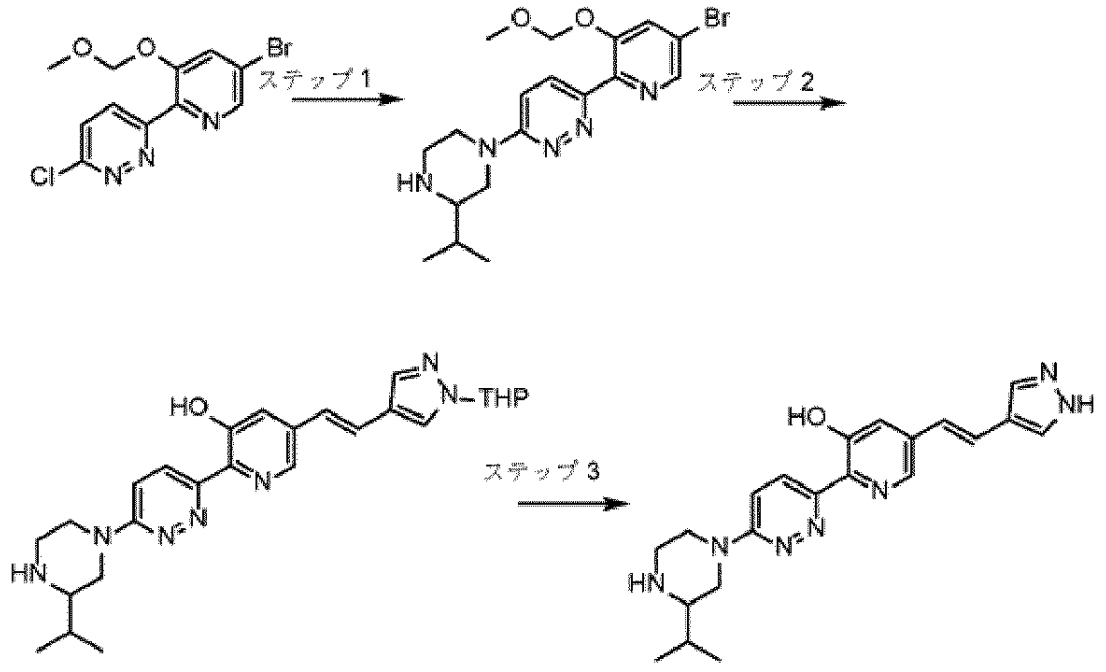
ステップ３：ＤＣＭ（１．０ｍＬ）中の６－（５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）ピリダジン－３－アミン（９０ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）の溶液に、BBr_3（ＤＣＭ中１．０Ｍ、５ｍＬ）を加え、反応物を５０℃にて終夜撹拌した。混合物を室温まで冷却し、濃縮し、残留物を氷水と混合させ、ａｑ．Na_2CO_3で中和し、ＤＣＭで抽出した。合わせた有機層を、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮し、分取ＨＰＬＣにより精製して、５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール（１７ｍｇ、２０％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４０８．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－d_4） δ：８．５１ （ｄ，Ｊ＝９．８ Ｈｚ，１Ｈ），８．４９ （ｄ，Ｊ＝２．２ Ｈｚ，１Ｈ），８．３２ （ｓ，１Ｈ），７．７３ （ｓ，１Ｈ），７．６４ （ｄ，Ｊ＝２．２ Ｈｚ，１Ｈ），７．４２ （ｄ，Ｊ＝９．８ Ｈｚ，１Ｈ），７．２３ （ｓ，１Ｈ），５．１９－５．３５ （ｍ，１Ｈ），３．０７ （ｓ，３Ｈ），１．６４－１．８４ （ｍ，４Ｈ），１．４９ （ｓ，６Ｈ），１．３４ （ｓ，６Ｈ）；２Ｈｓは観察されなかった （ＯＨおよびＮＨ）．

【０７３４】

（例１３）

化合物１３０の調製

【化２６】



【０７３５】

ステップ１：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－クロロ－ピリダジン（２．０ｇ、６．０５ｍｍｏｌ）、２－イソプロピルピペラジン（９５６．０ｍｇ、７．０８ｍｍｏｌ）、ＡＣＮ（１０ｍＬ）およびＤＢＵ（２．０ｇ、１２．９ｍｍｏｌ）の混合物を、６０℃にて１６ｈ撹拌した。冷却後、混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画した。有機相をブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濃縮した。粗生成物を、勾配０～１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン（１．５１ｇ、５８．９％収率）

を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２２．１，４２４．１ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７３６】

ステップ２：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン（８０．０ｍｇ、０．２ｍｍｏｌ）、１－メチル－４－ビニル－ピラゾール（１５０ｍｇ、０．３６ｍｍｏｌ）、Pd_2dba_3（２５ｍｇ、０．０２ｍｍｏｌ）、トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスホニウムテトラフルオロボラート（２５．０ｍｇ、０．０８２ｍｍｏｌ）の混合物をアルゴンでスパージし、次いでＤＩＥＡ（１００ｍｇ、０．７４ｍｍｏｌ）およびトルエン（２．０ｍｌ）を加えた。混合物をアルゴン雰囲気下１１０℃にて２ｈ撹拌した。冷却後、混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画した。水相をＥｔＯＡｃで抽出した（２回）。合わせた有機相をブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、次いで濃縮した。粗生成物を、勾配０～１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、２－［６－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（Ｅ）－２－（１－テトラヒドロピラン－２－イルピラゾール－４－イル）ビニル］ピリジン－３－オール（１５ｍｇ、９％収率）を、透明油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４７６．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７３７】

ステップ３：２－［６－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（Ｅ）－２－（１－テトラヒドロピラン－２－イルピラゾール－４－イル）ビニル］ピリジン－３－オール（１５ｍｇ、０．０３ｍｍｏｌ）およびＨＣｌ（０．５ｍｌ、ＭｅＯＨ中１．４Ｎ）の混合物を、ｒｔにて１ｈ撹拌して固体を得、これを濾過により収集し、続いてエーテルで洗浄して、２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；二塩酸塩（５ｍｇ、３４．１％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９２．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－d_6）：δ ｐｐｍ １．０７ － １．０９ （ｄ，６Ｈ），１．５５ － １．５６ （ｍ，１Ｈ），１．９８ － ２．０４ （ｍ，１Ｈ），３．５２ － ３．５７ （ｍ，１Ｈ），３．７５ － ３．７８ （ｍ，２Ｈ），３．９３ － ３．９８ （ｍ，１Ｈ），６．７９ － ７．０６ （ｄ，１Ｈ），７．２０ － ７．４２ （ｄ，１Ｈ），７．５６ （ｓ，１Ｈ），７．７７ － ７．７９ （ｄ，１Ｈ），７．９２ （ｓ，２Ｈ），８．３５ （ｓ，１Ｈ），８．４８ － ８．４９ （ｄ，１Ｈ），８．８４ （ｓ，１Ｈ），９．１０ （ｓ，１Ｈ）．

【０７３８】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１３に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１６】

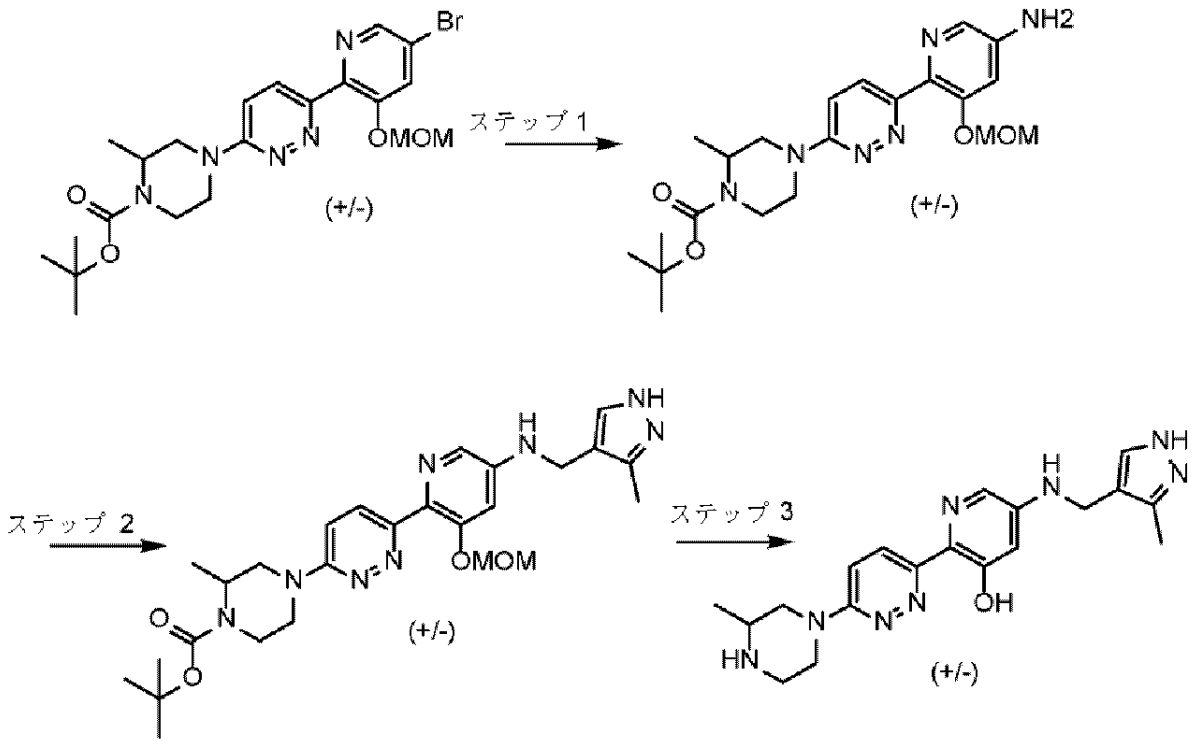
Cpd	データ
118	MS m/z 392.3 [M+H]$^{+}$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 1.37 - 1.38 (d, 6H), 3.16 - 3.21 (m, 2H), 3.35 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 4.61 (m, 2H), 6.96 - 7.0 (d, J=15.87 Hz, 1H), 7.32 - 7.35 (d, J=15.87 Hz, 1H), 7.75 - 7.81 (m, 3H), 7.97 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.51 - 8.53 (d, J=9.77 Hz, 1H), 8.65 (br, s, 1 H), 9.94 (br, s, 1H).

【０７３９】

（例１４）

化合物１０８の調製

【化２７】



【０７４０】

ステップ１：４－［６－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］ピリダジン－３－イル］－２－メチル－ピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３．０１５ｇ、６．０９８ｍｍｏｌ）、ナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（１．７８ｇ、１８．５ｍｍｏｌ）、Pd_2dba_3（１５７ｍｇ、０．１７１ｍｍｏｌ）、ｒａｃ－２，２′－ビス（ジフェニルホスフィノ）－１，１′－ビナフチル（２８３ｍｇ、０．４５４ｍｍｏｌ）、トルエン（６０ｍＬ）、およびベンゾフェノンイミン（１．２２ｍＬ、７．２９ｍｍｏｌ）を合わせ、アルゴンで脱気し、５ｈ、８０℃まで加熱した。塩酸ヒドロキシルアミン（１．５８ｇ、２２．７ｍｍｏｌ）、酢酸カリウム（２．９８ｇ、３０．４ｍｍｏｌ）、およびメタノール（１５０ｍＬ）を加え、反応物を２３℃にて１６ｈ撹拌した。反応物を濃縮し、残留物をＤＣＭ／ＭｅＯＨ中に懸濁させ、濾過した。濾液を濃縮し、残留物を、勾配０～１０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ　３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤を伴うＭｅＯＨ）で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、４－（６－（５－アミノ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）ピリダジン－３－イル）－２－メチルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．９７ｇ、７５％収率）を得た。ＭＳ　ｍ／ｚ　４３１．５　［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７４１】

ステップ２：４－（６－（５－アミノ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）ピリダジン－３－イル）－２－メチルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（７６．２ｍｇ、０．１７７ｍｍｏｌ）、３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－カルバルデヒド（２１．６ｍｇ、０．１９６ｍｍｏｌ）、ＤＣＭ（１．５ｍＬ）、および酢酸（１１μＬ）を合わせ、室温にて３０ｍｉｎ撹拌した。トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム（９０ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）を加え、反応物を室温にて１９ｈ撹拌した。少量のＣｅｌｉｔｅを通して反応物を濾過して、ＤＣＭ／ＭｅＯＨですすいだ。濾液を濃縮し、残留物を、勾配０～１５％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ　３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤を伴うＭｅＯＨ）で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、４－（６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（（（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル）アミノ）ピリジン－２－イル）ピリダジン－３－イル）－２－メ

チルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチルを得、これを次のステップに直接持ち越した。

【０７４２】

ステップ３：ｒａｃ－４－（６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（（（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル）アミノ）ピリジン－２－イル）ピリダジン－３－イル）－２－メチルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル、ＤＣＭ（１．０ｍＬ）、メタノール（０．５ｍＬ）、および塩酸（Et_2O中２．０Ｍ、１ｍＬ）を合わせ、５０℃にて１ｈ撹拌した。反応物を濃縮して、２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩（５５．５ｍｇ、２ステップにわたり６９％）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３８１．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－d_4）δ：８．８３ （ｄ，Ｊ ＝ １０．１ Ｈｚ，１Ｈ），８．２８ （ｓ，１Ｈ），８．０２ （ｄ，Ｊ ＝ １０．１ Ｈｚ，１Ｈ），７．９３ （ｓ，１Ｈ），６．８１ （ｓ，１Ｈ），４．５９ （ｂｒ ｄ，Ｊ ＝ １４．６ Ｈｚ，２Ｈ），４．４４ （ｓ，２Ｈ），３．５９ （ｂｒ ｔ，Ｊ ＝ １２．７ Ｈｚ，３Ｈ），３．３７ （ｓ，２Ｈ），２．５５ （ｓ，３Ｈ），１．４７ （ｂｒ ｄ，Ｊ ＝ ６．４ Ｈｚ，３Ｈ）；４Ｈは観察されなかった （３ ＮＨｓおよびＯＨ）．

【０７４３】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１４に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１７】

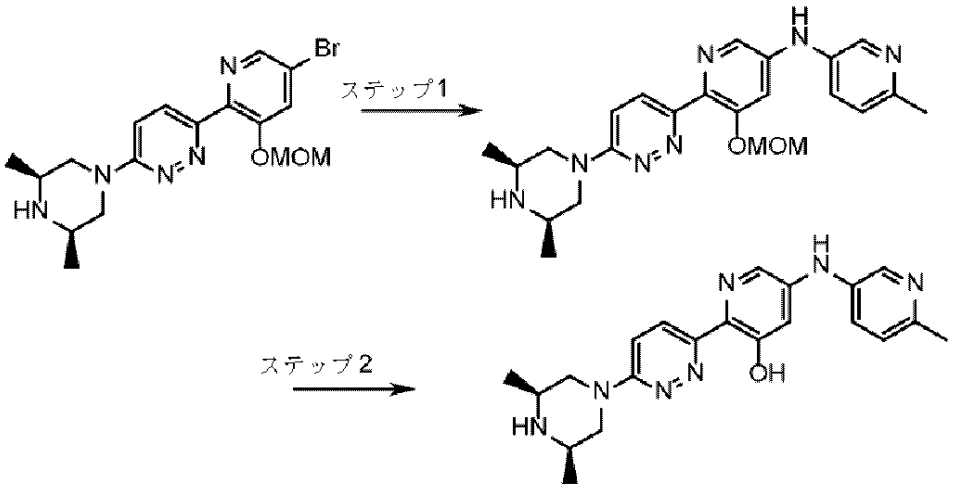
Cpd	データ
109	MS m/z 378.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.83-8.91 (m, 2H), 8.63-8.70 (m, 1H), 8.16 (br d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.02-8.09 (m, 2H), 8.01 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.69 (br s, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.59 (br d, J = 13.7 Hz, 2H), 3.44-3.63 (m, 4H), 3.26-3.31 (m, 1H), 1.46 (br d, J = 6.7 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (2 NHs および OH).
110	MS m/z 378.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.96 (s, 1H), 8.82-8.91 (m, 2H), 8.72 (br d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.13-8.18 (m, 1H), 8.01 (br d, J = 10.1 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 6.69 (br s, 1H), 4.79 (s, 2H), 4.58 (br d, J = 14.6 Hz, 2H), 3.45-3.64 (m, 4H), 3.25-3.31 (m, 1H), 1.46 (br d, J = 6.4 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
111	MS m/z 378.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 8.83-8.95 (m, 3H), 8.15 (br d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.03 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 6.62 (br s, 1H), 4.90 (br s, 2H), 4.58 (br d, J = 14.3 Hz, 2H), 3.45-3.65 (m, 4H), 3.26-3.32 (m, 1H), 1.46 (d, J = 6.4 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
112	MS m/z 428.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.36 (s, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.84 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.19-8.26 (m, 1H), 7.98-8.08 (m, 3H), 6.79 (s, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.58 (br d, J = 14.0 Hz, 2H), 3.44-3.64 (m, 4H), 3.25-3.31 (m, 1H), 1.46 (d, J = 6.7 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
113	MS m/z 428.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.31 (br d, J = 8.2 Hz, 1H), 9.28 (br d, J = 4.3 Hz, 1H), 8.85 (br d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.38 (br d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.18-8.28 (m, 2H), 7.96-8.04 (m, 3H), 6.81 (br s, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.54-4.63 (m, 2H), 3.44-3.63 (m, 4H), 3.24-3.30 (m, 1H), 1.47 (br d, J = 6.4 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).

【０７４４】

（例１５）

化合物１２５の調製

【化２８】



【０７４５】

ステップ１：３－［５－ブロモ－３－（メトキシメトキシ）－２－ピリジル］－６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン（６０．０ｍｇ、０．１４７ｍｍｏｌ）、４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）－９，９－ジメチルキサンテン（２５．５ｍｇ、０．０４４１ｍｍｏｌ）、Pd_2dba_3（１３．５ｍｇ、０．０１４７ｍｍｏｌ）、６－メチルピリジン－３－アミン（３１．２ｍｇ、０．２９４ｍｍｏｌ）、炭酸セシウム（１７０ｍｇ、０．５２２ｍｍｏｌ）、および１，４－ジオキサン（１．０ｍＬ）を合わせ、アルゴンで脱気し、１６ｈ、１００℃まで加熱した。反応物を濃縮し、残留物を、勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨ（２．５％ｖ／ｖ　３０％水酸化アンモニウム水溶液添加剤を伴うＭｅＯＨ）で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、粗６－（６－（（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）－Ｎ－（６－メチルピリジン－３－イル）ピリジン－３－アミンを得、これを次のステップに直接持ち越した。ＭＳ ｍ／ｚ ４３６．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７４６】

ステップ２：ステップ１からの６－（６－（（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル）－５－（メトキシメトキシ）－Ｎ－（６－メチルピリジン－３－イル）ピリジン－３－アミンおよびトリフルオロ酢酸（４ｍＬ）を合わせ、室温にて１ｈ３０ｍｉｎ撹拌した。反応物を濃縮し、残留物を塩酸（Et_2O中２．０Ｍ、４ｍＬ）およびメタノール（２ｍＬ）の混合物中に溶解させ、次いで濃縮して、２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩（２５．１ｍｇ、２ステップにわたり３７％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９２．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （メタノール－d_4） δ： ８．９８ （ｄ，Ｊ＝１０．１Ｈｚ，１Ｈ），８．５６ （ｄ，Ｊ＝２．７Ｈｚ，１Ｈ），８．３５ （ｄｄ，Ｊ＝８．９，２．４Ｈｚ，１Ｈ），８．３０ （ｄ，Ｊ＝１．８Ｈｚ，１Ｈ），８．１６ （ｄ，Ｊ＝１０．１Ｈｚ，１Ｈ），７．８９ （ｄ，Ｊ＝８．９Ｈｚ，１Ｈ），７．３５ （ｄ，Ｊ＝１．８Ｈｚ，１Ｈ），４．７３ （ｂｒｄｄ，Ｊ＝１４．０，１．８Ｈｚ，２Ｈ），３．５８ （ｄｄｄ，Ｊ＝１０．８，６．７，３．５Ｈｚ，２Ｈ），３．１９ （ｄｄ，Ｊ＝１４．３，１１．９Ｈｚ，２Ｈ），２．７７ （ｓ，３Ｈ），１．４９ （ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，６Ｈ）；３Ｈは観察されなかった （２ＮＨｓおよびＯＨ）．

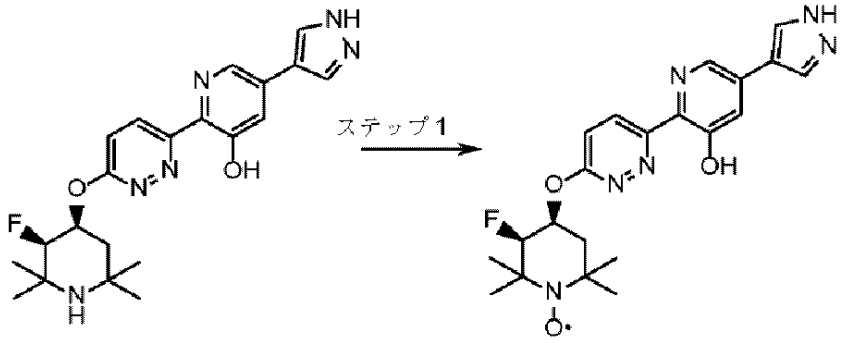
【０７４７】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１５に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することが

でき、以下から選択されるような化合物を得た。
【表１８】

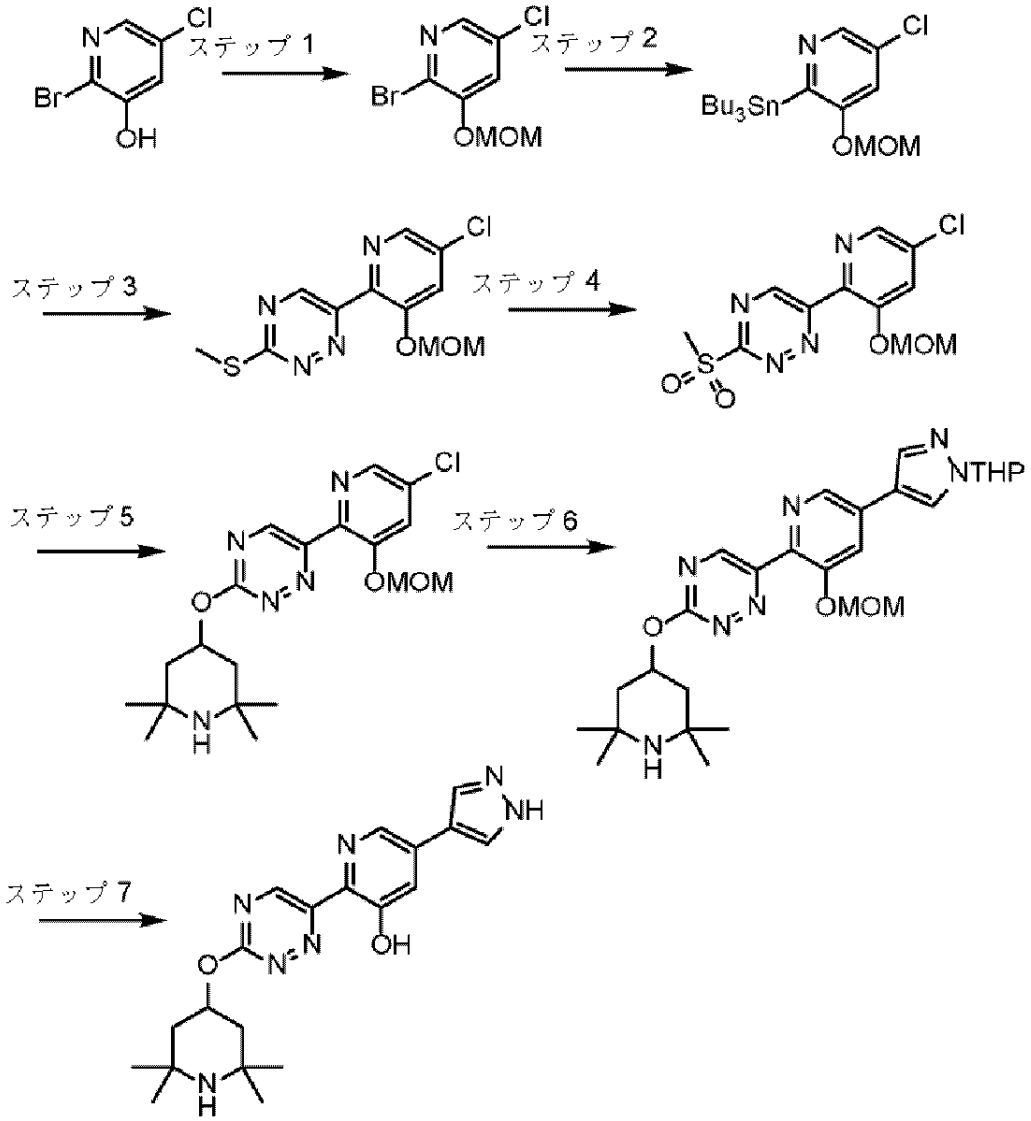
Cpd	データ
117	MS m/z 364.3 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 8.99 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.70-8.73 (m, 1H), 8.42-8.47 (m, 2H), 8.36 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 1H), 7.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.64 (br dd, J = 14.5, 2.9 Hz, 2H), 3.52-3.65 (m, 3H), 3.34-3.40 (m, 2H), 1.48 (d, J=6.7 Hz, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
127	MS m/z 406.5 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 8.96 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 8.9, 2.7 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.12 (br d, J = 10.1 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.75 (br d, J = 13.4 Hz, 1H), 4.64 (br d, J = 15.3 Hz, 1H), 3.46-3.65 (m, 3H), 3.27-3.42 (m, 2H), 2.76 (s, 3H), 2.09 (dt, J = 13.5, 6.8 Hz, 1H), 1.20 (d, J = 6.7 Hz, 6H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
133	MS m/z 407.5 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 8.94 (br d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.07 (br d, J = 10.1 Hz, 1H), 4.76 (br d, J = 13.7 Hz, 1H), 4.64 (br d, J = 14.3 Hz, 1H), 3.60 (br d, J = 12.8 Hz, 1H), 3.38-3.58 (m, 2H), 3.25-3.32 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.08 (td, J = 13.5, 6.6 Hz, 1H), 1.20 (d, J = 7.0 Hz, 6H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
134	MS m/z 407.5 [M+H]+; ^{1}H NMR (メタノール-d4) δ: 8.92 (br d, J = 10.1 Hz, 1H), 8.78 (s, 2H), 8.19 (br d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.07 (br d, J = 10.1 Hz, 1H), 7.20 (br d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.74 (br d, J = 12.5 Hz, 1H), 4.62 (br d, J = 13.7 Hz, 1H), 3.60 (br d, J = 12.5 Hz, 1H), 3.48-3.56 (m, 1H), 3.38-3.47 (m, 1H), 3.24-3.32 (m, 2H), 2.72-2.78 (m, 3H), 2.07 (td, J = 13.0, 6.9 Hz, 1H), 1.19 (d, J = 6.7 Hz, 6H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).

