(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)特許出願公表番号
特表2005-531574
(P2005-531574A)
(43)公表日　平成17年10月20日(2005.10.20)

(51)Int.Cl.[7]	F I		テーマコード（参考）
C07D 239/42	C07D 239/42	Z	4C063
A61K 31/4709	A61K 31/4709		4C065
A61K 31/501	A61K 31/501		4C086
A61K 31/505	A61K 31/505		
A61K 31/506	A61K 31/506		

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 187 頁）　最終頁に続く

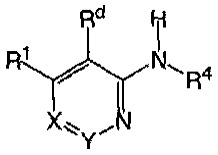
(21)出願番号　特願2004-506808 (P2004-506808)
(86)(22)出願日　平成15年5月20日 (2003.5.20)
(85)翻訳文提出日　平成17年1月18日 (2005.1.18)
(86)国際出願番号　PCT/US2003/016655
(87)国際公開番号　WO2003/099284
(87)国際公開日　平成15年12月4日 (2003.12.4)
(31)優先権主張番号　60/383,331
(32)優先日　平成14年5月22日 (2002.5.22)
(33)優先権主張国　米国 (US)

(71)出願人　500049716
アムジエン・インコーポレーテツド
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３２０－１７８９、サウザンド・オークス、ワン・アムジエン・センター・ドライブ（番地なし）
(74)代理人　100062007
弁理士　川口　義雄
(74)代理人　100113332
弁理士　一入　章夫
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100103920
弁理士　大崎　勝真

最終頁に続く

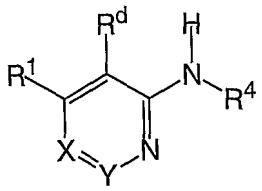
(54)【発明の名称】痛みの治療にバニロイド受容体リガンドとして使用するためのアミノ－ピリジン、－ピリジンおよびピリダジン誘導体

(57)【要約】
急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を含む皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続性痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性の領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療するためのこの一般的な構造を有する化合物およびこれらを含有する組成物。

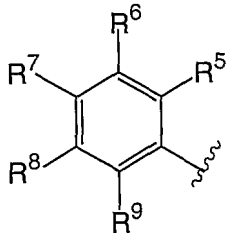


【化１５０】

【特許請求の範囲】
【請求項１】
構造
【化１】

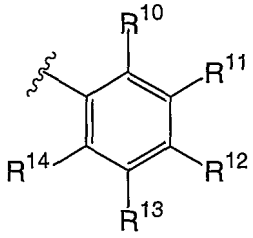


を有する化合物またはこれらの任意の医薬的に許容できる塩であって：
Ｘは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；
Ｙは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であり、ここでＸおよびＹの少なくとも１つは＝Ｎ－でなく；
ｎは独立に、各場合において、０、１または２であり、
Ｒ^{1} は
【化２】



であるか；
あるいはＲ^{1} はＲ^{5} から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されるナフチルであるか；あるいは
Ｒ^{1} はＲ^{5} から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるＲ^{b} であり；
Ｒ^{2} は、独立に、各場合においては、Ｒ^{10}、Ｒ^{10} から独立に選択される０、１または２個の置換基により置換されるＣ$_{1-8}$ アルキル、Ｒ^{10} から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換される－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$ フェニル、または
Ｎ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５または６員のヘテロ環であって、前記環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、前記ヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そして前記ヘテロ環または縮合フェニル環がＲ^{10} から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されているものであり；
Ｒ^{3} は、独立に、各場合においては、Ｈ、ハロ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-3}$ アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$ アルキル）Ｃ$_{1-3}$ アルキル、またはＣ$_{1-3}$ アルキルであり；Ｘが＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり、そしてＹが＝Ｃ（Ｒ^{3}）－である場合には、Ｒ^{2} およびＲ^{3} の少なくとも１つはＨ以外であり；
Ｒ^{4} は

【化３】



であるか；あるいは

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

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

R^5は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)NR^aR^f$、－$C(=O)NR^aR^g$、－$NR^fC(=O)R^e$、－$NR^fC(=O)R^g$、－$NR^fC(=O)NR^aR^f$、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－$S(=O)_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－$OC(=O)NR^eR^f$、R^{10}から独立に選択される０、１、２、または３個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは

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

R^6は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a

、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aまたは－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、または３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

R^7は独立に、各場合において、H、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－S（C_{1-6}アルキル）であるか；あるいは

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

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

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

R^9は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－OC（＝O）NR^aR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、または３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

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

R^{10}は独立に、各場合において、H、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（

＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択されるか；あるいは

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

Ｒ^{10}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されるＣ$_{1-4}$アルキルであり；

Ｒ^{11}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝

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

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

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

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

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

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

R^{12}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$$NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）$NR^aR^a$、－$NR^aR^a$、－N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）$NR^aR^a$、－N（$R^a$）C（＝$NR^a$）$NR^aR^a$、－N（$R^a$）S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）S（＝O）$_2$$NR^aR^a$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択される０、１、２または３個の基により置換されるC_{1-4}アルキルであり；ここで、R^{11}またはR^{13}がCF_3である場合には、R^{12}はFではなく；あるいは

R^{11}およびR^{12}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが２以下である限り、N、OおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋であって、前記架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^aR^f

、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＲ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}、－ＳＲ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}および－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}から選択される０、１または２個の置換基により置換されているものであり；ここで、Ｒ^{3}がＮＨ$_{2}$である場合には、－Ｒ^{11}－Ｒ^{12}は－Ｃ＝Ｃ－Ｃ＝Ｎ－またはこれらのいかなる置換物でもなく；

Ｒ^{13}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択されるか；あるいは

Ｒ^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６または７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０または１１員の二環式の環であって、前記環が０または１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する０または１個の飽和あるいは不飽和の５、６または７員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が０、１または２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されているか；あるいは

Ｒ^{13}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ

）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであり；

Ｒ^{14}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}に選択されるか；あるいは

Ｒ^{14}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６または７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０または１１員の二環式の環であって、前記環が０または１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する０または１個の飽和あるいは不飽和の５、６または７員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が０、１または２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されているか；あるいは

Ｒ^{14}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a

から選択される０、１、２または３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルであり；ここで、R^{10}、R^{11}、R^{12}、R^{13}およびR^{14}の少なくとも１つはH以外であり；

R^aは独立に、各場合において、H、フェニル、ベンジルまたはC_{1-6}アルキルであり；

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

ジアザペルヒドロイン、１，２，５－チアジアザペルヒドロイン、１，３，４－オキサジアザペルヒドロイン、１，４，３－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，２－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，６－テトラヒドロピラジン、１，２，３，４－テトラヒドロピラジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、１，２，３，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，３，５］トリアジン、２，３，４，５－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，４，５，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、４，５－ジヒドロピリジン、１，６－ジヒドロピリジン、５，６－ジヒドロピリジン、２Ｈ－ピラン、２Ｈ－チイン、３，６－ジヒドロピリジン、２，３－ジヒドロピリダジン、２，５－ジヒドロピリダジン、４，５－ジヒドロピリダジン、１，２－ジヒドロピリダジン、２，３－ジヒドロピリミジン、２，５－ジヒドロピリミジン、５，６－ジヒドロピリミジン、３，６－ジヒドロピリミジン、４，５－ジヒドロピラジン、５，６－ジヒドロピラジン、３，６－ジヒドロピラジン、４，５－ジヒドロピラジン、１，４－ジヒドロピラジン、１，４－ジチイン、１，４－ジオキシン、２Ｈ－１，２－オキサジン、６Ｈ－１，２－オキサジン、４Ｈ－１，２－オキサジン、２Ｈ－１，３－オキサジン、４Ｈ－１，３－オキサジン、６Ｈ－１，３－オキサジン、２Ｈ－１，４－オキサジン、４Ｈ－１，４－オキサジン、２Ｈ－１，３－チアジン、２Ｈ－１，４－チアジン、４Ｈ－１，２－チアジン、６Ｈ－１，３－チアジン、４Ｈ－１，４－チアジン、２Ｈ－１，２－チアジン、６Ｈ－１，２－

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

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

R^cはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５または６員のヘテロ環であって、前記環構成員の２以下はＯまたはＳであり、前記ヘテロ環はフェニル環と場合によっては縮合し、そして前記ヘテロ環の炭素原子は０、１または２個のオキソ基により置換され、前記ヘテロ環または縮合フェニル環はハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-3}ハロアルキル、－OR^aおよび－NR^aR^aから選択される０、１、２または３個の置換基により置換されるものであり；

R^dは水素または－CH_3であり；

R^eは独立に、各場合においては、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）R^b、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）R^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２、３または４個の置換基により置換されるC_{1-9}アルキルであって；そして前記C_{1-9}アルキルはR^gから独立に選択される０または１個の基により更に置換されているものであり；

R^fは独立に、各場合においては、R^eまたはＨであり；

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

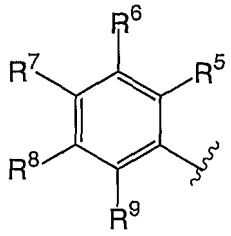
【請求項２】

Ｘは＝Ｎ－であり；

Ｙは＝Ｃ（R^3）－であり；

R^1は

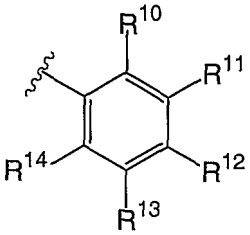
【化４】



であり；

R^4は

【化５】



であるか；あるいは

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

R^7は独立に、各場合において、C_{3-5}アルキルまたはC_{1-2}ハロアルキルであり；

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

（R^f）S（＝O）$_2$$NR^aR^f$、－$NR^fC_{2-6}$アルキル$NR^aR^f$および－$NR^fC_{2-6}$アルキル$OR^f$から選択される０、１、２または３個の置換基により置換されているか；あるいは代替としては

R^{11}およびR^{12}は一緒になって、－Ｏ－Ｃ－Ｃ－Ｏ－、－Ｎ－Ｃ－Ｃ－Ｃ－および－Ｎ＝Ｃ－Ｃ＝Ｃ－から選択される－R^{11}－R^{12}－架橋を形成するものであって、前記架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^c、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される０、１または２個の置換基により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

（１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インダゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－６－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イル）アミン；

（１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］アミン；

（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－（６－フェニルピリミジン－４－イル）アミン；

（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル）アミン；

（２－クロロピリジン－３－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－クロロキノリン－８－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－メトキシキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］－アミン；

（２－メチルアミノキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル

）ピリミジン－４－イル］アミン二ヒドロクロリド；
（２－メチルベンゾチアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（２Ｒ）－｛６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２Ｈ，３Ｈ－ベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル｝メタノール；
（３，４－ジクロロフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３，４－ジメチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－クロロ－２－メチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メタンスルホニルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メチルベンゾ［ｄ］イソチアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メチルスルファニルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（４－クロロ－３－トリフルオロメチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（４－クロロフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（５，６，７，８－テトラヒドロ［１，８］ナフチリジン－２－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（５－クロロ－２－メチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（６－メトキシピリジン－３－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
［（２－モルホリン－４－イル）キノリン－７－イル］－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン塩酸塩；
［２－アミノ－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン塩酸塩；
［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニル－ピリダジン－３－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）－アミン；
［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（２－アミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－６－イルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－クロロピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－４－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベン

ゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（３－メトキシフェニル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ナフタレン－１－イルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］フェニルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニルピリミジン－４－イル）キノリン－３－イルアミン；
｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
｛７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－イル｝メタノール；
｛スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
１－｛３，３－ジメチル－６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２，３－ジヒドロインドール－１－イル｝エタノン；
２－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－８－オール；
２－｛５－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ピリジン－２－イルオキシ｝エタノール；
３，４－ジヒドロ－７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－キノリン－２－オン；
４－メチル－７－｛［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミノ｝キノリン－２－オール，塩酸塩；
６－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ナフタレン－１－オン；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イルアミノ］－１，３－ジヒドロインドール－２－オン；
ベンゾチアゾール－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５，６－ビス－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－シクロヘキシルメチルアミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－ナフチル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－フルオロフェニル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－フェニル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－３－イル－５－（４－トリフルオロメ

チルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－４－イル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル｝アセトアミド；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ベンゾチアゾール－２－イル｝アセトアミド；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］フェニル｝アセトアミド；
N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２，４－ジアミン；
N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン；
N^4－ベンゾチアゾール－６－イル－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－２，４－ジアミン塩酸塩；
N^7－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，７－ジアミン；
N^8－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，８－ジアミン；
ナフタレン－１－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ナフタレン－２－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｏ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
フェニル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｐ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－３－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－８－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；および
キノリル－７－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
から選択される、請求項１に記載の化合物。

【請求項４】
請求項１、２または３のいずれか一項に記載の化合物および医薬的に許容できる希釈剤あるいはキャリアを含む医薬組成物。

【請求項５】
請求項１、２または３のいずれか一項に記載の化合物の医薬としての使用。

【請求項６】
急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を含む皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性の痛みおよび関連の痛覚過敏およ

び異痛症、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続性痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性の領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療するための医薬の製造における、請求項１、２あるいは３のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項７】

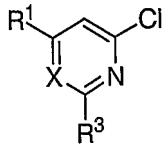
炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、および交感神経性持続性痛みを治療するための医薬の製造における、請求項１、２または３のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項８】

急性、炎症性および神経因性の痛みを治療するための医薬の製造における、請求項１、２または３のいずれか一項に記載の化合物の使用。

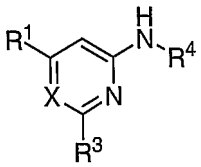
【請求項９】

【化６】



とＲ^{4}ＮＨ$_{2}$とを反応させて、

【化７】



を形成する工程を含む、請求項１に記載の化合物を製造する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

本出願は、参照して本明細書に組み込まれる２００２年５月２２日出願の米国特許仮出願第６０／３８３，３３１号の利益を主張する。

【背景技術】

【０００２】

このバニロイド受容体１（ＶＲ１）はトウガラシの実中の活性成分のカプサイシンの分子標的である。ＪｕｌｉｕｓらはＶＲ１の分子クローニングを報告した（Ｃａｔｅｒｉｎａら、１９９７）。ＶＲ１は、カプサイシンおよびレジニフェラトキシン（外因性活性化物質）、熱および酸刺激および脂質二重代謝の生成物、アナンダアミド（Ｐｒｅｍｋｕｍａｒら，２０００，Ｓｚａｂｏら，２０００，Ｇａｕｌｄｉｅら，２００１，Ｏｌａｈら，２００１）およびリポキシゲナーゼ代謝産物（Ｈｗａｎｇら，２０００）を含む一連の異なる刺激により活性化されるか、あるいは高感度化される非選択性のカチオンチャンネルである。ＶＲ１はラット、マウスおよびヒトにおける一次感覚ニューロン（Ｃａｔｅｒｉｎａら，１９９７）中で高度に発現される（Ｏｎｏｚａｗａら，２０００，Ｍｅｚｅｙら，２０００，Ｈｅｌｌｉｗｅｌｌら，１９９８，Ｃｏｒｔｒｉｇｈｔら，２００１）。これらの感覚ニューロンは真皮、骨、膀胱、胃腸管および肺を含む多くの内臓器官を刺激

する；ＶＲ１は、また、これらに限定されるものではないが、ＣＮＳ核、腎臓、胃およびＴ－細胞（Ｎｏｚａｗａら，２００１，Ｙｉａｎｇｏｕら，２００１，Ｂｉｒｄｅｒら，２００１）を含む他のニューロンおよび非ニューロン組織中でも発現される。恐らく、これらの種々の細胞および器官における発現は、細胞シグナル伝達および細胞分割などのこれらの基本的な性質に寄与し得る。

【０００３】

ＶＲ１の分子クローニングに先立ち、カプサイシンについての実験はカプサイシン敏感性受容体が存在し、これがヒト、ラットおよびマウスにおける感覚ニューロンの活性を増大させることができることを示した（Ｈｏｌｚｅｒ，１９９１；Ｄｒａｙ，１９９２，Ｓｚａｌｌａｓｉ ａｎｄ Ｂｌｕｍｂｅｒｇ １９９６，１９９９）。ヒトにおけるカプサイシンによる急性活性化の結果は、注射部位における痛みおよび他の種における感覚刺激に対する行動感受性の増加であった（Ｓｚａｌｌａｓｉ ａｎｄ Ｂｌｕｍｂｅｒｇ，１９９９）。ヒトの皮膚へのカプサイシン塗布は、神経因性痛みのヒトの状態の２つの特徴的な徴候（Ｈｏｌｚｅｒ，１９９１）である、投与部位における熱および痛みの知覚のみならず、痛覚過敏および異痛症の広い領域によっても特徴付けられる痛みを伴う反応を引き起こす。合わせて考えると、ＶＲ１の活性の増大が痛み状態の確立および維持において著しい役割を演じるようである。カプサイシンの局所的あるいは皮膚内注射も局所化された血管拡張および浮腫生成を生じることが示された（Ｓｚａｌｌａｓｉ ａｎｄ Ｂｌｕｍｂｅｒｇ １９９９，Ｓｉｎｇｈら、２００１）。この証拠はカプサイシンがＶＲ１の活性化により感覚神経の求心性および遠心性の機能を調整することができるということを示す。それゆえ、疾患における感覚神経の関与は、このバニロイド受容体の機能に影響を及ぼして、感覚神経の活性を増加あるいは減少させる分子により改変可能である。

【０００４】

ＶＲ１遺伝子ノックアウトマウスは、熱および酸刺激に対する低下した感覚感度を有することが示された（Ｃａｔｅｒｉｎａら、２０００））。このことは、ＶＲ１が痛み応答の生成（すなわち、熱、酸またはカプサイシン刺激により）のみならず、感覚神経の基礎的な活性の維持にも寄与するという概念を支持する。この証拠は、疾患におけるカプサイシン敏感性神経の関与を示す研究と一致する。継続するカプサイシン刺激によりヒトおよび他の種における一次の感覚神経を不活性とすることができる。このパラダイムは、受容体活性化誘起によるこの一次の感覚神経の脱感作を引き起こす－インビボでの感覚神経活性のこのような低下は被験者を引き続く痛みを伴う刺激に対して低感度とせしめる。この点で、カプサイシンおよびレジニフェラトキシン（ＶＲ１の外因性活性化物質）の両方は脱感作を生じ、そして疾患のインビボモデルの概念研究の多くの証明に使用されてきた（Ｈｏｌｚｅｒ，１９９１，Ｄｒａｙ １９９２，Ｓｚａｌｌａｓｉ ａｎｄ Ｂｌｕｍｂｅｒｇ １９９９）。

【０００５】

ＶＲ１作用薬あるいは拮抗薬は、種々の起源または原因の痛み、例えば急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛および頭痛、特に血管性頭痛、例えば片頭痛、群発性頭痛および混合血管性症候群並びに非血管性の緊張性頭痛を治療するための鎮痛薬としての使用を有する。これらは、また、炎症性疾患または状態の治療、例えば関節炎およびリューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害（例えばブドウ膜炎）、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害（例えば膀胱炎および尿失禁）、乾癬および炎症性成分を伴う皮膚愁訴、並びに他の慢性炎症性状態の治療のための抗炎症性剤としても有用である。これらは、炎症性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症の治療において特に有用である。これらは、また、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、例えば三叉神経痛または疱疹性神経痛、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続痛みおよび上腕神経叢裂離などの求心路遮断症候群の治療においても特に有用である。これらは、また、喘息、上皮性組織損傷または機能障害、例えば突発性病変、単純ヘルペスの予防または治療における使用、および例えば創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症および白斑の治療のための、胃腸障害、例えば胃潰瘍、十二指腸潰瘍、炎症性腸疾患および下痢、壊死性

剤、例えばエタノールまたは化学療法剤により誘起される胃病変、毛髪成長の予防または治療のための、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎の治療のための、そして気管支障害または膀胱反射亢進などの膀胱障害の治療のための呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管における内臓運動性障害のコントロールにおける使用にも指示される。

【０００６】

参考文献一覧

Ｂｉｒｄｅｒ－ＬＡ．Ｋａｎａｉ－ＡＪ．ｄｅ－Ｇｒｏａｔ－ＷＣ．Ｋｉｓｓ－Ｓ．Ｎｅａｌｅｎ－ＭＬ．Ｂｕｒｋｅ－ＮＥ．Ｄｉｎｅｌｅｙ－ＫＥ．Ｗａｔｋｉｎｓ－Ｓ．Ｒｅｙｎｏｌｄｓ－ＩＪ．Ｃａｔｅｒｉｎａ－ＭＪ．（２００１）「バニロイド受容体発現は膀胱上皮細胞に対する感覚役割を示唆する」ＰＮＡＳ９８：２３：１３３９６－１３４０１。

【０００７】

Ｃａｔｅｒｉｎａ，Ｍ．Ｊ，Ｓｃｈｕｍａｃｈｅｒ，Ｍ．Ａ．，Ｔｏｍｉｎａｇａ，Ｍ．，Ｒｏｓｅｎ，Ｔ．Ａ．，Ｌｅｖｉｎｅ，Ｊ．Ｄ．，ａｎｄＪｕｌｉｕｓ，Ｄ，（１９９７）．「カプサイシン受容体：痛み経路における熱活性化されたイオンチャンネル」Ｎａｔｕｒｅ３８９：８１６－８２４。

【０００８】

Ｃａｔｅｒｉｎａ－ＭＪ．Ｌｅｆｆｌｅｒ－Ａ．Ｍａｌｍｂｅｒｇ－ＡＢ．Ｍａｒｔｉｎ－ＷＪ．Ｔｒａｆｔｏｎ－Ｊ．Ｐｅｔｅｒｓｅｎ－Ｚｅｉｔｚ ＫＲ．Ｋｏｌｔｚｅｎｂｕｒｇ－Ｍ．Ｂａｓｂａｕｍ－ＡＩ．Ｊｕｌｉｕｓ－Ｄ（２０００）「カプサイシン受容体を欠くマウスにおける傷害受容性および痛み知覚性の障害」Ｓｃｉｅｎｃｅ（ＷＡＳＨ－ＤＣ）。２８８：５４６４：３０６－３１３。

【０００９】

Ｃｏｒｔｒｉｇｈｔ－ＤＮ．Ｃｒａｎｄａｌｌ－Ｍ．Ｓａｎｃｈｅｚ－ＪＦ．Ｚｏｕ－Ｔ．Ｋｒａｕｓｅ－ＪＥ．Ｗｈｉｔｅ－Ｇ（２００１）「ヒトＶＲ１の組織分布および機能特性化」Ｂｉｏｃｈｅｍｉｃａｌ ａｎｄ Ｂｉｏｐｈｙｓｉｃａｌ Ｒｅｓｅａｒｃｈ Ｃｏｍｍｕｎｉｃａｔｉｏｎｓ ２８１：５：１１８３－１１８９。

【００１０】

Ｄｒａｙ，Ａ．，（１９９２）「カプサイシン様分子の治療潜在性」Ｌｉｆｅ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ ５１：１７５９－１７６５。

【００１１】

Ｇａｕｌｄｉｅ－ＳＤ．ＭｃＱｕｅｅｎ－ＤＳ．Ｐｅｒｔｗｅｅ－Ｒ．Ｃｈｅｓｓｅｌｌ－ＩＰ．（２００１）「アナンダミドは正常および関節炎のラットの膝関節における末梢傷害受容器を活性化する」Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ１３２：３：６１７－６２１。

【００１２】

Ｈｅｌｌｉｗｅｌｌ－ＲＪＡ．ＭｃＬａｔｃｈｉｅ－ＬＭ．Ｃｌａｒｋｅ－Ｍ．Ｗｉｎｔｅｒ－Ｊ．Ｂｅｖａｎ－Ｓ．ＭｃＩｎｔｙｒｅ－Ｐ（１９９８）「カプサイシン感度は成熟ラット感覚神経節におけるバニロイド（カプサイシン）受容体（ＶＲ１）ｍＲＮＡの発現と対応する」Ｎｅｕｒｏｓｃｉｅｎｃｅ Ｌｅｔｔ．２５０：３：１７７－１８０。

【００１３】

Ｈｏｌｚｅｒ，Ｐ．（１９９１）「カプサイシン：細い感覚ニューロンに対する細胞標的，作用機構および感度」Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｉｃａｌ Ｒｅｖｉｅｗｓ ４３：２：１４３－２０１。

【００１４】

Ｈｗａｎｇ－ＳＷ．Ｃｈｏ－Ｈ．Ｋｗａｋ－Ｊ．Ｌｅｅ－ＳＹ．Ｋａｎｇ－ＣＪ．Ｊｕｎｇ－Ｊ．Ｃｈｏ－Ｓ．Ｍｉｎ－ＫＨ．Ｓｕｈ－ＹＧ．Ｋｉｍ－Ｄ．Ｏｈ－Ｕ．（２０００）「リポキシゲナーゼの生成物によるカプサイシン受容体の直接活性化：内因性カプサイシン様物質」ＰＮＡＳ ９７：１１：６１５５－６１６０。

【００１５】

Ｍｅｚｅｙ－Ｅ．Ｔｏｔｈ－ＺＥ．Ｃｏｒｔｒｉｇｈｔ－ＤＮ．Ａｒｚｕｂｉ－ＭＫ．Ｋｒａｕｓｅ－ＪＥ．Ｅｌｄｅ－Ｒ．Ｇｕｏ－Ａ．Ｂｌｕｍｂｅｒｇ－ＰＭ．Ｓｚａｌｌａｓｉ－Ａ（２０００）「ラットおよびヒトの中枢神経系におけるバニロイド受容体サブタイプ１（ＶＲ１）に対するｍＲＮＡの分布およびＶＲ１様免疫活性」ＰＮＡＳ　９７：７：３６５５－３６６０。

【００１６】

Ｎｏｚａｗａ－Ｙ．Ｎｉｓｈｉｈａｒａ－Ｋ．Ｙａｍａｍｏｔｏ－Ａ．Ｎａｋａｎｏ－Ｍ．Ａｊｉｏｋａ－Ｈ．Ｍａｔｓｕｕｒａ－Ｎ．（２００１）「ラット腹中のバニロイド受容体の分布および特性化」Ｎｅｕｒｏｓｃｉｅｎｃｅ　Ｌｅｔｔｅｒｓ　３０９：１：３３－３６。

【００１７】

Ｏｌａｈ－Ｚ．Ｋａｒａｉ－Ｌ．Ｉａｄａｒｏｌａ－ＭＪ．（２００１）「アナンダミドは後根神経節ニューロンおよびＶＲ１を異所的に発現する細胞中で酸性ｐＨでバニロイド受容体１（ＶＲ１）を活性化する」Ｊｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ｂｉｏｌｏｇｉｃａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　２７６：３３，３１１６３－３１１７０。

【００１８】

Ｏｎｏｚａｗａ－Ｋ．Ｎａｋａｍｕｒａ－Ａ．Ｔｓｕｔｓｕｍｉ－Ｓ．Ｙａｏ－Ｊ．Ｉｓｈｉｋａｗａ－Ｒ．Ｋｏｈａｍａ－Ｋ．（２０００）「ラットの種々の器官中でのカプサイシン受容体の組織分布」Ｐｒｏｃ．Ｊｐｎ．Ａｃａｄ．Ｓｅｒ．Ｂ，Ｐｈｙｓ．－Ｂｉｏｌ．Ｓｃｉ．７６：５：６８－７２。

【００１９】

Ｐｒｅｍｋｕｍａｒ－ＬＳ．Ａｈｅｒｎ－ＧＰ．（２０００）「プロテインキナーゼＣによるバニロイド受容体チャンネル活性の誘導」Ｎａｔｕｒｅ（Ｌｏｎｄｏｎ）４０８：６８１５：９８５－９９０。

【００２０】

Ｓｉｎｇｈ－ＬＫ．Ｐａｎｇ－Ｘ．Ａｌｅｘａｃｏｓ－Ｎ．Ｌｅｔｏｕｒｎｅａｕ－Ｒ．Ｔｈｅｏｈａｒｉｄｅｓ－ＴＣ．（１９９９）「急性固定化ストレスは皮膚巨大細胞脱顆粒ビアコルチコトロピン放出ホルモン，ニューロテンシン，および物質Ｐの引き金を引く：神経因性皮膚障害への関連」Ｂｒａｉｎ　Ｂｅｈａｖ．Ｉｍｍｕｎ．１３：３：２２５－２３９。

【００２１】

Ｓｚａｌｌａｓｉ，Ａ．Ｂｌｕｍｂｅｒｇ－ＰＭ（１９９６）「バニロイド受容体：新しい洞察は治療標的としての潜在力を増強する」Ｐａｉｎ　６８：１９５－２０８。

【００２２】

Ｓｚａｌｌａｓｉ－Ａ．Ｂｌｕｍｂｅｒｇ－ＰＭ．（１９９９）「バニロイド（カプサイシン）受容体および機構」Ｐｈａｒｍａｃｏｌ．Ｒｅｖ．５１：２：１５９－２１１。

【００２３】

Ｓｚａｂｏ－Ｔ．Ｗａｎｇ－Ｊ．Ｇｏｎｚａｌｅｚ－Ａ．Ｋｅｄｅｉ－Ｎ．Ｌｉｌｅ－Ｊ．Ｔｒｅａｎｏｒ－Ｊ．Ｂｌｕｍｂｅｒｇ－ＰＭ．（２０００）「ヒトバニロイド受容体タイプ－１（ｈＶＲ１）の薬理学的特性化」Ｓｏｃｉｅｔｙ　ｆｏｒ　Ｎｅｕｒｏｓｃｉｅｎｃｅ　Ａｂｓｔｒａｃｔｓ．２６：１－２：６３４．１８。

【００２４】

Ｔｏｍｉｎａｇａ，Ｍ．，Ｃａｔｅｒｉｎａ，Ｍ．Ｊ．，Ｍａｌｍｂｅｒｇ，Ａ．Ｂ．，Ｒｏｓｅｎ，Ｔ．Ａ．，Ｇｉｌｂｅｒｔ，Ｈ．，Ｓｋｉｎｎｅｒ，Ｋ．，Ｒａｕｍａｎｎ，Ｂ．Ｅ．，Ｂａｓｂａｕｍ，Ａ．Ｉ．，ａｎｄ　Ｊｕｌｉｕｓ，Ｄ．，（１９９８）「クローン化カプサイシン受容体は多数の痛みを生む刺激を集積化する」Ｎｅｕｒｏｎ　２１：５３１－５４３。

【００２５】

Ｙｉａｎｇｏｕ－Ｙ．Ｆａｃｅｒ－Ｐ．Ｄｙｅｒ－ＮＨＣ．Ｃｈａｎ－ＣＬＨ．Ｋｎｏｗｌｅｓ－Ｃ．Ｗｉｌｌｉａｍｓ－ＮＳ．Ａｎａｎｄ－Ｐ．（２００１）「炎症性ヒト腸

におけるバニロイド受容体１免疫活性」Ｌａｎｃｅｔ（Ｎｏｒｔｈ Ａｍｅｒｉｃａｎ Ｅｄｉｔｉｏｎ）３５７：９２６５：１３３８－１３３９。

【００２６】

Ｙｉａｎｇｏｕ－Ｙ．Ｆａｃｅｒ－Ｐ．Ｆｏｒｄ－Ａ．Ｂｒａｄｙ－Ｃ．Ｗｉｓｅｍａｎ－Ｏ．Ｆｏｗｌｅｒ－ＣＪ．Ａｎａｎｄ－Ｐ．（２００１）「ヒト膀胱におけるカプサイシン受容体ＶＲ１およびＡＴＰによりゲーティングされたイオンチャンネルＰ２Ｘ３」ＢＪＵ Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ ８７：９：７７４－７７９。