【０７４８】
（例１６）
化合物１０２の調製
【化２９】



【０７４９】
ステップ１：ジクロロメタン（１．０ｍＬ）中の２－［６－［［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチル－４－ピペリジル］オキシ］ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール（化合物５１、５０ｍｇ、０．１２）の懸濁液に、３－クロロ過安息香酸（５６ｍｇ、０．２４ｍｍｏｌ、７５質量％）を加えた。混合物を室温にて１２ｈ撹拌した。反応混合物を濃縮し、生成物を、勾配０～３０％ＤＣＭ中ＭｅＯＨで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－（｛６－［３－ヒドロキシ－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル］ピリダジン－３－イル｝オキシ）－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－１－イル］オキシダニル（２０．０ｍｇ、３９％収率）を、白色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４２８．４ ［Ｍ＋Ｈ］+.
【０７５０】

（例１７）
化合物１４１の調製
【化３０】



【０７５１】
ステップ１：ＤＭＦ（１００ｍＬ）中の２－ブロモ－５－クロロピリジン－３－オール（５．０ｇ、２４．０ｍｍｏｌ、１．）の溶液を０℃まで冷却した。水素化ナトリウム（１．１５ｇ、２８．８ｍｍｏｌ）をゆっくりと加え、混合物を０℃にて３０分間撹拌させた。次いで、シリンジを用いて、ＭＯＭ－Ｃｌ（２．４ｍＬ、３７．０ｍｍｏｌ）をゆっくりと加えた。混合物を室温まで温め、次いで２ｈ撹拌した。混合物をＥｔＯＡｃおよびNH_4Clで希釈した。有機層を水、ブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濃縮した。粗油状物を、勾配０～４０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンを用いるシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、２－ブロモ－５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン（４．２ｇ、６９％収率）を、白色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２５２．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.
【０７５２】
ステップ２：２－ブロモ－５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン（４．２ｇ、１７．０ｍｍｏｌ）をトルエン（１００ｍＬ）中に溶解させ、アルゴン下で－３０℃まで冷却した。ｎＢｕＬｉ（１２．０ｍＬ、１９．０ｍｍｏｌ）をゆっくりと加え、溶液を－３０℃にて３０ｍｉｎ撹拌させた。塩化トリブチルスズ（５．９ｍＬ、２２．０ｍｍｏｌ）を反応混合物にゆっくりと加え、溶液を室温まで温め、２ｈ撹拌した。少量のシリカゲルパッドを１０％NEt_3／ヘキサンで不活性化し、ヘキサンを使用してこのシリカゲル

にスタンナンを通した。濃縮して、５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）－２－（トリブチルスタンニル）ピリジン（７．７ｇ、９４％収率）を、黄色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４８６．４ ［Ｍ＋Ｎａ］$^{+}$.

【０７５３】

ステップ３：６－ブロモ－３－（メチルチオ）－１，２，４－トリアジン（２．０ｇ、９．７ｍｍｏｌ）、５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）－２－（トリブチルスタンニル）ピリジン（５．８ｇ、１３．０ｍｍｏｌ）、ヨウ化銅（０．３７ｇ、１．９ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ＰＰｈ$_3$）$_2$Ｃｌ$_2$（０．６８ｇ、１．０ｍｍｏｌ）を入れたマイクロ波バイアルをアルゴンでパージし、ジオキサン（１５ｍＬ）を加えた。バイアルをマイクロ波内で１２０℃にて１ｈ加熱した。黒色溶液を濾過し、真空下にて濃縮した。粗油状物を、勾配７０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンを用いるシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（メチルチオ）－１，２，４－トリアジン（１．８ｇ、６２％収率）を黄色油状物として得、これを静置して結晶化させた。ＭＳ ｍ／ｚ ２９９．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７５４】

ステップ４：ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$（１０ｍＬ）中の６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（メチルチオ）－１，２，４－トリアジン（０．６ｇ、２．０ｍｍｏｌ、１．０ｅｑｕｉｖ．）の溶液に、乾燥ｍ－ＣＰＢＡ（０．７６ｇ、４．４ｍｍｏｌ、２．２ｅｑｕｉｖ．）をゆっくりと加え、反応物を室温にて４ｈ撹拌した。粗混合物を、勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンを用いるシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（メチルスルホニル）－１，２，４－トリアジン（０．３５ｇ、５３％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３３１．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７５５】

ステップ５：２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－オール（０．１７ｇ、１．０６ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（３．０ｍＬ）中に溶解させ、アルゴン下で０℃まで冷却した。ＬｉＯｔＢｕ（０．８５ｍＬ、０．８５ｍｍｏｌ、ＴＨＦ中１．０Ｍ）を反応混合物に滴下添加し、０℃にて２０ｍｉｎ撹拌させた。別のバイアルに、６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（メチルスルホニル）－１，２，４－トリアジン（０．１４ｇ、０．４２ｍｍｏｌ、１．０ｅｑｕｉｖ．）を加え、ＴＨＦ（３．０ｍＬ）中に溶解させ、０℃まで冷却した。アルコキシド溶液（第１のバイアル）を、スルホンを含有するバイアル（第２のバイアル）に滴下添加し、反応物を０℃にて４５ｍｉｎ撹拌した。溶液をＥｔＯＡｃで希釈し、水で洗浄し、ＭｇＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗混合物を、勾配０～３０％ＭｅＯＨ／ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$を用いるシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－１，２，４－トリアジン（０．１２ｇ、７０％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４０８．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$

【０７５６】

ステップ６：バイアルに６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－１，２，４－トリアジン（０．０７ｇ、０．１７ｍｍｏｌ）、１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－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）－１Ｈ－ピラゾール（０．０８ｇ、０．２９ｍｍｏｌ、１．５ｅｑｕｉｖ．）、ＸＰｈｏｓ Ｐｄ Ｇ３（０．０２ｇ、０．０８ｍｍｏｌ）、Ｋ$_2$ＣＯ$_3$（０．０７ｇ、０．５８ｍｍｏｌ）、ジオキサン（５ｍＬ）、水（１ｍＬ）を入れ、アルゴンでパージした。混合物を１００℃にて１ｈ撹拌した。冷却および濃縮したら、混合物を勾配０～２５％ＭｅＯＨ／ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）－３－（（２，２，６，

６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－１，２，４－トリアジン（０．０８ｇ、８９％収率）を、橙色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５２４．６ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７５７】

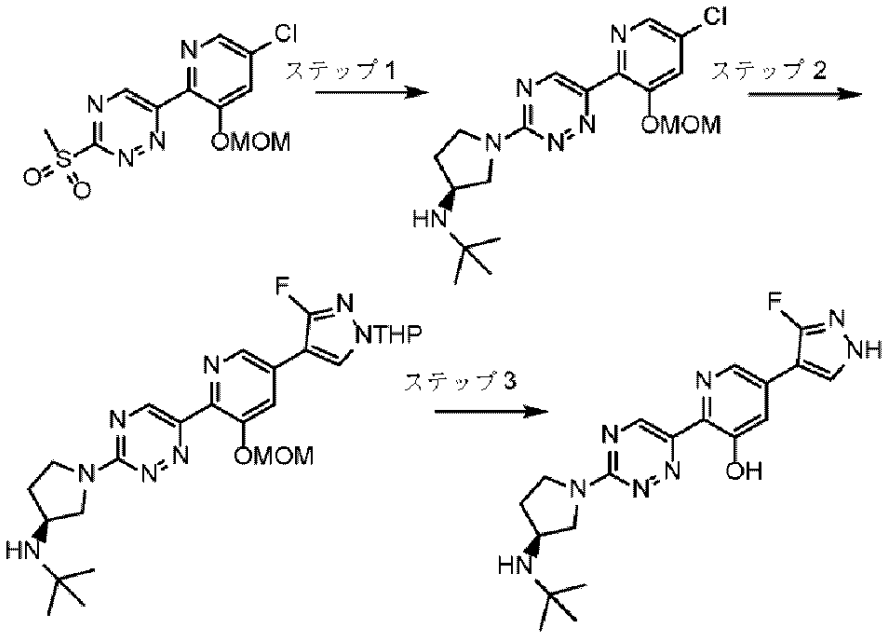
ステップ７：ＭｅＯＨ（１ｍＬ）中の６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）－３－（（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ）－１，２，４－トリアジン（０．０８ｇ、０．１５ｍｍｏｌ）の溶液に、４．０Ｍ ＨＣｌ／ジオキサン（０．５ｍＬ）を滴下添加し、反応物を室温にて１ｈ撹拌させた。混合物を濃縮し、勾配０～３０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール（０．０５ｇ、０．１３ｍｍｏｌ、８４％収率）を、黄色固体としてのＨＣｌ塩として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９６．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（メタノール－d_4）δ：９．６９（ｓ，１Ｈ），８．６０（ｓ，１Ｈ），８．１８（ｓ，２Ｈ），７．７０（ｓ，１Ｈ），５．７８（ｂｒ，ｓ，１Ｈ），２．５２（ｄ，Ｊ＝１４．５Ｈｚ，２Ｈ），１．９４（ｔ，Ｊ＝１２．０Ｈｚ，２Ｈ），１．６４（ｓ，６Ｈ），１．５６（ｓ，６Ｈ）；３Ｈｓは観察されなかった（２ＮＨｓおよびＯＨ）．

【０７５８】

（例１８）

化合物１４５の調製

【化３１】



【０７５９】

ステップ１：６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（メチルスルホニル）－１，２，４－トリアジン（０．１６ｇ、０．４８ｍｍｏｌ）および（Ｓ）－Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）ピロリジン－３－アミン（０．０９ｇ、０．６０ｍｍｏｌ）をＤＭＦ（４ｍＬ）中に溶解させ、NEt_3（０．７ｍＬ、４．８ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を室温にて２ｈ撹拌した。溶媒を除去し、粗混合物を勾配０～２０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）－１－（６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピロリジン－３－アミン（０．０４ｇ、５２％収率）を、黄色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９３．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７６０】
ステップ２：（Ｓ）－Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）－１－（６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピロリジン－３－アミン（０．０５ｇ、０．１３ｍｍｏｌ）、３－フルオロ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－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）－１Ｈ－ピロール（０．０６ｇ、０．２０ｍｍｏｌ）、ＸＰｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ３（０．０１ｇ、０．０３ｍｍｏｌ）およびK_2CO_3（０．０５ｇ、０．３８ｍｍｏｌ、３．０ｅｑｕｉｖ．）を含有するバイアルに、ジオキサン（５ｍＬ）、水（１ｍＬ）を加え、バイアルをアルゴンでパージした。混合物を１００℃にて１ｈ撹拌した。冷却および濃縮したら、混合物を勾配０～２５％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（３Ｓ）－Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）－１－（６－（５－（３－フルオロ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピロリジン－３－アミン（０．０４ｇ、５２％収率）を、橙色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５２７．６ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７６１】
ステップ３：ＭｅＯＨ（１ｍＬ）中の（３Ｓ）－Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブチル）－１－（６－（５－（３－フルオロ－１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピロリジン－３－アミン（０．０４ｇ、０．０７ｍｍｏｌ）を含有するバイアルに、４．０Ｍ　ＨＣｌ／ジオキサン（０．５ｍＬ）を滴下添加し、溶液を室温にて１ｈ撹拌した。溶液を濃縮し、勾配０～３０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、２－｛３－［（３Ｓ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（３－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール（０．０１ｇ、４７％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３９９．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ（メタノール－d_4）ｄ：９．４１（ｓ，１Ｈ），８．４６（ｓ，１Ｈ），８．１２（ｓ，１Ｈ），７．５６（ｓ，１Ｈ），４．１１（ｔ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），３．９４（ｔ，Ｊ＝１１．０Ｈｚ，１Ｈ），３．９０－３．８３（ｍ，１Ｈ），３．７３－３．６３（ｍ，１Ｈ），３．５１－３．４１（ｍ，１Ｈ），２．５０－２．４１（ｍ，１Ｈ），２．１０－２．００（ｍ，１Ｈ），１．３１（ｓ，９Ｈ）；３Ｈは観察されなかった（１ＯＨ，２ＮＨ）．

【０７６２】
本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１８に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表１９－１】

Cpd	データ
135	MS m/z 409.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.43 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.15 (s, 2H), 7.66 (s, 1H), 5.50-5.36 (m, 1H), 3.26 (s, 3H), 2.02 (d, J＝8.0 Hz, 4H), 1.65 (s, 6H), 1.54 (s, 6H); 3Hs は観察されなかった (2NHs および OH).
136	MS m/z 381.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.39 (s, 2H), 9.18-9.31 (m, 1H), 9.06-9.18 (m, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.29 (br s, 2H), 7.73 (s, 1H), 4.13-4.25 (m, 2H), 4.04-4.13 (m, 1H), 3.78-3.96 (m, 2H), 3.55-3.77 (m, 1H), 2.26-2.47 (m, 1H), 1.40 (s, 9H)
137	MS m/z 398.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.39-9.47 (m, 1H), 9.36 (s, 1H), 9.29-9.34 (m, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.74 (br s, 1H), 4.01-4.23 (m, 2H), 3.79-4.01 (m, 2H), 3.56-3.74 (m, 1H), 2.25-2.47 (m, 2H), 1.40 (s, 9H).
139	MS m/z 413.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.31 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.32 (s, 2H), 7.88 (s, 1H), 4.70-4.90 (m, 2H), 1.99-2.07 (m, 1H), 1.90-1.96 (m, 1H), 1.53-1.60 (m, 6H), 1.48 (s, 6H); 4Hs は観察されなかった (3 NHs および OH).
140	MS m/z 430.7 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.43 (s, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.51 (s, 1H), 4.70-4.85 (m, 1H), 4.40-4.60 (m, 1H), 1.76-1.80 (m, 2H), 1.38 (s, 6H), 1.27 (s, 6H); 3Hs は観察されなかった (2 NHs および OH).
142	MS m/z 426.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.31 (s, 1H), 8.81 (d, J=11.9 Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.79-7.96 (m, 2H), 5.18-5.40 (m, 1H), 3.17 (s, 3H), 1.98 (t, J=12.8 Hz, 2H), 1.83-1.92 (m, 2H), 1.51 (s, 6H), 1.44 (s, 6H).
143	MS m/z 427.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 13.15 (br s, 1H), 9.34 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.36-7.56 (m, 1H), 6.69 (d, J=5.8 Hz, 1H), 5.07-5.35 (m, 1H), 3.12 (s, 3H), 1.55-1.70 (m, 4H), 1.32 (s, 6H), 1.21 (s, 6H); 1 H は観察されなかった (NH).
146	MS m/z 475.5 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.36 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 6.97 (s, 1H) 4.17 (s, 3H), 4.02 (s, 3H), 3.96-3.87 (m, 1H), 3.83-3.71 (m, 1H), 3.63-3.50 (m, 1H), 2.57 (t, J＝6.5 Hz, 1H), 2.30-2.20 (m, 1H), 1.96-1.83 (m, 1H), 1.14 (s, 9H), 0.85 (t, J＝6.5 Hz, 1H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
147	MS m/z 470.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d_4) δ: 9.54 (s, 1H), 9.46 (br s, 1H), 8.83 (d, J=12.2 Hz, 1H), 8.68 (d, J=24.1 Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.88 (d, J=9.2 Hz, 1H), 4.29-4.44 (m, 1H), 4.14-4.28 (m, 1H), 3.91-4.13 (m, 2H), 3.74-3.90 (m, 1H), 2.67-2.80 (m, 1H), 2.64 (s, 3H), 2.26-2.53 (m, 1H), 1.53 (s, 9H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).

【表１９－２】

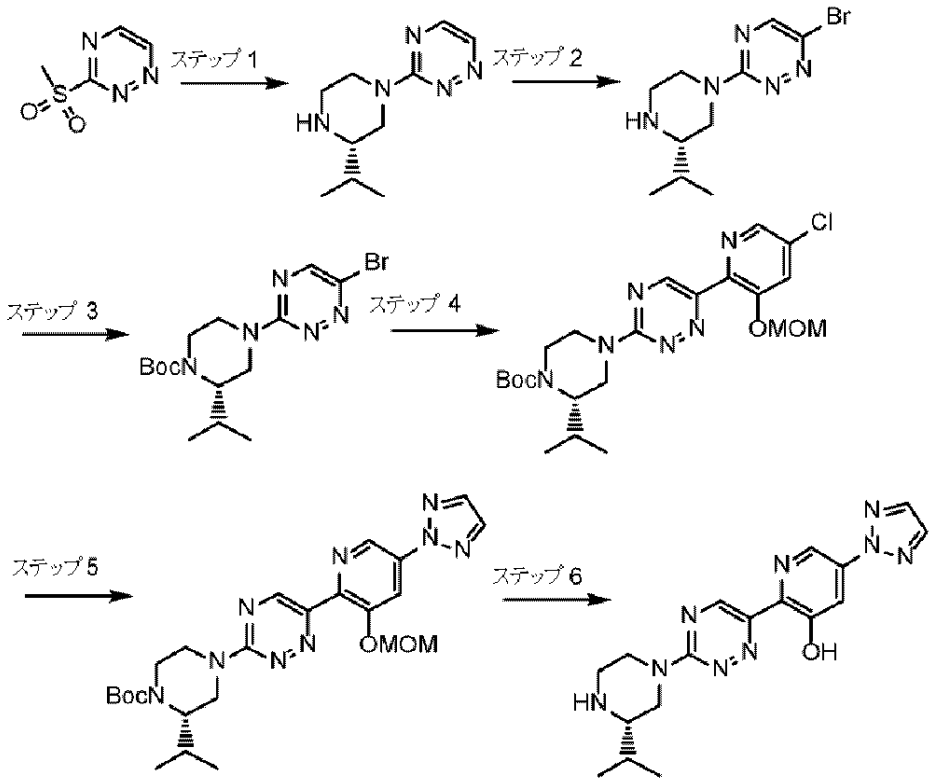
Cpd	データ
148	MS m/z 473.5 [M+H]+; 1H NMR (メタノール-d4) δ: 9.54 (s, 1H), 9.06 (d, J=8.9 Hz, 1H), 8.67 (d, J=28.1 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.85 (br d, J=10.4 Hz, 1H), 4.28-4.42 (m, 1H), 4.12-4.26 (m, 1H), 4.02-4.09 (m, 1H), 3.92-3.99 (m, 1H), 3.75-3.89 (m, 1H), 3.12 (q, J=7.5 Hz, 2H), 2.67-2.76 (m, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.29-2.52 (m, 1H), 1.53 (s, 9H), 1.49 (t, J=7.5 Hz, 3H); 2Hs は観察されなかった (NH および OH).
149	MS m/z 433.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 11.71-12.29 (m, 1H), 9.28-9.39 (m, 1H), 8.66 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.77 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 6.99 (s, 1H), 4.18 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 3.84-3.94 (m, 2H), 3.18 (d, J=5.1 Hz, 2H), 2.46 (br t, J=5.1 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.24 (s, 2H).
150	MS m/z 433.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 11.71-12.29 (m, 1H), 9.28-9.39 (m, 1H), 8.66 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.77 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 6.99 (s, 1H), 4.18 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 3.84-3.94 (m, 2H), 3.18 (d, J=5.1 Hz, 2H), 2.46 (br t, J=5.1 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.24 (s, 2H).
151	MS m/z 421.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 9.41 (s, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.67 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 3.72-3.50 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 2.78 (s, 4H), 2.39 (s, 3H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
152	MS m/z 339.2 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 13.21 (s, 1H), 12.00 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.67 (s, 1H), 3.88 (s, 4H), 2.45 (s, 4H), 2.24 (s, 3H).
153	MS m/z 417.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO-d6) δ: 12.04 (s, 1H), 11.57 (s, 1H), 9.42 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.65-3.53 (m, 4H), 3.22-3.17 (m, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.64 (s, 6H).
155	MS m/z 449.5 [M+H]+; 1H NMR (DMSO- d6) δ: 12.08 (s, br, 1H), 9.35 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.56 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 4.71-4.52 (m, 2H), 3.07 (t, J = 11.5 Hz, 2H), 2.82 (t, J = 11.5 Hz, 2H), 2.71 (t, J = 12.0 Hz, 2H), 1.70-1.64 (m, 1H), 0.98 (d, J = 7.0 Hz, 6H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
157	MS m/z 431.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO- d6) δ: 12.03 (s, 1H), 9.46 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 9.18 (br s, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 4.80-4.61 (m, 2H), 4.61 (s, 3H), 3.50 (t, J = 13.0 Hz, 3H), 3.12 (t, J = 11.5 Hz, 1H), 2.71 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 1.06 (s, br, 1H), 0.73-0.64 (m, 2H), 0.55 (s, br, 1H), 0.46 (s, 1H); 3H は観察されなかった (1 OH, 2 NH).
158	MS m/z 447.4 [M+H]+; 1H NMR (DMSO- d6) δ: 11.98 (br s, 1H), 9.32 (s, 1H), 8.61 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 13.0, 1.0 Hz, 1H), 4.65 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 4.56 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 4.19 (s, 3H), 3.20-3.05 (m, 4H), 2.75 (t, J = 11.5 Hz, 1H), 2.13 (br s, 1H), 0.89-0.81 (m, 1H), 0.53-0.44 (m, 2H), 0.35-0.32 (m, 1H), 0.29-0.26 (m, 1H).

【０７６３】

（例１９）

化合物１５６の調製

【化３２】



【０７６４】

ステップ１：ＤＭＦ（２００ｍＬ）中の３－（メチルスルホニル）－１，２，４－トリアジン（３．０ｇ、１８．８ｍｍｏｌ）および（Ｓ）－２－イソプロピルピペラジンのビス－ＴＦＡ塩（７．３３ｇ、２２．６ｍｍｏｌ）を含有するフラスコに、ＮＥｔ$_3$（２６ｍＬ、１８７．０ｍｍｏｌ）を加え、反応物を室温にて１２ｈ撹拌した。溶媒を除去し、粗混合物を勾配０～３０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン（１．８ｇ、４６％収率）を、褐色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２０８．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$

【０７６５】

ステップ２：メタノール（２５ｍＬ）および水（１００ｍＬ）の混合物中の（Ｓ）－３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン（１．８ｇ、８．７ｍｍｏｌ）の溶液に、臭素（０．７ｍＬ、１３．０ｍｍｏｌ）を滴下添加し、反応物を室温にて１２ｈ撹拌した。混合物をＥｔＯＡｃと水との間で分画し、$NaHCO_3$、水およびブラインで洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗油状物を、勾配０～２５％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－６－ブロモ－３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン（１．７ｇ、６８％収率）を、濃褐色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２８６．２，２８８．２ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$

【０７６６】

ステップ３：CH_2Cl_2（１００ｍＬ）中の（Ｓ）－６－ブロモ－３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン（１．７ｇ、６．０ｍｍｏｌ）、Boc_2O（１．７ｇ、７．８ｍｍｏｌ）およびNEt_3（２．５ｍＬ、１８．０ｍｍｏｌ）を含有するフラスコに、ＤＭＡＰ（０．２ｇ、１．２ｍｍｏｌ）を加え、反応混合物を室温にて１２ｈ撹拌した。混合物を水で洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗生成物を、勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して（Ｓ）－４－（６－ブロモ－１，２，４－トリアジン－３

－イル）－２－イソプロピルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２．１ｇ、９０％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３８６．３，３８８．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７６７】