【００２７】

Ｗａｎｇ－Ｈ．Ｂｉａｎ－Ｄ．Ｚｈｕ－Ｄ．Ｚａｊｉｃ－Ｇ．Ｌｏｅｌｏｆｆ－Ｒ．Ｌｉｌｅ－Ｊ．Ｗｉｌｄ－Ｋ．Ｔｒｅａｎｏｒ－Ｊ．Ｃｕｒｒａｎ－Ｅ．（２０００）「ラット脊髄およびＤＲＧ中のＶＲ１の炎症誘導アップレギュレーションは侵害受容性処理の増進と相関関係がある」Ｓｏｃｉｅｔｙ ｆｏｒ Ｎｅｕｒｏｓｃｉｅｎｃｅ Ａｂｓｔｒａｃｔｓ ２６：１－２：６３２．１５。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【００２８】

本発明は、バニロイド受容体仲介疾患および他の疾病、例えば炎症性あるいは神経因性の痛みおよび感覚神経機能に関与する疾患、例えば喘息、リューマチ性関節炎、変形性関節炎、炎症性腸障害、尿失禁、片頭痛および乾癬などの疾患の治療に有用な新しいクラスの化合物を含む。特に、本発明の化合物は、急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性膀胱障害、乾癬、炎症性成分を伴う皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性の持続痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷または機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性領域での内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害の治療に有用である。したがって、本発明は、また、この化合物を含む医薬組成物、この化合物および本発明の組成物を用いて、バニロイド受容体仲介疾患、例えば炎症性あるいは神経因性の痛み、喘息、リューマチ性関節炎、変形性関節炎、炎症性腸障害、尿失禁、片頭痛および乾癬疾患を治療するための方法、および本発明の化合物の製剤に有用な中間体および方法も含む。

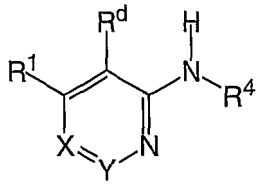
【課題を解決するための手段】

【００２９】

本発明の化合物は、次の一般的な構造

【００３０】

【化８】



またはこれらの医薬的に許容できる塩により表される。ここで、Ｒ^{1}、Ｒ^{4}、Ｒ^{d}、ＸおよびＹは下記に定義されるものである。

【００３１】

上記の記載は本発明のある側面を単に要約するものであり、そして本発明をどのような方法によっても限定するように意図され、あるいは解釈されるべきものでない。本明細書

中で挙げられたすべての特許、特許出願および他の出版物は、参照により本明細書に全体で組み込まれる。

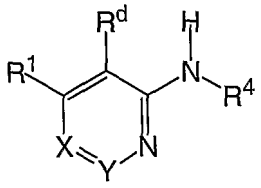
【発明を実施するための最良の形態】

【００３２】

本発明の一つの側面は一般的な構造

【００３３】

【化９】



を有する化合物またはこれらの任意の医薬的に許容できる塩に関する：

ここで、

Ｘは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；

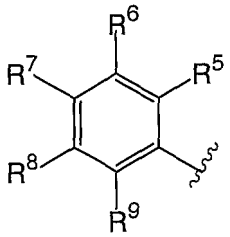
Ｙは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であり、ここでＸおよびＹの少なくとも１つは＝Ｎ－でなく；

ｎは独立に、各場合において、０、１または２であり

Ｒ^{1}は

【００３４】

【化１０】



であるか；あるいは

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

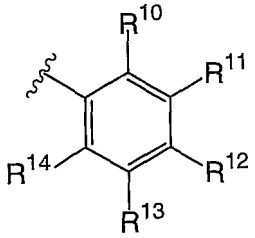
Ｒ^{2}は、独立に、各場合においては、Ｒ^{10}、Ｒ^{10}から独立に選択される０、１または２個の置換基により置換されるＣ$_{1-8}$アルキル、Ｒ^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換される－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$フェニル、またはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、このヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そしてこのヘテロ環または縮合フェニル環がＲ^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されているものであり；

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

Ｒ^{4}は

【００３５】

【化１１】



であるか；あるいは

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

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

R^5は独立に、各場合において、Ｒ^f、Ｒ^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－ＯＲ^e、－ＯＲ^g、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－ＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｒ^g、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、ナフチル、－ＣＯ$_2$Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^f、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^g、－ＮＲ^{f}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^e、－ＮＲ^{f}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^g、－ＮＲ^{f}Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{f}ＣＯ$_2$Ｒ^e、－Ｃ$_{1-8}$アルキルＯＲ^f、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$Ｒ^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｒ^e、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは

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

R^6は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-5}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、－ＯＣ$_{1-6}$アルキル、－ＯＣ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a

、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aまたは－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

R^7は独立に、各場合において、H、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－S（C_{1-6}アルキル）であるか；あるいは

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

R^8は独立に、各場合において、H、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

R^9は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－OC（＝O）NR^aR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

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

R^{10}は独立に、各場合において、H、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（

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

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

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

Ｒ^{11}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝

O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{a}および－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択されるか；あるいは

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

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

R^{10}およびR^{11}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが２以下である限り、O、NおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^{a}R^f、－C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}およ

び－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}から選択される０、１または２個の置換基により置換されているものであり；

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

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

Ｒ^{12}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されるＣ$_{1-4}$アルキルであり；ここで、Ｒ^{11}またはＲ^{13}がＣＦ$_{3}$である場合には、Ｒ^{12}はＦではなく；あるいは

Ｒ^{11}およびＲ^{12}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素であ

る飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、$-OR^f$、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^f、$-OC_{2-6}$アルキルOR^f、$-SR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、$-NR^aR^f$、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、$-NR^fC_{2-6}$アルキルNR^aR^fおよび$-NR^fC_{2-6}$アルキルOR^fから選択される０、１または２個の置換基により置換されているものであり；ここで、R^3がNH_2である場合には、$-R^{11}-R^{12}$は－Ｃ＝Ｃ－Ｃ＝Ｎ－またはこれらのいかなる置換物でもなく；

R^{13}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、$-OR^a$、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-SR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、$-NR^aR^a$、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aおよび$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^aから選択されるか；あるいは

R^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し、この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、この環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、$-OR^a$、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-SR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、$-NR^aR^a$、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aおよび$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは

R^{13}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、$-OR^a$、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-SR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）（ア

ルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであり；

Ｒ^{14}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}に選択されるか；あるいは

Ｒ^{14}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し、この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、この環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは

Ｒ^{14}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_1$

$_{-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであり；ここで、Ｒ^{10}、Ｒ^{11}、Ｒ^{12}、Ｒ^{13}およびＲ^{14}の少なくとも１つはＨ以外であり；

Ｒ^{a}は独立に、各場合において、Ｈ、フェニル、ベンジルまたはＣ$_{1-6}$アルキルであり；

Ｒ^{b}はチオフェン、ピロール、１，３－オキサゾール、１，３－チアゾール、１，３，４－オキサジアゾール、１，３，４－チアジアゾール、１，２，３－オキサジアゾール、１，２，３－チアジアゾール、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール、イソチアゾール、１，２，４－オキサジアゾール、１，２，４－チアジアゾール、１，２，３，４－オキサトリアゾール、１，２，３，４－チアトリアゾール、１Ｈ－１，２，３，４－テトラアゾール、１，２，３，５－オキサトリアゾール、１，２，３，５－チアトリアゾール、フラン、イミダゾール－１－イル、イミダゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－５－イル、イソオキサゾール－３－イル、イソキサゾール－５－イル、ピラゾール－３－イル、ピラゾール－５－イル、チオラン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、４，５－ジヒドロチオフェン、２－ピロリン、４，５－ジヒドロフラン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、１，２，３－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，３，５－トリアジン、ピリジン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロピラン、チアン、１，２－ジアザペルヒドロイン、１，３－ジアザペルヒドロイン、ピペラジン、１，３－オキサアザペルヒドロイン、モルホリン、１，３－チアザペルヒドロイン、１，４－チアザペルヒドロイン、ピペリジン、２Ｈ－３，４－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－４Ｈ－チイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリジン、２Ｈ－５，６－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－６Ｈ－チイン、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン、３，４，５，６－テトラヒドロピリジン、４Ｈ－ピラン、４Ｈ－チイン、１，４－ジヒドロピリジン、１，４－ジチアン、１，４－ジオキサン、１，４－オキサチアン、１，２－オキサゾリジン、１，２－チアゾリジン、ピラゾリジン、１，３－オキサゾリジン、１，３－チアゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－オキサジアゾリジン、１，３，４－オキサジアゾリジン、１，２，４－チアジアゾリジン、１，３，４－チアジアゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、２－ピラゾリン、４－イミダゾリン、２，３－ジヒドロイソチアゾール、４，５－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロイソチアゾール、２，５－ジヒドロイソキサゾール、２，５－ジヒドロイソチアゾール、２，３－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロオキサゾール、２，３－ジヒドロオキサゾール、２，５－ジヒドロオキサゾール、４，５－ジヒドロチアゾール、２，３－ジヒドロチアゾール、２，５－ジヒドロチアゾール、１，３，４－オキサチアゾリジン、１，４，２－オキサチアゾリジン、２，３－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール、［１，４，２］オキサチアゾール、［１，３，４］オキサチアゾール、１，３，５－トリアザペルヒドロイン、１，

２，４－トリアザペルヒドロイン、１，４，２－ジチアザペルヒドロイン、１，４，２－ジオキサアザペルヒドロイン、１，３，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，２，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，３，４－チアジアザペルヒドロイン、１，３，５－チアジアザペルヒドロイン、１，２，５－チアジアザペルヒドロイン、１，３，４－オキサジアザペルヒドロイン、１，４，３－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，２－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，６－テトラヒドロピラジン、１，２，３，４－テトラヒドロピラジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、１，２，３，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，３，５］トリアジン、２，３，４，５－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，４，５，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、４，５－ジヒドロピリジン、１，６－ジヒドロピリジン、５，６－ジヒドロピリジン、２Ｈ－ピラン、２Ｈ－チイン、３，６－ジヒドロピリジン、２，３－ジヒドロピリダジン、２，５－ジヒドロピリダジン、４，５－ジヒドロピリダジン、１，２－ジヒドロピリダジン、２，３－ジヒドロピリミジン、２，５－ジヒドロピリミジン、５，６－ジヒドロピリミジン、３，６－ジヒドロピリミジン、４，５－ジヒドロピラジン、５，６－ジヒドロピラジン、３，６－ジヒドロピラジン、４，５－ジヒドロピラジン、１，４－ジヒドロピラジン、１，４－ジチイン、１，４－ジオキシン、２Ｈ－１，２－オキサジン、６Ｈ－１，２－オキサジン、４Ｈ－１，２－オキサジン、２Ｈ－１，３－オキサジン、４Ｈ－１，３－オキサ

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

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

R^cはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２以下はＯまたはＳであり、このヘテロ環はフェニル環と場合によっては縮合し、そして前記ヘテロ環の炭素原子は０、１あるいは２個のオキソ基により置換され、前記ヘテロ環または縮合フェニル環はハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-3}ハロアルキル、－OR^aおよび－NR^aR^aから選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されるものであり；

R^dは水素または－CH_3であり；

R^eは独立に、各場合においては、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）R^b、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）R^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）R^b、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）OR^b、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^b$、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２、３または４個の置換基により置換されるC_{1-9}アルキルであって；そしてこのC_{1-9}アルキルはR^gから独立に選択される０あるいは１個の基により更に置換されているものであり；

R^fは独立に、各場合においては、R^eまたはＨであり；

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

【００３６】

一つの実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；Ｙは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であって、ＸおよびＹの少なくとも１つが＝Ｎ－でないものである。

【００３７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；Ｙは＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であり；そしてＲ^{3}はハロ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-3}$アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$アルキル）Ｃ$_{1-3}$アルキル、またはＣ$_{1-3}$アルキルである。

【００３８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；Ｙは＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であり；そしてＲ^{3}はＨである。

【００３９】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｎ－であり；そしてＹは＝Ｃ（Ｒ^{3}）－である。

【００４０】

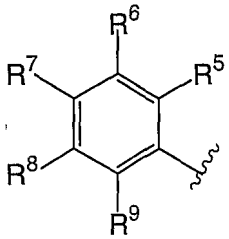
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；そしてＹは＝Ｎ－である。

【００４１】

下位実施態様Ａ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{1}は

【００４２】

【化１２】



であるか、あるいは

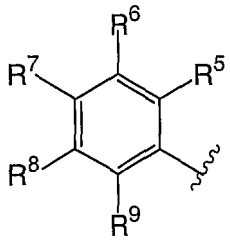
Ｒ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されるナフチルであるか；あるいはＲ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるＲ^{b}である。

【００４３】

下位実施態様Ｂ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{1}は

【００４４】

【化１３】



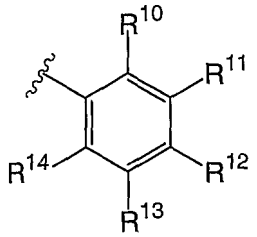
である。

【００４５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されるナフチルである。

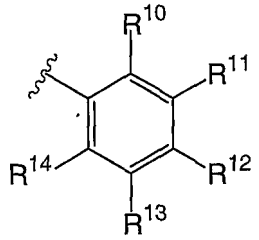
【００４６】
下位実施態様Ｃ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^1はR^5から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるR^bである。
【００４７】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2は、独立に、各場合においては、R^{10}、R^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されるC_{1-8}アルキル、R^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換される－$(CH_2)_n$フェニル、またはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、このヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そしてこのヘテロ環または縮合フェニル環がR^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されている。
【００４８】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2は、独立に、各場合においては、R^{10}、R^{10}から独立に選択される０、１、または２個の置換基により置換されるC_{1-8}アルキル、R^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換される－$(CH_2)_n$フェニル、またはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、このヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そしてこのヘテロ環または縮合フェニル環がR^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されている。
【００４９】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2はR^{10}から選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されているC_{1-8}アルキルである。
【００５０】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2はR^{10}から独立に選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されている－$(CH_2)_{1-2}$フェニルである。
【００５１】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2は、独立に、Ｎ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、このヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そしてこのヘテロ環または縮合フェニル環がR^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されている。
【００５２】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^2はＨである。
【００５３】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^3は、独立に、各場合においては、Ｈ、ハロ、－NH_2、－NHC_{1-3}アルキル、－Ｎ（C_{1-3}アルキル）C_{1-3}アルキル、またはC_{1-3}アルキルであって；Ｘが＝Ｃ（R^2）－であり、そしてＹが＝Ｃ（R^3）－である場合には、R^2およびR^3の少なくとも１つがＨ以外であるものである。
【００５４】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^3はハロ、－NH_2、－NHC_{1-3}アルキル、－Ｎ（C_{1-3}アルキル）C_{1-3}アルキル、またはC_{1-3}アルキルである。

【００５５】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^3はＨである。
【００５６】
下位実施態様Ｄ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4は
【００５７】
【化１４】



であるか、あるいは
R^4がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がR^e、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－OR^f、－$S(=O)_nR^e$、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－OC_{1-6}アルキル$C(=O)OR^e$、－NR^aR^f、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^f、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)OR^e$、－$OC(=O)R^e$、－$C(=O)NR^aR^f$および－$NR^aC(=O)R^e$から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子は＝Ｏにより更に置換されてもよく；そしてこのヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がＨ、－C_{1-6}アルキルOR^f、R^e、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－C_{1-3}アルキル$C(=O)OR^e$、－C_{1-3}アルキル$C(=O)NR^aR^f$、C_{1-3}アルキル$OC(=O)R^e$、－C_{1-3}アルキル$NR^aC(=O)R^e$、－$C(=O)R^c$または－C_{1-3}アルキルR^cにより置換されるものであるか；あるいは
R^4はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、－$S(=O)_nR^e$、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－OC_{1-6}アルキル$C(=O)OR^e$、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^f、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)OR^e$、－$OC(=O)R^e$および－$C(=O)NR^aR^f$から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるナフチルであるが；どの場合にもR^4は３，５－ジトリフルオロメチルフェニルまたは３－トリフルオロメチル－４－フルオロフェニル、－フェニル－（C_{1-8}アルキル）、－フェニル－Ｏ－（C_{1-6}アルキル）、－フェニル－NR^aR^aまたは－フェニル－$N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル）ではないものである。
下位実施態様Ｅ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4は
【００５８】

【化１５】



であるが、どの場合にもR[4]は３，５－ジトリフルオロメチルフェニルまたは３－トリフルオロメチル－４－フルオロフェニル、－フェニル－（C_{1-8}アルキル）、－フェニル－Ｏ－（C_{1-6}アルキル）、－フェニル－NR^aR^aまたは－フェニル－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）でない。

【００５９】

下位実施態様Ｆ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R[4]がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がR^e、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、$-OR^f$、$-S(=O)_nR^e$、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^f、$-OC_{2-6}$アルキルOR^f、$-OC_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）OR^e、$-NR^aR^f$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^f、$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^f、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^fおよび$-NR^aC(=O)R^e$から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；そしてこのヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がＨ、$-C_{1-6}$アルキルOR^f、R^e、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^f、$-C_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）OR^e、$-C_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、$-C_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）R^e、$-C_{1-3}$アルキル$NR^aC(=O)R^e$、－Ｃ（＝Ｏ）R^cまたは$-C_{1-3}$アルキルR^cにより置換されるものである。

【００６０】

下位実施態様Ｇ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R[4]がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がR^e、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、$-OR^f$、$-S(=O)_nR^e$、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^f、$-OC_{2-6}$アルキルOR^f、$-OC_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）OR^e、$-NR^aR^f$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^f、$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^f、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^fおよび$-NR^aC(=O)R^e$から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；そしてこのヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がＨ、$-C_{1-6}$アルキルOR^f、R^e、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^f、$-C_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）OR^e、$-C_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、$-C_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）R^e、$-C_{1-3}$アルキル$NR^aC(=O)R^e$、－Ｃ（＝Ｏ）R^cまたは$-C_{1-3}$アルキルR^cにより置換されるものである。

【００６１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、－S（＝O）$_n$$R^e$、－O$C_{1-4}$ハロアルキル、－O$C_{2-6}$アルキル$NR^aR^f$、－O$C_{2-6}$アルキル$OR^f$、－O$C_{1-6}$アルキルC（＝O）$OR^e$、－$NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^f$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^f$、－C（＝O）$R^e$、－C（＝O）$OR^e$、－OC（＝O）$R^e$および－C（＝O）$NR^aR^f$から選択される１、２または３個の置換基により置換されるナフチルである。

【００６２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^5は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_n$$R^e$、－S（＝O）$_2$$NR^aR^f$、－$NR^aS$（＝O）$_2$$R^e$、－OC（＝O）$NR^aR^f$、$R^{10}$から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか、あるいは

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

【００６３】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^5はHである。

【００６４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^5はR^fまたはR^gである。

【００６５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^5は独立に、各場合において、R^e、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_n$$R^e$、－S（＝O）$_2$$NR^aR^f$、－$NR^aS$（＝O）$_2$$R^e$、－OC（＝O）$NR^aR^f$、$R^{10}$から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか、あるいは

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

【００６６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6は独立に、各場合において、H、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルR^aR^aまたは－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

R^6はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換され

るO、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5あるいは6員のヘテロ環である。

【0067】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6は独立に、各場合において、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-NR^aR^a$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aまたは$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^a、$-C_{1-8}$アルキルOR^a、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^a、$-S$（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される1、2、あるいは3個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

【0068】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6は独立に、各場合において、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-NR^aR^a$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aまたは$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^a、$-C_{1-8}$アルキルOR^a、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^aまたは$-S$（C_{1-6}アルキル）である。

【0069】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6はR^{10}から独立に選択される1、2、あるいは3個の置換基により置換されているフェニル環である。

【0070】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6はR^{10}から独立に選択される0、1、2、あるいは3個の置換基により置換されるO、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の5あるいは6員のヘテロ環である。

【0071】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^6はHである。

【0072】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、H、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-NR^aR^a$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、$-C_{1-8}$アルキルOR^a、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^aまたは$-S$（C_{1-6}アルキル）であるか；あるいは

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

【0073】

下位実施態様H：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-NR^aR^a$、$-NR^aC_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^a、$-C_{1-8}$アルキルOR^a、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^aまたは$-S$（C_{1-6}アルキル）で

あるか；あるいは
R^7は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されている。
【００７４】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7はＨである。
【００７５】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されている。
【００７６】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－Ｓ（C_{1-6}アルキル）である。
【００７７】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、Ｂｒ、またはＣｌである。
【００７８】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、非環状C_{1-8}アルキルまたはC_{1-4}ハロアルキルである。
【００７９】
下位実施態様Ｉ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は独立に、各場合において、C_{3-5}アルキルまたはC_{1-2}ハロアルキルである。
【００８０】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7はC_{3-5}アルキルである。
【００８１】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は－Ｃ（CH_3）$_3$である。
【００８２】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^7は－CF_3である。
【００８３】
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－Ｓ（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは
R^8はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和

の５あるいは６員のヘテロ環である。

【００８４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8はＨである。

【００８５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8は独立に、各場合において、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^a、－Ｓ（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

【００８６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8は独立に、各場合において、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－Ｓ（C_{1-6}アルキル）である。

【００８７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8はR^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環である。

【００８８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^8はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環である。

【００８９】

下位実施態様Ｊ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^g、－NR^fC（＝Ｏ）R^e、－NR^fC（＝Ｏ）R^g、－NR^fC（＝Ｏ）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－Ｓ（＝Ｏ）$_nR^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－NR^aS（＝Ｏ）$_2R^e$、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

R^9はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって；R^5、R^6、R^7、R^8およびR^9の少なくとも１つがC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－Ｓ（C_{1-6}アルキル）であり；あるいは

R^9は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されている。

【００９０】

下位実施態様Ｋ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9はＨである。

【００９１】

下位実施態様Ｌ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は独立に、各場合において、R^e、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^g、－NR^fC（＝Ｏ）R^e、－NR^fC（＝Ｏ）R^g、－NR^fC（＝Ｏ）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－$S(=O)_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

R^9はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって；R^5、R^6、R^7、R^8およびR^9の少なくとも１つがC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－Ｓ（C_{1-6}アルキル）であり；あるいは

R^9は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されている。

【００９２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は独立に、各場合においてR^eである。

【００９３】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は独立に、各場合において、R^gである。

【００９４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は独立に、各場合において、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、－CO_2R^e、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^g、－NR^fC（＝Ｏ）R^e、－NR^fC（＝Ｏ）R^g、－NR^fC（＝Ｏ）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－$S(=O)_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$または－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^fである。

【００９５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

の５あるいは６員のヘテロ環である。

【００９６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^9は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されている。

【００９７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}は独立に、各場合において、H、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^aR^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択されるか；あるいは

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

R^{10}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR

$^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$N$R^{a}R^{a}$、－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルN$R^{a}R^{a}$および－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されるC_{1-4}アルキルである。

【００９８】

下位実施態様Ｍ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}はＨである。

【００９９】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}は独立に、各場合において、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－C（＝NR^{a}）N$R^{a}R^{a}$、－OR^{a}、OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、OC（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－OC（＝O）N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルN$R^{a}R^{a}$、－OC_{2-6}アルキルOR^{a}、－SR^{a}、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N$R^{a}R^{a}$、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）C（＝NR^{a}）N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$N$R^{a}R^{a}$、－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルN$R^{a}R^{a}$および－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択されるか；あるいは

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

R^{10}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－C（＝NR^{a}）N$R^{a}R^{a}$、－OR^{a}、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－OC（＝O）N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルN$R^{a}R^{a}$、－OC_{2-6}アルキルOR^{a}、－SR^{a}、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N$R^{a}R^{a}$、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_{2}$N（R^{a}）C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）C（＝O）N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）C（＝NR^{a}）N$R^{a}R^{a}$、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^{a}）S（＝O）$_{2}$N$R^{a}R^{a}$、－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルN$R^{a}R^{a}$および－N$R^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されている

$^{a}R^{a}$、－Ｎ（R^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（R^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ$R^{a}$$Ｃ_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}R^{a}$および－Ｎ$R^{a}$$Ｃ_{2-6}$アルキルＯ$R^{a}$から選択される０、１、２または３個の基により置換される$Ｃ_{1-4}$アルキルである。

【０１００】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{1}^{1}は独立に、各場合において、Ｈ、$Ｃ_{1-8}$アルキル、$Ｃ_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｃ（＝ＮR^{a}）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－ＯR^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｏ$Ｃ_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}R^{a}$、－Ｏ$Ｃ_{2-6}$アルキルＯR^{a}、－ＳR^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ（R^{a}）Ｃ（＝ＮR^{a}）Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ（R^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（$Ｃ_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（R^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ$R^{a}R^{a}$、－Ｎ$R^{a}$$Ｃ_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}R^{a}$および－Ｎ$R^{a}$$Ｃ_{2-6}$アルキルＯ$R^{a}$から選択されるか；あるいは

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

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

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

【０１０１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}は独立に、各場合において、C_{1-8}アルキル、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）$S(=O)_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2NR^aR^a$、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)O$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、－$NR^aR^a$、－$N(R^a)C(=O)$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)C(=O)O$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、－$N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$、－$N(R^a)S(=O)_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択されるか；あるいは
R^{11}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し；この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）$S(=O)_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2NR^aR^a$、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)O$（C_{1-8}アルキル）、－$S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、－$NR^aR^a$、－$N(R^a)C(=O)$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)C(=O)O$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、－$N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$、－$N(R^a)S(=O)_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－$N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$、および－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは
R^{11}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アル

キル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであるか；あるいは

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

【０１０２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{11}は独立に、各場合において、Ｃ$_{1-8}$アルキル、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲＲ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される。

【０１０３】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{11}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合しているものであり；この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換され、この環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、

シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されている。

【０１０４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{11}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルである。

【０１０５】

下位実施態様Ｎ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{10}およびＲ^{11}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝Ｏ、Ｒ^{e}、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＲ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}、－ＳＲ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}および－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}から選択される０、１または２個の置換基により置換されている。

【０１０６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{10}およびＲ^{11}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝Ｏ、Ｒ^{e}、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－

C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}および－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}から選択される０、１、または２個の置換基により置換されている。

【０１０７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}およびR^{11}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の４個の原子の架橋であって、この架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＯR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^{a}R^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}および－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}から選択される０、１、あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１０８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}およびR^{11}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限りＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋がR^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＯR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^{a}R^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}および－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}から選択される１あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１０９】

下位実施態様Ｏ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}およびR^{11}はＮ、ＯおよびＳから選択される１あるいは２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、この架橋がR^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＯR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^{a}R^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^a

R^f、－NR^aR^f、－$N(R^f)C(=O)R^e$、－$N(R^f)C(=O)OR^e$、－$N(R^f)C(=O)NR^aR^f$、－$N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$、－$N(R^f)S(=O)_2R^e$、－$N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される１あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１１０】

下位実施態様Ｐ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}およびR^{11}はＮ、ＯおよびＳから選択される１あるいは２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、この架橋がR^e、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、OR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される置換基により置換されているものであり；

この架橋がR^e、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される０または１個の置換基により更に置換されている。

【０１１１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}およびR^{11}は一緒になってＯ、ＮおよびＳから選択される１または２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、この架橋が－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－OR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される置換基により置換されている。

【０１１２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{12}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ

)$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^aR^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択されるか；あるいは

R^{12}はN、OおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５，６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびN、OおよびSから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５，６あるいは７員のヘテロ環と縮合し；この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^aR^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは

R^{12}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^aR^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２または３個の基により置換されるC_{1-4}アルキルであり；ここで、R^{11}またはR^{13}がCF_3である場合には、R^{12}はFでなく；あるいは

R^{11}およびR^{12}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが２以下である限り、O、NおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^aR^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2R^e$、－S（＝O）$_2NR^aR^f$、S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（

R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）$NR^a R^f$、－$NR^a R^f$、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）$NR^a R^f$、－N（R^f）C（＝NR^a）$NR^a R^f$、－N（R^f）S（＝O）$_2 R^e$、－N（R^f）S（＝O）$_2 NR^a R^f$、－$NR^f C_{2-6}$アルキル$NR^a R^f$および－$NR^f C_{2-6}$アルキルOR^fから選択される０、１、または２個の置換基により置換されているものであり；ここで、R^3がNH_2である場合には、－R^{11}－R^{12}は－C＝C－C＝N－またはこれらのいかなる置換物でもないものである。

【０１１３】

下位実施態様Q：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{12}はHである。

【０１１４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{12}は独立に、各場合において、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）$NR^a R^a$、－C（＝NR^a）$NR^a R^a$、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）$NR^a R^a$、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキル$NR^a R^a$、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2 NR^a R^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）$NR^a R^a$、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）$NR^a R^a$、－N（R^a）C（＝NR^a）$NR^a R^a$、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2 NR^a R^a$、－$NR^a C_{2-6}$アルキル$NR^a R^a$および－$NR^a C_{2-6}$アルキルOR^aから選択されるか；あるいは

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

R^{12}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）$NR^a R^a$、－C（＝NR^a）$NR^a R^a$、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）$NR^a R^a$、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキル$NR^a R^a$、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2 NR^a R^a$、－S（＝

O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{a}および－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されるC$_{1-4}$アルキルであり；ここで、R^{11}またはR^{13}がCF$_3$である場合には、R^{12}はFでなく；あるいは

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

【０１１５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{12}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し；この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がC$_{1-8}$アルキル、C$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）NR^{a}R^a、－C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－OR^a、－OC（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）NR^{a}R^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^a、－OC$_{2-6}$アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{a}および－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されている。

【０１１６】

下位実施態様Ｒ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O

）NR^aR^f、－C（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^aR^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2R^e$、－S（＝O）$_2NR^aR^f$、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－NR^aR^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^aR^f、－N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－N（R^f）S（＝O）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される0、1、または2個の置換基により置換されているものであり；ここで、R^3がNH_2である場合には、－R^{11}－R^{12}は－C＝C－C＝N－またはこれらのいかなる置換物でもない。

【0117】

下位実施態様S：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが2以下である限り、O、NおよびSから選択される1、2または3個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^aR^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2R^e$、－S（＝O）$_2NR^aR^f$、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－NR^aR^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^aR^f、－N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－N（R^f）S（＝O）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される0、1、または2個の置換基により置換されている。

【0118】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってO、NおよびSから選択される1あるいは2個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^aR^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2R^e$、－S（＝O）$_2NR^aR^f$、S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－NR^aR^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^aR^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^aR^f、－N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－N（R^f）S（＝O）$_2NR^aR^f$、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^fおよび－NR^fC_{2-6}アルキルOR^fから選択される0、1、または2個の置換基により置換されている。

【0119】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってO、NおよびSから選択される1または2個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の3個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝NR^a）NR^aR^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^aR^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝

O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}および－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}から選択される１あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１２０】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってO、NおよびSから選択される１または２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、この架橋がR^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^{a}R^f、－C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}または－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}により置換されている。

【０１２１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってO、NおよびSから選択される１または２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、この架橋が－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^{a}R^f、－C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}または－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}により置換されている。

【０１２２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが２以下であり、かつR^{12}中の第１の結合原子がNでない限り、O、NおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の４個の原子の架橋であって、この架橋が＝O、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）NR^{a}R^f、－C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－OR^f、－OC（＝O）R^e、－OC（＝O）NR^{a}R^f、－OC（＝O）N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^f、－OC$_{2-6}$アルキルOR^f、－SR^f、－S（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$R^e、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）R^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）OR^e、－S（＝O）$_2$N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）NR^{a}R^f、－N（R^f）C（＝NR^a）NR^{a}R^f、－N（R^f）S（＝O）$_2$R^e、－N（R^f）S（＝O）$_2$NR^{a}R^f、－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{f}および－NR^{f}C$_{2-6}$アルキルOR^{f}から選択される０、１、あ

るいは２個の置換基により置換されている。

【０１２３】

下位実施態様Ｔ：別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になって、－Ｏ－Ｃ－Ｃ－Ｏ－、－Ｎ－Ｃ－Ｃ－Ｃ－および－Ｎ＝Ｃ－Ｃ＝Ｃ－から選択される－R^{11}－R^{12}－架橋を形成し、この架橋が＝Ｏ、R^{e}、ハロ、シアノ、ニトロ、Ｃ（＝Ｏ）R^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯR^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｏ$R^{f}$、－ＯＣ（＝Ｏ）$R^{e}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{f}$、－Ｓ$R^{f}$、－Ｓ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ$R^{f}$$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{f}$および－Ｎ$R^{f}$$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{f}$から選択される０、１、あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１２４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{11}およびR^{12}は一緒になって、－Ｏ－Ｃ－Ｃ－Ｏ－、－Ｎ－Ｃ－Ｃ－Ｃ－および－Ｎ＝Ｃ－Ｃ＝Ｃ－から選択される－R^{11}－R^{12}－架橋を形成し、この架橋が＝Ｏ、R^{e}、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯR^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｏ$R^{f}$、－ＯＣ（＝Ｏ）$R^{e}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{f}$、－Ｓ$R^{f}$、－Ｓ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^{e}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$R^{e}$、－Ｎ（$R^{f}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{f}$、－Ｎ$R^{f}$$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{f}$および－Ｎ$R^{f}$$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{f}$から選択される１あるいは２個の置換基により置換されている。

【０１２５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{13}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｏ$R^{a}$、－ＯＣ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（$R^{a}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{a}$、－Ｓ$R^{a}$、－Ｓ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｎ（$R^{a}$）Ｃ（＝Ｎ$R^{a}$）Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｎ（$R^{a}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^{a}$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ$R^{a}$$R^{a}$、－Ｎ$R^{a}$$C_{2-6}$アルキルＮ$R^{a}$$R^{a}$および－Ｎ$R^{a}$$C_{2-6}$アルキルＯ$R^{a}$から選択されるか；あるいは

R^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５

、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し、この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは

R^{13}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルである。

【０１２６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{13}はＨである。

【０１２７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{13}は独立に、各場合において、C_{1-8}アルキル、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される。

【０１２８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不

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

【０１２９】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{13}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）$NR^aR^a$、－$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝$NR^a$）$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$NR^aR^a$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルである。

【０１３０】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{14}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$$NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）$NR^aR^a$、－$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝Ｏ）$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｃ（＝$NR^a$）$NR^aR^a$、－Ｎ（$R^a$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（$R^a$）Ｓ（＝Ｏ）$_2$$NR^aR^a$、－$NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および－$NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$に選択されるか；あるいは

R^{14}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員

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

R^{14}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルである。

【０１３１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{14}はＨである。

【０１３２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{14}は独立に、各場合において、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aに選択されるか；あるいは

R^{14}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和ある

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

R^{14}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルである。

【０１３３】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}、R^{11}、R^{12}、R^{13}およびR^{14}の少なくとも１つはＨ以外である。

【０１３４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^{10}、R^{11}、R^{12}、R^{13}およびR^{14}の少なくとも２つはＨ以外である。

【０１３５】

R^aは独立に、各場合において、Ｈ、フェニル、ベンジルまたはC_{1-6}アルキルであり；

R^bはチオフェン、ピロール、１，３－オキサゾール、１，３－チアゾール、１，３，４－オキサジアゾール、１，３，４－チアジアゾール、１，２，３－オキサジアゾール、１，２，３－チアジアゾール、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール、イソチアゾール、１，２，４－オキサジアゾール、１，２，４－チアジアゾール、１，２，３，４－オキサトリアゾール、１，２，３，４－チアトリアゾール、１Ｈ－１，２，３，４－テトラアゾール、１，２，３，５－オキサトリアゾール、１，２，３，５－チアトリアゾール、フラン、イミダゾール－１－イル、イミダゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－５－イル、イソキサゾール－３－イル、イソキサゾール－５－イル、ピラゾール－３－イル、ピラゾール－５－イル、チオラン、ピロリジン、テ

トラヒドロフラン、４，５－ジヒドロチオフェン、２－ピロリン、４，５－ジヒドロフラン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、１，２，３－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，３，５－トリアジン、ピリジン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロピラン、チアン、１，２－ジアザペルヒドロイン、１，３－ジアザペルヒドロイン、ピペラジン、１，３－オキサアザペルヒドロイン、モルホリン、１，３－チアザペルヒドロイン、１，４－チアザペルヒドロイン、ピペリジン、２Ｈ－３，４－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－４Ｈ－チイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリジン、２Ｈ－５，６－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－６Ｈ－チイン、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン、３，４，５，６－テトラヒドロピリジン、４Ｈ－ピラン、４Ｈ－チイン、１，４－ジヒドロピリジン、１，４－ジチアン、１，４－ジオキサン、１，４－オキサチアン、１，２－オキサゾリジン、１，２－チアゾリジン、ピラゾリジン、１，３－オキサゾリジン、１，３－チアゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－オキサジアゾリジン、１，３，４－オキサジアゾリジン、１，２，４－チアジアゾリジン、１，３，４－チアジアゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、２－ピラゾリン、４－イミダゾリン、２，３－ジヒドロイソチアゾール、４，５－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロイソチアゾール、２，５－ジヒドロイソキサゾール、２，５－ジヒドロイソチアゾール、２，３－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロオキサゾール、２，３－ジヒドロオキサゾール、２，５－ジヒドロオキサゾール、４，５－ジヒドロチアゾール、２，３－ジヒドロチアゾール、２，５－ジヒドロチアゾール、１，３，４－オキサチアゾリジン、１，４，２－オキサチアゾリジン、２，３－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール、［１，４，２］オキサチアゾール、［１，３，４］オキサチアゾール、１，３，５－トリアザペルヒドロイン、１，２，４－トリアザペルヒドロイン、１，４，２－ジチアアザペルヒドロイン、１，４，２－ジオキサアザペルヒドロイン、１，３，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，２，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，３，４－チアジアザペルヒドロイン、１，３，５－チアジアザペルヒドロイン、１，２，５－チアジアザペルヒドロイン、１，３，４－オキサジアザペルヒドロイン、１，４，３－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，２－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，６－テトラヒドロピラジン、１，２，３，４－テトラヒドロピラジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１、３］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１、３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４

］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、１，２，３，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，３，５］トリアジン、２，３，４，５－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，４，５，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、４，５－ジヒドロピリジン、１，６－ジヒドロピリジン、５，６－ジヒドロピリジン、２Ｈ－ピラン、２Ｈ－チイン、３，６－ジヒドロピリジン、２，３－ジヒドロピリダジン、２，５－ジヒドロピリダジン、４，５－ジヒドロピリダジン、１，２－ジヒドロピリダジン、２，３－ジヒドロピリミジン、２，５－ジヒドロピリミジン、５，６－ジヒドロピリミジン、３，６－ジヒドロピリミジン、４，５－ジヒドロピラジン、５，６－ジヒドロピラジン、３，６－ジヒドロピラジン、４，５－ジヒドロピラジン、１，４－ジヒドロピラジン、１，４－ジチイン、１，４－ジオキシン、２Ｈ－１，２－オキサジン、６Ｈ－１，２－オキサジン、４Ｈ－１，２－オキサジン、２Ｈ－１，３－オキサジン、４Ｈ－１，３－オキサジン、６Ｈ－１，３－オキサジン、２Ｈ－１，４－オキサジン、４Ｈ－１，４－オキサジン、２Ｈ－１，３－チアジン、２Ｈ－１，４－チアジン、４Ｈ－１，２－チアジン、６Ｈ－１，３－チアジン、４Ｈ－１，４－チアジン、２Ｈ－１，２－チアジン、６Ｈ－１，２－チアジン、１，４－オキサチイン、２Ｈ，５Ｈ－１，２，３－トリアジン、１Ｈ，４Ｈ－１，２，３－トリアジン、４，５－ジヒドロ－１，２，３－トリアジン、１Ｈ，６Ｈ－１，２，３－トリアジン、１，２－ジヒドロ－１，２，３－トリアジン、２，３－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン、３Ｈ，６Ｈ－１，２，４－トリアジン、１Ｈ，６Ｈ－１，２，４－トリアジン、３，４－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン、１Ｈ，４Ｈ－１，２，４－トリアジン、５，６－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン、４，５－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン、２Ｈ，５Ｈ－１，２，４－トリアジン、１，２－ジヒドロ－１，２，４－トリアジン、１Ｈ，４Ｈ－１，３，５－トリアジン、１，２－ジヒドロ－１，３，５－トリアジン、１，４，２－ジチアジン、１，４，２－ジオキサジン、２Ｈ－１，３，４－オキサジアジン、２Ｈ－１，３，５－オキサジアジン、６Ｈ－１，２，５－オキサジアジン、４Ｈ－１，３，４－オキサジアジン、４Ｈ－１，３，５－オキサジアジン、４Ｈ－１，２，５－オキサジアジン、２Ｈ－１，３，５－チアジアジン、６Ｈ－１，２，５－チアジアジン、４Ｈ－１，３，４－チアジアジン、４Ｈ－１，３，５－チアジアジン、４Ｈ－１，２，５－チアジアジン、２Ｈ－１，３，４－チアジアジン、６Ｈ－１，３，４

－チアジアジン、６Ｈ－１，３，４－オキサジアジンおよび１，４，２－オキサチアジンの群から選択されるヘテロ環であって、このヘテロ環がＮ、ＯおよびＳから独立に選択される０、１あるいは２個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員環と場合によっては隣接して縮合するものであり；

R^cは独立に、各場合においては、ハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-3}ハロアルキル、$-OR^a$および$-NR^aR^a$から選択される０、１あるいは２個の基により置換されているフェニルであるか；あるいは

R^cはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２あるいは３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、この環構成員の２個以下がＯまたはＳであって、このヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そしてこのヘテロ環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換され、このヘテロ環または縮合フェニル環がハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-3}ハロアルキル、$-OR^a$および$-NR^aR^a$から選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されているものであり；

R^dは水素または$-CH_3$であり；

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

R^fは独立に、各場合においては、R^eまたはＨであり；

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

【０１３６】

上述のように、この上記の実施態様および下位実施態様は、他の実施態様および下位実施態様と関連して使用してもよい。次の表は実施態様の組み合わせの一部の非排他的で、非限定的なリストである。次の実施態様の組は上記の実施態様のいずれとも使用するというような意味であるが、これらはR^5、R^6、R^8、R^{13}およびR^{14}がすべてＨであるものも考慮される。

【０１３７】

Ｘが＝Ｎ－であり、そしてＹが－ＣＨ－である場合には：

【０１３８】

【表１】

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
1001	C	E	-	-	N	N	Q
1002	C	E	-	-	O	O	Q
1003	C	E	-	-	P	P	Q
1004	C	E	-	-	M	R	R
1005	C	E	-	-	M	S	S
1006	C	E	-	-	M	T	T
1007	C	D	-	-	-	-	-
1008	C	F	-	-	-	-	-
1009	C	G	-	-	-	-	-
1010	A	E	H	J	N	N	Q
1011	A	E	H	J	O	O	Q
1012	A	E	H	J	P	P	Q
1013	A	E	H	J	M	R	R
1014	A	E	H	J	M	S	S
1015	A	E	H	J	M	T	T
1016	A	D	H	J	-	-	-
1017	A	F	H	J	-	-	-
1018	A	G	H	J	-	-	-
1019	A	E	H	K	N	N	Q
1020	A	E	H	K	O	O	Q
1021	A	E	H	K	P	P	Q
1022	A	E	H	K	M	R	R
1023	A	E	H	K	M	S	S

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
1024	A	E	H	K	M	T	T
1025	A	D	H	K	-	-	-
1026	A	F	H	K	-	-	-
1027	A	G	H	K	-	-	-
1028	A	E	H	L	N	N	Q
1029	A	E	H	L	O	O	Q
1030	A	E	H	L	P	P	Q
1031	A	E	H	L	M	R	R
1032	A	E	H	L	M	S	S
1033	A	E	H	L	M	T	T
1034	A	D	H	L	-	-	-
1035	A	F	H	L	-	-	-
1036	A	G	H	L	-	-	-
1037	A	E	I	J	N	N	Q
1038	A	E	I	J	O	O	Q
1039	A	E	I	J	P	P	Q
1040	A	E	I	J	M	R	R
1041	A	E	I	J	M	S	S
1042	A	E	I	J	M	T	T
1043	A	D	I	J	-	-	-
1044	A	F	I	J	-	-	-
1045	A	G	I	J	-	-	-
1046	A	E	I	K	N	N	Q
1047	A	E	I	K	O	O	Q
1048	A	E	I	K	P	P	Q
1049	A	E	I	K	M	R	R
1050	A	E	I	K	M	S	S
1051	A	E	I	K	M	T	T
1052	A	D	I	K	-	-	-
1053	A	F	I	K	-	-	-

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
1054	A	G	I	K	-	-	-
1055	A	E	I	L	N	N	Q
1056	A	E	I	L	O	O	Q
1057	A	E	I	L	P	P	Q
1058	A	E	I	L	M	R	R
1059	A	E	I	L	M	S	S
1060	A	E	I	L	M	T	T
1061	A	D	I	L	-	-	-
1062	A	F	I	L	-	-	-
1063	A	G	I	L	-	-	-
1064	B	E	H	J	N	N	Q
1065	B	E	H	J	O	O	Q
1066	B	E	H	J	P	P	Q
1067	B	E	H	J	M	R	R
1068	B	E	H	J	M	S	S
1069	B	E	H	J	M	T	T
1070	B	D	H	J	-	-	-
1071	B	F	H	J	-	-	-
1072	B	G	H	J	-	-	-
1073	B	E	H	K	N	N	Q
1074	B	E	H	K	O	O	Q
1075	B	E	H	K	P	P	Q
1076	B	E	H	K	M	R	R
1077	B	E	H	K	M	S	S
1078	B	E	H	K	M	T	T
1079	B	D	H	K	-	-	-
1080	B	F	H	K	-	-	-
1081	B	G	H	K	-	-	-
1082	B	E	H	L	N	N	Q
1083	B	E	H	L	O	O	Q

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
1084	B	E	H	L	P	P	Q
1085	B	E	H	L	M	R	R
1086	B	E	H	L	M	S	S
1087	B	E	H	L	M	T	T
1088	B	D	H	L	-	-	-
1089	B	F	H	L	-	-	-
1090	B	G	H	L	-	-	-
1091	B	E	I	J	N	N	Q
1092	B	E	I	J	O	O	Q
1093	B	E	I	J	P	P	Q
1094	B	E	I	J	M	R	R
1095	B	E	I	J	M	S	S
1096	B	E	I	J	M	T	T
1097	B	D	I	J	-	-	-
1098	B	F	I	J	-	-	-
1099	B	G	I	J	-	-	-
1100	B	E	I	K	N	N	Q
1101	B	E	I	K	O	O	Q
1102	B	E	I	K	P	P	Q
1103	B	E	I	K	M	R	R
1104	B	E	I	K	M	S	S
1105	B	E	I	K	M	T	T
1106	B	D	I	K	-	-	-
1107	B	F	I	K	-	-	-
1108	B	G	I	K	-	-	-
1109	B	E	I	L	N	N	Q
1110	B	E	I	L	O	O	Q
1111	B	E	I	L	P	P	Q
1112	B	E	I	L	M	R	R
1113	B	E	I	L	M	S	S

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
1114	B	E	I	L	M	T	T
1115	B	D	I	L	-	-	-
1116	B	F	I	L	-	-	-
1117	B	G	I	L	-	-	-

【０１３９】
ＸがＣＨであり、そしてＹがＮである場合には：
【０１４０】
【表２】

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
2001	C	E	-	-	N	N	Q
2002	C	E	-	-	O	O	Q
2003	C	E	-	-	P	P	Q
2004	C	E	-	-	M	R	R
2005	C	E	-	-	M	S	S
2006	C	E	-	-	M	T	T
2007	C	D	-	-	-	-	-
2008	C	F	-	-	-	-	-
2009	C	G	-	-	-	-	-
2010	A	E	H	J	N	N	Q
2011	A	E	H	J	O	O	Q
2012	A	E	H	J	P	P	Q
2013	A	E	H	J	M	R	R
2014	A	E	H	J	M	S	S
2015	A	E	H	J	M	T	T
2016	A	D	H	J	-	-	-
2017	A	F	H	J	-	-	-
2018	A	G	H	J	-	-	-
2019	A	E	H	K	N	N	Q
2020	A	E	H	K	O	O	Q
2021	A	E	H	K	P	P	Q
2022	A	E	H	K	M	R	R
2023	A	E	H	K	M	S	S

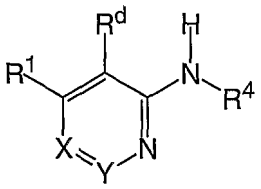
実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
2024	A	E	H	K	M	T	T
2025	A	D	H	K	-	-	-
2026	A	F	H	K	-	-	-
2027	A	G	H	K	-	-	-
2028	A	E	H	L	N	N	Q
2029	A	E	H	L	O	O	Q
2030	A	E	H	L	P	P	Q
2031	A	E	H	L	M	R	R
2032	A	E	H	L	M	S	S
2033	A	E	H	L	M	T	T
2034	A	D	H	L	-	-	-
2035	A	F	H	L	-	-	-
2036	A	G	H	L	-	-	-
2037	A	E	I	J	N	N	Q
2038	A	E	I	J	O	O	Q
2039	A	E	I	J	P	P	Q
2040	A	E	I	J	M	R	R
2041	A	E	I	J	M	S	S
2042	A	E	I	J	M	T	T
2043	A	D	I	J	-	-	-
2044	A	F	I	J	-	-	-
2045	A	G	I	J	-	-	-
2046	A	E	I	K	N	N	Q
2047	A	E	I	K	O	O	Q
2048	A	E	I	K	P	P	Q
2049	A	E	I	K	M	R	R
2050	A	E	I	K	M	S	S
2051	A	E	I	K	M	T	T
2052	A	D	I	K	-	-	-
2053	A	F	I	K	-	-	-

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
2054	A	G	I	K	-	-	-
2055	A	E	I	L	N	N	Q
2056	A	E	I	L	O	O	Q
2057	A	E	I	L	P	P	Q
2058	A	E	I	L	M	R	R
2059	A	E	I	L	M	S	S
2060	A	E	I	L	M	T	T
2061	A	D	I	L	-	-	-
2062	A	F	I	L	-	-	-
2063	A	G	I	L	-	-	-
2064	B	E	H	J	N	N	Q
2065	B	E	H	J	O	O	Q
2066	B	E	H	J	P	P	Q
2067	B	E	H	J	M	R	R
2068	B	E	H	J	M	S	S
2069	B	E	H	J	M	T	T
2070	B	D	H	J	-	-	-
2071	B	F	H	J	-	-	-
2072	B	G	H	J	-	-	-
2073	B	E	H	K	N	N	Q
2074	B	E	H	K	O	O	Q
2075	B	E	H	K	P	P	Q
2076	B	E	H	K	M	R	R
2077	B	E	H	K	M	S	S
2078	B	E	H	K	M	T	T
2079	B	D	H	K	-	-	-
2080	B	F	H	K	-	-	-
2081	B	G	H	K	-	-	-
2082	B	E	H	L	N	N	Q
2083	B	E	H	L	O	O	Q

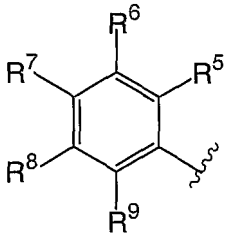
実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
2084	B	E	H	L	P	P	Q
2085	B	E	H	L	M	R	R
2086	B	E	H	L	M	S	S
2087	B	E	H	L	M	T	T
2088	B	D	H	L	-	-	-
2089	B	F	H	L	-	-	-
2090	B	G	H	L	-	-	-
2091	B	E	I	J	N	N	Q
2092	B	E	I	J	O	O	Q
2093	B	E	I	J	P	P	Q
2094	B	E	I	J	M	R	R
2095	B	E	I	J	M	S	S
2096	B	E	I	J	M	T	T
2097	B	D	I	J	-	-	-
2098	B	F	I	J	-	-	-
2099	B	G	I	J	-	-	-
2100	B	E	I	K	N	N	Q
2101	B	E	I	K	O	O	Q
2102	B	E	I	K	P	P	Q
2103	B	E	I	K	M	R	R
2104	B	E	I	K	M	S	S
2105	B	E	I	K	M	T	T
2106	B	D	I	K	-	-	-
2107	B	F	I	K	-	-	-
2108	B	G	I	K	-	-	-
2109	B	E	I	L	N	N	Q
2110	B	E	I	L	O	O	Q
2111	B	E	I	L	P	P	Q
2112	B	E	I	L	M	R	R
2113	B	E	I	L	M	S	S

実施態様番号	R^1	R^4	R^7	R^9	R^{10}	R^{11}	R^{12}
2114	B	E	I	L	M	T	T
2115	B	D	I	L	-	-	-
2116	B	F	I	L	-	-	-
2117	B	G	I	L	-	-	-

【０１４１】
本発明の別の側面は、一般的な構造
【０１４２】
【化１６】

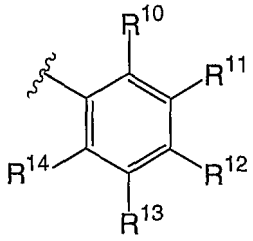


を有する化合物またはこれらの任意の医薬的に許容できる塩である：ここで
Ｘは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；
Ｙは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{3}）－であり、ここでＸおよびＹの少なくとも１つは＝Ｎ－でなく；
ｎは独立に、各場合において、０、１または２であり
Ｒ^{1}は
【０１４３】
【化１７】



であるか；あるいは
Ｒ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される０、１または２個の置換基により置換されるナフチルであるか；あるいはＲ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるＲ^{b}であり；
Ｒ^{2}は、独立に、各場合においては、Ｒ^{10}、Ｒ^{10}から独立に選択される０、１または２個の置換基により置換されるＣ$_{1-8}$アルキル、Ｒ^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換される－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$フェニル、またはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、前記環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、前記ヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、そして前記ヘテロ環または縮合フェニル環がＲ^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されているものであり；
Ｒ^{3}は、独立に、各場合においては、Ｈ、ハロ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-3}$アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$アルキル）Ｃ$_{1-3}$アルキル、またはＣ$_{1-3}$アルキルであり；
Ｒ^{4}は

【０１４４】
【化１８】



であるか；あるいは
Ｒ[4]はＯ、ＮおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がC_{1-9}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－ＯＲ[a]、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$$C_{1-6}$アルキル、－Ｏ$C_{1-4}$ハロアルキル、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－Ｏ$C_{2-6}$アルキルＯＲ[a]、－Ｏ$C_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ[a]、－ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]C_{1-4}ハロアルキル、－ＮＲ[a]C_{2-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]C_{2-6}アルキルＯＲ[a]、－Ｃ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯC_{1-6}アルキル、－Ｏ Ｃ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ[a]C_{1-6}アルキルおよび－ＮＲ[a]Ｃ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキルから独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；そして前記鎖中の任意の窒素原子がＨ、－C_{1-6}アルキルＯＲ[a]、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－C_{1-3}アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ[a]、－C_{1-3}アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ[a]Ｒ[a]、－C_{1-3}アルキルＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－C_{1-3}アルキルＮＲ[a]Ｃ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ[c]または－C_{1-3}アルキルＲ[c]により置換されるものであるか；あるいはＲ[4]は複数の縮合６員環を含む１０員の二環式の環であって、０、１、２、３または４個のＮ原子を含有し、残りが炭素原子であり、その６員環の少なくとも１つが芳香族である前記炭素原子がＨ、ハロ、ＯＲ[a]、ＮＲ[a]Ｒ[a]、C_{1-6}アルキルおよびC_{1-3}ハロアルキルにより置換されているものであり；不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよいが；どの場合にもＲ[4]が３，５－ジトリフルオロメチルフェニルまたは３－トリフルオロメチル－４－フルオロフェニルではなく；
Ｒ[5]は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、－ＯC_{1-6}アルキル、－ＯC_{1-4}ハロアルキル、－ＯC_{2-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＯC_{2-6}アルキルＯＲ[a]、－ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]C_{1-4}ハロアルキル、－ＮＲ[a]C_{2-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]C_{2-6}アルキルＯＲ[a]、ナフチル、－CO_2（C_{1-6}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-6}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]Ｃ（＝Ｏ）Ｒ[a]、－ＮＲ[a]Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]Ｃ Ｏ$_2$（C_{1-6}アルキル）、－C_{1-8}アルキルＯＲ[a]、－C_{1-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$（C_{1-6}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-6}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ[a]Ｒ[a]、Ｒ[10]から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは
Ｒ[5]はＲ[10]から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であり；
Ｒ[6]は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-5}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－ＯC_{1-6}アルキル、－ＯC_{1-4}ハロアルキル、－ＯC_{2-6}アルキルＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＯC_{2-6}アルキルＯＲ[a]、－ＮＲ[a]Ｒ[a]、－ＮＲ[a]C_{1-4}ハロアルキル、－ＮＲ

$^{a}C_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$または$-NR^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-C_{1-8}$アルキルOR^{a}、$-C_{1-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-S(C_{1-6}$アルキル$)$、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

R^{7}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-OC_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}C_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^{a}C_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}、C_{1-8}アルキルOR^{a}、$-C_{1-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$または$-S(C_{1-6}$アルキル$)$であるか；あるいは

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

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

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

R^{9}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、$-OC_{1-6}$アルキル、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-OC_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}C_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^{a}C_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$または$-NR^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-CO_{2}(C_{1-6}$アルキル$)$、$-C(=O)(C_{1-6}$アルキル$)$、$-C(=O)NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}C(=O)(C_{1-6}$アルキル$)$、$-NR^{a}C(=O)NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}CO_{2}(C_{1-6}$アルキル$)$、$-C_{1-8}$アルキルOR^{a}、$-C_{1-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-S(=O)_{n}(C_{1-6}$アルキル$)$、$-S(=O)_{2}NR^{a}R^{a}$、$-NR^{a}S(=O)_{2}(C_{1-6}$アルキル$)$、$-OC(=O)NR^{a}R^{a}$、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

R^{9}はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって；R^{5}、R^{6}、R^{7}、R^{8}およびR^{9}の少なくとも１つがC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、$-OC_{1-4}$ハロアルキル、$-OC_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$-OC_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-NR^{a}C_{1-4}$ハロアルキル、$-NR^{a}C_{2-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$、$NR^{a}C_{2-6}$アルキルOR^{a}、$-C_{1-8}$アルキルOR^{a}、$-C_{1-6}$アルキル$NR^{a}R^{a}$または$-S(C_{1-6}$アルキル$)$であり；あるいは

R^{9}は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４あるいは５員のヘテロ環であって、この環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１あるいは２個の置換基により置換されるものであり；

R^{10}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、$-C(=O)(C_{1-8}$アルキル$)$、$-C(=O)O(C_{1-8}$ア

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

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

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

Ｒ^{11}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-}$

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

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

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

Ｒ^{10}およびＲ^{11}は一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４原子の架橋であって；この鎖中の炭素原子の各々がＨ、＝Ｏ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）

NR^aR^a、$-NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$、$-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aおよび$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^aにより置換され、そしてこの鎖中の任意の窒素原子がH、$-C_{1-6}$アルキルOR^a、$-C_{1-6}$アルキル、$-C_{1-6}$アルキルNR^aR^a、$-C_{1-3}$アルキル$C(=O)OR^a$、$-C_{1-3}$アルキル$C(=O)NR^aR^a$、$-C_{1-3}$アルキル$OC(=O)C_{1-6}$アルキル、$-C_{1-3}$アルキル$NR^aC(=O)C_{1-6}$アルキル、$-C(=O)R^c$または$-C_{1-3}$アルキルR^cにより置換されるものであり；

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

R^{12}はN、OおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、前記環が０あるいは１個のベンゾ基およびN、OおよびSから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し；この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、この環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、$-C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-C(=O)NR^aR^a$、$-C(=NR^a)NR^aR^a$、$-OR^a$、$-OC(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-OC(=O)NR^aR^a$、$-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-OC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$、$-OC_{2-6}$アルキル$OR^a$、$-SR^a$、$-S(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2NR^aR^a$、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$、$-N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および$-NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているか；あるいは

R^{12}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、$-C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-C(=O)NR^aR^a$、$-C(=NR^a)NR^aR^a$、$-OR^a$、$-OC(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-OC(=O)NR^aR^a$、$-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-OC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$、$-OC_{2-6}$アルキル$OR^a$、$-SR^a$、$-S(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2NR^aR^a$、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)O(C_{1-8}$アルキル)、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=O)(C_{1-8}$アルキル)、$-N(R^a)C(=O)O(C_{1}$

$_{-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されるＣ$_{1-4}$アルキルであり；ここで、

Ｒ^{11}またはＲ^{13}がＣＦ$_{3}$である場合には、Ｒ^{12}はＦでなく；あるいはＲ^{11}およびＲ^{12}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋であって、前記鎖中の炭素原子の各々がＨ、＝Ｏ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}により置換されているものであり、そしてこの鎖中の任意の窒素原子がＨ、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＯＲ^{a}、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^{a}、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－Ｃ$_{1-3}$アルキルＲ^{c}により置換されているものであり；

Ｒ^{13}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択されるか；あるいは

Ｒ^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、前記環が０あるいは１個のベンゾ基およびＮ、ＯおよびＳから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘトロ環と縮合し、前記環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、前記環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$ア

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

R^{13}はC$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）NR^{a}R^a、－C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－OR^a、－OC（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）NR^{a}R^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^a、－OC$_{2-6}$アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルR^{a}R^{a}および－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているC$_{1-4}$アルキルであり；

R^{14}は独立に、各場合において、H、C$_{1-8}$アルキル、C$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）NR^{a}R^a、－C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－OR^a、－OC（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）NR^{a}R^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^a、－OC$_{2-6}$アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^{a}および－NR^{a}C$_{2-6}$アルキルOR^{a}から選択されるか；あるいは