ステップ４：（Ｓ）－４－（６－ブロモ－１，２，４－トリアジン－３－イル）－２－イソプロピルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．３ｇ、３．４ｍｍｏｌ）、５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）－２－（トリブチルスタンニル）ピリジン（１．９ｇ、４．１ｍｍｏｌ）、ヨウ化銅（０．１ｇ、０．７ｍｍｏｌ）、Ｐｄ（ＰＰｈ$_3$）$_2$Ｃｌ$_2$（０．２４ｇ、０．３ｍｍｏｌ）を含有するマイクロ波バイアルに、ジオキサン（２０ｍＬ）を加え、アルゴンでパージした。バイアルをマイクロ波内で１２０℃にて１ｈ加熱した。粗混合物を濾過し、濃縮し、勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－４－（６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）－２－イソプロピルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（０．８ｇ、５１％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４７９．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７６８】

ステップ５：Ｐｄ$_2$（ｄｂａ）$_3$（０．０１ｇ、０．０１ｍｍｏｌ）、４－ＭｅｔＢｕＸＰｈｏｓ（０．０１ｇ、０．０１ｍｍｏｌ）を含有するマイクロ波バイアルに、トルエン（３．０ｍＬ）を加えた。バイアルをアルゴンでパージし、マイクロ波内で１２０℃にて１０ｍｉｎ加熱して、活性触媒を生成した。別のバイアル内で、（Ｓ）－４－（６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）－２－イソプロピルピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（０．０６ｇ、０．１ｍｍｏｌ）、トリアゾール（０．０６ｇ、０．２ｍｍｏｌ）、Ｋ$_3$ＰＯ$_4$（０．３ｇ、１．４ｍｍｏｌ）およびトルエン（３ｍＬ）を混合し、アルゴンでパージした。このバイアルに触媒溶液をシリンジで加え、次いでマイクロ波内で１２０℃にて１ｈ加熱した。溶媒を除去し、粗混合物を勾配０～１００％ＥｔＯＡｃ／ヘキサンで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－２－イソプロピル－４－（６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（０．０４ｇ、７２％収率）を、黄色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５１２．４ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７６９】

ステップ６：ＭｅＯＨ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－２－イソプロピル－４－（６－（３－（メトキシメトキシ）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－１，２，４－トリアジン－３－イル）ピペラジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（０．０４ｇ、０．０８ｍｍｏｌ）の溶液に、４．０Ｍ ＨＣｌ／ジオキサン（０．５ｍＬ）を滴下添加し、反応物を室温にて１ｈ撹拌した。混合物を濃縮し、勾配０～３０％ＭｅＯＨ／ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール（０．０２ｇ、７３％収率）を、黄色固体として得た。

【０７７０】

ＭＳ ｍ／ｚ ３６８．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ： ９．２８（ｓ，１Ｈ），８．９１（ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，１Ｈ），８．２６（ｓ，２Ｈ），７．９４（ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，１Ｈ），４．６８－４．５８（ｍ，２Ｈ），３．０７（ｔ，Ｊ＝１１．０Ｈｚ，２Ｈ），２．８３（ｔ，Ｊ＝１１．５Ｈｚ，１Ｈ），２．７１（ｔ，Ｊ＝１０．０Ｈｚ，２Ｈ），２．４０（ｓ，ｂｒ，１Ｈ），１．７１－１．６４（ｍ，１Ｈ），０．９８（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，６Ｈ）；３ＨｓはＮＨｓおよびＯＨ）．

【０７７１】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例１９に記載されている手順を使用し

て、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表２０】

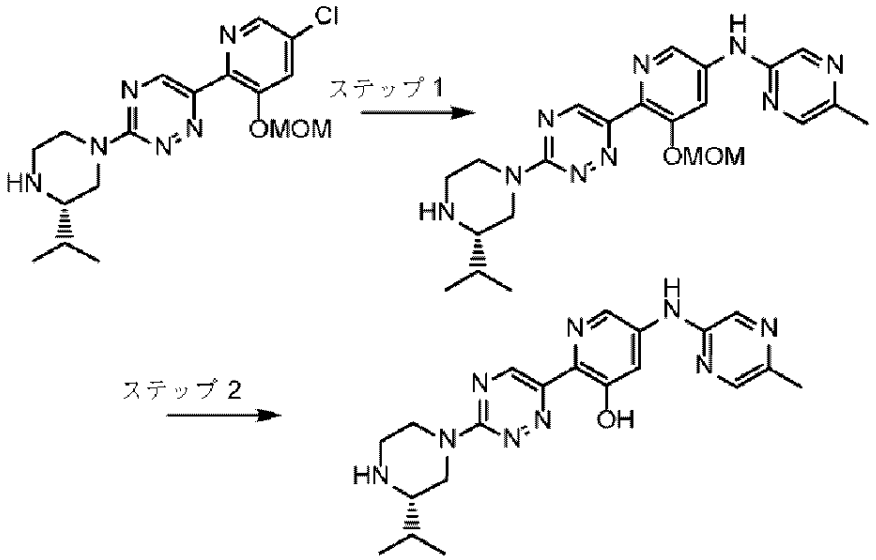
Cpd	データ
138	MS m/z 382.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO- d_6) δ: 12.29 (br s, 1H), 9.36 (s, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.64-8.80 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 6.46-6.61 (m, 1H), 4.07-4.27 (m, 3H), 3.67-3.91 (m, 3H), 2.20-2.31 (m, 1H), 1.38 (s, 9H).
144	MS m/z 410.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 9.31 (s, 1H), 8.78-9.01 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.03 (d, J=11.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.59-7.82 (m, 2H), 5.15-5.33 (m, 1H), 3.17 (s, 3H), 2.01 (t, J=13.2 Hz, 2H), 1.86 (d, J=13.2 Hz, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.45 (s, 6H).
159	MS m/z 366.4 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 12.15 (s, 1H), 9.35 (s, 1H), 9.09 (br s, 1H), 8.95 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.98 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 3.53-3.47 (m, 4H), 3.16-3.09 (m, 1H), 2.76-2.67 (m, 1H), 1.08-1.00 (m, 1H), 0.72-0.63 (m, 2H), 0.59-0.52 (m, 1H), 0.48-0.42 (m, 1H).

【０７７２】

（例２０）

化合物１５４の調製

【化３３】



【０７７３】

ステップ１：マイクロ波バイアルに（Ｓ）－６－（５－クロロ－３－（メトキシメトキシ）ピリジン－２－イル）－３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン（０．０３ｇ、０．０８ｍｍｏｌ）、５－メチルピラジン－２－アミン（０．０１ｇ、０．１３ｍｍｏｌ）、K_2CO_3（０．０４ｇ、０．２５ｍｍｏｌ）およびＢｒｅｔｔＰｈｏｓ　Ｐｄ　Ｇ３（０．０１ｇ、０．０１ｍｍｏｌ）を入れた。次いで、ｔＢｕＯＨ（２．０ｍＬ）を加え、バイアルをアルゴンでパージした。反応物をマイクロ波内で１１０℃にて１ｈ加熱した。溶媒を除去し、粗混合物を勾配０～３０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、（Ｓ）－Ｎ－（６－（３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－５－メチルピラジン－２－アミン（０．０２ｇ、６０％収率）を、濃赤色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ４５２．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７７４】
ステップ２：ＭｅＯＨ（１．０ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（６－（３－（３－イソプロピルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（メトキシメトキシ）ピリジン－３－イル）－５－メチルピラジン－２－アミン（０．０２ｇ、０．０５ｍｍｏｌ）の溶液に、４．０Ｍ　ＨＣｌ／ジオキサン（０．５ｍＬ）を滴下添加し、混合物を室温にて１ｈ撹拌した。混合物を濃縮し、勾配０～３０％ＭｅＯＨ／CH_2Cl_2で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール（０．０２ｇ、８３％収率）を、橙色固体として得た。

【０７７５】
ＭＳ　ｍ／ｚ　４０８．４　［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（メタノール－d_4）　ｄ：　９．３３（ｓ，１Ｈ），８．３７（ｓ，１Ｈ），８．１６（ｓ，１Ｈ），８．１４（ｓ，１Ｈ），８．０７（ｓ，１Ｈ），４．９２（ｄ，Ｊ＝１４．５Ｈｚ，１Ｈ），４．８１（ｄ，Ｊ＝１２．５Ｈｚ，１Ｈ），３．２７（ｔ，Ｊ＝１４．０Ｈｚ，２Ｈ），３．０２（ｔ，Ｊ＝１３．０Ｈｚ，２Ｈ），２．７６（ｔ，Ｊ＝７．５Ｈｚ，１Ｈ），２．４５（ｓ，３Ｈ），１．９０－１．８３（ｍ，１Ｈ），１．１１（ｄ，Ｊ＝７．５Ｈｚ，６Ｈ）；３Ｈは観察されなかった（２ＮＨｓおよびＯＨ）．

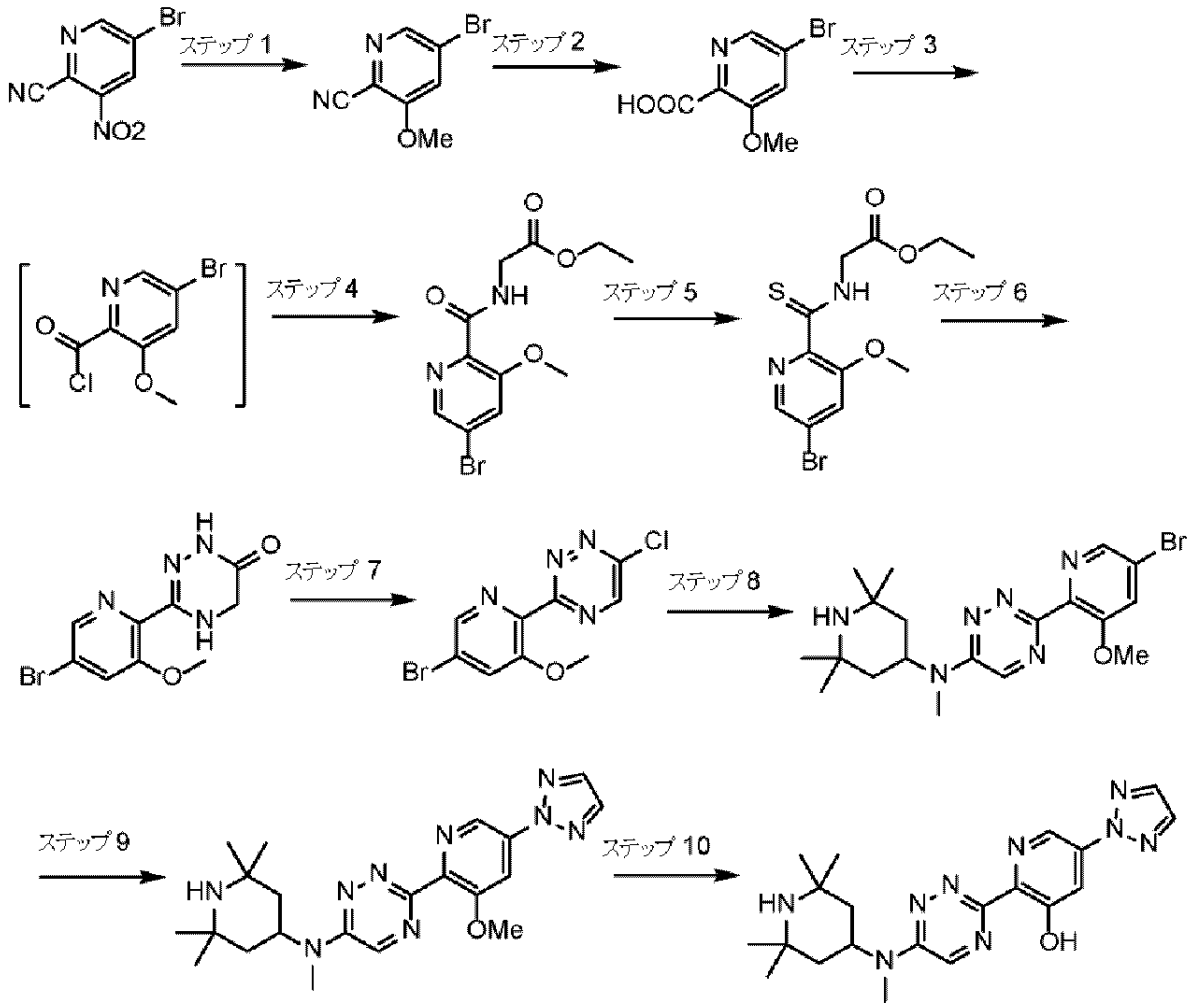
【０７７６】
本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例２０に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表２１】

Cpd	データ
160	MS m/z 406.3 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 12.02 (s, 1H), 9.87 (s, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.38 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.03 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.61 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 4.52 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 3.07 (t, J = 11.0 Hz, 2H), 2.95-2.90 (m, 1H), 2.72-2.65 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.36 (br s, 1H), 2.02-1.94 (m, 1H), 1.07 (br s, 1H), 0.85-0.76 (m, 1H), 0.49-0.42 (m, 2H), 0.32-0.23 (m, 1H).