R^{14}はN、OおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有する、飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０あるいは１１員の二環式の環であって、この環が０あるいは１個のベンゾ基およびN、OおよびSから選択される１、２あるいは３個の原子を含有する０あるいは１個の飽和あるいは不飽和の５、６あるいは７員のヘテロ環と縮合し、この環の炭素原子が０、１あるいは２個のオキソ基により置換されたものであって、この環がC$_{1-8}$アルキル、C$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－C（＝O）NR^{a}R^a、－C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－OR^a、－OC（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）NR^{a}R^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－OC$_{2-6}$アルキルNR^{a}R^a、－OC$_{2-6}$アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C$_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C

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

Ｒ^{14}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであり；

Ｒ^{a}は独立に、各場合において、Ｈ、フェニル、ベンジルまたはＣ$_{1-6}$アルキルであり；

Ｒ^{b}はチオフェン、ピロール、１，３－オキサゾール、１，３－チアゾール、１，３，４－オキサジアゾール、１，３，４－チアジアゾール、１，２，３－オキサジアゾール、１，２，３－チアジアゾール、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール、イソチアゾール、１，２，４－オキサジアゾール、１，２，４－チアジアゾール、１，２，３，４－オキサトリアゾール、１，２，３，４－チアトリアゾール、１Ｈ－１，２，３，４－テトラアゾール、１，２，３，５－オキサトリアゾール、１，２，３，５－チアトリアゾール、フラン、イミダゾール－１－イル、イミダゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－４－イル、１，２，４－トリアゾール－５－イル、イソキサゾール－３－イル、イソキサゾール－５－イル、ピラゾール－３－イル、ピラゾール－５－イル、チオラン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、４，５－ジヒドロチオフェン、２－ピロリン、４，５－ジヒドロフラン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、１，２，３－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，２，４－トリアジン、１，３，５－トリアジン、ピリジン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロピラン、チアン、１，２－ジアザペルヒドロイン、１，３－ジアザペルヒドロイン、ピペラジン、１，３－オキサアザペルヒドロイン、モルホリン、１，３－チアザペルヒドロイン、１，４－チアザペルヒドロイン、ピペリジン、２Ｈ－３，４－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－４Ｈ－チイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリジン、２Ｈ－５，６－ジヒドロピラン、２，３－ジヒドロ－６Ｈ－チイン、１，２，５，６－テトラヒドロピリジン、３，４，５，６－テトラヒドロピリジン、４Ｈ－ピラン、４Ｈ－チイン、１，４－ジヒドロピリジン、１，４－ジチアン、１，４－ジオキサン、１，４－オキサチアン、１，２－オキサゾリジン、１，２－チアゾリジン、ピラゾリジン、１，３－オキサゾリジン、１，３－チアゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－オキサジアゾリジン、１，３，４－オキサジアゾリジン、１，２，４－チアジアゾリジン、１，３，４－チアジアゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、２－イミダゾリン、３－イミダゾリン、２－ピラゾリン、４－イミダゾリン、２，３－ジヒドロイソチアゾール、４，５－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロイソチアゾール、２，５－ジヒドロイソキサゾール、２，５－ジヒドロイソチアゾール、２，３－ジヒドロイソキサゾール、４，５－ジヒドロオキサゾール、２，３－ジヒドロオキサゾール、２，５－ジヒドロオキサゾール、４，５－ジヒドロチアゾール、２，３－ジヒドロチアゾール、２，５－ジヒドロチアゾール、１，３，４－オキサチアゾリジン、１，４，２－オキサチアゾリジン、２，３－ジ

ヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，３］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、４，５－ジヒドロ－１Ｈ－［１，２，４］トリアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール、［１，４，２］オキサチアゾール、［１，３，４］オキサチアゾール、１，３，５－トリアザペルヒドロイン、１，２，４－トリアザペルヒドロイン、１，４，２－ジチアザペルヒドロイン、１，４，２－ジオキサアザペルヒドロイン、１，３，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，２，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，３，４－チアジアザペルヒドロイン、１，３，５－チアジアザペルヒドロイン、１，２，５－チアジアザペルヒドロイン、１，３，４－オキサジアザペルヒドロイン、１，４，３－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，２－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，６－テトラヒドロピラジン、１，２，３，４－テトラヒドロピラジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、１，２，３，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，３，５］トリアジン、２，３，４，５－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，４，５，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジ

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

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

R^cはＮ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、前記環構成員の２以下はＯまたはＳであり、前記ヘテロ環はフェニル環と場合によっては縮合し、そして前記ヘテロ環の炭素原子は０、１あるいは２個のオキソ基により置換され、前記ヘテロ環または縮合フェニル環はハロ、C_{1-4}アルキル、C_{1-3}ハロアルキル、－OR^aおよび－NR^aR^aから選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されるものであり；

R^dは水素または－CH_3である。

【０１４５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｘは＝Ｎ－であり；そしてどちらかのR^6は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-5}アルキル、C_{2-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aまたは－NR^aC_{2-6}ア

ルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^{a}R^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されているフェニル環であるか；あるいは

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

R^8は独立に、各場合において、H、C_{1-5}アルキル、C_{2-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^{a}R^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^{a}R^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^{a}R^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^{a}R^a、－S（C_{1-6}アルキル）、R^{10}から独立に選択される１、２、あるいは３個の置換基により置換されているフェニル環であるか、あるいは

R^8はR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されているO、NおよびSから選択される飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環である。

【０１４６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^3はハロ、－NH_2、－NHC_{1-3}アルキル、－N（C_{1-3}アルキル）C_{1-3}アルキルまたはC_{1-3}アルキルである。

【０１４７】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連してYは＝N－である。

【０１４８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連してR^{10}は独立に、各場合においてC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^{a}R^a、－C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^{a}R^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^{a}R^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^{a}R^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^{a}R^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2$NR^{a}R^a、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^{a}R^{a}および－NR^aC_{2-6}アルキルOR^{a}であるか；あるいは

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

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

Ｒ^{10}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されるＣ$_{1-4}$アルキルである。

【０１４９】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連してＸは＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；そしてＹは＝Ｃ（Ｒ^{3}）－である。

【０１５０】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連してＲ^{3}はハロ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＣ$_{1-3}$アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$アルキル）Ｃ$_{1-3}$アルキルまたはＣ$_{1-3}$アルキルである。

【０１５１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連してＲ^{10}は独立に、各場合において、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}であるか；あるいは

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

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

Ｒ^{10}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２あるいは３個の基により置換されるＣ$_{1-4}$アルキルである。

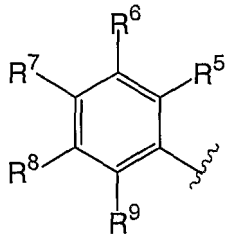
【０１５２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、

Ｒ^{1}は

【０１５３】

【化１９】



である。

【０１５４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{7}はＣ$_{1-5}$アルキル、ハロまたはＣ$_{1-4}$ハロアルキルである。

【０１５５】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されているナフチルである。

【０１５６】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{1}はＲ^{5}から独立に選択される０、１、２あるいは３個の置換基により置換されているＲ^{b}である。

【０１５７】

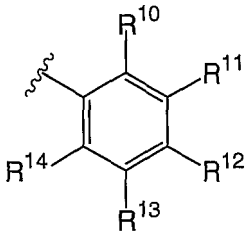
別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^1はR^5から独立に選択される１、２あるいは３個の置換基により置換されているR^bである。

【０１５８】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4は

【０１５９】

【化２０】



である。

【０１６０】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、

R^{10}およびR^{11}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この鎖中の炭素原子の各々がＨ、＝Ｏ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－ＯC_{2-6}アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯC_{2-6}アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^aC_{2-6}アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^aC_{2-6}アルキルＯＲ^{a}により置換されているものであり、そしてこの鎖中の任意の窒素原子がＨ、－C_{1-6}アルキルＯＲ^a、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－C_{1-3}アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－C_{1-3}アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－C_{1-3}アルキルＯＣ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－C_{1-3}アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）C_{1-6}アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－C_{1-3}アルキルＲ^{c}により置換されているものであるか；あるいは

R^{11}およびR^{12}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、この鎖中の炭素原子の各々がＨ、＝Ｏ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＲ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－ＯC_{2-6}アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯC_{2-6}アルキルＯＲ^a、－ＳＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（

＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝ＮＲ^a）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}により置換され、そしてこの鎖中の炭素原子の任意の窒素原子がＨ、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＯＲ^a、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－Ｃ$_{1-3}$アルキルＲ^{c}により置換されている。

【０１６１】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{4}がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がＣ$_{1-9}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－ＯＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$Ｃ$_{1-6}$アルキル、－ＯＣ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＯＣ$_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$アルキル、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-6}$アルキルおよび－ＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキルから独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；そしてこの鎖中の任意の窒素原子がＨ、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＯＲ^a、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－Ｃ$_{1-3}$アルキルＲ^{c}により置換されている。

【０１６２】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、Ｒ^{4}がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がＣ$_{1-9}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－ＯＲ^a、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$Ｃ$_{1-6}$アルキル、－ＯＣ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－ＯＣ$_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－ＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^a、－Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＣ$_{1-6}$アルキル、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-6}$アルキルおよび－ＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキルから独立に選択される１、２または３個の置換基により置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；そしてこの鎖中の任意の窒素原子がＨ、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＯＲ^a、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^a、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－Ｃ$_{1-3}$アルキルＲ^{c}により置換されている。

【０１６３】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4は複数の縮合６員環を含む１０員の二環式の環であって、０、１、２、３あるいは４個のＮ原子を含有し、残りが炭素原子であり、前記６員環の少なくとも１つが芳香環であり、前記炭素原子がＨ、ハロ、OR^a、NR^aR^a、C_{1-6}アルキルおよびC_{1-3}ハロアルキルにより置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されていてもよい。

【０１６４】

別の実施態様においては、上記および下記の実施態様のいずれか一つと関連して、R^4は複数の縮合６員環を含む１０員の二環式の環であって、１、２、３あるいは４個のＮ原子を含有し、残りが炭素原子であり、前記６員環の少なくとも１つが芳香環であり、前記炭素原子がＨ、ハロ、OR^a、NR^aR^a、C_{1-6}アルキルおよびC_{1-3}ハロアルキルにより置換され；そして不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されている。

【０１６５】

本発明の別の側面は、急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を伴う皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療する方法であって、上記の実施態様のいずれかに従う化合物を投与する工程を含む方法に関する。

【０１６６】

本発明の別の側面は、上記の実施態様のいずれかに従う化合物および薬学的に許容できる希釈剤またはキャリアを含む医薬組成物に関する。

【０１６７】

本発明の別の側面は、上記の実施態様のいずれかに従う化合物の医薬としての使用に関する。

【０１６８】

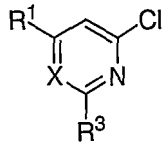
本発明の別の側面は、急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を伴う皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療するための医薬の製造において上記の実施態様のいずれかに従う化合物を使用することに関する。

【０１６９】

本発明の別の側面は、

【０１７０】

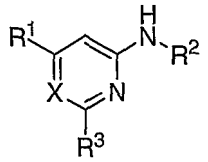
【化２１】



とR^2NH_2とを反応させて、

【０１７１】

【化２２】



を形成する工程を含む上記の実施態様に従う化合物を製造する方法に関する。

【０１７２】

本発明の化合物は一般にいくつかの不斉中心を有してもよく、そして典型的にはラセミ混合物の形で表される。本発明はラセミ混合物、部分的にラセミの混合物および別々のエナンチオマーとジアステレオマーを含むことを意図している。

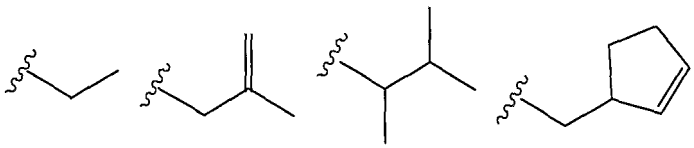
【０１７３】

別段のことわりがない限り、次の定義は明細書および特許請求の範囲に見出される用語に当てはまる：

「$C_{\alpha-\beta w}$アルキル」は分岐、環状あるいは線状の関係により、あるいはこれら３つの組み合わせにより最小のαおよび最大のβ個の炭素原子を含むアルキル基を意味し、αおよびβは整数を表す。この節において述べるアルキル基は、１つあるいは２つの二重あるいは三重結合も含有してもよい。C_{1-6}アルキルの例は、限定するものではないが次のものを含む：

【０１７４】

【化２３】



【０１７５】

「ベンゾ基」は、単独あるいは結合して、二価の基C_4H_4＝を意味し、これの一つの代表は－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－であり、これは別の環に隣接して結合する場合、ベンゼン様の環－例えばテトラヒドロナフチレン、インドールなどを形成する。

【０１７６】

「ハロ」または「ハロゲン」はＦ、Ｃｌ、ＢｒおよびＩから選択されるハロゲン原子を意味する。

【０１７７】

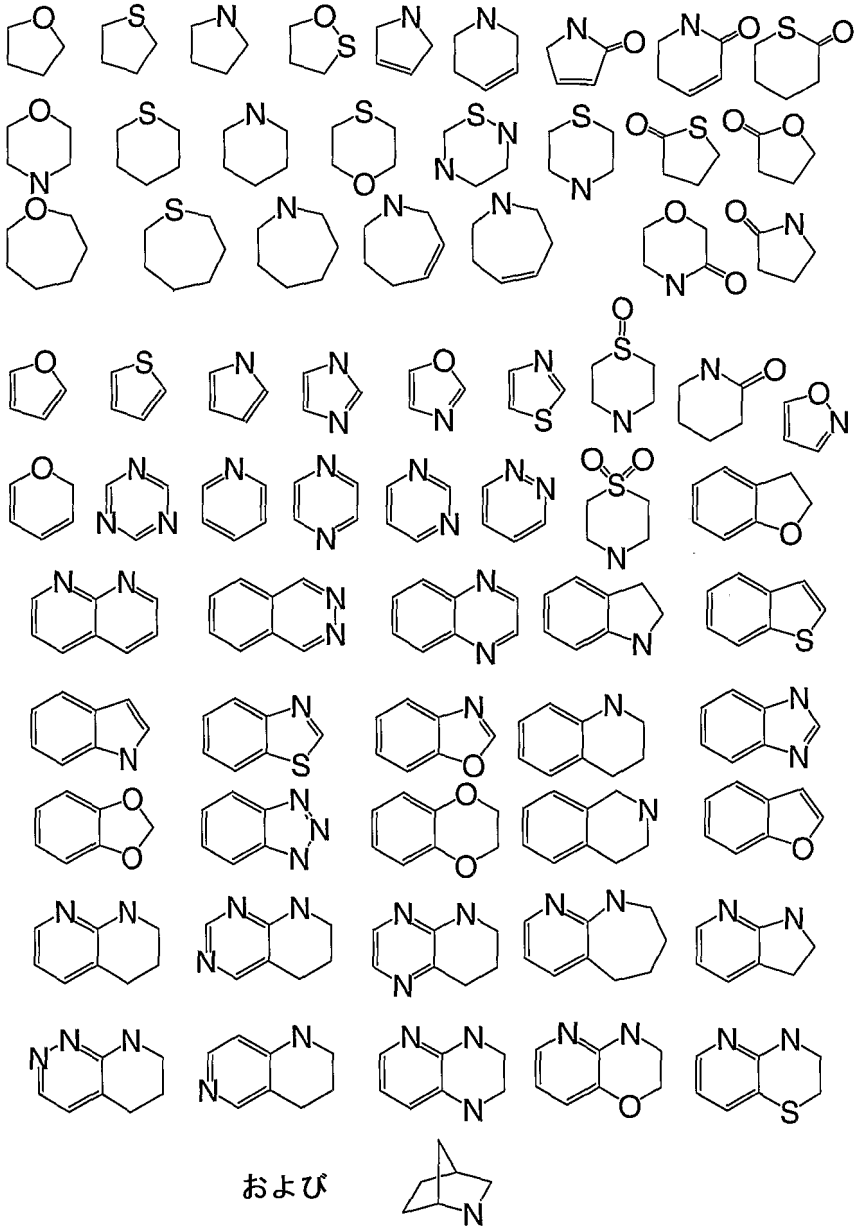
「C_{v-w}ハロアルキル」は、上述のように、そのアルキル鎖に結合した任意の数－少なくとも１つ－の水素原子がＦ、Ｃｌ、ＢｒまたはＩにより置き換えられているアルキル基を意味する。

【０１７８】

「ヘテロ環」は、少なくとも１つ炭素原子とＮ、ＯおよびＳから選択される少なくとも１つの他の原子を含む環を意味する。特許請求の範囲中に見出されるヘテロ環の例は、限定するものではないが、次のものを含む：

【０１７９】

【化２４】



【０１８０】

「医薬的に許容できる塩」は慣用の手段により製造される塩を意味し、そして当業者にはよく知られている。この「医薬的に許容できる塩」は、無機および有機酸の塩基性塩を含み、限定するものではないが、塩酸、臭素水素酸、硫酸、リン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、リンゴ酸、酢酸、シュウ酸、酒石酸、クエン酸、乳酸、フマル酸、コハク酸、マレイン酸、サリシル酸、安息香酸、フェニル酢酸、マンデル酸などを含む。本発明の化合物がカルボキシ基などの酸性の官能基を含む場合、このカルボキシ基に対する好適な医薬的に許容できるカチオン対は当業者によく知られ、そしてアルカリカチオン、アルカリ土類カチオン、アンモニウムカチオン、四級アンモニウムカチオン等を含む。「医薬的に許容できる塩」の更なる例として、下記およびＢｅｒｇｅら，Ｊ．Ｐｈａｒｍ．Ｓｃｉ．６６：１（１９７７）を参照のこと。

【０１８１】

「脱離基」は、一般に、求核剤、例えばアミン、チオールあるいはアルコール求核剤により容易に置換され得る基を指す。このような脱離基は当分野でよく知られている。このような脱離基の例は、限定するものではないが、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシベンゾトリアゾール、ハライド、トリフレート、トシレートなどを含む。好まし

い脱離基は適切な場合には本明細書中で指示される。「保護基」は、一般に、選択された反応性基、例えばカルボキシ、アミノ、ヒドロキシ、メルカプトなどが所望しない反応、例えば求核反応、求電子反応、酸化、還元を受けないように使用される当分野でよく知られた基を指す。好ましい保護基は適切な場合には本明細書中で指示される。アミノ保護基の例は、限定するものではないが、アラルキル、置換アラルキル、シクロアルケニルアルキルおよび置換シクロアルケニルアルキル、アルキル、アリル、置換アリル、アシル、アルコキシカルボニル、アラルコキシカルボニル、シリルなどを含む。アラルキルの例は、限定するものではないが、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、アシルアミノ、アシルなどおよび塩、例えばホスホニウムおよびアンモニウム塩により場合によっては置換可能であるベンジル、オルト－メチルベンジル、トリチルおよびベンズヒドリルを含む。アリール基の例は、フェニル、ナフチル、インダニル、アントラセニル、９－（９－フェニルフルオレニル）、フェナントレニル、デュレニルを含む。シクロアルケニルアルキルまたは置換シクロアルキレニルアルキル基の例は、好ましくは６～１０個の炭素原子を有し、限定するものではないが、シクロヘキセニルメチルなどを含む。好適なアシル、アルコキシカルボニルおよびアラルコキシカルボニル基は、ベンジルオキシカルボニル、ｔ－ブトキシカルボニル、イソ－ブトキシカルボニル、ベンゾイル、置換ベンゾイル、ブチリル、アセチル、トリフルオロアセチル、トリクロロアセチル、フタロイルなどを含む。保護基の混合物を使用して、同一のアミノ基を保護することができ、例えば一級アミノ基は、アラルキル基およびアラルコキシカルボニル基の両方により保護可能である。アミノ保護基は結合している窒素と共にヘテロ環、例えば１，２－ビス（メチレン）ベンゼン、フタルイミジル、スクシンイミジル、マレイミジルなども形成することができ、そしてこれらのヘテロ環基は隣接するアリールおよびシクロアルキル環を更に含むことができる。加えて、このヘテロ環基は、ニトロフタルイミジルなどモノ－、ジ－あるいはトリ置換であることができる。アミノ基も塩酸塩、トルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸など付加塩の形成により所望しない反応、例えば酸化に対して保護されてもよい。このアミノ保護基の多くもカルボキシ、ヒドロキシおよびメルカプト基を保護するのに好適である。例えば、アラルキル基。ｔ－ブチルなどのアルキル基もヒドロキシおよびメルカプト基を保護するのに好適な基である。

【０１８２】

シリル保護基は、１つ以上のアルキル、アリールおよびアラルキル基により場合によっては置換されているケイ素原子である。好適なシリル保護基は、限定するものではないが、トリメチルシリル、トリエチルシリル、トリ－イソプロピルシリル、ｔ－ブチルジメチルシリル、ジメチルフェニルシリル、１，２－ビス（ジメチルシリル）ベンゼン、１，２－ビス（ジメチルシリル）エタンおよびジフェニルメチルシリルを含む。アミノ基のシリル化はモノ－あるいはジ－シリルアミノ基をもたらす。アミノアルコール化合物のシリル化はＮ，Ｎ，Ｏ－トリ－シリル誘導体を生じることができる。シリルエーテル官能基からのこのシリル官能基の除去は、例えば分離した反応段階としての、あるいはこのアルコール基との反応時系内での金属水酸化物またはフッ化アンモニウム反応試剤による処理により容易に行われる。好適なシリル化剤は、例えばトリメチルシリルクロリド、ｔ－ブチル－ジメチルシリルクロリド、フェニルジメチルシリルクロリド、ジフェニルメチルシリルクロリドまたはイミダゾールまたはＤＭＦとの合体生成物である。アミンのシリル化およびシリル保護基の除去のための方法は当業者によく知られている。対応するアミノ酸、アミノ酸アミドまたはアミノ酸エステルからこれらのアミン誘導体を製剤する方法もアミノ酸／アミノ酸エステルあるいはアミノアルコール化学を含む有機化学の業界の者にはよく知られている。

【０１８３】

保護基はこの分子の残りの部分に影響しない条件下で除去される。これらの方法は当分野でよく知られ、そして酸加水分解、水素化分解などを含む。好ましい方法は、アルコール、酢酸などまたはこれらの混合物などの好適な溶媒系中での炭素上のパラジウムを使用する水素化分解によるベンジルオキシカルボニル基の除去などの保護基の除去を伴う。Ｈ

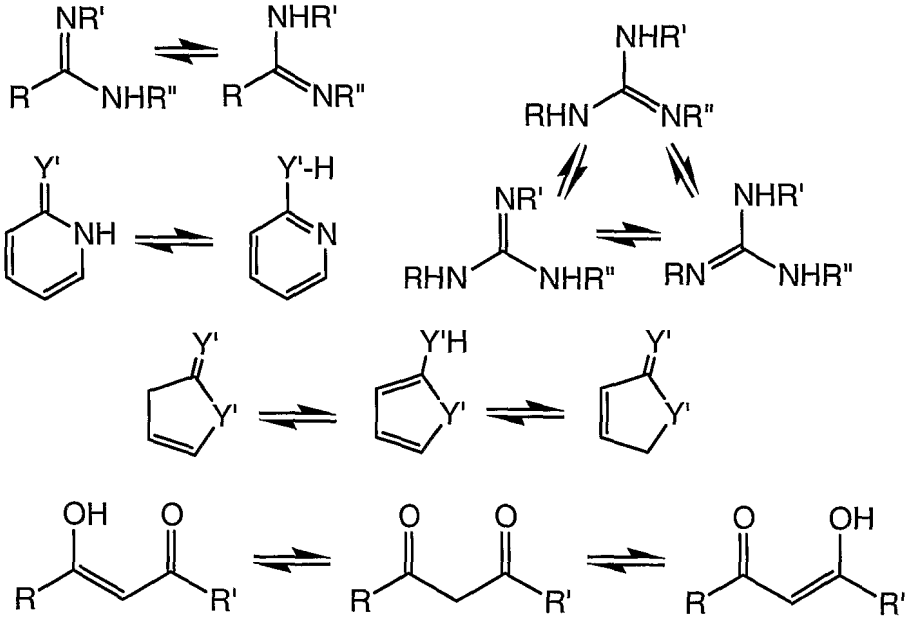
Ｃｌまたはトリフルオロ酢酸などの無機あるいは有機酸をジオキサンまたはメチレンクロリドなどの好適な溶媒系中で使用して、ｔ－ブトキシカルボニル保護基を除去することができる。この生成アミノ塩を容易に中和して、この遊離のアミンを得ることができる。カルボキシ保護基、例えばメチル、エチル、ベンジル、ｔ－ブチル、４－メトキシフェニルメチルなどは、当業者によく知られた加水分解および水素化分解条件下で除去可能である。

【０１８４】

本発明の化合物は、例えば環状および非環状のアミジンおよびグアニジン基、ヘテロ原子置換ヘテロアリール基（Ｙ’＝Ｏ、Ｓ、ＮＲ）などの互変異性形で存在し得る基を含有してもよいことを特記すべきであり、これらは次の例に例示され：

【０１８５】

【化２５】



そして１つの形が本明細書では命名され、記述され、示され、およびまたは特許請求されるが、すべての互変異性形はこのような命名、記述、表示および／または特許請求中に本来的に含まれるように意図されている。

【０１８６】

本発明の化合物のプロドラッグも本発明により考慮されている。プロドラッグは、このプロドラッグを患者に投与した後に加水分解、代謝などのインビボの生理学的作用により、本発明の化合物に化学的に変成される活性あるいは不活性な化合物である。プロドラッグの製造および使用に伴われる適合性および方法は、当業者によく知られている。エステルを含むプロドラッグの一般的な議論には、Ｓｖｅｎｓｓｏｎ ａｎｄ Ｔｕｎｅｋ Ｄｒｕｇ Ｍｅｔａｂｏｌｉｓｍ Ｒｅｖｉｅｗｓ １６５（１９８８） および Ｂｕｎｄｇａａｒｄ Ｄｅｓｉｇｎ ｏｆ Ｐｒｏｄｒｕｇｓ，Ｅｌｓｅｖｉｅｒ（１９８５）を参照のこと。マスクされたカルボキシレートアニオンの例は、種々のエステル、例えばアルキル（例えば、メチル、エチル）、シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）、アラルキル（例えば、ベンジル、ｐ－メトキシベンジル）、およびアルキルカルボニルオキシアルキル（例えば、ピバロイルオキシメチル）を含む。アミンはアリールカルボニルオキシメチル置換誘導体としてマスクされ、エステラーゼによりインビボで解裂され、この遊離の薬剤およびホルムアルデヒドを放出する（Ｂｕｎｇａａｒｄ Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２５０３（１９８９））。また、酸性ＮＨ基、例えばイミダゾール、イミド、インドールなどを含有する薬剤は、Ｎ－アシルオキシメチル基によりマスクされる（Ｂｕｎｄｇａａｒｄ Ｄｅｓｉｇｎ ｏｆ Ｐｒｏｄｒｕｇｓ，Ｅｌｓｅｖｉｅｒ（１９８５））。

ヒドロキシ基はエステルおよびエーテルとしてマスクされる。ＥＰ０３９，０５１（Ｓｌｏａｎ ａｎｄ Ｌｉｔｔｌｅ，４／１１／８１）は、マンニッヒ－ベースのヒドロキサム酸プロドラッグ、これらの製剤および使用を開示している。

【０１８７】

本明細書および特許請求の範囲は、「．．．および．．．から選択される」および「．．．あるいは．．．である」といった言葉遣い（時にはＭａｒｋｕｓｈグループと呼ばれる）を用いて種、実施態様および下位実施態様のリストを含む。この言葉遣いを本明細書で使用する場合には、別段のことわりがない限り、これは、この群を全体として、あるいはこれらの任意の単一の構成員として、あるいはこれらの下位群として含むように意味される。この言葉遣いの使用は単に略記の目的のためであり、そして必要に応じての個別の要素または下位群の除去を制限するようには決して意味されていない。

【０１８８】

一般的な実験法

別段のことわりがない限り、すべての材料を商品供給者から入手し、そして更に精製せずに使用した。別段のことわりがない限り、部はすべて重量によるものであり、温度は摂氏度である。すべての化合物は帰属した構造に一致するＮＭＲスペクトルを示した。融点はＢｕｃｈｉ装置で定量したものであり、未補正のものである。質量スペクトルデータをエレクトロスプレーイオン化法により求めた。すべての実施例は高性能液体クロマトグラフィにより定量して＞９５％純度まで精製したものであった。別段のことわりがない限り、反応を室温で行った。Ｓｍｉｔｈ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｚｅｒ（登録商標）装置（Ｐｅｒｓｏｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ，Ｉｎｃ．，Ｕｐｓｓａｌａ、Ｓｗｅｄｅｎ）を用いて、マイクロウエーブ反応を行った。

【０１８９】

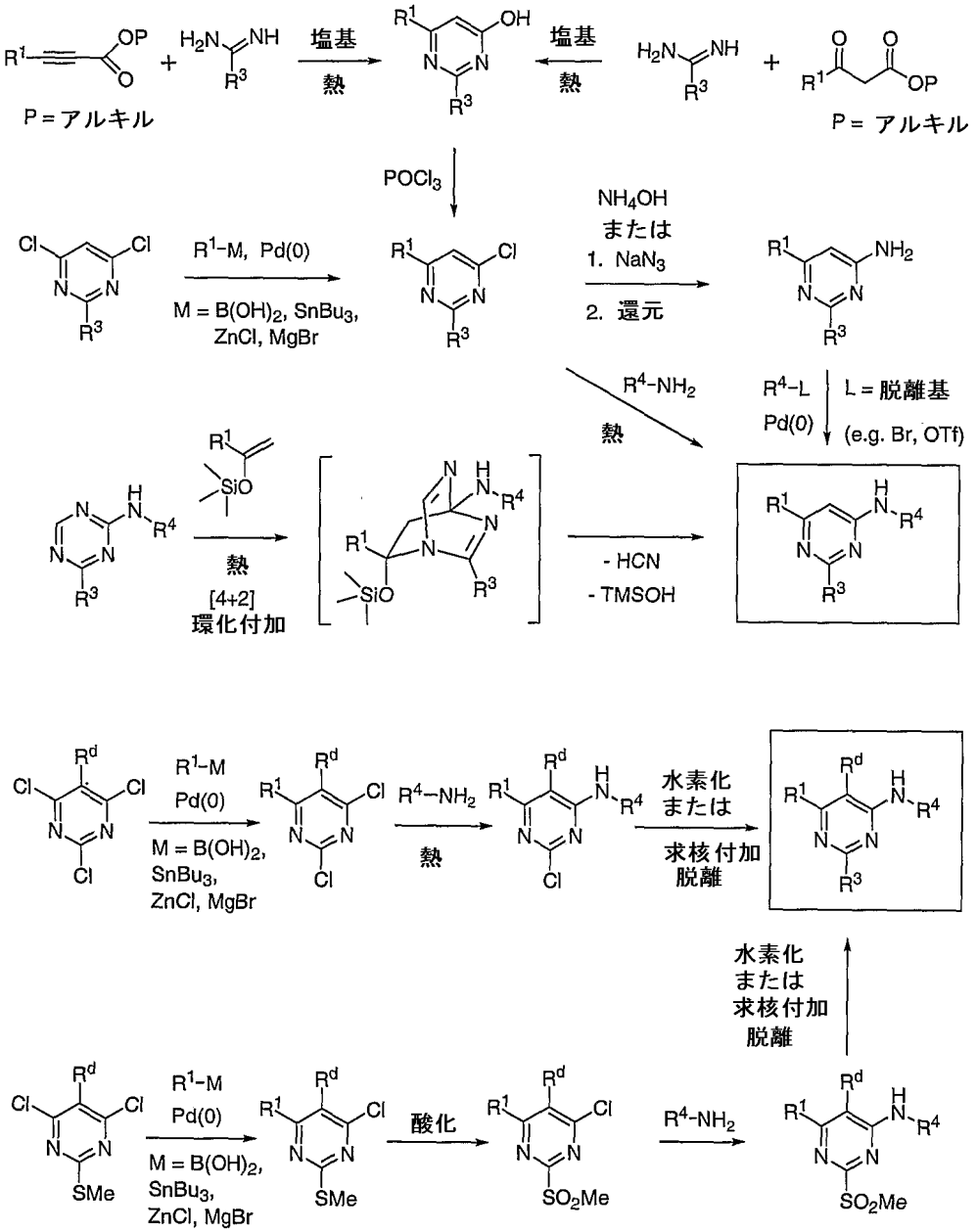
次の略称を使用する：

ａｑ－ 水溶液
ＢＩＮＡＰ－ ２，２’－ビス（ジフェニルホスフィノ）－１，１’－ビナフチル
ブライン－ 飽和水溶液ＮａＣｌ
ｃｏｎｃｄ－ 濃縮した
ＤＭＦ－ Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド
Et_2O－ ジエチルエーテル
ＢＳＡ－ Ｎ，Ｏ－ビス（トリメチルシリル）アセトアミド
ＢＳＴＦＡ－ Ｎ，Ｏ－ビス（トリメチルシリル）トリフルオロアセトアミド
ＮＭＰ Ｎ－メチルピロリジノン
ＥｔＯＡｃ－ 酢酸エチル
ＥｔＯＨ－ エチルアルコール
ｈ－ 時間
ｍｉｎ－ 分
ＭｅＯＨ－ メチルアルコール
ｓａｔｄ－ 飽和
ＴＨＦ－ テトラヒドロフラン
ＴＬＣ－ 薄層クロマトグラフィ

【０１９０】

【化２６】

スキームＩ：ピリミジン核の調製のための一般的なスキーム：

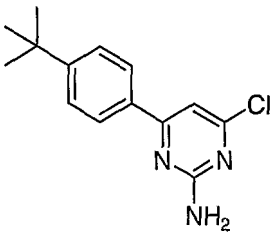


【０１９１】

（実施例１）

【０１９２】

【化２７】



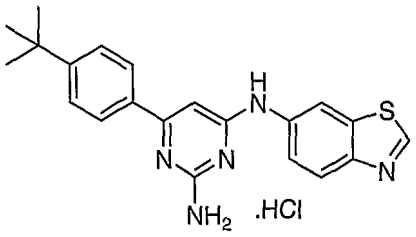
（ａ）４－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－クロロピリミジン－２－イルアミン

CH_3CN（３５ｍＬ）中に２－アミノ－４，６－ジクロロピリミジン（０．８８ｇ、

５．４ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）を入れた２５０ｍＬの丸底フラスコに４－ｔ－ブチルフェニルボロン酸（０．８０ｇ、４．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）およびＰｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（０．２６ｇ、０．２３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。１０％Ｎａ$_2$ＣＯ$_3$（２０ｍＬ）溶液を添加し、そしてこの生成した混合物を９０℃で１０時間Ｎ$_2$雰囲気下で攪拌した。この反応混合物を室温まで冷却した。この有機相を集め、そしてＮａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥した。この溶液を濾過し、真空中で濃縮して、この粗生成物を得、そしてヘキサン：ＥｔＯＡｃ（３：１）によるシリカゲルの上でのカラムクロマトグラフィにより所望の生成物を透明なオイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２６２（Ｍ＋１）。

【０１９３】

【化２８】



（ｂ）Ｎ^4－ベンゾチアゾール－６－イル－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－２，４－ジアミン塩酸塩

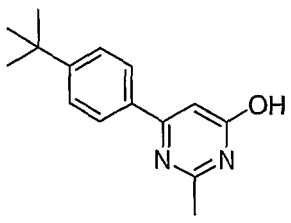
４－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－クロロピリミジン－２－イルアミン（０．１６ｇ、０．５９ミリモル）を入れた２５ｍＬの丸底フラスコに、６－アミノ－ベンゾチアゾール（０．１１ｇ、０．７１ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）とＥｔＯＨ（８ｍＬ）を添加した。この溶液をＮ$_2$雰囲気下還流で２０時間加熱した。この混合物を真空中で濃縮し、そしてこの残渣を溶媒混合物（２０ｍＬ、１：１のＭｅＯＨ：ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$）中に入れた。この溶液を濾過し、真空中で濃縮して、この生成物（５０ｍｇ、２３％）を白色固体として得た。この生成物固体（５０ｍｇ、０．１３ミリモル）を溶媒混合物（８ｍＬ、１：１ｖ／ｖ、ＭｅＯＨ：ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$）に再溶解し、ＨＣｌ溶液（０．１４ｍＬ、０．１４ミリモル、Ｅｔ$_2$Ｏ中１．０Ｎ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの溶液を真空中で濃縮することにより、塩酸塩塩の形成を行った。この表題化合物をオフホワイトの固体として得た。ＭＰ：２２０－２２２℃。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７６（Ｍ＋１）。

【０１９４】

（実施例２）

【０１９５】

【化２９】



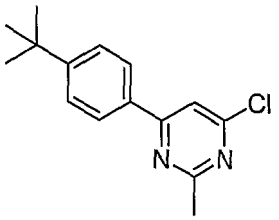
（ａ）６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－オール

２５０ｍＬの丸底フラスコにエチル３－（４－ｔ－ブチルフェニル）プロパ－２イノエート（１．５ｇ、６．５ミリモル）、ＥｔＯＨ（５０ｍＬ）、アセトアミジン塩酸塩（１．５ｇ、１６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）およびナトリウムエトキシド（１．６ｇ、２３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この生成した溶液をＮ$_2$下還流で１６時間加熱した。この反応混合物を２５℃まで冷却し、この溶媒を真空中で除去し、そしてこの残渣

をＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）と水（２５ｍＬ）により処理した。この混合物を２Ｎ　ＨＣｌによりｐＨ～４．０まで酸性とした。この有機相を分離し、そして水（２０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（ステップ勾配、１：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ、次に２０：２０：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ／ＭｅＯＨ）による精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２４３（Ｍ＋１）。

【０１９６】

【化３０】

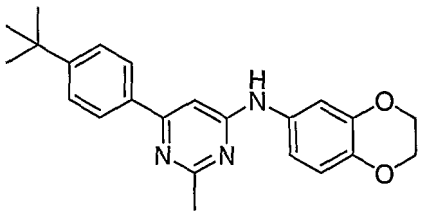


（ｂ）６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロ－２－メチルピリミジン

１００ｍＬの丸底フラスコに６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－オール（０．１５ｇ、０．６２ミリモル）とオキシ塩化リン（８．０ｍＬ、８６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この生成した溶液をN_2下還流で３時間加熱した。この溶液を真空中で濃縮して、この表題生成物を黄色オイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２６１（Ｍ＋１）。

【０１９７】

【化３１】



（ｃ）［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］－ジオキシン－６－イル）アミン

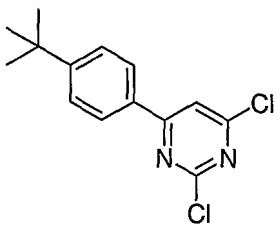
１，４－ジオキサン（８ｍＬ）中に６－（４－（ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロ－２－メチルピリミジン（０．１４ｇ、０．６０ミリモル）を入れた１００ｍＬの丸底フラスコに１，４－ベンゾジオキサン－６－アミン（０．１１ｇ、０．７２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この生成した溶液をN_2下還流で５時間加熱した。この溶媒を真空中で除去し、そしてこの粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィ（３：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）により精製して、この表題生成物を黄色オイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７６（Ｍ＋１）。

【０１９８】

（実施例３）

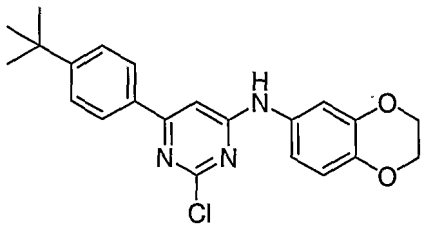
【０１９９】

【化３２】



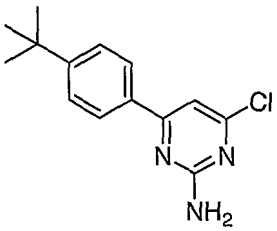
（ａ）６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２，４－ジクロロピリミジン
（Ｆｉｎｃｈ、Ｈ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．、Ｐｅｒｋｉｎ　Ｔｒａｎｓ．１　１９９４、９、１１９３；Ｇｏｎｇ、Ｙ．Ｓｙｎ１ｅｔｔ２０００、６、８２９の手順に類似して）
CH_3CN（１００ｍＬ）中に２，４，６－トリクロロピリミジン（２６ｇ、０．１４モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を入れた２５０ｍＬの丸底フラスコに４－ｔ－ブチルフェニルボロン酸（７．２ｇ、４０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）と$Pd(PPh_3)_4$（１．４ｇ、１．２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この混合物を１０％Na_2CO_3水溶液（６０ｍＬ）に処理し、次にN_2下で９０℃で一晩磁気撹拌した。この反応混合物をＥｔＯＡｃ（８０ｍＬ）、CH_3CN（５０ｍＬ）および水（５０ｍＬ）により希釈した。この混合物を２５℃まで冷却し、そしてこの生成した沈澱を濾過により集めた。この沈澱をCH_2Cl_2（１４０ｍＬ）に溶解し、飽和ＮａＣｌ（６０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（６：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を得た。シリカゲルクロマトグラフィ（６：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２８１（Ｍ＋１）。

【０２００】
【化３３】



（ｂ）［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－クロロピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］－ジオキシン－６－イル）アミン
（Ａｂｄｅ１－Ｆａｔｔａｈ、Ａ．Ｊ．Ｃｈｅｍ．Ｒｅｓ．Ｓｙｎｏｐ．１９９４、１１、４１２の手順に類似して）
１：１ＥｔＯＨ／１，４－ジオキサン（１００ｍＬ）中の６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２，４－ジクロロピリミジン（３．０ｇ、１１ミリモル）を入れた２５０ｍＬの丸底フラスコに１，４－ベンゾジオキサン－６－アミン（１．３ｇ、８．６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を２５℃で一晩撹拌し、そしてこの溶媒を真空中で除去した。シリカゲルクロマトグラフィ（６：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３９６（Ｍ＋１）。

【０２０１】
（実施例４）
【０２０２】
【化３４】

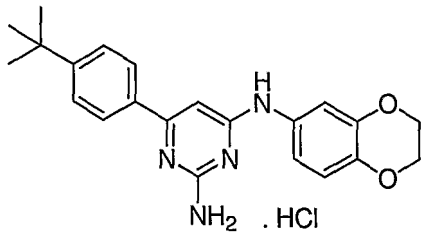


（ａ）６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロピリミジン－２－イルアミン
３５ｍＬCH_3CN中の４，６－ジクロロ－２－アミノピリミジン（０．８７ｇ、５．４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を入れた１００ｍＬの丸底フラスコに４－ｔ－ブチルフェニ

ルボロン酸（０．８０ｇ、４．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）とＰｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（０．２６ｇ、０．２３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。１０％Ｎａ$_2$ＣＯ$_3$水溶液（２０ｍＬ）を添加し、そしてこの混合物をＮ$_2$下で９０℃で一晩攪拌した。この有機相を集め、そしてＮａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥した。ヘキサン／ＥｔＯＡｃ（３：１）によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この所望の生成物を透明なオイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２６２（Ｍ＋１）。

【０２０３】

【化３５】



（ｂ）［２－アミノ－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］－ジオキシン－６－イル）アミン塩酸塩

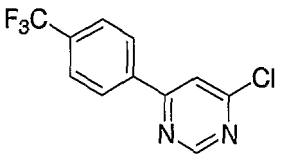
ＥｔＯＨ（８ｍＬ）中の６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロピリミジン－２－イルアミン（０．１６ｇ、０．５９ミリモル）を入れた２５０ｍＬの丸底フラスコに１，４－ベンゾジオキサン－６－アミン（０．１１ｇ、０．７１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この溶液を還流で８時間加熱し、そしてこの溶媒を真空中で除去した。シリカゲルクロマトグラフィ（１０：１０：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ／ＭｅＯＨ）による精製によって、この表題生成物を遊離塩基（０．１３ｇ、５７％）として得た。ＭｅＯＨ（８ｍＬ）中のこの遊離塩基（０．１３ｇ、０．３５ミリモル）を溶解することにより、この塩酸塩塩を製造した。この溶液にＨＣｌ（０．３５ｍＬ、０．３５ミリモル、Ｅｔ$_2$Ｏ中１．０Ｍ　ＨＣｌ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、この混合物を２５℃で１０分間攪拌し、そしてこの溶媒を真空中で除去して、この表題生成物を得た。ＭＰ：２２１－２２４℃。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７７（Ｍ＋１）。

【０２０４】

（実施例５）

【０２０５】

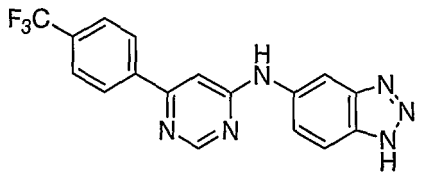
【化３６】



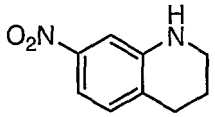
（ａ）４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン

５００ｍＬの丸底フラスコに４，６－ジクロロピリミジン（１４ｇ、９５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、４－（トリフルオロメチル）フェニルボロン酸（６．０ｇ、３２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、アセトニトリル（９５ｍＬ）および１Ｍ炭酸ナトリウム水溶液（９５ｍＬ）を添加した。Ｎ$_2$により１５分間噴霧することにより、この混合物を脱酸素した。触媒のＰｄ（ＰＰｈ$_3$）$_4$（１．９ｇ、１．６ミリモル、Ｓｔｒｅｍ）を添加し、そしてこの黄色混合物を８０℃で１５時間加熱した。２５℃まで冷却後、この溶液を濃縮して、このアセトニトリルを除去した。この溶液をＮａＨＣＯ$_3$水溶液により希釈し、そしてＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$により抽出した。合せた抽出物をＮａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。ヘキサン中の１．５％から１０％の勾配の酢酸エチルの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２５９（Ｍ＋１）。

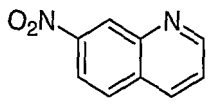
【０２０６】
【化３７】



（ｂ）（１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．１０ｇ、０．３９ミリモル）、５－アミノベンゾトリアゾール（０．０５２ｇ、０．３９ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）およびエタノール（１ｍＬ）の混合物を電子レンジ中１８０℃で２０分間加熱した。この混合物を飽和ＮａＨＣＯ$_3$により希釈し、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。合せた抽出物をＮａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。ヘキサン中の３０％から７０％の勾配の酢酸エチルの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３５７（Ｍ＋１）。
【０２０７】
（実施例６）
【０２０８】
【化３８】



（ａ）７－ニトロ－１，２，３，４－テトラヒドロキノリン
１，２，３，４－テトラヒドロキノリン（１９ｍＬ、０．１５モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を攪拌しながら濃Ｈ$_2$ＳＯ$_4$（５４ｍＬ）の中に０℃で３０分間にわたって滴加した。次に、氷浴により冷却することにより、内部反応温度を５－１０℃に維持しながらこの溶液に濃Ｈ$_2$ＳＯ$_4$（３０ｍＬ）と９０％ＨＮＯ$_3$（６．４ｍＬ、０．１７モル）の混合物を攪拌しながら約２．５時間滴加した。この反応混合物を２．５時間攪拌し、そして２５℃までゆっくりと温めた。次に、この混合物を砕いた氷（～１Ｌ）に添加し、そしてｐＨ８に達するまで攪拌しながら固体ＫＯＨにより処理した。この生成した懸濁液を濾過し、そしてこの濾液をＥｔＯＡｃ（１．５Ｌ）により洗浄した。この水相をＥｔＯＡｃ（２×５００ｍＬ）により抽出し、このＥｔＯＡｃ相を合せ、１Ｎ　ＮａＯＨ（１Ｌ）と飽和ＮａＣｌ（５００ｍＬ）により洗浄し、ＭｇＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（８：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を明るい黄橙色結晶として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ１７９（Ｍ＋１）。
【０２０９】
【化３９】

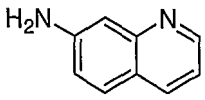


（ｂ）７－ニトロキノリン
ジクロロメタン（５００ｍＬ）中の７－ニトロ－１，２，３，４－テトラヒドロキノリン（４．０ｇ、２２ミリモル）の溶液を２５℃で攪拌し、そして区分けした２，３－ジク

ロロ－５，６－ジシアノ－１，４－ベンゾキノン（１０ｇ、４４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この反応混合物を２５℃で１時間攪拌し、次に濾過し、そしてこのフィルターケーキをジクロロメタンにより洗浄した。この濾液を濃縮して、褐色固体（４．４ｇ）を得た。この粗生成物を熱ＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）に溶解し、脱色用炭素（１ｇ）により処理し、セライト（登録商標）から濾過し、そして濃縮した。ＥｔＯＡｃからの再結晶によって、この表題生成物を黄橙色－黄褐色固体として得た。シリカゲルクロマトグラフィ（２５％ＥｔＯＡｃ／ヘキサン）によるこの濃縮母液の精製によって、更なる量のこの表題生成物をオフホワイトの固体として得た。

【０２１０】

【化４０】

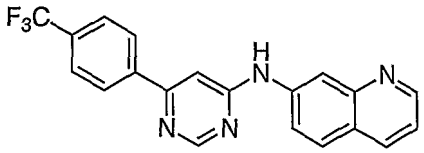


（ｃ）７－キノリルアミン

ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）中の７－ニトロキノリン（３．２ｇ、１８ミリモル）の溶液をN_2によりパージし、そして炭素上の１０％パラジウム（１．０ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この懸濁液をH_2により掃気し、そして１気圧のH_2の下で１６時間磁気攪拌した。この混合物をN_2によりパージし、セライト（登録商標）を通して濾過し、そして真空中で濃縮した。ジクロロメタン中の５％から１０％の勾配のＭｅＯＨ溶液でのシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ１４５（Ｍ＋１）。

【０２１１】

【化４１】



（ｄ）キノリル－７－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

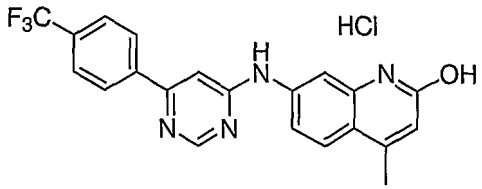
磁気攪拌棒付きのガラスバイアルに実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチル－フェニル）ピリミジン（０．３０ｇ、１．２ミリモル）と７－キノリルアミン（０．１７ｇ、１．２ミリモル）を添加した。この固体を攪拌し、そして電子レンジ中２００℃で１０分間加熱した。この生成した固体を飽和$NaHCO_3$（１００ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）の間で分配した。この有機相を飽和ＮａＣｌ（５０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。この粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィ（６０％酢酸エチル／ヘキサン）により精製し、シリカゲルクロマトグラフィ（５０％ＥｔＯＡｃ／ジクロロメタン）により再度精製し、そして固体まで濃縮し、１：１CH_2Cl_2／ヘキサン（５０ｍＬ）と共にすりつぶした。この固体を真空中６０℃で一晩乾燥し、この表題生成物を淡黄褐色固体として得た。ＭＰ：２６０℃。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３６７（Ｍ＋１）。

【０２１２】

（実施例７）

【０２１３】

【化４２】



４－メチル－７－｛［６（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミノ｝キノリン－２－オール、塩酸塩

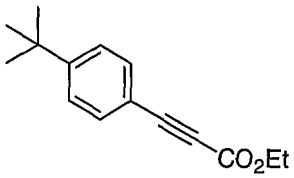
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（１５０ｍｇ、０．５８ミリモル）とカルボスチリル１２４（５０ｍｇ、０．２９ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、ＭｅＯＨからの再結晶後、この表題生成物を明るい黄色結晶を得た。ＭＰ：３７３℃（分解しながら）ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３９７（Ｍ＋１）。

【０２１４】

（実施例８）

【０２１５】

【化４３】

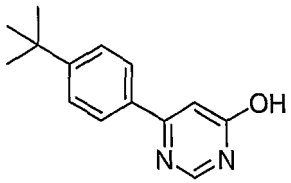


（ａ）エチル３－（４－ｔ－ブチルフェニル）プロパ－２イノエート

ＴＨＦ（１５０ｍＬ）中の４－ｔ－ブチルフェニルアセチレン（１０ｇ、６４ミリモル、ＧＦＳ　Ｃｈｅｍｉｃａｌｓ）の溶液を入れた５００ｍＬの丸底フラスコにｎ－ブチルリチウム（４０ｍＬ、６４ミリモル、ヘキサン中１．６Ｍ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を攪拌しながら－７８℃で添加した。この添加を完結した後、この反応混合物を－７８℃で４０分間攪拌した。次に、この溶液を０℃まで温め、そして３０分間攪拌した。この溶液を－７８℃まで冷却し、そしてエチルクロロホルメート（６．１ｍＬ、６４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。２時間攪拌後、この溶液を２５℃まで温め、そして一晩攪拌した。この反応物を５％ＮａＨＣＯ$_3$水溶液（８０ｍＬ）と飽和ＮａＣｌ（８０ｍＬ）によりクエンチし、そしてＥｔＯＡｃ（２×１３０ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物を水（２×１５ｍＬ）により洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（２０：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２３１（Ｍ＋１）。

【０２１６】

【化４４】



（ｂ）６－［４－ｔ－ブチルフェニル］ピリミジン－４－オール

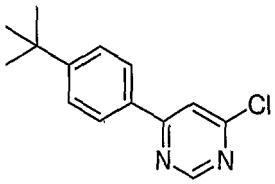
（Ｈａｄｄａｃｈ、Ｍ．Ｊ．Ｆｌｕｏｒｉｎｅ　Ｃｈｅｍ．１９９１、５１、１９７の手順に類似して）

２５０ｍＬの丸底フラスコにエチル３－（４－ｔ－ブチルフェニル）プロパ－２イノエート（１．９ｇ、８．４ミリモル）、ＥｔＯＨ（１００ｍＬ）、ホルムアミジン塩酸塩（

１０ｇ、０．１３モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）およびジイソプロピルエチルアミン（２２ｍＬ、０．１３モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この溶液をN_2下還流で６時間加熱した。この反応混合物を２５℃まで冷却し、この溶媒を真空中で除去し、そしてこの残渣をN_2下１７０℃で２時間加熱した。この残渣を２５℃まで冷却し、そしてＥｔＯＨ（１５ｍＬ）に溶解した。この溶液をナトリウムエトキシド（１５ｍＬ、２１重量％、４６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理し、次にN_2下還流で４時間加熱した。この反応混合物をＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）により希釈し、そして２Ｎ　ＨＣｌによりｐＨ～４．０まで酸性とした。この有機相を分離し、水（５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（ステップ勾配、１：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ、次に２０：２０：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ／ＭｅＯＨ）による精製によって、この表題生成物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２２９（Ｍ＋１）。

【０２１７】

【化４５】

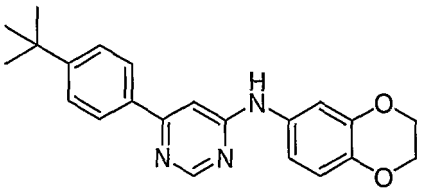


（ｃ）６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロピリミジン

１００ｍＬの丸底フラスコに６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－オール（０．７３ｇ、３．２ミリモル）とオキシ塩化リン（２５ｍＬ、０．２７モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この生成した溶液をN_2下還流で３時間加熱した。この溶液を真空中で濃縮して、この表題生成物を黄色オイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２４７（Ｍ＋１）。

【０２１８】

【化４６】



（ｄ）［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン

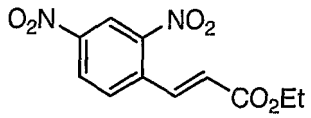
１，４－ジオキサン（５ｍＬ）中の６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－クロロピリミジン（０．２５ｇ、１．０ミリモル）を入れた１００ｍＬの丸底フラスコに１，４－ベンゾジオキサン－６－アミン（０．１５ｇ、１．０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この溶液をN_2下還流で３時間加熱した。この溶媒を真空中で除去し、そしてこの残渣をシリカゲルクロマトグラフィ（２：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）により精製して、この表題生成物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３６２（Ｍ＋１）。ＭＰ：１９９－２０２℃。

【０２１９】

（実施例９）

【０２２０】

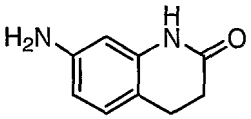
【化４７】



（ａ）エチル３－（２，４－ジニトロフェニル）プロパ－２－エノエート
ベンゼン（２００ｍＬ）中の２，４－ジニトロベンズアルデヒド（１０ｇ、５１ミリモル、Ａｖｏｃａｄｏ）とメチル（トリフェニルホスホラニリデン）－アセテート（１７ｇ、５１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物をN_2下還流で３時間加熱した。この反応混合物を２５℃まで冷却し、そしてEt_2O（５００ｍＬ）により希釈した。この混合物を水（３×２００ｍＬ）と飽和ＮａＣｌ（１００ｍＬ）により洗浄し、$MgSO_4$の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（４：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を明るい黄色固体として得た。

【０２２１】

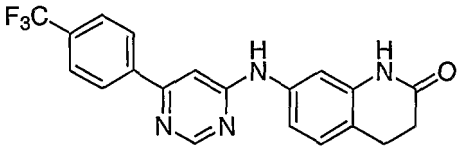
【化４８】



（ｂ）７－アミノ－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－２－オン
ＥｔＯＨ（１５０ｍＬ）と氷酢酸（１０ｍＬ）中のエチル３－（２，４－ジニトロフェニル）プロパ－２－エノエート（１０ｇ、３８ミリモル）の溶液に炭素上の１０％パラジウム（５．０ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物をＰａｒｒ　ｓｈａｋｅｒ装置により６０ｐｓｉのH_2下２５℃で６時間水素化した。この反応混合物をN_2によりパージし、セライト（登録商標）を通して濾過し、そしてこのフィルターケーキをＥｔＯＨ（４００ｍＬ）により洗浄した。この濾液を真空中で濃縮して、この表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１６３（Ｍ＋１）。

【０２２２】

【化４９】



（ｃ）３，４－ジヒドロ－７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－キノリン－２－オン
ＥｔＯＨ（２０ｍＬ）中の実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（３．２ｇ、１２ミリモル）と７－アミノ－１，３，４－トリヒドロキノリン－２－オン（１．０ｇ、６．２ミリモル）の混合物を４．５時間還流で攪拌した。この生成した懸濁液を２５℃まで冷却し、次にＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）により希釈した。この固体を濾過により集め、ＥｔＯＡｃ（３０ｍＬ）とヘキサン（３０ｍＬ）により洗浄し、そして真空中で乾燥して、２．９ｇ（９７％）の７－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イルアミノ］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－２－オン塩酸塩を明るい黄色固体として得た。この固体（４６０ｍｇ、１．１ミリモル）の部分をＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）と１Ｎ　ＮａＯＨ（１００ｍＬ）の間で分配した。この有機相を分離し、そして水（５０ｍＬ）と飽和ＮａＣｌ（５０ｍＬ）により洗浄し、次に真空中シリカゲル上で乾燥した。シリカゲルクロマトグラフィ（５％ＭｅＯＨ

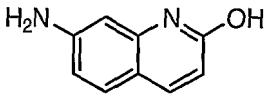
／ジクロロメタン）による精製によって、この表題生成物を３８０ｍｇ（９０％）非晶質のオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８５（Ｍ＋１）。

【０２２３】

（実施例１０）

【０２２４】

【化５０】

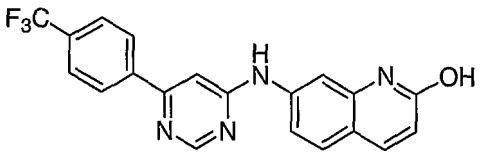


（ａ）７－アミノキノリン－２－オール

実施例９（ｂ）の７－アミノ－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－２－オン（１．０ｇ、６．２ミリモル）を還流コンデンサーを備えた火焔乾燥した丸底フラスコ中でN_2下で無水１，４－ジオキサン（２０ｍＬ）に懸濁させた。この懸濁液を２５℃で磁気攪拌し、そして２，３－ジクロロ－５，６－ジシアノ－１，４－ベンゾキノン（１．７ｇ、７．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、続いてＮ，Ｏ－ビス（トリメチルシリル）アセトアミド（７．６ｍＬ、３．１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この反応混合物を１０５℃油浴中で４５分間攪拌し、次に微細な焼結ガラス漏斗を通して熱い間に濾過した。この濾液を真空中で濃縮し、次にシリカゲル（ジクロロメタン中の５％ＭｅＯＨ）の短いプラグから濾過し、そして再度濃縮して、３．１ｇの褐色固体を得た。この固体を１Ｎ　ＨＣｌに溶解し、そしてＥｔＯＡｃにより洗浄した。５Ｎ　ＮａＯＨと氷酢酸を添加することにより、この水相のｐＨを～５に調整した。この溶液をＮａＣｌにより飽和させ、そして水相がＴＬＣにより生成物を含まないように見えるまでｎ－ブタノールにより抽出した。この組み合せたｎ－ブタノール抽出物を真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（ジクロロメタン中５％ＭｅＯＨ）によるこの残渣の精製によって、この表題生成物を淡黄橙色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１６１（Ｍ＋１）。

【０２２５】

【化５１】

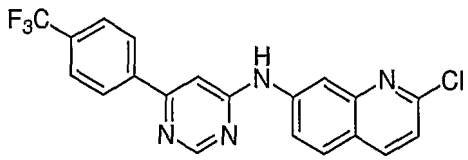


（ｂ）７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール

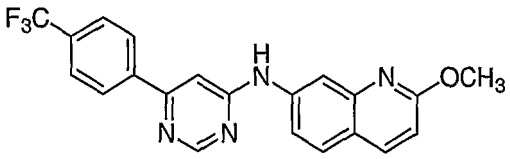
実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．４８ｇ、１．９ミリモル）、７－アミノキノリン－２－オール（０．１５ｇ、０．９４ミリモル）およびＥｔＯＨ（１．５ｍＬ）の混合物を攪拌し、そして電子レンジ中１６０℃で１０分間加熱した。この生成した明るい黄色固体を濾過により集め、そしてＥｔＯＡｃ（３０ｍＬ）とヘキサン（３０ｍＬ）により洗浄した。この固体を１Ｎ　ＮａＯＨ（１００ｍＬ）に懸濁させ、激しく振盪し、次にこの懸濁液を氷ＡｃＯＨにより０℃でｐＨ～５まで酸性とした。この生成した懸濁液を濾過し、そしてこの固体をシリカゲルクロマトグラフィ（ステップ勾配：ジクロロメタン中５－１０％ＭｅＯＨ）により精製し、ＭｅＯＨとジクロロメタンから再結晶し、そして真空中８０℃で乾燥して、２５５ｍｇ（７１％）のこの表題生成物を淡黄色結晶として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８３（Ｍ＋１）。ＭＰ：３３７℃（分解しながら）。