【０７７７】
（例２１）
化合物１６１の調製

【化３４】



【０７７８】

ステップ１：ＭｅＯＨ（４００ｍＬ）中の５－ブロモ－３－ニトロ－ピリジン－２－カルボニトリル（４５ｇ、１９７．３７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＭｅＯＨ（３７５ｍＬ、２００ｍｍｏｌ、０．５ｍｏｌ／Ｌ）中のＮａＯＭｅ（０．５ｍｏｌ／Ｌ）をゆっくりと加えた。混合物を窒素下７５℃にて８時間撹拌した。溶媒を除去して粗５－ブロモ－３－メトキシピコリノニトリルを得、これを勾配０～２０％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、５－ブロモ－３－メトキシピコリノニトリル（２５．０ｇ、６０％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２１０．９，２１２．９ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７７９】

ステップ２：ＴＨＦ（２００．０ｍＬ）中の５－ブロモ－３－メトキシ－ピリジン－２－カルボニトリル（２５．０ｇ、１１７．３５ｍｍｏｌ）の溶液を、水（１００ｍＬ）中のＮａＯＨ（２０ｇ、５００．０３９ｍｍｏｌ）の溶液と混合させた。混合物を７０℃にて１２時間撹拌した。混合物を４Ｎ ＨＣｌで中和し、次いでＥｔＯＡｃで抽出した。有機相を$MgSO_4$で乾燥させ、濃縮して５－ブロモ－３－メトキシピコリン酸（２３．５ｇ、８７％収率）を得、これをさらに精製することなく次のステップで使用した。ＭＳ ｍ／ｚ ２３１．７，２３３．９ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７８０】

ステップ３およびステップ４：ＤＣＭ（６００．０ｍＬ）中の５－ブロモ－３－メトキシ－ピリジン－２－カルボン酸（３０ｇ、１２９．２９ｍｍｏｌ）の溶液に、塩化チオニル（４７ｇ、３９５．０６ｍｍｏｌ）をゆっくりと加えた。混合物を５０℃にて３ｈ撹拌し、次いで０℃まで冷却し、グリシンエチルエステル塩酸塩（２８ｇ、２００．６ｍｍｏ

ｌ）およびＥｔ$_3$Ｎ（４０ｇ、３９５．３ｍｍｏｌ）を混合物に加えた。反応物を室温にて１６ｈ撹拌し、次いで濃縮し、勾配０～２０％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、（５－ブロモ－３－メトキシピコリノニトリル）グリシン酸エチル（２７．５ｇ、６７％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３１５．０，３１７．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７８１】

ステップ５：ＴＨＦ（３００ｍＬ）中の２－［（５－ブロモ－３－メトキシ－ピリジン－２－カルボニル）アミノ］酢酸エチル（２５ｇ、７８．８３０ｍｍｏｌ）の溶液に、ラヴェッソン試薬（２７．０ｇ、６４．７５０６ｍｍｏｌ）を加えた。ＵＰＬＣが反応の完了を示すまで、混合物を６６℃にて１６ｈ撹拌した。混合物を濃縮し、勾配０～２０％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－カルボニトリル）グリシン酸エチル（１７．５ｇ、６７％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３３１．０，３３３．３ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７８２】

ステップ６：ＥｔＯＨ（３００ｍＬ）中の２－［（５－ブロモ－３－メトキシ－ピリジン－２－カルボチオイル）アミノ］酢酸エチル（３０．０ｇ、９０．０４ｍｍｏｌ）の溶液に、ヒドラジン（３０．０ｍＬ、８９８．０ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を９０℃にて５ｈ撹拌した。溶媒を除去し、粗混合物を、勾配５０～１００％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－４，５－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン－６（１Ｈ）－オン（１６．７ｇ、６５％収率）を得た。ＭＳ ｍ／ｚ ２８５．０，２８７．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７８３】

ステップ７：３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－４，５－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン－６（１Ｈ）－オン（１０．０ｇ、３５．０８ｍｍｏｌ）およびＰＯＣｌ$_3$（１００ｍＬ）を、７０℃にて２．５ｈ加熱した。その後にロータバップを用いてＰＯＣｌ$_3$を除去し、粗生成物をＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）中に溶解させ、混合物をＮａＨＣＯ$_3$水溶液で洗浄した。有機相を分離し、ＭｇＳＯ$_4$で乾燥させ、溶媒を真空下で除去した。残りをジオキサン（２００ｍＬ）中に再溶解させ、ＭｎＯ$_2$（６０ｇ、６９０．１６ｍｍｏｌ）を混合物に加えた。反応物を９０℃にて１６ｈ撹拌した。室温まで冷却した後、混合物をＣｅｌｉｔｅを通して濾過し、濾液を濃縮し、勾配５０～１００％ＥｔＯＡｃ／石油エーテルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーにより精製して、３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－６－クロロ－１，２，４－トリアジン（２．５ｇ、２４％収率）を、黄色固体として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ３００．９，３０２．９ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ： ３．８８ （ｓ，３Ｈ），８．０６ （ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，１Ｈ），８．４７ （ｄ，Ｊ＝１．６Ｈｚ，１Ｈ），９．１９ （ｓ，１Ｈ）．

【０７８４】

ステップ８：５０－ｍＬ丸底フラスコに、３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－６－クロロ－１，２，４－トリアジン（１．０ｇ、３．３ｍｍｏｌ）、Ｎ，２，２，６，６－ペンタメチルピペリジン－４－アミン（６７８ｍｇ、４．０ｍｍｏｌ）、ジイソプロピルエチルアミン（１．５ｍＬ、８．６ｍｍｏｌ）、およびＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド（１７ｍＬ）を加えた。反応物を窒素雰囲気下に置き、１１０℃にて２１時間撹拌した。反応混合物を分液漏斗に移し、ｉ－ＰｒＯＡｃ１００ｍＬおよびＨ$_2$Ｏ１００ｍＬとの間で分画した。水層をｉ－ＰｒＯＡｃ１００ｍＬで３回抽出した後、合わせた有機層を追加のｉ－ＰｒＯＡｃ１００ｍＬで希釈し、Ｈ$_2$Ｏ４００ｍＬで３回洗浄し、ブライン４００ｍＬで１回洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させた。粗物質をＣ１８クロマトグラフィー（１０～１００％Ｈ$_2$Ｏ中ＡＣＮ）により精製して、３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミンを、薄橙色固体として得た（６０３．

０ｍｇ、４３％収率）。ＭＳ ｍ／ｚ ２８５．０，２８７．０ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７８５】

ステップ９：５０－ｍＬ丸底フラスコに、Pd_2dba_3（１１ｍｇ、０．０１２ｍｍｏｌ）、２－ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィノ－３，４，５，６－テトラメチル－２′，４′，６′－トリイソプロピル－１，１′－ビフェニル（１６ｍｇ、０．０３３ｍｍｏｌ）、および脱気したトルエン（２．０ｍＬ）を加えた。反応容器を排気し、アルゴンを３回再充填し、次いでアルゴン雰囲気下１２０℃にて２分間加熱し、その間の時間で溶液を紫色から褐色に変化させた。熱源を除去し、１，２，３－トリアゾール（１６．０μＬ、０．２８ｍｍｏｌ）、三塩基性リン酸カリウム（９８ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）、および３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミン（１００ｍｇ、０．２３ｍｍｏｌ）を加えた。反応容器を排気し、アルゴンを３回再充填し、アルゴン雰囲気下１２０℃にて２時間撹拌させた。粗反応混合物をＣｅｌｉｔｅ上に直接ドライロードし、Ｃ１８クロマトグラフィー（１０～１００％H_2O中ＡＣＮ）により精製して、３－（３－メトキシ－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミンを、黄色油状物として得た（７８．０ｍｇ、８０％収率）。ＭＳ ｍ／ｚ ４２４．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$.

【０７８６】

ステップ１０：５０－ｍＬ丸底フラスコに、３－（３－メトキシ－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミン（７７．０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）およびジクロロメタン（７．５ｍＬ）を加えた。氷浴で冷却した後、窒素雰囲気下にて、ジクロロメタン（２．０ｍＬ）中の三臭化ホウ素の１Ｍ溶液を、シリンジを介してゆっくりと加えた。反応物を周囲温度まで温め、１７時間撹拌した。反応混合物を追加のジクロロメタンで希釈し、氷浴で冷却し、次いで氷の塊を数個、続いて飽和$NaHCO_3$水溶液２０ｍＬを加えた。層を分離し、水層をジクロロメタン２０ｍＬで２回抽出し、合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させた。粗物質をＣ１８クロマトグラフィー（１０～１００％H_2O中ＡＣＮ）により精製し、凍結乾燥して、２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールを黄色固体として得た（３０．０ｍｇ、４０％収率）。ＭＳ ｍ／ｚ ４１０．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－d_6） δ：８．９０－８．９７ （ｍ，１Ｈ），８．７９ （ｓ，１Ｈ），８．２６ （ｓ，２Ｈ），７．９１－７．９５ （ｍ，１Ｈ），４．９３－５．０８ （ｂｒ ｍ，１Ｈ），３．０７ （ｓ，３Ｈ），１．５４－１．６２ （ｍ，２Ｈ），１．３８－１．５４ （ｍ，２Ｈ），１．２６ （ｓ，６Ｈ），１．１１ （ｓ，６Ｈ）．

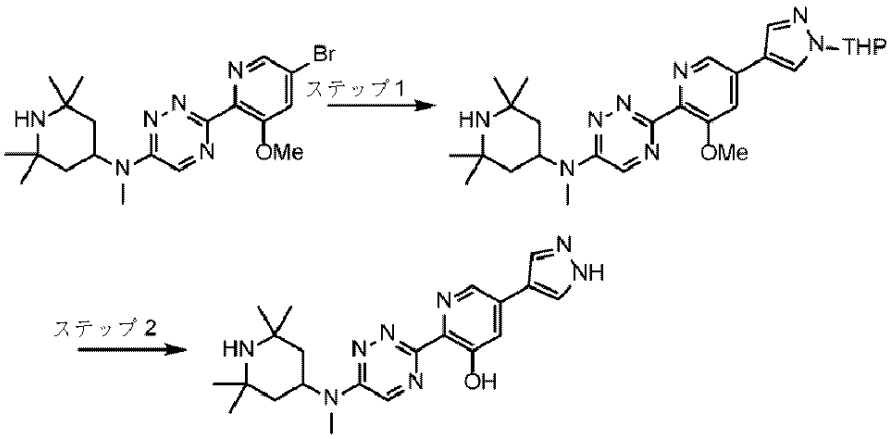
【０７８７】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例２１に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表２２】

Cpd	データ
163	MS m/z 396.5 $[M+H]^+$; ^{1}H NMR (DMSO-d_6) δ: 8.88-8.91 (m, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.24 (s, 2H), 7.88-7.92 (m, 1H), 7.84 (br d, J=7.48 Hz, 1H), 4.34 (dtd, J=11.69, 7.89, 7.89, 3.81 Hz, 1H), 1.91 (dd, J=12.13, 3.43 Hz, 2 H), 1.22 (s, 6II), 1.05 - 1.12 (m, 2II), 1.07 (s, 6II); 2IIs は欠損 (NIIs または OH).

【０７８８】
（例２２）
化合物１６２の調製
【化３５】



【０７８９】
ステップ１：５０－ｍＬ丸底フラスコに、３－（５－ブロモ－３－メトキシピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミン（１９９．１ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）、１－テトラヒドロピラン－２－イル－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）ピラゾール（１５６ｍｇ、０．５５ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（１９０．０ｍｇ、１．３７ｍｍｏｌ）、およびＰｄ（ｄｐｐｆ）Cl_2（３４．０ｍｇ、０．０４６ｍｍｏｌ）を加えた。反応容器を排気し、アルゴンを３回再充填し、次いで脱気したジオキサン（６．０ｍＬ）と水（１．５ｍＬ）を加え、反応混合物を９０℃にて２０ｈ撹拌した。粗反応混合物をＣｅｌｉｔｅ上に直接ドライロードし、Ｃ１８クロマトグラフィー（１０～１００％H_2O中ＡＣＮ）により精製して、３－（３－メトキシ－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミン（１９６ｍｇ、８５％収率）を、黄色油状物として得た。ＭＳ ｍ／ｚ ５０７．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$.