【０２２６】

（実施例１１）
【０２２７】
【化５２】



（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
実施例９（ｃ）の７－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－２－オン塩酸塩（５００ｍｇ、１．２ミリモル）を還流コンデンサーを備えた火焔乾燥した丸底フラスコ中に無水１，４－ジオキサン（１０ｍＬ）にN_2下で懸濁させた。この懸濁液を２５℃で磁気攪拌し、そして２，３－ジクロロ－５，６－ジシアノ－１，４－ベンゾキノン（３５０ｍｇ、１．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、続いてビス（トリメチルシリル）トリフルオロアセトアミド（１．４ｍＬ、５．３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この反応混合物を１０５℃油浴中で１５分間攪拌し、次に２５℃まで冷却し、ＥｔＯＡｃ（１５０ｍＬ）と１％$NaHSO_3$水溶液（１００ｍＬ）の間に分配した。この生成した乳化液を安定させ、そしてこの有機相を分離し、そして真空中で褐色固体（１．１ｇ）まで濃縮した。この固体をオキシ塩化リン（１０ｍＬ、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理し、そして１００℃油浴中で１時間攪拌した。室温まで冷却後、ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）にゆっくり添加することによりこの反応物をクエンチし、次に真空中で濃縮した。この残渣を３０％NH_4OHと氷（２００ｍＬ）の混合物により処理し、次にＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物を飽和ＮａＣｌ（５０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（ヘキサン中３０％ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物と（２－メトキシキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（実施例１２）の混合物およびこの純粋な表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０１（Ｍ＋１）。ＭＰ：２３３℃。
【０２２８】
（実施例１２）
【０２２９】
【化５３】



（２－メトキシキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミンと実施例１１の（２－メトキシキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（２１０ｍｇ）の混合物を、ＭｅＯＨ（５０ｍＬ）にアセチルクロリド（５ｍＬ）を添加することにより製造したＭｅＯＨ中のＨＣｌの溶液に溶解した。この反応混合物を２５℃で１５時間攪拌し、そして還流で２時間加熱した。この溶液を真空中で濃縮し、そしてこの残渣をＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）と１Ｎ　ＮａＯＨ（５０ｍＬ）の間で分配した。この有機相を水（２０ｍＬ

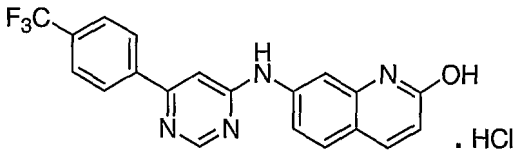
）、飽和ＮａＣｌ（２０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（ヘキサン中の２５％ＥｔＯＡｃ）による精製と、それに続くＥｔＯＡｃとヘキサンからの再結晶によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３９７（Ｍ＋１）。ＭＰ：１９９℃。

【０２３０】

（実施例１３）

【０２３１】

【化５４】

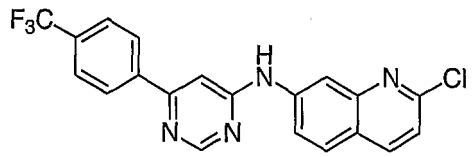


（ａ）７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール塩酸塩

実施例９（ｃ）の７－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－２－オン塩酸塩（１．０ｇ、２．４ミリモル）を還流コンデンサーを備えた火焔乾燥した丸底フラスコ中で無水１，４－ジオキサン（１５ｍＬ）にN_2下で懸濁させた。この懸濁液を２５℃で磁気攪拌し、そして２，３－ジクロロ－５，６－ジシアノ－１，４－ベンゾキノン（７１０ｍｇ、３．１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、続いてビス（トリメチルシリル）－トリフルオロアセトアミド（２．８ｍＬ、１０．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この反応混合物を１０５℃油浴中で７５分間攪拌し、次に２５℃まで冷却し、そして～５ｍＬの容積まで濃縮した。この混合物を１Ｎ　ＨＣｌ（１００ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）により処理し、そして激しく振盪した。この生成した微細な沈澱を濾過により集め、そして風乾して、この表題生成物を緑色－黄褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８３（Ｍ＋１）。

【０２３２】

【化５５】

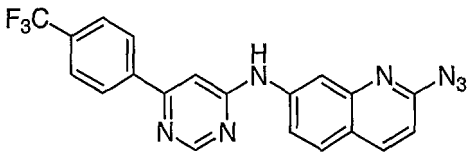


（ｂ）（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール塩酸塩（８１０ｍｇ、１．９ミリモル）とオキシ塩化リン（５ｍＬ）の混合物を１００℃油浴中で１時間磁気攪拌した。この反応混合物を２５℃まで冷却し、次に砕いた氷により１５０ｍＬまで希釈した３０％NH_4OH（１００ｍＬ）にゆっくり添加した。この混合物を真空中で～１００ｍＬまで濃縮し、そしてこの生成した暗褐色沈澱を濾過により集めた。この水相をｎ－ブタノール（１００ｍＬ）により抽出し、そしてこの抽出物と沈澱を合せ、そして真空中で濃縮した。ジクロロメタン中の１０％から３０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０１（Ｍ＋１）。

【０２３３】

【化５６】

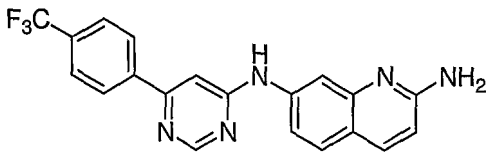


（ｃ）（２－アジドキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

ジメチルスルホキシド（８ｍＬ）中の（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（５００ｍｇ、１．２ミリモル）の溶液をナトリウムアジド（８１０ｍｇ、１２ミリモル）により処理し、そして１１０℃油浴中で１８時間磁気攪拌した。この反応混合物を２５℃まで冷却し、そして水（１００ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）により処理した。この混合物を激しく振盪し、そしてこの生成した沈澱を濾過により集めて、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０８（Ｍ＋１）。

【０２３４】

【化５７】



（ｄ）Ｎ^{7}－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，７－ジアミン

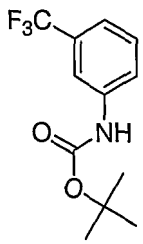
１，４－ジオキサン（３０ｍＬ）中の（２－アジドキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（４２５ｍｇ、１．０ミリモル）とトリフェニルホスフィン（３３０ｍｇ、１．３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物を水（１５ｍＬ）と濃ＨＣｌ（０．５ｍＬ）により処理した。この反応混合物を還流で３時間攪拌し、次に真空中で～１５ｍＬまで濃縮した。この混合物を飽和ＮａＨＣＯ$_{3}$（１００ｍＬ）により処理し、そしてＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）により抽出した。この有機相を水（５０ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（５０ｍＬ）により洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$の上で乾燥し、濾過し、そしてシリカゲル上で濃縮した。ジクロロメタン中の５％ＭｅＯＨ溶液とそれに続くジクロロメタン中の５％（ＭｅＯＨ中１Ｍ　ＮＨ$_{3}$）溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を淡黄色非晶質として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８２（Ｍ＋１）。

【０２３５】

（実施例１４）

【０２３６】

【化５８】



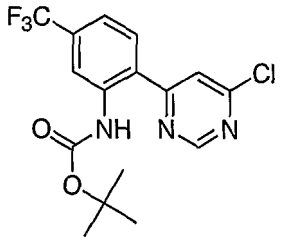
（ａ）（３－トリフルオロメチルフェニル）カルバミン酸ｔ－ブチルエステル

２５０ｍＬの丸底フラスコに３－（トリフルオロメチル）アニリン（５．０ｇ、３１ミ

リモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、ＴＨＦ（１００ｍＬ）、ジ－ｔ－ブチルジカーボネート（２０．０．ｇ、９３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）および４－（ジメチルアミノ）ピリジン（０．３８ｇ、３．１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この混合物を還流で３時間加熱した。K_2CO_3（１３ｇ、９３ミリモル）とＭｅＯＨ（５０ｍＬ）を添加し、そして加熱を一晩継続した。室温に冷却後、この混合物をCH_2Cl_2により希釈し、次に濾過し、そしてCH_2Cl_2により洗浄し、そしてこの濾液を濃縮して、褐色のオイルを得た。このオイルをＥｔＯＡｃ（２００ｍＬ）に溶解し、そしてH_2O（２×１００ｍＬ）、ブライン（１×１００ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の０％から１５％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を無色オイルとして得、これは放置すると白色固体に固化した。ＭＳ（ＥＳＩ、陰イオン）ｍ／ｚ：２６０（Ｍ－１）。

【０２３７】

【化５９】



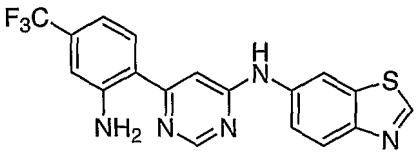
（ｂ）［２－（６－クロロピリミジン－４－イル）－５－トリフルオロメチルフェニル］カルバミン酸ｔ－ブチルエステル

（Ｂｏｉｓｎａｒｄ、Ｓ．；Ｃａｒｂｏｎｎｅｌｌｅ、Ａ．Ｃ．；Ｚｈｕ、Ｊ．Ｏｒｇ．Ｌｅｔ．２００１、３、２０６１－２０６４およびＨｅｗａｗａｓａｍ、Ｐ．；Ｍｅａｎｗｅｌｌ、Ｎ．Ａ．Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔ．１９９４、３５、７３０３の手順に類似して）

－４０℃で攪拌したＴＨＦ（１００ｍＬ）中の（３－トリフルオロメチルフェニル）カルバミン酸ｔ－ブチルエステル（２．５ｇ、９．６ミリモル）を入れた５００ｍＬの丸底フラスコにｓｅｃ－ＢｕＬｉ（１７ｍＬ、シクロヘキサン中１．３Ｍ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を１０分間にわたって添加した。この混合物を－４０℃で１時間攪拌し、次に－７８℃まで冷却した。トリメチルボレート（４．４ｍＬ、３８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を１０分間にわたって添加した。この反応混合物を室温まで温め、そしてその温度で１０分間攪拌した。この混合物をKH_2PO_4水溶液によりクエンチし、そして濃縮して、ＴＨＦを除去した。次に、この水性混合物をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）により抽出し、そして合せた抽出物をブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして濃縮して、黄色の泡を得た。この泡をCH_3CN（３０ｍＬ）に溶解し、そして４，６－ジクロロピリミジン（４．１ｇ、２８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、続いてH_2O（３０ｍＬ）中のNa_2CO_3（２．９ｇ、２８ミリモル）溶液により処理した。次に、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（０．５３ｇ、０．４６ミリモル、Ｓｔｒｅｍ）を添加し、そしてこの混合物を７５℃で１５時間攪拌した。室温まで冷却後、この混合物を真空中で濃縮して、CH_3CNを除去し、次にＥｔＯＡｃにより抽出した。合せた抽出物をH_2Oとブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮した。ヘキサン中の０％から１０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を無色オイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７４（Ｍ＋１）。

【０２３８】

【化６０】



（ｃ）［６－（２－アミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－６－イルアミン

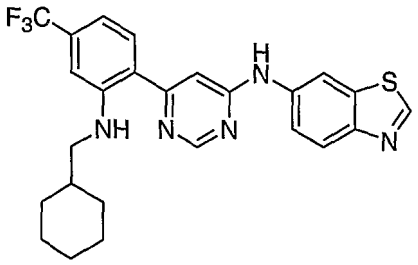
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、［２－（６－クロロピリミジン－４－イル）－５－トリフルオロメチルフェニル］カルバミン酸ｔ－ブチルエステル（１．０ｇ、２．７ミリモル）と６－アミノベンゾチアゾール（０．８０ｇ、５．３５ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）によって、CH_2Cl_2中０．５から３．０％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　NH_3）溶液でのシリカゲルクロマトグラフィによる精製後、粗材料を得、これをCH_2Cl_2中の１．３％から１．４％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　NH_3）溶液でのシリカゲルクロマトグラフィによる第２の精製にかけて、この表題化合物を黄色固体として得た。　ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８８（Ｍ＋１）。ＭＰ：２０３．１－２０３．２℃。

【０２３９】

（実施例１５）

【０２４０】

【化６１】



ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－シクロヘキシルメチルアミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン

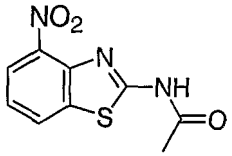
５ｍＬの丸底フラスコに［６－（２－アミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－６－イルアミン（０．０６０ｇ、０．１５ミリモル）、１，２－ジクロロエタン（１ｍＬ）、酢酸（０．０１８ｍＬ、０．３１ミリモル）およびシクロヘキサンカルボキサアルデヒド（０．０５５ｍＬ、０．４５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。ナトリウムトリアセトキシボロハイドライド（０．０８３ｇ、０．３９ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を攪拌しながらこの混合物に０℃で添加し、そしてこの混合物を室温で１７時間攪拌した。この反応混合物をＥｔＯＡｃ（３ｍＬ）により希釈し、そしてH_2O（３ｍＬ）と飽和$NaHCO_3$（７ｍＬ）によりクエンチした。この相を分離し、そしてこの水相をＥｔＯＡｃ（３×３ｍＬ）により抽出した。この組み合せた有機抽出物をブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の２０％から５０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４８４（Ｍ＋１）。

【０２４１】

（実施例１６）

【０２４２】

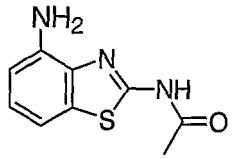
【化６２】



（ａ）Ｎ－（４－ニトロベンゾチアゾール－２－イル）アセトアミド
４－ニトロベンゾチアゾール－２－イルアミン（８６０ｍｇ、４．４ミリモル、Ｈｅｌｖ．Ｃｈｉｍ．Ａｃｔａ　１９４０　２３、３２８）と酢酸無水物（１０ｍＬ、１０５ミリモル）を８０℃で２時間加熱した。この反応物を室温まで冷却し、そしてＥｔ$_2$Ｏにより希釈した。この固体を濾過し、そしてＥｔ$_2$Ｏにより激しく攪拌した。この固体を再度濾過し、Ｅｔ$_2$Ｏにより洗浄し、そして真空中で乾燥して、この表題生成物を淡黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２３８（Ｍ＋１）。

【０２４３】

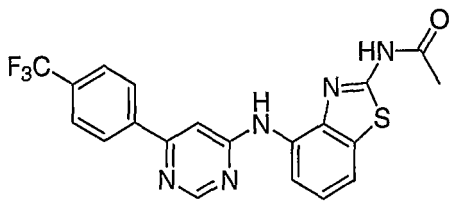
【化６３】



（ｂ）Ｎ－（４－アミノベンゾチアゾール－２－イル）アセトアミド
７０％水性ＭｅＯＨ（２５ｍＬ）中のＮ－（４－ニトロベンゾ－チアゾール－２－イル）アセトアミド（８４０ｍｇ、３．５ミリモル）、ＮＨ$_4$Ｃｌ（１９６ｍｇ、３．７ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）および鉄粉（９９６ｍｇ、１８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物を６５℃まで加熱した。１時間後、この反応混合物を熱い間に濾過し、そしてこの濾液を真空中で濃縮した。この残渣をＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$中の０％から３．５％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　ＮＨ$_3$）溶液でのシリカゲルカラムクロマトグラフィにより精製して、この表題生成物を白色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２０８（Ｍ＋１）。

【０２４４】

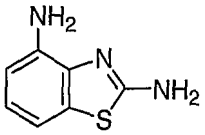
【化６４】



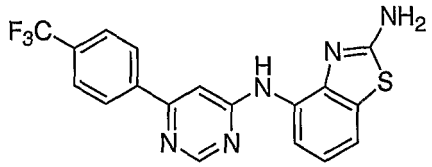
（ｃ）Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ベンゾチアゾール－２－イル｝アセトアミド
ガラス管に実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン（２８０ｍｇ、１．１ミリモル）、Ｎ－（４－アミノベンゾチアゾール－２－イル）アセトアミド（１９７ｍｇ、０．９５ミリモル）、ＣｕＩ（５５ｍｇ、０．３０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）およびＥｔＯＨ（２．５ｍＬ）を添加した。この反応混合物を電子レンジ中１６０℃で１５分間加熱した。この溶液をデカントし、そしてＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$中の０％から４％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　ＮＨ$_3$）溶液でのシリカゲルカラムクロマトグラフィにより２回精製して、この表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４３０（Ｍ＋１）。ＭＰ：＞２５０℃。

【０２４５】

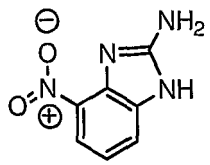
（実施例１７）
【０２４６】
【化６５】



（ａ）ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン
７５％ＭｅＯＨ水溶液（２５ｍＬ）中で４－ニトロベンゾチアゾール－２－イルアミン（６４０ｍｇ、３．３ミリモル、Ｈｅｌｖ．Ｃｈｉｍ．Ａｃｔａ　１９４０　２３、３２８）、NH_4Cl（１８０ｍｇ、３．３ミリモル）および鉄粉（７８５ｍｇ、１４ミリモル）を使用して実施例１６（ｂ）に従いこの化合物を製造した。この反応物をフラッシュカラムにより精製した。CH_2Cl_2中の０％から５％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　NH_3）の溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を淡黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１６６（Ｍ＋１）。
【０２４７】
【化６６】



（ｂ）N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン
実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（４９５ｍｇ、１．９ミリモル）、ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン（３２０ｍｇ、１．９ミリモル）およびＣｕＩ（１０２ｍｇ、０．５ミリモル）をイソプロパノール（４ｍＬ）中１５０℃で使用して実施例１６（ｃ）に従いこの化合物を製造した。この反応物をフラッシュカラムクロマトグラフィによりシリカゲル上でCH_2Cl_2中の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　NH_3）の０％から４％溶液により精製して、この表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８８（Ｍ＋１）。ＭＰ：２２５－２２７℃．
【０２４８】
（実施例１８）
【０２４９】
【化６７】

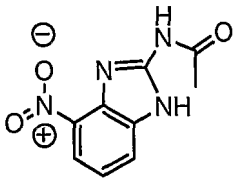


（ａ）４－ニトロ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イルアミン
ＥｔＯＨ（２５ｍＬ）中の３－ニトロ－１，２－フェニレンジアミン（０．５０ｇ、３．２６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）と臭化シアン（０．３８ｇ、３．５８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の溶液を２４時間攪拌した。この生成した固体を濾過し、そして風乾して、

この表題生成物を赤褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１７９（Ｍ＋１）。

【０２５０】

【化６８】

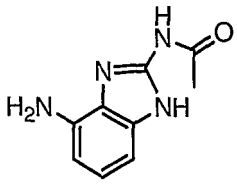


（ｂ）Ｎ－（４－ニトロ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル）アセトアミド

酢酸無水物（１０ｍＬ）中の４－ニトロ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イルアミン（０．１３ｇ、０．７３ミリモル）の混合物を８０℃で３時間加熱した。この混合物を室温まで冷却し、そしてこの沈澱を濾過し、水により洗浄し、そして風乾して、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２２１（Ｍ＋１）。

【０２５１】

【化６９】

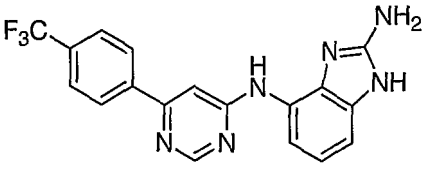


（ｃ）Ｎ－（４－アミノ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル）アセトアミド

１０％Ｐｄ／Ｃ（０．０４０ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）、Ｎ－（４－ニトロ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル）アセトアミド（０．０９０ｇ、０．４１ミリモル）およびＥｔＯＨ（６ｍＬ）の混合物を窒素によりパージし、そして１気圧のH_2下で１８時間攪拌した。この混合物をセライト（登録商標）から濾過し、そして蒸発させて、この表題生成物を淡黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１９１（Ｍ＋１）。

【０２５２】

【化７０】

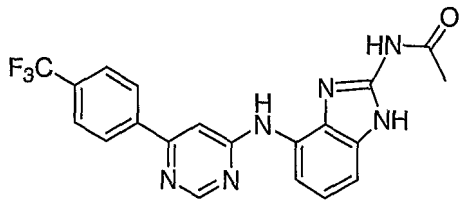


（ｄ）N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２，４－ジアミン

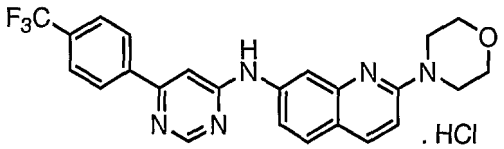
ＥｔＯＨ（２ｍＬ）中のＮ－（４－アミノ－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル）アセトアミド（０．０６７ｇ、０．３５ミリモル）と実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．１０３ｇ、０．４１ミリモル）の溶液を電子レンジ中で攪拌しながら１７５℃で１５分間加熱した。この生成した黄色沈澱を濾過し、そして合成用ＨＰＬＣ（Ｃ１８カラム、CH_3CN／H_2O中の０．１％ＴＦＡの移動相、２０分間にわたる１０％CH_3CNから９０％の勾配）により精製して、この表題化合物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７１（Ｍ＋１）。

【０２５３】

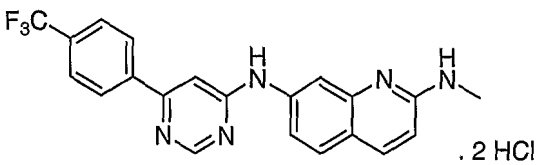
（実施例１９）
【０２５４】
【化７１】



Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル｝アセトアミド
この表題化合物を実施例１８（ｄ）の合成用ＨＰＬＣ精製の区分の１つから単離し、そして合成用ＨＰＬＣ（Ｃ８カラム、CH_3CN／H_2O中の０．１％ＴＦＡの移動相、２０分間にわたる２０％CH_3CNから８０％の勾配）により再精製して、白色固体を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４１３（Ｍ＋１）。
【０２５５】
（実施例２０）
【０２５６】
【化７２】



［（２－モルホリン－４－イル）キノリン－７－イル］－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン塩酸塩
モルホリン（０．６５ｍＬ、７．４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）中の実施例１３（ｂ）の（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（１５０ｍｇ、０．３７ミリモル）の溶液を攪拌し、そして電子レンジ中２００℃で１０分間加熱した。この生成した明るい黄色固体をＥｔＯＡｃとCH_2Cl_2から沈澱させ、次にＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）に溶解し、そして１Ｎ　ＨＣｌ（５０ｍＬ）により処理した。この生成した明るい黄色沈澱を濾過により集め、水（２０ｍＬ）、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）により洗浄し、そして風乾して、この表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４５２（Ｍ＋１）。
【０２５７】
（実施例２１）
【０２５８】
【化７３】



（２－メチルアミノキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン二ヒドロクロリド
実施例１３（ｂ）の（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル－フェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（１００ｍｇ、０．２５ミリモル）をＥ

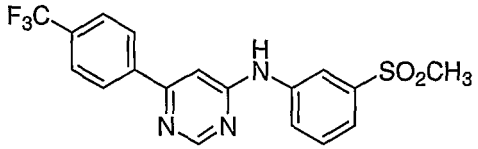
ｔＯＨ（２ｍＬ）中の飽和メチルアミン（メチルアミン（Ａｌｄｒｉｃｈ）をＥｔＯＨの中に０℃で泡として添加することにより製造した）に溶解した。この溶液を電子レンジ中１６０℃で２０分間加熱した。追加のＥｔＯＨ（２ｍＬ）中の飽和メチルアミンを添加し、そしてこの反応混合物を電子レンジ中１６０℃で２０分間再度加熱した。この混合物を真空中で濃縮し、ＥｔＯＨ（２ｍＬ）中の飽和メチルアミンに再溶解し、そして１６０℃で更に２０分間加熱した。この混合物を真空中で濃縮し、そしてこの残渣を１Ｎ　ＨＣｌ（２０ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）に懸濁させた。この懸濁液を激しく振盪し、そしてこの固体を濾過により集め、水（２０ｍＬ）、ＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）、ヘキサン（２０ｍＬ）により洗浄し、そして風乾した。この固体をＭｅＯＨに溶解し、そして真空中で濃縮して、この表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３９６（Ｍ＋１）。

【０２５９】

（実施例２２）

【０２６０】

【化７４】



（３－メタンスルホニルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

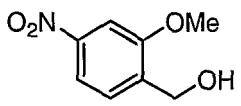
実施例５（ｂ）の製造で使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（２００ｍｇ、０．７７ミリモル）と３－メチルスルホニルアニリン塩酸塩（８０ｍｇ、０．３９ミリモル、Ａｃｒｏｓ）により粗反応生成物混合物を得、これをＥｔＯＡｃ（１００ｍＬ）と１Ｎ　ＮａＯＨ（５０ｍＬ）の間で分配した。この有機層を１Ｎ　ＮａＯＨ（５０ｍＬ）、水（５０ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（２０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（９：１CH_2Cl_2／ＥｔＯＡｃ）による精製によってこの表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３９４（Ｍ＋１）。ＭＰ：２０４－２０５℃。

【０２６１】

（実施例２３）

【０２６２】

【化７５】

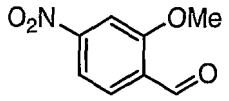


（ａ）（２－メトキシ－４－ニトロフェニル）メタン－１－オール

還流コンデンサーを備えた丸底フラスコ中N_2下０℃で磁気攪拌したＴＨＦ（３０ｍＬ）中の２－メトキシ－４－ニトロ安息香酸（２．０ｇ、１０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の溶液にボラン－ＴＨＦ錯体（３０ｍＬ、３０ミリモル、ＴＨＦ中１．０Ｍ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を還流で一晩攪拌した。ＭｅＯＨ（５ｍＬ）を、続いて１Ｎ　ＮａＯＨ（３０ｍＬ）を注意深く添加することにより、この反応物をクエンチした。この混合物をＥｔＯＡｃ（２×５０ｍＬ）により抽出し、この組み合せた有機抽出物を飽和ＮａＣｌにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮して、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陰イオン）ｍ／ｚ：１８２（Ｍ－１）。

【０２６３】

【化７６】

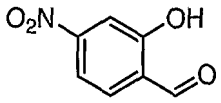


（ｂ）２－メトキシ－４－ニトロベンズアルデヒド

１：１ヘキサン／CH_2Cl_2（６０ｍＬ）中の（２－メトキシ－４－ニトロフェニル）－メタン－１－オール（１．６ｇ、８．９ミリモル）とMnO_2（１５ｇ、１８０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物を４０℃で３時間磁気撹拌した。この固体を濾過により除去し、そしてCH_2Cl_2により洗浄した。この濾液を真空中で濃縮し、そしてこの残渣をＥｔＯＡｃおよびヘキサンから再結晶して、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陰イオン）ｍ／ｚ：１８０（Ｍ－１）。

【０２６４】

【化７７】

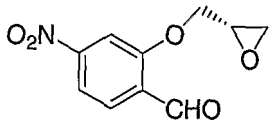


（ｃ）２－ヒドロキシ－４－ニトロベンズアルデヒド

丸底フラスコ中－７８℃で磁気撹拌したCH_2Cl_2（５ｍＬ）中の２－メトキシ－４－ニトロベンズアルデヒド（１９０ｍｇ、１．０ミリモル）の溶液にBBr_3（０．１９ｍＬ、２．０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を２５℃まで温め、そしてこの温度で２時間撹拌した。次に、この反応混合物を－７８℃まで冷却し、そしてＭｅＯＨ（５ｍＬ）により処理した。この混合物を２５℃まで温め、そしてこの温度で３０分間撹拌し、次に真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（３：２ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製によって、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陰イオン）ｍ／ｚ：１６６（Ｍ－１）。

【０２６５】

【化７８】

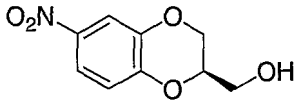


（ｄ）（２Ｓ）－４－ニトロ－２－オキシラニルメトキシベンズアルデヒド

１００ｍＬの丸底フラスコ中のＤＭＦ（５ｍＬ）中の（２Ｓ）－（＋）－グリシジルトシレート（１．１ｇ、５．０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、２－ヒドロキシ－４－ニトロベンズアルデヒド（８４０ｍｇ、５．０ミリモル）およびK_2CO_3（１．４ｇ、１０ミリモル）の混合物を１００℃で３０分間撹拌した。この混合物を室温まで冷却し、水（２０ｍＬ）を添加し、そしてこの混合物をＥｔＯＡｃ（３×３０ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物を水（２×２０ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（１０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮した。この粗材料をシリカゲルクロマトグラフィ（ヘキサン中８０％ＥｔＯＡｃ）により精製して、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２２４（Ｍ＋１）。

【０２６６】

【化７９】



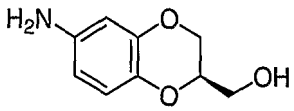
（ｅ）（２Ｒ）－（２，３－ジヒドロ－６－ニトロベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル）メタノール

（Ａｎｄｒｅｗ、Ｍ．；Ｂｉｒｃｈ、Ａ．Ｍ．；Ｂｒａｄｌｅｙ、Ｐ．Ａ．Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ　１９９９、７、１１８１－１１８７の手順に類似して）

１００ｍＬの丸底フラスコ中のCH_2Cl_2（１０ｍＬ）中の（２Ｓ）－４－ニトロ－２－オキシラニルメトキシベンズアルデヒド（７３０ｍｇ、３．３ミリモル）の溶液に８６％のｍ－クロロ過安息香酸（１．１ｇ、６．４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を０℃で添加した。この混合物を室温まで温め、そしてこの温度で１８時間攪拌した。この混合物をCH_2Cl_2（２０ｍＬ）により希釈し、１０％$Na_2S_2O_3$（６ｍＬ）、$NaHCO_3$水溶液（３×５ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（３ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮した。この粗材料をＭｅＯＨ（２０ｍＬ）および１Ｎ　ＮａＯＨ（６．５ｍＬ）中で１６時間攪拌した。水（１０ｍＬ）を添加し、そしてこの混合物をＥｔＯＡｃ（３×１０ｍＬ）により抽出した。この組み合せた有機相を飽和ＮａＣｌにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、真空中で濃縮し、そしてこの粗材料をシリカゲルクロマトグラフィ（ヘキサン中４０％ＥｔＯＡｃ）により精製して、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２１２（Ｍ＋１）。

【０２６７】

【化８０】

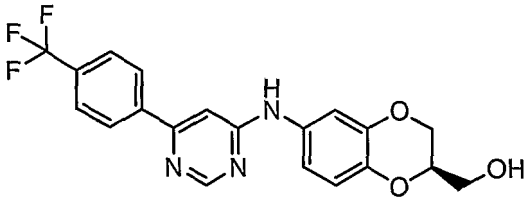


（ｆ）（２Ｒ）－（６－アミノ－２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル）メタノール

１００ｍＬの丸底フラスコ中のＭｅＯＨ（５ｍＬ）中の（２Ｒ）－（２，３－ジヒドロ－６－ニトロベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル）メタノール（１２０ｍｇ、０．５６ミリモル）と１０％Ｐｄ／Ｃ（２０ｍｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物を１気圧のH_2下で２時間攪拌した。この触媒を濾別し、ＭｅＯＨにより洗浄した。この溶媒を真空中で除去して、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１８２（Ｍ＋１）。

【０２６８】

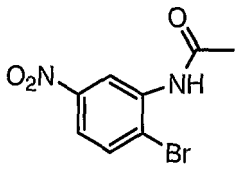
【化８１】



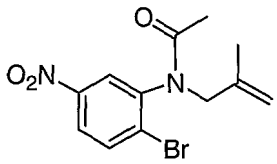
（ｇ）（２Ｒ）－｛６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２Ｈ，３Ｈ－ベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル｝メタノール

実施例５（ｂ）の製造に述べた手順に類似して、（２Ｒ）－（６－アミノ－２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル）メタノール（１００ｍｇ、０．５５ミリモル）および実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン（２８５ｍｇ、１．１ミリモル）により、シリカゲルクロマトグラフィ（６０％ＥｔＯＡｃ／ヘキサン）による精製後、この表題生成物を非晶質の黄色固体として得た

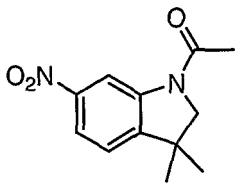
。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０４（Ｍ＋１）。
【０２６９】
（実施例２４）
【０２７０】
【化８２】



（ａ）Ｎ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニル）アセトアミド
氷酢酸（１．３Ｌ）中の２－ブロモ－５－ニトロアニリン（４３ｇ、０．２０モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の溶液を２５℃で磁気撹拌し、そして酢酸無水物（２０ｍＬ、０．２１モル）により処理した。この反応混合物を２５℃で一晩撹拌し、次に水（６Ｌ）の中に注ぐことによりクエンチした。この沈澱を濾過により集め、水により洗浄し、そして真空中で乾燥して、この表題生成物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２５９、２６２（Ｍ＋１、Ｍ＋３）。
【０２７１】
【化８３】



（ｂ）Ｎ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニル）－Ｎ－（２－メチル－２－プロペニル）アセトアミド
磁気撹拌と滴加漏斗を備えた火焔で乾燥した丸底フラスコにＮ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニル）アセトアミド（４８ｇ、０．１９モル）、炭酸カリウム（１０３ｇ、７４４ミリモル）および無水ＤＭＦ（８３０ｍＬ）を添加した。この生成した溶液を２５℃で撹拌し、そして滴加漏斗から滴加して無水ＤＭＦ（１００ｍＬ）中の３－ブロモ－２－メチルプロペン（３８ｍＬ、３８０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の溶液により４５分間にわたって処理した。この反応混合物を２５℃で一晩撹拌し、次に濾過し、そして飽和ＮａＨＣＯ$_3$により処理した。この有機層を除去し、そしてこの水層をＥｔＯＡｃ（３×１５０ｍＬ）により抽出した。この組み合せた有機抽出物を水（４×７０ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（７０ｍＬ）により洗浄し、ＭｇＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３１３、３１５（Ｍ＋１、Ｍ＋３）。
【０２７２】
【化８４】

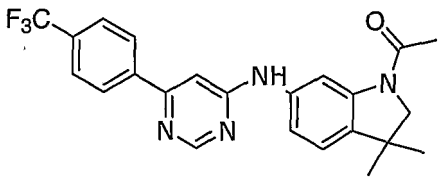


（ｃ）１－（３，３－ジメチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロインドール－イル）エタノン
磁気撹拌を備えた火焔で乾燥した丸底フラスコにＮ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニ

ル）－Ｎ－（２－メチル－２－プロペニル）アセトアミド（５５ｇ、０．１８モル）、テトラエチルアンモニウムクロリド水和物（３０．８ｇ、１８６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、ギ酸ナトリウム（１４．４ｇ、２１２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、酢酸ナトリウム（３６．３ｇ、４４３ミリモル）および無水ＤＭＦ（４４３ｍＬ）を添加した。この生成した溶液をN_2によりパージし、そして酢酸パラジウム（ＩＩ）（３．９７ｇ、１７．７ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この反応混合物を８０℃で１５時間攪拌し、次に２５℃まで冷却し、そしてセライト（登録商標）のパッドを通して濾過した。セライト（登録商標）をＥｔＯＡｃにより洗浄し、そしてこの組み合せた濾液を飽和ＮａＨＣＯ$_3$（５００ｍＬ）により洗浄した。この水性層をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）により抽出し、そしてこの組み合せた有機抽出物を水（４×１００ｍＬ）、飽和ＮａＣｌ（２×１００ｍＬ）により洗浄し、$MgSO_4$の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２３５（Ｍ＋１）。

【０２７３】

【化８５】



（ｄ）１－｛３，３－ジメチル－６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２，３－ジヒドロインドール－１－イル｝エタノン

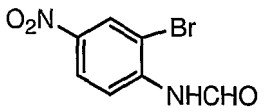
丸底フラスコ中０℃で磁気攪拌したエチルエーテル（３ｍＬ）中の１－（３，３－ジメチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロインドール－イル）エタノン（１１０ｍｇ、０．４７ミリモル）の溶液に塩化スズ（ＩＩ）二水和物（０．６７ｇ、２．９６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）と濃ＨＣｌ（０．３ｍＬ）を添加した。この反応混合物を０℃で１０分間攪拌し、２５℃まで温め、そしてこの温度で一晩攪拌した。この反応混合物を１０Ｎ　ＮａＯＨ（１０ｍＬ）により洗浄し、ＥｔＯＡｃにより抽出し、そして真空中で濃縮した。実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、この粗生成物と実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．１９ｇ、０．７５ミリモル）によりシリカゲルクロマトグラフィ（３：２ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製後この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４２７（Ｍ＋１）。ＭＰ：２２７－２３０℃。

【０２７４】

（実施例２５）

【０２７５】

【化８６】

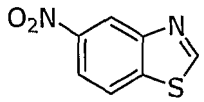


（ａ）Ｎ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニル）ホルムアミド

５０ｍＬの丸底フラスコ中の２－ブロモ－５－ニトロアニリン（２ｇ、９．２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）と８５％ギ酸（２０ｍＬ、Ａｌｄｒｉｃｈ）の混合物を還流で３時間加熱した。この反応混合物を冷水（７５ｍＬ）の中に注ぎ、そしてこの黄色沈澱を濾過し、水により洗浄し、そして真空オーブン中で６０℃で一晩乾燥して、この表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２４６（Ｍ＋１）。

【０２７６】

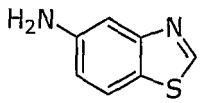
【化８７】



（ｂ）５－ニトロベンゾチアゾール
熱エタノール（４０ｍＬ）中のＮ－（２－ブロモ－５－ニトロフェニル）ホルムアミド（２．１ｇ、８．６ミリモル）の溶液に硫化ナトリウム（１．１ｇ、１３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物を還流で４時間加熱した。この溶媒を真空中で蒸発させ、そしてこの残渣を水により希釈し、そして濾過した。１Ｎ　ＨＣｌを添加することにより、この濾液のｐＨを～７に調整し、分離した沈澱を濾過し、水により洗浄し、そして真空オーブン中６０℃で一晩乾燥して、この表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１８１（Ｍ＋１）。

【０２７７】

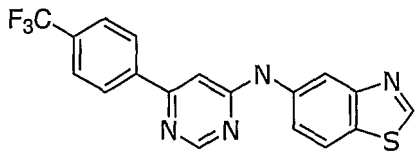
【化８８】



（ｃ）５－アミノベンゾチアゾール
エタノール（３０ｍＬ）中の５－ニトロベンゾチアゾール（０．５５ｇ、３．１ミリモル）の溶液に炭素上の１０％パラジウム（０．１８ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応物を１気圧の水素下で５時間攪拌した。この反応混合物をセライト（登録商標）のパッドを通して濾過した。この濾液を濃縮して、この表題化合物を黄橙色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１５１（Ｍ＋１）。

【０２７８】

【化８９】



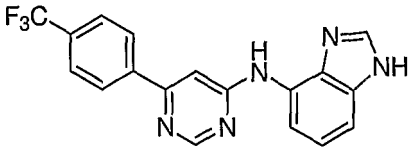
（ｄ）ベンゾチアゾール－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、５－アミノベンゾチアゾール（０．１６ｇ、１．１ミリモル）および実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．４２ｇ、１．６ミリモル）により、シリカゲルクロマトグラフィ（２：１ヘキサン／ＥｔＯＡｃ）による精製後、この表題生成物を淡黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７３（Ｍ＋１）。ＭＰ：１９２．１－１９２．２℃。

【０２７９】

（実施例２６）

【０２８０】

【化９０】



（１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

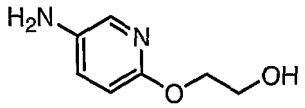
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（６９０ｍｇ、２．６７ミリモル）および４－アミノベンズイミダゾール（２９６ｍｇ、２．２２ミリモル、Ａｓｔａｔｅｃｈ）により、CH_2Cl_2中の１％から１０％の勾配の（ＭｅＯＨ中２Ｍ　NH_3）の溶液によるシリカゲルクロマトグラフィの精製後表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３５６（Ｍ＋１）。

【０２８１】

（実施例２７）

【０２８２】

【化９１】

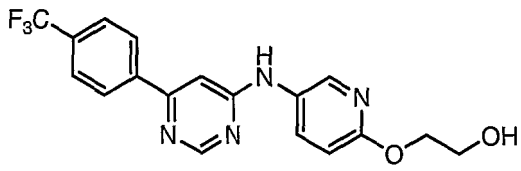


（ａ）２－（５－アミノピリジン－２－イルオキシ）エタノール

ＥｔＯＨ（５０ｍＬ）中の２－（５－ニトロ－２－ピリジルオキシ）エタノール（１ｇ、５．４３ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）の溶液に炭素上の１０％パラジウム（０．２ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物をアルゴンにより掃気し、次に１気圧のH_2下で１５時間攪拌した。この反応混合物をセライト（登録商標）のパッドを通して濾過し、そしてこの濾液を濃縮し、そしてこの残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（ＥｔＯＡｃ）により精製して、この表題化合物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１５５（Ｍ＋１）。

【０２８３】

【化９２】



（ｂ）２－｛５－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ピリジン－２－イルオキシ｝エタノール

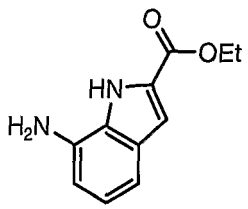
実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（２１６ｍｇ、０．８３ミリモル）をＥｔＯＨ（３ｍＬ）中で２－（５－アミノピリジン－２－イルオキシ）エタノール（１３０ｍｇ、０．８３ミリモル）と実施例５（ｂ）に述べたものと類似の方法で反応させて、この表題化合物を白色粉末として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７７（Ｍ＋１）。ＭＰ：１８９．５－１９０．５℃。

【０２８４】

（実施例２８）

【０２８５】

【化９３】

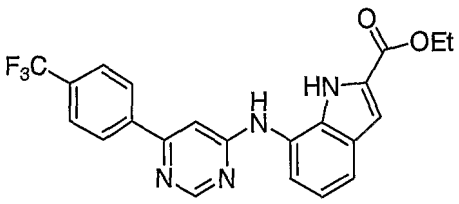


（ａ）７－アミノ－１Ｈ－インドール－２－カルボン酸エチルエステル

ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）中の７－ニトロ－１Ｈ－インドール－２－カルボン酸エチルエステル（５．０ｇ、２１．３６ミリモル、Ａｃｒｏｓ）の溶液に炭素上の１０％パラジウム（２．０ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物をアルゴンにより掃気し、次に１気圧のH_2下で５時間攪拌した。この反応混合物をセライト（登録商標）のパッドを通して濾過し、そしてこの濾液を濃縮して、この表題化合物をオフホワイトの固体として得、これを更なる精製をせずに次の工程で使用した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２０５（Ｍ＋１）。

【０２８６】

【化９４】

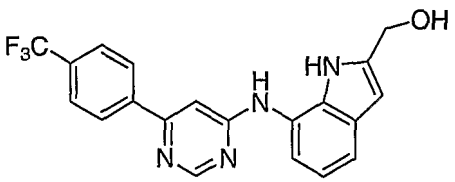


（ｂ）７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－カルボン酸エチルエステル

７－アミノ－１Ｈ－インドール－２－カルボン酸エチルエステル（１４２ｍｇ、０．６９ミリモル）をＥｔＯＨ（３ｍＬ）中の実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン（１８３ｍｇ、０．７１ミリモル）と実施例５（ｂ）に述べたものと類似の方法で反応させて、この表題化合物を褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４２７（Ｍ＋１）。

【０２８７】

【化９５】



（ｃ）｛７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－イル｝メタノール

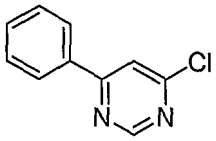
ＴＨＦ（２ｍＬ）中の７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－カルボン酸エチルエステル（２８５ｍｇ、０．６７ミリモル）の溶液に０℃でＴＨＦ（１．０ｍＬ、Ａｌｄｒｉｃｈ）中の$LiAlH_4$の１Ｍ溶液を添加した。この混合物を室温で攪拌し、そしてこの反応の進行を薄層クロマトグラフィによりモニターした。この反応の完結後、０℃で攪拌しながらこの混合物に$Na_2SO_4 \cdot 10H_2O$（２ｇ）を添加し、それに続いてＭｅＯＨ（１ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（２０ｍＬ）を添加した。この攪拌を５分間継続し、そしてこの混合物セライト（登録商標）のパッドを通して濾過した。この濾液を真空下で濃縮し、そしてこの残渣をCH_2Cl_2中の２％から１０％の勾配の（ＭｅＯＨ中の２Ｍ　NH_3）溶液でのシリカゲルカラムクロマトグラフィにより精製して、この表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８５（Ｍ＋１）。ＭＰ：２２１－２２３℃。

【０２８８】

（実施例２９）

【０２８９】

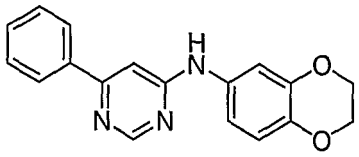
【化９６】



（ａ）４－クロロ－６－フェニルピリミジン
５００ｍＬの丸底フラスコに４，６－ジクロロピリミジン（６．１ｇ、４１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、フェニルボロン酸（２．０ｇ、１６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、アセトニトリル（１５０ｍＬ）および０．４０Ｍ炭酸ナトリウム水溶液（１００ｍＬ）を添加した。N_2により１５分間噴霧することにより、この混合物を脱酸素した。触媒のＰｄ（PPh_3）$_4$（１．９ｇ、０．７０ミリモル、Ｓｔｒｅｍ）を添加し、そしてこの黄色混合物を９０℃で１５時間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そして真空中で濃縮して、このアセトニトリルを除去した。この残渣を水（１００ｍＬ）により希釈し、そして酢酸エチル（３×５０ｍＬ）により抽出した。この組み合せた有機抽出物をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（２：１ CH_2Cl_2／ヘキサン）による精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１９１（Ｍ＋１）。

【０２９０】

【化９７】



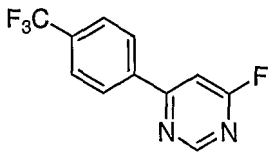
（ｂ）（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－（６－フェニルピリミジン－４－イル）アミン
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、４－クロロ－６－フェニル）ピリミジン、（０．２０ｇ、１．０ミリモル）および２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イルアミン（０．２０ｇ、１．０ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）により、シリカゲルクロマトグラフィ（１：１酢酸エチル／ヘキサン）による精製後、この表題化合物を紫色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３０６（Ｍ＋１）。

【０２９１】

（実施例３０）

【０２９２】

【化９８】

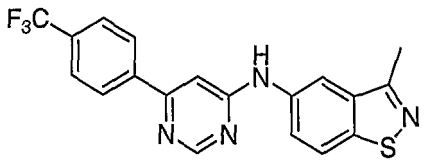


（ａ）４－フルオロ－６－［４－（トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン
５００ｍＬの丸底フラスコに実施例５（ａ）の４－クロロ－６－［４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン（３．０ｇ、１１ミリモル）、フッ化カリウム（５．４ｇ、９３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）および無水ＤＭＳＯ（２５ｍＬ）を添加した。この反応混合物をN_2雰囲気下１００℃で４時間攪拌した。この混合物を水（２００ｍＬ）により希釈し、そして酢酸エチル（３×５０ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。ヘキサン中の５％から１０％の勾配

の酢酸エチルの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２４３（Ｍ＋１）。

【０２９３】

【化９９】



（ｂ）（３－メチルベンゾ［ｄ］イソチアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

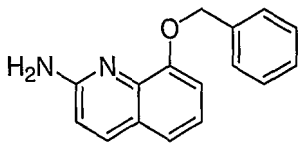
磁気撹拌棒を入れたガラスバイアルに、４－フルオロ－６－［４－（トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン（０．１０ｇ、０．３９ミリモル）、５－アミノベンゾトリアゾール（０．１０ｇ、０．４２ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）およびＤＭＳＯ（１ｍＬ）を添加した。この反応混合物を撹拌し、そして電子レンジ中で１８０℃で２０分間加熱した。この混合物を水（１００ｍＬ）により希釈し、そして酢酸エチル（２×１０ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中で濃縮した。シリカゲルクロマトグラフィ（１：１酢酸エチル／ヘキサン）による精製によって、この表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８７（Ｍ＋１）。

【０２９４】

（実施例３１）

【０２９５】

【化１００】

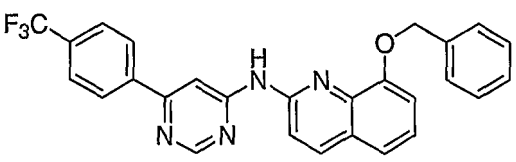


（ａ）８－ベンジルオキシキノリン－２－イルアミン

２５ｍＬの丸底フラスコにN_2雰囲気下で２－アミノ－キノリン－８－オール（０．２０ｇ、１．３ミリモル、Ｓｉｇｍａ）とＤＭＦ（８ｍＬ）を添加した。この混合物を０℃まで冷却し、そしてＮａＨ（０．０６ｇ、１．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ、オイル中６０％分散液）を添加した。０℃で１０分間撹拌した後、ベンジルブロミド（０．１６ｍＬ、１．４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物を室温まで温めた。２３時間撹拌した後、この反応物をH_2Oによりクエンチし、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。合せた抽出物を１Ｎ　ＮａＯＨ（２×）、H_2Oおよびブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物をオフホワイトの固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２５１（Ｍ＋１）。

【０２９６】

【化１０１】

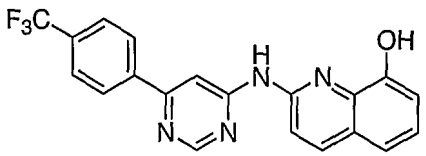


（ｂ）（８－ベンジルオキシキノリン－２－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

オーブン乾燥した１５ｍＬの丸底フラスコにＰｄ（ＯＡｃ）$_2$（４ｍｇ、０．０２ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）とラセミ－２、２’－ビス（ジフェニルホスフィノ）－１，１’－ビナフチル（１２ｍｇ、０．０２０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。このフラスコを注意深く排気し、そしてＮ$_2$により２回逆充填した。トルエン（４ｍＬ）を添加し、そしてこの混合物を室温で５分間攪拌した。次に、この混合物に実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロ－メチルフェニル）ピリミジン（１００ｍｇ、０．４０ミリモル）、８－ベンジルオキシ－キノリン－２－イルアミン（１００ｍｇ、０．４０ミリモル）およびＫ$_2$ＣＯ$_3$（１．１ｇ、８．０ミリモル）を添加した。この反応容器を注意深く排気し、そしてＮ$_2$により２回逆充填した。この反応物を９０℃で１６時間攪拌した。室温まで冷却後、この反応混合物をＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$／ＭｅＯＨ（３：１）により希釈し、そして濾過した。この濾液を真空中シリカゲル上で濃縮し、そしてＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$中の０．３％から１．５％の勾配の（ＭｅＯＨ中２Ｍ　ＮＨ$_3$）溶液でのシリカゲルクロマトグラフィにより精製した。この表題化合物をオフホワイトの固体として単離した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４７３（Ｍ＋１）。

【０２９７】

【化１０２】



（ｃ）２－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－８－オール

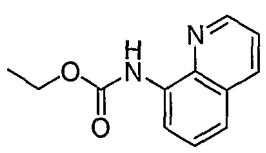
ＭｅＯＨ（５ｍＬ）とＡｃＯＨ（０．５ｍＬ）中の（８－ベンジルオキシキノリン－２－イル）－［６－（４－トリフルオロ－メチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（０．０５０ｇ、０．１１ミリモル）を入れる丸底フラスコに活性炭（湿潤、Ｄｅｇｕｓｓａ　ｔｙｐｅ　Ｅ１０１ＮＥ／Ｗ、０．０２２ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）上のパラジウム（１０重量％（乾燥基準））を添加した。このフラスコを注意深く排気し、そしてＮ$_2$により２回逆充填した。この反応混合物を１気圧のＨ$_2$下で２４時間攪拌した。次に、このフラスコを排気し、そしてＮ$_2$により２回逆充填した。この懸濁液をＭｅＯＨにより希釈し、そして濾過した。このフィルターケーキをＭｅＯＨとＭｅＯＨ／ＣＨ$_2$Ｃｌ$_2$により洗浄し、そしてこの組み合せた濾液を真空中で濃縮した。この粗生成物を合成用ＨＰＬＣにより精製した。生成物を含有する区分を組み合せ、真空中で濃縮して、ＣＨ$_3$ＣＮを除去し、ｐＨ７の緩衝液（Ｇｉｂｃｏ　ＢＲＬ　２０×ＳＳＣ、３．０Ｍ　ＮａＣｌおよび０．３Ｍクエン酸ナトリウム）により中和した。この生成した沈澱を濾過により集め、そして真空中で乾燥して、この表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８３（Ｍ＋１）。

【０２９８】

（実施例３２）

【０２９９】

【化１０３】



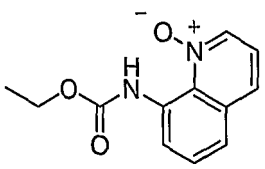
（ａ）キノリン－８－イルカルバミン酸エチルエステル

ピリジン（５０ｍＬ）中の８－アミノキノリン（２．５ｇ、１７ミリモル、Ａｌｄｒｉ

ｃｈ）の溶液にエチルクロロホルメート（２．０ｍＬ、２０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この混合物を０℃まで冷却し、そして３０分間攪拌し、次に室温まで温め、そしてこの温度で３日間攪拌した。この混合物を真空中で濃縮し、そして飽和ＮａＨＣＯ$_3$およびＨ$_2$Ｏ（１：１）により希釈した。この混合物をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）により抽出し、そして合せた抽出物をＨ$_2$Ｏ（１００ｍＬ）、ブライン（１００ｍＬ）により洗浄し、ＭｇＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を褐色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２１７（Ｍ＋１）。

【０３００】

【化１０４】

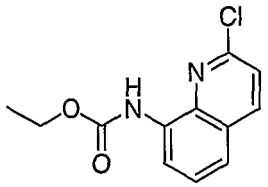


（ｂ）（１－オキシキノリン－８－イル）カルバミン酸エチルエステル

１００ｍＬの丸底フラスコにキノリン－８－イルカルバミン酸エチルエステル（３．６ｇ、１７ミリモル）、ＡｃＯＨ（１４ｍＬ）および３０％Ｈ$_2$Ｏ$_2$水溶液（４．０ｍＬ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を６５℃で３時間攪拌した。追加のＨ$_2$Ｏ$_2$（２．０ｍＬ）を添加し、そして攪拌を６５℃で１７時間継続した。この反応混合物を室温まで冷却し、そしてＨ$_2$Ｏ（１５０ｍＬ）と飽和ＮａＨＣＯ$_3$（１５０ｍＬ）により希釈した。このガス発生がほぼ鎮まったならば、この混合物をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）により抽出する。合せた抽出物をＮａＨＣＯ$_3$水溶液、ブラインにより洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そしてこの濾液を真空中で濃縮した。この粗生成物をシリカゲルのプラグを通してＥｔＯＡｃにより溶離し、そして真空中で濃縮して、この表題化合物を黄橙色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２３３（Ｍ＋１）。

【０３０１】

【化１０５】

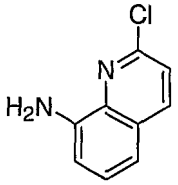


（ｃ）（２－クロロキノリン－８－イル）カルバミン酸エチルエステル

トルエン（５０ｍＬ）中の（１－オキシ－キノリン－８－イル）カルバミン酸エチルエステル（２．７ｇ、１２ミリモル）を入れた丸底フラスコにＳＯＣｌ$_2$（１ｍＬ、１４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を７５℃で５時間攪拌し、次に室温まで冷却し、そして真空中で濃縮した。この残渣を飽和ＮａＨＣＯ$_3$（５０ｍＬ）とＨ$_2$Ｏ（５０ｍＬ）により希釈し、そしてＥｔＯＡｃ（２×１００ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物をＨ$_2$Ｏ（１００ｍＬ）、ブライン（１００ｍＬ）により洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の０％から１０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィとそれに続くヘキサンからの再結晶による精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２５１（Ｍ＋１）。

【０３０２】

【化１０６】

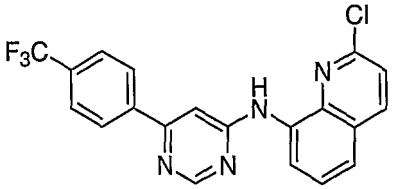


（ｄ）２－クロロキノリン－８－イルアミン

２－メチル－２－プロパノール（２５ｍＬ）中の（２－クロロキノリン－８－イル）カルバミン酸エチルエステル（０．２８ｇ、１．１ミリモル）を入れた丸底フラスコに１０Ｎ　ＮａＯＨ（１５ｍＬ）を添加した。この混合物を７０℃で２日間攪拌した。この混合物を室温まで冷却し、次に飽和$NaHCO_3$により希釈し、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。この水相を濃ＨＣｌにより中和し、そしてＥｔＯＡｃにより中和した。合せた抽出物をH_2O（２×）、ブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の０％から１０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を淡黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１７９（Ｍ＋１）。

【０３０３】

【化１０７】



（ｅ）（２－クロロキノリン－８－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン

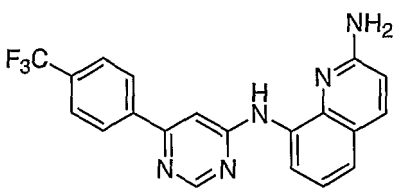
磁気攪拌棒を入れたガラスバイアルに実施例２９（ａ）の４－フルオロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．３９ｇ、１．６ミリモル）、２－クロロ－キノリン－８－イルアミン（０．１４ｇ、０．７９ミリモル）および無水ＤＭＳＯ（１ｍＬ）を添加した。この反応混合物を攪拌し、そして電子レンジ中１７０℃で２０分間加熱した。この混合物を飽和$NaHCO_3$により希釈し、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。合せた抽出物をH_2O、ブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の３％から１８％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０１（Ｍ＋１）。ＭＰ：２４０℃。

【０３０４】

（実施例３３）

【０３０５】

【化１０８】



N^8－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－

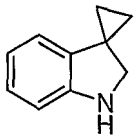
２，８－ジアミン
ＤＭＳＯ（１０ｍＬ）中の実施例３２（ｅ）の（２－クロロキノリン－８－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル－フェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（０．０９０ｇ、０．２２ミリモル）を入れた丸底フラスコにNaN_3（０．５３ｇ、８．１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この反応混合物を１０５℃で４日間、次に１１５℃で１日間攪拌した。この反応混合物を室温まで冷却し、次にH_2Oにより希釈し、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。合せた抽出物をH_2O（３×）、ブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮して、黄褐色固体を得た。この黄褐色固体をトルエン（５ｍＬ）に溶解し、トリフェニルホスフィン（０．１２ｇ、０．４４ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を攪拌しながら室温で添加し、そしてこの混合物を還流で８時間攪拌した。室温まで冷却後、この混合物を真空中で濃縮して、トルエンを除去した。この残渣にＡｃＯＨ／H_2O（２：１、７ｍＬ）を添加し、そしてこの混合物を５５℃で１日間攪拌した。この反応混合物を室温まで冷却し、そして飽和$NaHCO_3$（７５ｍＬ）により希釈し、そしてＥｔＯＡｃ（２×７５ｍＬ）により抽出した。合せた抽出物をブラインにより洗浄し、K_2CO_3の上で乾燥し、そして濃縮した。この残渣をＥｔＯＡｃに溶解し、そして真空中シリカゲル上で濃縮した。ヘキサン中の２０％から６０％の勾配のＥｔＯＡｃの溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８２（Ｍ＋１）。ＭＰ：２１１－２１３℃。

【０３０６】

（実施例３４）

【０３０７】

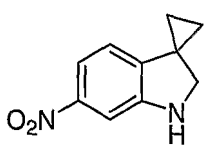
【化１０９】



（ａ）スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］
無水CH_3CN（１００ｍＬ）中の３－（２－ブロモエチル）インドール（５ｇ、２２．３１ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）の溶液にオーブン乾燥したK_2CO_3（２０ｇ、１４４．７ミリモル）を添加し、そしてこの混合物を攪拌しながら還流下で１０時間加熱した。この混合物を室温まで冷却し、濾過し、そしてこのフィルターケーキをＥｔＯＨ（５０ｍＬ）により洗浄した。次に、この組み合せた濾液を$NaBH_4$（３００ｍｇ、７．９３ミリモル）により処理し、そして室温で３時間攪拌した。この溶媒を真空中で除去し、そしてこの残渣を水（１６０ｍＬ）とＥｔＯＡｃ（６０ｍＬ）の間で分配した。この有機層を０．５Ｎ　ＨＣｌ水溶液（３０ｍＬ×２）により抽出した。次に、この酸層を２８％NH_4OH水溶液により塩基性とし、次にＥｔＯＡｃにより抽出した。この組み合せた有機抽出物をブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして濃縮して、この表題生成物を無色オイルとして得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１４６（Ｍ＋１）。

【０３０８】

【化１１０】

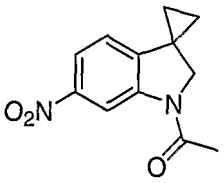


（ｂ）６’－ニトロスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］
スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］（１．８ｇ、１２．４ミリモル）を

濃H_2SO_4（３０ｍＬ）中の$NaNO_3$（１．３ｇ、１５．３ミリモル）の溶液の中に２０分間にわたって攪拌しながら滴加し、そして冷却（－５から－１０℃）した。この反応混合物を冷却しながら更に４０分間攪拌し、そして砕いた氷（２００ｇ）の上に注いだ。この生成した混合物を冷却しながら２８％NH_4OH水溶液により塩基性とし、そしてＥｔＯＡｃにより抽出した。この組み合せた有機抽出物をブライン（１００ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮し、そしてこの所望の生成物を暗灰色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１９１（Ｍ＋１）。