【０７９０】
ステップ２：５０－ｍＬ丸底フラスコに、３－（３－メトキシ－５－（１－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）－１，２，４－トリアジン－６－アミン（１９６ｍｇ、０．３９ｍｍｏｌ）およびジクロロメタン（１０．０ｍＬ）を加えた。氷浴で冷却した後、窒素雰囲気下にて、ジクロロメタン（２．０ｍＬ）中の三臭化ホウ素の１Ｍ溶液を、シリンジを介してゆっくりと加えた。反応物を室温にて１８ｈ撹拌した。氷浴で冷却した後、H_2O１０ｍＬを加えた。混合物を周囲温度まで温め、空気にさらして数時間勢いよく撹拌し、その後、飽和$NaHCO_3$水溶液４０ｍＬを加えた。混合物を濃縮し、ジクロロメタン中に懸濁させ、Ｃｅｌｉｔｅ上に直接ドライロードし、Ｃ１８クロマトグラフィー（１０～１００％H_2O中ＡＣＮ）により精製し、凍結乾燥して、２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールを、黄色固体として得た（５９ｍｇ、３７％収率）。ＭＳ ｍ／ｚ ４０９．５ ［Ｍ＋Ｈ］$^+$；^{1}Ｈ ＮＭＲ （ＤＭＳＯ－d_6） δ：１３．１２（ｂｒｓ，１Ｈ），１２．６２（ｂｒｓ，１Ｈ），８．７６（ｓ，１Ｈ），８．５７（ｓ，１Ｈ），８．１７－８．３７（ｂｒｍ，１Ｈ），７．６６（ｓ，１Ｈ），４．９０－５．０６（ｂｒｓ，１Ｈ），３．０５（ｓ，３Ｈ），１．５２－１．６２（ｍ，２Ｈ），１．４２－１．５０（ｍ，２Ｈ），１．２５（ｓ，６Ｈ），１．０９

（ｓ，６Ｈ）．

【０７９１】

本明細書に記載されている追加の化合物は、上の例２２に記載されている手順を使用して、適切な出発材料、適切な試薬、および反応条件を置換することにより調製することができ、以下から選択されるような化合物を得た。

【表２３】

Cpd	データ
164	MS m/z 435.4 [M+H]$^+$; ^{1}H NMR (メタノール-d$_4$) δ: 8.82 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.40 (d, J=12.5 Hz, 1H), 4.53 (br d, J=13.4 Hz, 2H), 4.28 (s, 3H), 2.93-3.18 (m, 2H), 2.74 (t, J=12.1 Hz, 2H), 1.26 (d, J=6.7 Hz, 6H); 2Hsは欠損 (NHおよびOH).

【０７９２】

生物学的実施例

以下のｉｎ　ｖｉｔｒｏ生物学的実施例は、本明細書の化合物のハンチントン病処置に対する有用性を実証する。

【０７９３】

本明細書をより詳細に説明し、理解を補助するために、以下の非限定的な生物学的実施例は、明細書の範囲をより十分に例証するように設けられており、その範囲を具体的に限定すると解釈されるべきではない。当業者が確認できる範囲内の現在公知であり得る、または後に開発され得る本明細書の変化は、本明細書の範囲内にあり、以下に請求されていると考えられる。

【０７９４】

２０１６年１２月１１日に出願された国際出願第ＰＣＴ／ＵＳ２０１６／０６６０４２号に示され、２０１５年１２月１０日に出願された米国仮出願Ｕ．Ｓ．６２／２６５，６５２号の優先権を主張する式（Ｉ）、式（ＩＩ）、または式（ＩＩＩ）の化合物は、Ｍｅｓｏ　Ｓｃａｌｅ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ（ＭＳＤ）アッセイを使用してテストし、これらの全体は、参照により本明細書に組み込む。

【０７９５】

例１で使用される内因性ハンチンチンタンパク質アッセイは、ＥＬＩＳＡに基づくＭＳＤ電気化学発光アッセイプラットフォームを使用して開発した。

【０７９６】

例１

内因性ハンチンチンタンパク質アッセイ

Ｍｅｓｏ　Ｓｃａｌｅ　Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ（ＭＳＤ）９６ウェルまたは３８４ウェルプレートは、ＰＢＳ中１μｇ／ｍＬ（ウェル当たり３０μＬ）の濃度で、ＭＷ１（伸張したポリグルタミン）またはＭＡＢ２１６６モノクローナル抗体（捕捉のため）で、４℃にて終夜コーティングした。プレートを、次いで、洗浄緩衝液３００μＬ（ＰＢＳ中０．０５％Ｔｗｅｅｎ－２０）で３回洗浄し、回転振とうさせながら、室温にて４～５時間ブロックし（ブロッキング緩衝液１００μＬ、ＰＢＳ中５％ＢＳＡ）、次いで洗浄緩衝液で３回洗浄した。

【０７９７】

試料（２５μＬ）は、抗体でコーティングしたＭＳＤプレートに移し、４℃にて終夜インキュベーションした。溶解物を除去した後で、プレートを洗浄緩衝液で３回洗浄し、２５μＬの＃５６５６Ｓ（Ｃｅｌｌ　ｓｉｇｎａｌｉｎｇ、ウサギモノクローナル）二次抗体（ブロッキング緩衝液中０．０５％Ｔｗｅｅｎ－２０中、０．２５μｇ／ｍＬに希釈した）を、各ウェルに添加し、振とうしながら、室温にて１時間インキュベーションした。二次抗体でのインキュベーションに続いて、ウェルを洗浄緩衝液ですすぎ、その後２５μ

Ｌのヤギ抗ウサギＳＵＬＦＯ　ＴＡＧ二次検出抗体（ＭＳＤ系の必要な態様）（ブロッキング緩衝液中０．０５％Ｔｗｅｅｎ－２０中、０．２５μｇ／ｍＬに希釈した）を、各ウェルに添加し、振とうしながら、室温にて１時間インキュベーションした。洗浄緩衝液で３回すすいだ後で、１５０μＬのリード緩衝液Ｔと界面活性剤（ＭＳＤ）を空の各ウェルに添加し、プレートをＳＩ　６０００　ｉｍａｇｅｒ（ＭＳＤ）で、９６または３８４ウェルプレートに添えられた製造者の説明書に従って撮像した。テストした化合物の生じたＩＣ$_{50}$値（μＭ）は、表１で示されている。

【０７９８】

表１で示されているように、本明細書に記載されているテスト化合物は、以下のＩＣ$_{50}$値を有していた。＞３μＭから≦９μＭの間のＩＣ$_{50}$値は、単一のアスタリスク（*）により指し示され、＞１μＭから≦３μＭの間のＩＣ$_{50}$値は、２つのアスタリスク（**）により指し示され、＞０．５μＭから≦１μＭの間のＩＣ$_{50}$値は、３つのアスタリスク（***）により指し示され、＞０．１μＭから≦０．５μＭの間のＩＣ$_{50}$値は、４つのアスタリスク（****）により指し示され、≦０．１μＭのＩＣ$_{50}$値は、５つのアスタリスク（*****）により指し示される。

【表２４】

表１：化合物１～１６４のＩＣ$_{50}$値（μM）

Cpd	IC50	Cpd	IC50	Cpd	IC50	Cpd	IC50
1	*****	42	***	83	****	124	*****
2	*****	43	*****	84	***	125	****
3	*****	44	*****	85	***	126	****
4	*****	45	*****	86	****	127	*****
5	*****	46	****	87	*****	128	*****
6	*****	47	*****	88	****	129	*****
7	****	48	*****	89	*****	130	***
8	*****	49	*****	90	****	131	***
9	****	50	*****	91	*****	132	*****
10	*****	51	*****	92	*****	133	*****
11	*****	52	*****	93	*****	134	***
12	*****	53	*****	94	***	135	*****
13	*****	54	*****	95	*****	136	*****
14	*****	55	*****	96	****	137	*****
15	*****	56	*****	97	*****	138	*****
16	*****	57	*****	98	*****	139	*****
17	***	58	***	99	****	140	*****
18	*****	59	*****	100	****	141	***
19	*****	60	*****	101	*****	142	*****
20	*****	61	*****	102	***	143	****
21	*****	62	*****	103	*****	144	*****
22	****	63	****	104	*****	145	*****
23	*****	64	*****	105	*****	146	*****
24	*****	65	*****	106	*****	147	****
25	*****	66	****	107	*****	148	****
26	*****	67	*****	108	***	149	*****
27	*****	68	*****	109	***	150	*****
28	*****	69	*****	110	***	151	*****
29	*****	70	*****	111	***	152	***
30	*****	71	****	112	***	153	*****
31	****	72	****	113	***	154	*****
32	*****	73	****	114	*****	155	*****
33	*****	74	*****	115	****	156	****
34	*****	75	*****	116	***	157	*****
35	*****	76	*****	117	***	158	*****
36	***	77	*****	118	*****	159	****
37	****	78	*****	119	*****	160	*****
38	*****	79	*****	120	*****	161	*****
39	*****	80	****	121	*****	162	*****
40	*****	81	*****	122	*****	163	*****
41	****	82	*****	123	*****	164	****

【０７９９】

本明細書で引用される文書が、参照により組み込まれると具体的かつ個々に指し示されているか否かにかかわらず、本明細書で言及されているすべての文書は、いずれかの、およびすべての目的に関して、個々の参照がそれぞれ本明細書で完全に明記されているのと同じように、参照により本出願に組み込まれる。

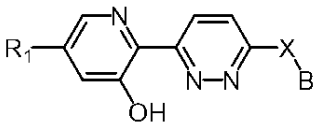
【０８００】

特許請求の範囲の主題についてここで十分に説明されているように、それが、本明細書に記載されている主題または詳細な態様の範囲に影響を与えることなく、幅広い等価物の範囲内で行われ得ることは、当業者により理解される。添付の特許請求の範囲は、そのよ

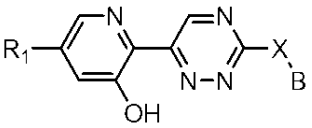
うな等価物すべてを含むよう解釈されることが意図される。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

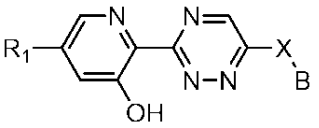
〔１〕式（Ｉ）、式（ＩＩ）、もしくは式（ＩＩＩ）の化合物、またはその形態を含む化合物であって、化合物の形態が、その塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、および混合物からなる群から選択される、前記化合物。



（Ｉ）



（ＩＩ）



（ＩＩＩ）

（式中、

ＸはＯ、ＮＲ$_x$、および結合からなる群から選択され、

Ｒ$_x$が、水素およびＣ$_{1-4}$アルキルからなる群から選択され、

Ｂは、ヘテロシクリルであり、

ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_b$置換基で置換されていてもよく、

Ｒ$_b$が、ハロゲン、Ｃ$_{1-4}$アルキル、アミノ、Ｃ$_{1-4}$アルキル－アミノ、（Ｃ$_{1-4}$アルキル）$_2$－アミノ、およびＣ$_{3-6}$シクロアルキルからなる群から独立して選択され、

Ｒ$_1$は、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロアリール－Ｃ$_{1-4}$アルキル、ヘテロアリール－Ｃ$_{2-4}$アルケニル、ヘテロアリール－アミノ、およびヘテロアリール－Ｃ$_{1-4}$アルキル－アミノからなる群から選択され、

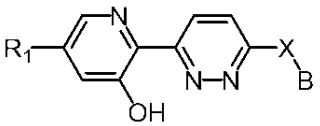
ヘテロアリールが、Ｎ、Ｏ、またはＳから独立して選択される１、２、３、または４個のヘテロ原子環員を有する３～７員環の単環式または６～１０員環の二環式環系であり、

ヘテロシクリルが、Ｎ、ＯまたはＳから独立して選択される１、２または３個のヘテロ原子環員を有する飽和または部分的不飽和３～７員環の単環式、６～１０員環の二環式または１３～１６員環の多環式環系であり、

フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルの各例が、利用できる価数により可能であれば、１または２個のＲ$_{1a}$置換基で置換されていてもよく、

Ｒ$_{1a}$が、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、重水素－Ｃ$_{1-4}$アルキル、ハロ－Ｃ$_{1-4}$アルキル、アミノ、Ｃ$_{1-4}$アルキル－アミノ、（Ｃ$_{1-4}$アルキル）$_2$－アミノ、Ｃ$_{1-4}$アルコキシ、重水素－Ｃ$_{1-4}$アルコキシ、およびハロ－Ｃ$_{1-4}$アルコキシからなる群から独立して選択される）

〔２〕化合物が、式（Ｉ）の化合物である、前記〔１〕に記載の化合物。



（Ｉ）

〔３〕Ｘが、Ｏおよび結合からなる群から選択される、前記〔１〕または〔２〕のいずれか１項に記載の化合物。
〔４〕Ｂが、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジン－１－オラート－イル、ピペラジニル、４－アザスピロ［２．５］オクタニル、８－アザビシクロ［３．２．１］オクタニル、２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタニル、１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタニル、２－オキサ－５，８－ジアザスピロ［３．５］ノナニル、および４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカニルからなる群から選択されるヘテロシクリルであり、利用できる価数により可能であれば、１、２、３、４または５個のＲ$_{b}$置換基で置換されていてもよい、前記〔１〕または〔２〕のいずれか１項に記載の化合物。
〔５〕Ｒ$_{1}$が、１Ｈ－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾリル、１，３－チアゾリル、オキサゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾリル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾリル、ピリジニル、ピリジン－２（１Ｈ）－オン－イル、ピリミジン－４（３Ｈ）－オン－イル、ピリダジニル、１Ｈ－インダゾリル、２Ｈ－インダゾリル、１，３－ベンゾオキサゾリル、ピロロ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピラジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジニル、２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、および［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジニルからなる群から選択されるヘテロアリールである、前記〔１〕または〔２〕のいずれか１項に記載の化合物。
〔６〕Ｒ$_{1}$が、１Ｈ－ピラゾリルおよび２Ｈ－インダゾリルからなる群から選択されるヘテロアリールである、前記〔５〕に記載の化合物。
〔７〕Ｒ$_{1a}$が、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、重水素－Ｃ$_{1-4}$アルキル、ハロ－Ｃ$_{1-4}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$アルコキシ、および重水素－Ｃ$_{1-4}$アルコキシからなる群から選択される、前記〔１〕または〔２〕のいずれか１項に記載の化合物。
〔８〕Ｒ$_{1a}$が、ハロゲン、Ｃ$_{1-4}$アルキル、およびＣ$_{1-4}$アルコキシからなる群から選択される、前記〔７〕に記載の化合物。
〔９〕５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール

－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－オキサゾール－２－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピ

ラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；

５－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－

イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジ

ン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；

２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；

２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－チアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３

－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（ピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（４－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；

５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－（｛６－［３－ヒドロキシ－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル］ピリダジン－３－イル｝オキシ）－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－１－イル］オキシダニル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（６，６－ジメチル－２－オキサ－５－アザスピロ［３．５］ノナン－８－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；

２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オー

ル；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（３－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ

］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（８－フルオロ－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；および
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－

イル）ピリジン－３－オール
からなる群から選択される化合物、またはその塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、もしくは混合物。
〔１０〕５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－オキサゾール－２－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；

５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）－２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ピリジン－３－オール
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリ

ジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール；
６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；
６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシ－１′－メチル［３，４′－ビピリジン］－２′（１′Ｈ）－オン；

５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（４－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－３－メチルピリミジン－４（３Ｈ）－オン；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオ

ロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３

Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ａ］ピラジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；

５－（１，３－ジメチルピロロ［１，２－ａ］ピラジン－７－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール；
６－［６－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
６－［６－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－８－カルボニトリル；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピラジン－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（^{2}Ｈ$_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
５－（６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－チアゾール－２－イル）ピリジン－３－オ

ール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（メチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（ピペ

ラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
６－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
６－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－２′－メトキシ［３，４′－ビピリジン］－５－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（４，７－ジアザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（４－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール；
［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－（｛６－［３－ヒドロキシ－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－２－イル］ピリダジン－３－イル｝オキシ）－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－１－イル］オキシダニル；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ）－３－メチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピ

リジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（６，６－ジメチル－２－オキサ－５－アザスピロ［３．５］ノナン－８－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；

２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール；および
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール
からなる群から選択される、前記〔９〕に記載の化合物、またはその塩、水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、もしくは混合物。
〔１１〕前記化合物が、
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；

５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オールニギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オールニ塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－

ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジ

ン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；

５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－

メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オールニギ酸塩；

２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールニギ酸塩；
２－｛３－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
２－（３－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（３－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝－１，２，４－トリアジン－６－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールニトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（３－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
６－（６－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－ヒドロキシピリジン－３－イル）－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－８－カルボニトリル塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（８－フルオロ－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－［３－（４－メチルピペラジン－１－イル）－１，２，４－トリアジン－６－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；

５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２－メチル－２Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；および
２－｛３－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］－１，２，４－トリアジン－６－イル｝－５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］ピリジン－３－オール塩酸塩
からなる群から選択される塩、またはその水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、もしくは混合物である、前記〔９〕に記載の化合物。
〔１２〕前記化合物が、
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［メチル（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オールギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］アミノ｝ピリダジン－３－イル）－５－｛６－［（$^{2}H_{3}$）メチルオキシ］

ピリミジン－４－イル｝ピリジン－３－オール二ギ酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二トリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１，３－オキサゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（４－アザジスピロ［２．１．２^{5}．３^{3}］デカン－９－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（ピリミジン－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩
５－（５－フルオロ－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６

－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
５－（８－エチル－２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［２－メチル－８－（トリフルオロメチル）イミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル］ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，８－ジメチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（２－メチル［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール三塩酸塩；

５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（２，４－ジメチル－１，３－ベンゾキサゾール－６－イル）－２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｒ，４Ｓ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［６－（６－｛［２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－ヒドロキシピリジン－３－イル］－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－７－カルボニトリル二塩酸塩；
２－｛６－［（５，５－ジメチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル）（メチル）アミノ］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（イミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－（６－｛［（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－１，５－ジメチル－８－アザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノ）ピロリジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチル－１，３－オキサゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（８－メトキシ－２－メチルイミダゾ［１，２－ｂ］ピリダジン－６－イル）－２－｛６－［（２，２，６，６－テトラメチルピペリジン－４－イル）オキシ］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｓ，７Ｓ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール

－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－（６－｛［（５Ｒ，７Ｒ）－５－メチル－４－アザスピロ［２．５］オクタン－７－イル］オキシ｝ピリダジン－３－イル）－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３，３，５，５－テトラメチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，４，５－トリメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－メトキシ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－［６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール塩酸塩；
２－［６－（１，６－ジアザスピロ［３．４］オクタン－６－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリジン－６－イル）ピリジン－３－オ

ール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（３－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－２－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（ピリジン－４－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－３－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－｛［（キノリン－８－イル）メチル］アミノ｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（２，５－ジアザビシクロ［２．２．１］ヘプタン－２－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（２－メチルイミダゾ［１，２－ａ］ピリミジン－６－イル）ピリジン－３－オールトリフルオロ酢酸塩；
２－［６－（３－メチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－［（ピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－エチルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－（７－フルオロ－２－メチル－２Ｈ－インダゾール－５－イル）－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－［６－（３－シクロプロピルピペラジン－１－イル）ピリダジン－３－イル］－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；

２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１－メチル－１Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（６－メチルピリジン－３－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－シクロプロピルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［１－（$^{2}H_{3}$）メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－［（Ｅ）－２－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）エテニル］ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｒ，５Ｓ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ，５Ｒ）－３，５－ジメチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（２Ｈ－インダゾール－５－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
２－｛６－［（３Ｓ）－３－エチルピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝－５－（１Ｈ－ピラゾール－４－イル）ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（５－メチルピラジン－２－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｒ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩；
５－［（２－メチルピリミジン－５－イル）アミノ］－２－｛６－［（３Ｓ）－３－（プロパン－２－イル）ピペラジン－１－イル］ピリダジン－３－イル｝ピリジン－３－オール二塩酸塩
からなる群から選択される塩、またはその水和物、溶媒和物、ラセミ化合物、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、互変異性体、もしくは混合物である、前記〔１１〕に記載の化合物。
〔１３〕有効量の前記〔１〕、〔９〕、または〔１０〕のいずれか１項に記載の化合物を対象に投与するステップを含む、ハンチントン病の処置または寛解を必要とする対象においてハンチントン病を処置または寛解するための方法。
〔１４〕化合物の有効量が、約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、前記〔１３〕に記載の方法。
〔１５〕有効量の前記〔１〕、〔９〕、または〔１０〕のいずれか１項に記載の化合物を対象に投与するステップを含む、ハンチントン病の処置または寛解を必要とする対象においてハンチントン病を処置または寛解するための前記化合物の使用。
〔１６〕化合物の有効量が、約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、前記〔１５〕に記載の使用。
〔１７〕ＨＤの処置または寛解を必要とする対象においてＨＤを処置または寛解するため

の医薬の製造における、前記〔１〕、〔９〕、または〔１０〕のいずれか１項に記載の化合物の使用であって、有効量の医薬を前記対象に投与するステップを含む、前記使用。
〔１８〕医薬における化合物の有効量が、約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、前記〔１７〕に記載の使用。
〔１９〕ハンチントン病の処置または寛解を必要とする対象においてハンチントン病を処置または寛解するための医薬組成物の調製における、前記〔１〕、〔９〕、または〔１０〕のいずれか１項に記載の化合物の使用であって、１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和した前記化合物、またはその形態の有効量を前記対象に投与するステップを含む、前記使用。
〔２０〕医薬組成物における化合物の有効量が、約０．００１ｍｇ／ｋｇ／日～約５００ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である、前記〔１９〕に記載の使用。
〔２１〕１つまたは複数の医薬として許容できる賦形剤と混和した、前記〔１〕、〔９〕、または〔１０〕のいずれか１項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

フロントページの続き

(51)国際特許分類
C07D 471/08 (2006.01)
A61K 31/5025(2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/519(2006.01)
A61K 31/4985(2006.01)
C07D 491/107(2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)

FI
C07D 471/08
A61K 31/5025
C07D 487/04 144
C07D 471/04 108A
A61K 31/519
C07D 471/04 108Z
A61K 31/4985
C07D 487/04 145
C07D 491/107
C07D 519/00 311
A61K 31/53

弁理士 市川 さつき
(74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信
(72)発明者 シドレンコ ナディヤ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５４０ プリンストン シカモア プレイス ３７
(72)発明者 アラム ラウフル
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８５４ ピスカタウェイ ノース ランドルフビル ロード ３００ ＃１２４
(72)発明者 アメゾ ルキアナ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８７３ サマセット フルトン ロード １７
(72)発明者 アーノルド マイケル エー
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８２２ フレミントン マルベリー レーン １７
(72)発明者 バブ スレシュ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５３４ ペニントン コンコード プレイス ２２５
(72)発明者 バタチャリア アヌラダ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８２０ エディソン インバーネス ドライヴ １１５
(72)発明者 カープ ギャリー ミッチェル
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５５０ プリンストン ジャンクション カートライト ドライヴ ３７
(72)発明者 ケントン ナサニエル ティー
アメリカ合衆国 マサチューセッツ州 ０２４７４ アーリントン ワシントン ストリート １８６
(72)発明者 ルオン トム トゥアン
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８５４ ピスカタウェイ アヴァロン ウェイ ２０００ アパートメント ２３０４
(72)発明者 マゾッティ アンソニー アール
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０７０６５ ローウェイ キャンベル ストリート １４２０ アパートメント ２１５
(72)発明者 ムーン ヨン チョン
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５０２ ベル ミード エッジウッド ドライヴ １１
(72)発明者 モリル クリスティ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８１２ グリーン ブルック グリーンウェイ レーン １
(72)発明者 ムスザール ニコラス ウォルター
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８９０１ ニュー ブランズウィック ジョージ ストリート ２８５ ＃９０６
(72)発明者 ナラシムハン ジャナ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０７０７６ スコッチ プレインズ ニューヨーク アベニュー ２２５７
(72)発明者 パテル ジガール エス

アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０７０９０ ウェストフィールド ジェネシー トレイル ７１
(72)発明者 レン ホンユ
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５１８ フローレンス レフラー サークル ２５６
(72)発明者 ターポフ アンソニー
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８８４４ ヒルズバラ メドーブルック ドライヴ ９４
(72)発明者 ワン ガン
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０７３０２ ジャージーシティ クリストファー コロンブス ドライブ ７０ アパートメント １００９
(72)発明者 ウォル マシュー ジー
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８０１２ ダンエレン マウンテンビュー テラス ４２０
(72)発明者 ジャン ナンジン
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５４０ プリンストン ピッカーリング サークル ４
(72)発明者 ジャン シャオヤン
アメリカ合衆国 ニュージャージー州 ０８５０２ ベル ミード リビングストン ドライヴ ７

審査官 早川 裕之
(56)参考文献 特表２０２１－５２８４６７（ＪＰ，Ａ）
特表２０１７－５３３２３７（ＪＰ，Ａ）
米国特許出願公開第２０１４／０３０３１７４（ＵＳ，Ａ１）
国際公開第２０１７／１００７２６（WO，Ａ１）
(58)調査した分野 (Int.Cl.，ＤＢ名)
Ｃ０７Ｄ
Ａ６１Ｋ ３１／
Ａ６１Ｐ
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）