【０３０９】

【化１１１】

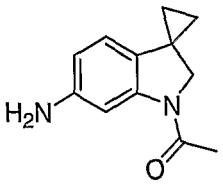


（ｃ）１’－アセチル－６’－ニトロスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］

塩化アセチル（１．１ｇ、１４ミリモル）をジクロロメタン（２００ｍＬ）中の６’－ニトロスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］（２．６ｇ、１３．７ミリモル）の溶液中の$NaHCO_3$（５ｇ、５９．５ミリモル）の懸濁液に激しく攪拌しながら室温で滴加した。この反応混合物を室温で２時間攪拌し、そして濾過した。この濾液を真空中で濃縮し、そしてこの残渣をヘキサン中の７５％から８０％の勾配のＥｔＯＡｃ溶液でのシリカゲルのフラッシュクロマトグラフィにより精製して、この表題化合物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２３３（Ｍ＋１）。

【０３１０】

【化１１２】

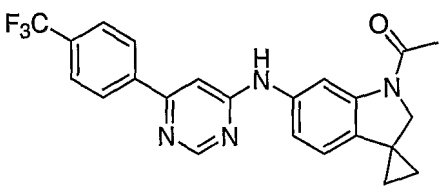


（ｄ）｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝アミン

ＥｔＯＨ（２００ｍＬ）中の１’－アセチル－６’－ニトロスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン］（２ｇ、８．６１ミリモル）の溶液に炭素上の１０％パラジウム（０．１ｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物をアルゴンにより掃気し、次に１気圧のH_2下で１．５時間攪拌した。この反応混合物をセライト（登録商標）のパッドを通して濾過し、そしてこの濾液を濃縮して、この表題化合物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２０３（Ｍ＋１）。

【０３１１】

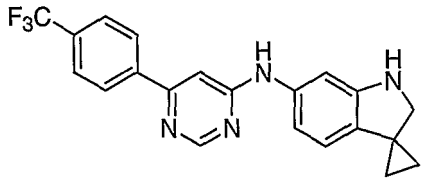
【化１１３】



（ｅ）｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル

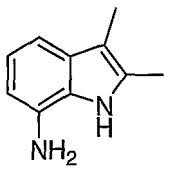
｝－［６－（４－トリフルオロメチル－フェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
ＤＭＳＯ（１ｍＬ）中の実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチル－フェニル）ピリミジン（０．１３８ｇ、０．５３ミリモル）と｛１’－アセチルスピロ－［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝アミン（０．１１９ｇ、０．５８ミリモル）の混合物を攪拌し、そして電子レンジ中１８０℃で１０分間加熱した。この混合物を水により希釈し、そしてCH_2Cl_2により抽出した。合せた抽出物をNa_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮した。CH_2Cl_2中のＭｅＯＨの０％から４０％の勾配の溶液によるシリカゲルクロマトグラフィによる精製によって、この表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４２５（Ｍ＋１）。

【０３１２】
（実施例３５）
【０３１３】
【化１１４】



｛スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン
実施例３４（ｅ）の｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン（０．０４３ｇ、０．１０ミリモル）、ＨＣｌの５Ｎ（水溶液）（３．０ｍＬ）およびＴＨＦ（１．０ｍＬ）の混合物を攪拌し、そして還流で３時間加熱した。この混合物を室温まで冷却し、１０Ｎ　ＮａＯＨ水溶液によりｐＨ～１０まで塩基性とし、そしてCH_2Cl_2により抽出した。合せた抽出物を水により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８３（Ｍ＋１）。

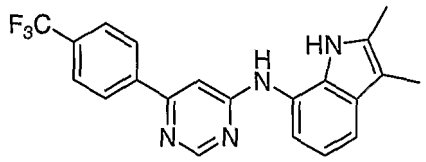
【０３１４】
（実施例３６）
【０３１５】
【化１１５】



（ａ）２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－７－イルアミン
ＭｅＯＨ（２５ｍＬ）中の２，３－ジメチル－７－ニトロインドール（５００ｍｇ、２．６ミリモル、Ａｃｒｏｓ）の溶液をN_2下に置き、そして炭素上の１０％パラジウム（２８１ｍｇ、Ａｌｄｒｉｃｈ）により処理した。この懸濁液をN_2によりパージし、そして１気圧のH_2下１６時間磁気攪拌した。この反応混合物をセライト（登録商標）のパッドを通して濾過し、そしてこの濾液を濃縮して、この表題化合物を褐色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１６１（Ｍ＋１）。

【０３１６】

【化１１６】



（ｂ）（２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル）アミン

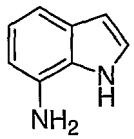
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（２４０ｍｇ、９３ミリモル）および２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－７－イルアミン（１５０ｍｇ、０．９３ミリモル）により、合成用ＨＰＬＣによる精製後、この表題化合物を褐色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３８３（Ｍ＋１）。

【０３１７】

（実施例３７）

【０３１８】

【化１１７】

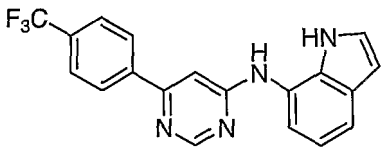


（ａ）１Ｈ－インドール－７－イルアミン

実施例３６（ａ）に述べた方法によりこの表題化合物を７－ニトロインドール（５００ｍｇ、２．６ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）から製造して、緑色の非晶質固体を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１３３（Ｍ＋１）。

【０３１９】

【化１１８】



（ｂ）（１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イル）アミン

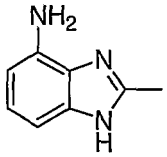
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（０．５８８ｇ、２．２８ミリモル）および１Ｈ－インドール－７－イルアミン（１５０ｍｇ、１．１３ミリモル）により、この表題化合物を褐色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３５５（Ｍ＋１）。

【０３２０】

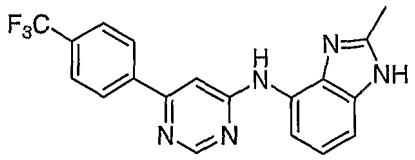
（実施例３８）

【０３２１】

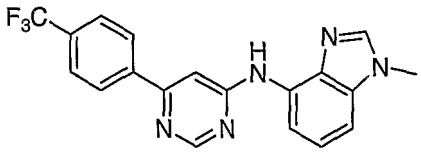
【化１１９】



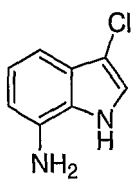
（ａ）２－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イルアミン
実施例３６（ａ）に述べた方法によりこの表題化合物を７－ニトロ－２－メチルベンズイミダゾール（０．３ｇ、１．６ミリモル、Ｔｙｇｅｒ　Ｓｃｉ．）から製造して、褐色の非晶質固体を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１４８（Ｍ＋１）。
【０３２２】
【化１２０】



（ｂ）（２－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］－ピリミジン－４－イル］アミン
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（２２７ｍｇ、０．８８ミリモル）および７－アミノ－２－メチルベンズイミダゾール（１５０ｍｇ、０．８８ミリモル）により、この表題化合物を淡黄色結晶性固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７０（Ｍ＋１）。
【０３２３】
（実施例３９）
【０３２４】
【化１２１】



（１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］アミン
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（２２７ｍｇ　０．８８ミリモル）および７－アミノ－１－メチル－Ｎ－ベンズイミダゾール（３５０ｍｇ、０．８８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、CH_2Cl_2中の１０％の（ＭｅＯＨ中２Ｍ　NH_3）溶離溶液によるシリカゲルカラムクロマトグラフィによる精製後、この表題化合物を淡黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７１．２（Ｍ＋１）。
【０３２５】
（実施例４０）
【０３２６】
【化１２２】

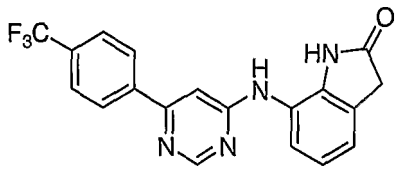


（ａ）３－クロロ－１Ｈ－インドール－７－イルアミン
実施例１６（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、３－クロロ－７－ニトロインドール（０．１５ｇ、０．７６ミリモル、ＵｂｉＣｈｅｍ　Ｒｅｓ．）を鉄粉（０．６３５ｇ、１１．３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により還元して、この表題化合物を黄色の非晶質

固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：１６７（Ｍ＋１）。

【０３２７】

【化１２３】



（ｂ）７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イルアミノ］－１，３－ジヒドロインドール－２－オン

実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例５（ａ）の４－クロロ－６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン（１７２ｍｇ、０．６６ミリモル）および３－クロロ－１Ｈ－インドール－７－イルアミン（１１０ｍｇ、０．６６ミリモル）により、この表題化合物を褐色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３７１（Ｍ＋１）。

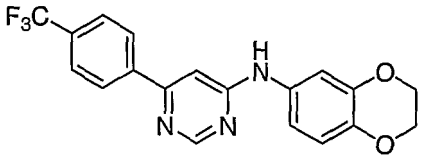
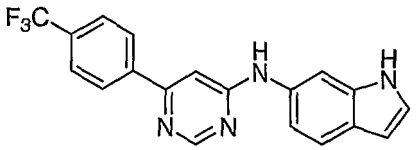
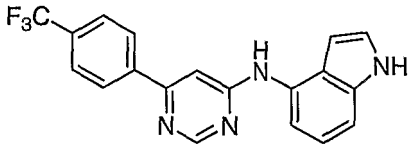
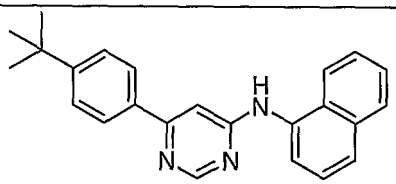
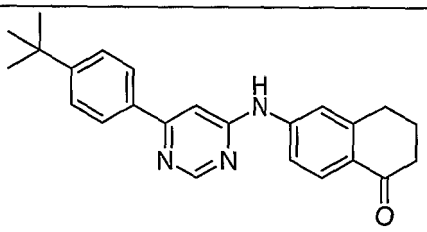
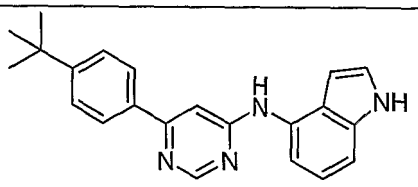
【０３２８】

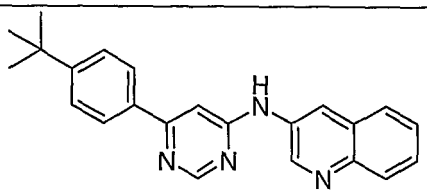
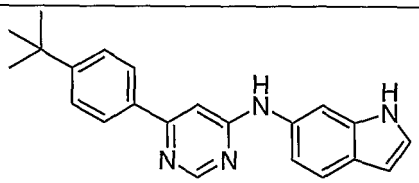
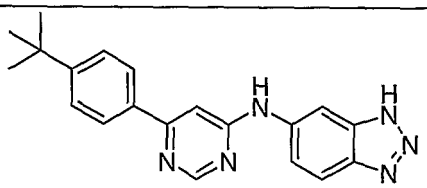
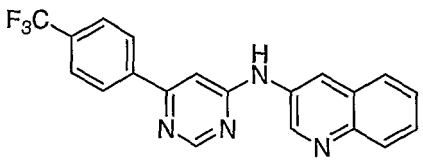
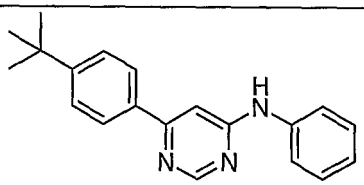
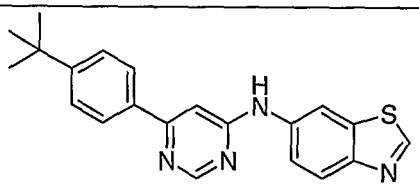
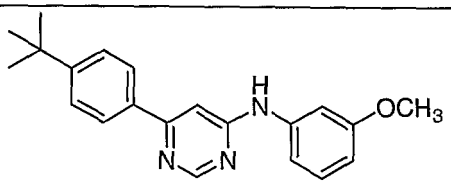
追加例

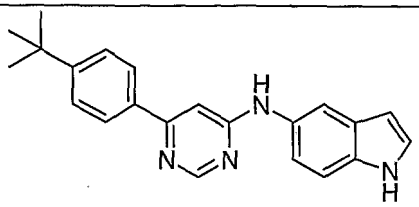
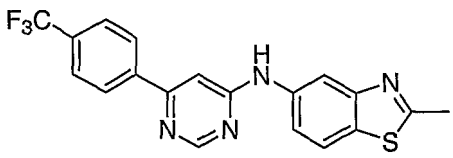
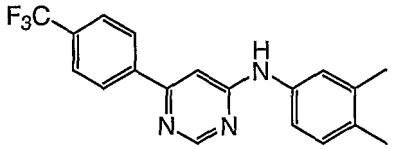
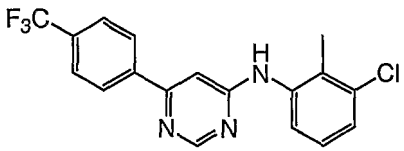
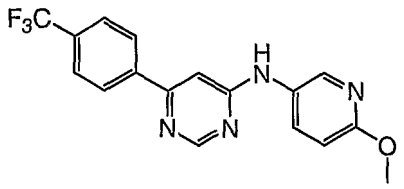
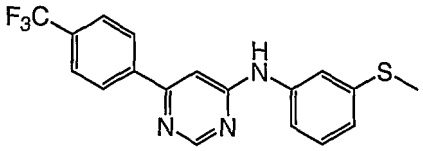
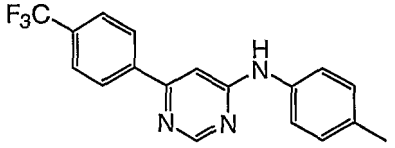
スキーム１で上述したか、あるいはこれらを若干改変した手順に従って、そして当業者になじみのある手順に従って、次の実施例品を市販の試薬から製造した：

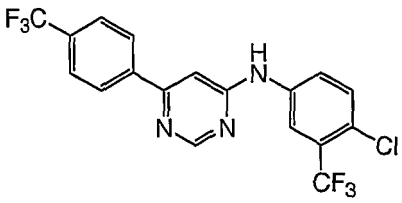
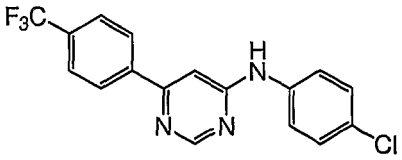
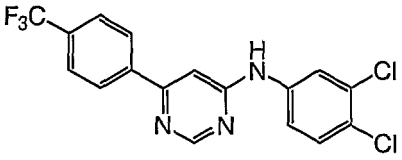
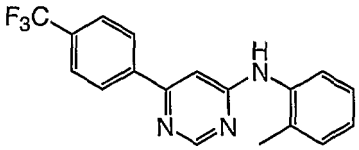
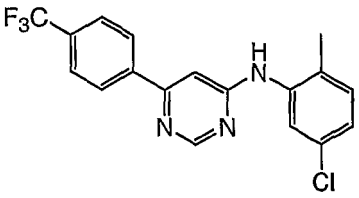
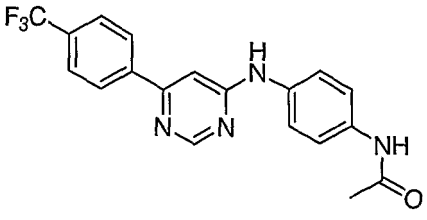
【０３２９】

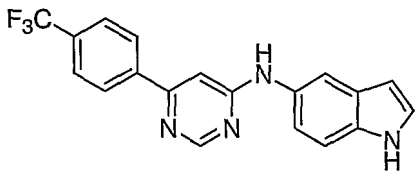
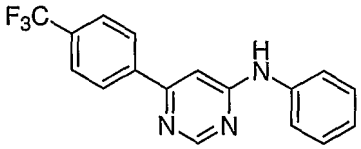
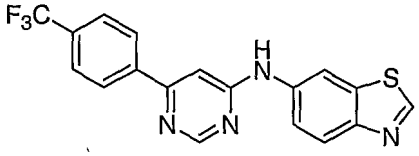
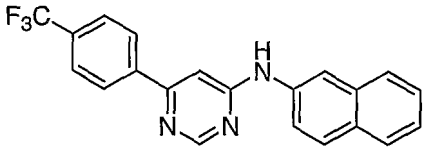
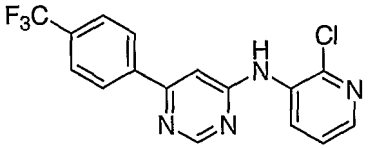
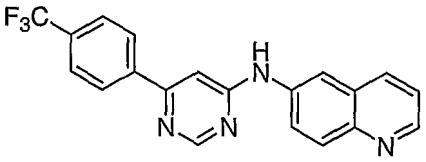
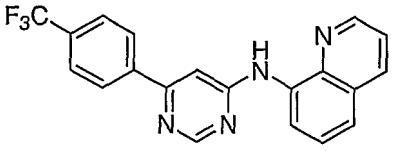
【表３】

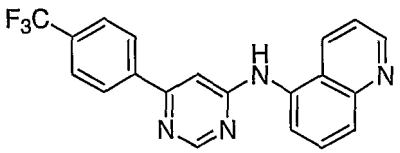
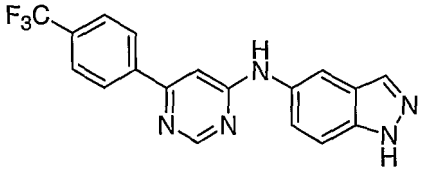
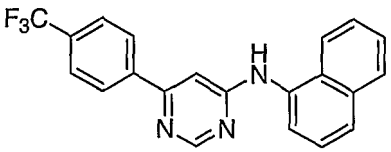
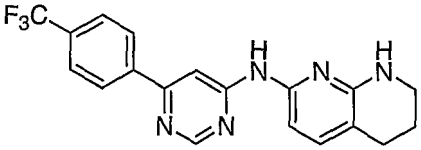
実施例	構造	MS (ESI, 陽ｲｵﾝ、)m/z	融点℃
41		374 (M+1)	167-168
42		355 (M+1)	231-232
43		355 (M+1)	222-224
44		355 (M+1)	183-185
45		372 (M+1)	230-232
46		343 (M+1)	241-242

実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン) m/z	融点℃
47		355 (M+1)	227-229
48		343 (M+1)	194-196
49		345 (M+1)	250-252
50		367 (M+1)	262-263
51		304 (M+1)	166
52		361 (M+1)	237
53		334 (M+1)	184-187

実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン)m/z	融点℃
54		343 (M+1)	238-240
55		387 (M+1)	219.5-220.5
56		344 (M+1)	154-156
57		364 (M+1)	148-150
58		347 (M+1)	123-127
59		362 (M+1)	130-132
60		330 (M+1)	159-160

実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン) m/z	融点℃
61		418 (M+1)	172-175
62		350 (M+1)	193-196
63		384 (M+1)	178-180
64		330 (M+1)	117-119
65		364 (M+1)	144-146
66		373 (M+1)	236-238

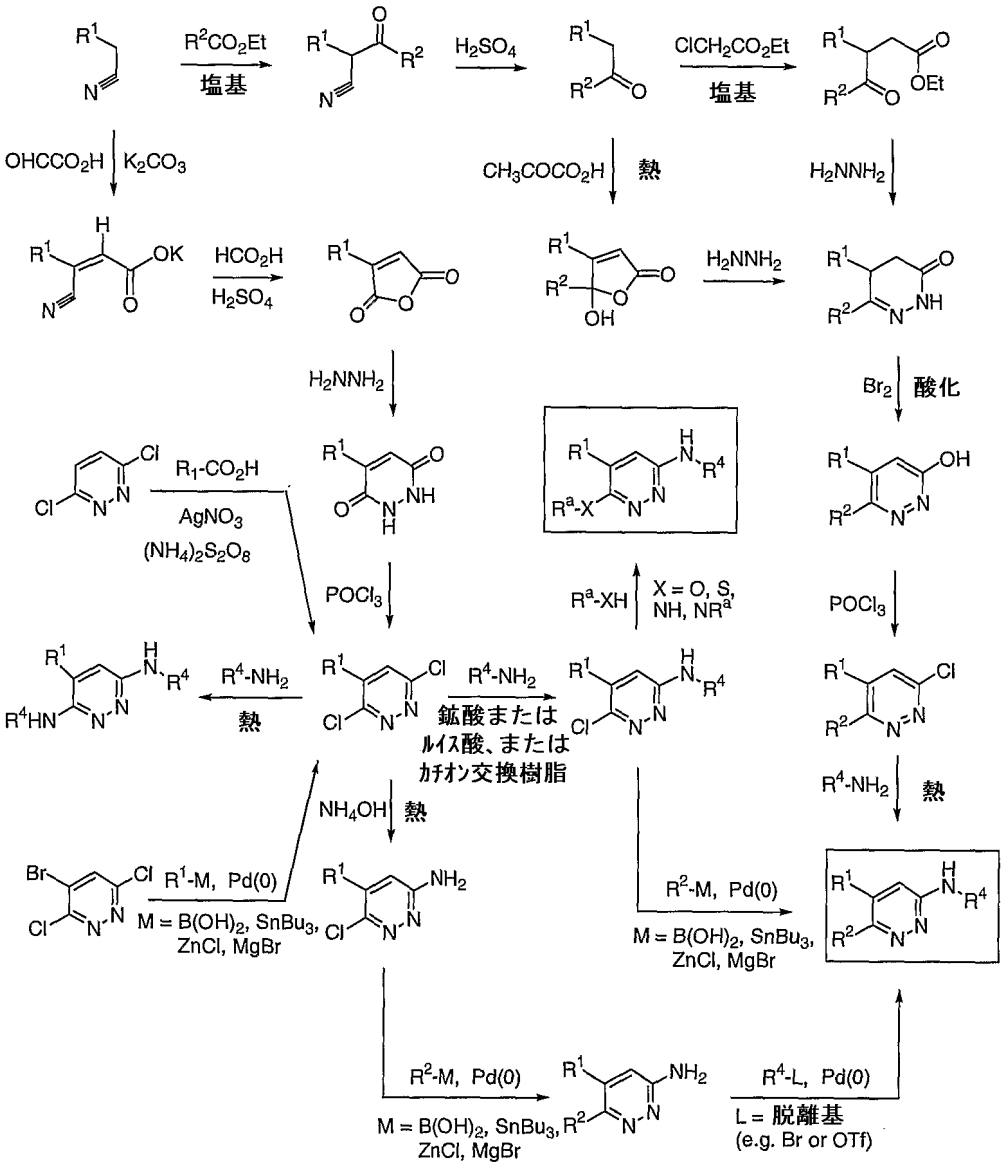
実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン) m/z	融点℃
67		355 (M+1)	非晶質固体
68		316 (M+1)	184-186
69		373 (M+1)	非晶質固体
70		366	212-213
71		351	134-135
72		367	268-269
73		367	162-163

実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン) m/z	融点℃
74		367	238-239
75		356	224-226
76		366	232-233
77		372	168

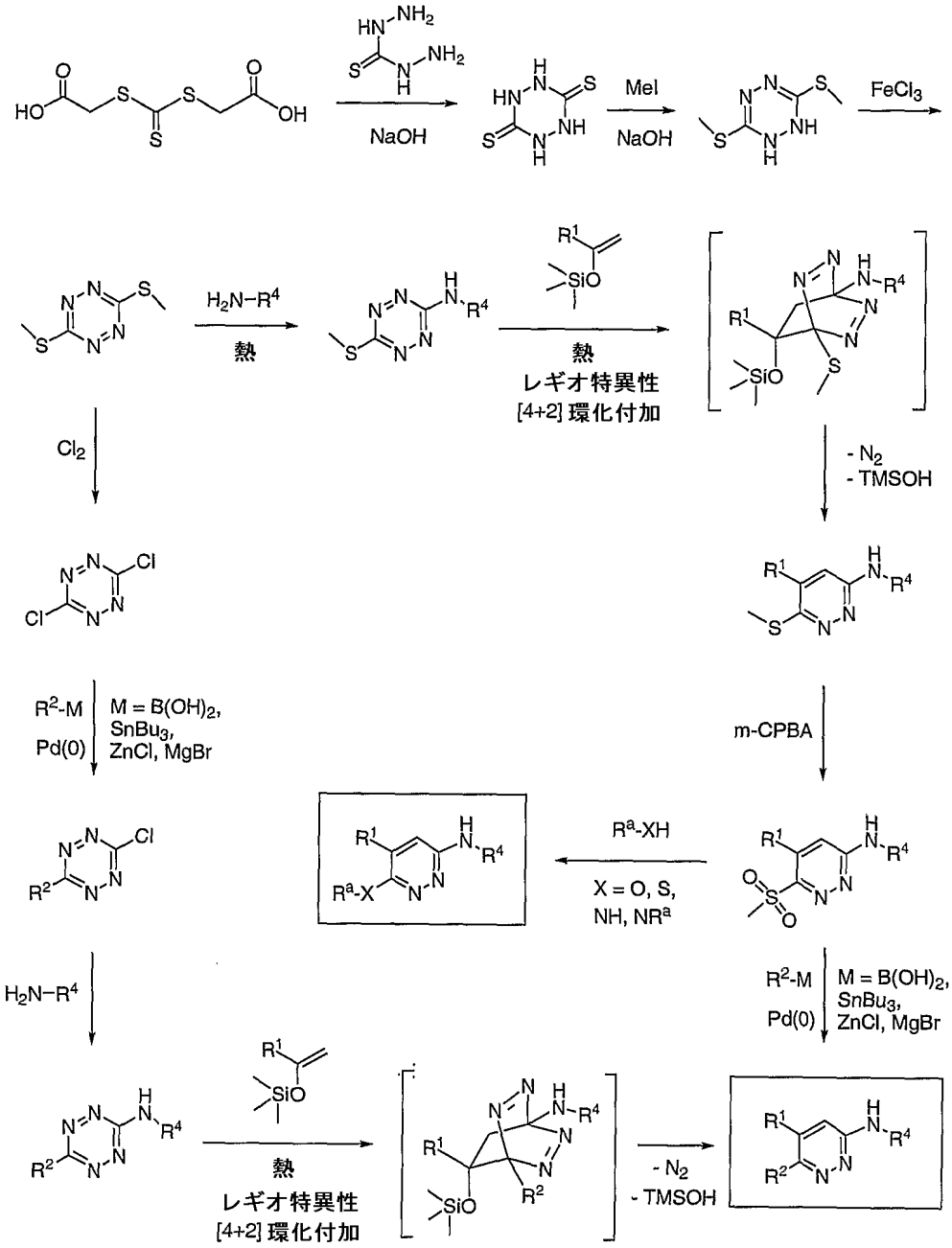
【０３３０】

【化１２４】

スキームＩＩ：ピリダジン核の調製のための一般的なスキーム：



スキームＩＩ（続き）：

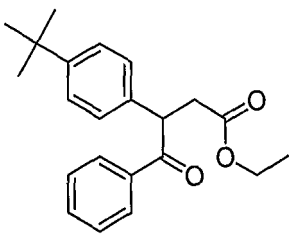


【０３３１】

（実施例７８）

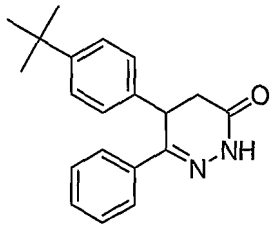
【０３３２】

【化１２５】

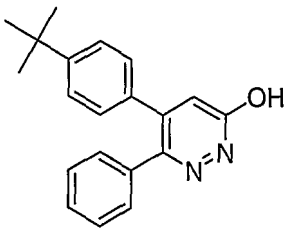


（ａ）３－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－オキソ－４－フェニル酪酸エチルエステル

（ＥＰ０４６９９９２Ｂ１の手順に類似して）
丸底フラスコ中に鉱油（２６４ｍｇ、６．６ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）中のＮａＨの６０％分散液を入れ、そしてこのオイルをヘキサンにより洗浄した（２×）。このフラスコにＤＭＳＯ（３０ｍＬ）中の２－（４－ｔ－ブチルフェニル）－１－フェニルエタノン（１．５ｇ、５．９ミリモル、Ｊ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．１９９７、１１９、１２３８２）の溶液を攪拌しながら０℃で添加した。この混合物を室温で１時間攪拌し、次に、エチルクロロアセテート（０．６ｍＬ、０．７ｇ、６．０ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そして攪拌を１８時間継続した。この反応混合物を１Ｍ H_3PO_4 水溶液によりクエンチし、ＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）により希釈し、飽和$NaHCO_3$水溶液とブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３３９（Ｍ＋１）。
【０３３３】
【化１２６】

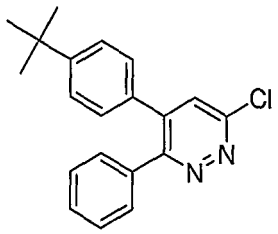


（ｂ）５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニル－４，５－ジヒドロ－２Ｈ－ピリダジン－３－オン
ジオキサン（５ｍＬ）中の３－（４－ｔ－ブチルフェニル）－４－オキソ－４－フェニル酪酸エチルエステル（１．８１ｇ、５．４ミリモル）の溶液にヒドラジン水和物（０．３４６ｇ、１０．８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、そしてこの混合物を還流下攪拌しながら一晩加熱した。この混合物を室温まで冷却し、ＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）により希釈し、そして０．５％H_3PO_4水溶液と飽和$NaHCO_3$とブラインにより洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮し、そしてこの表題生成物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３０７（Ｍ＋１）。
【０３３４】
【化１２７】



（ｃ）５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－オール
５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニル－４，５－ジヒドロ－２Ｈ－ピリダジン－３－オン（１．１５ｇ、３．８ミリモル）を氷ＡｃＯＨ（５ｍＬ）に溶解し、そして６０℃まで加熱した。臭素（７２２ｍｇ、４．５ミリモル）を滴加し、そしてこの混合物を攪拌しながら６０℃で１０分間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そしてＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）により希釈し、そして飽和$NaHCO_3$水溶液（３×）により抽出した。この有機層をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、濃縮し、そしてこの表題生成物を得、これを次の段階で更なる精製をせずに使用した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３０５（Ｍ＋１）。
【０３３５】

【化１２８】

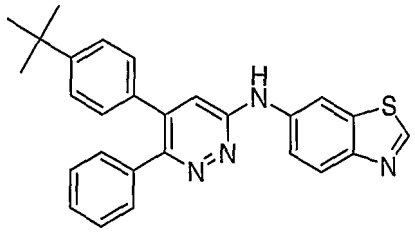


（ｄ）４－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－クロロ－３－フェニルピリダジン

５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－オール（５４９ｍｇ、１．８ミリモル）をＰＯＣｌ$_3$（３ｍＬ）に溶解し、そして攪拌しながら１００℃で一晩加熱した。このＰＯＣｌ$_3$を真空中で除去し、そしてこの残渣をＥｔＯＡｃに溶解し、そして飽和ＮａＨＣＯ$_3$水溶液により洗浄した（２×）。この有機層を組み合せ、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$の上で乾燥し、濾過し、そしてこの溶媒を真空中で蒸発させて、この表題生成物を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３２３（Ｍ＋１）。

【０３３６】

【化１２９】



（ｅ）ベンゾチアゾール－６－イル－［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］アミン

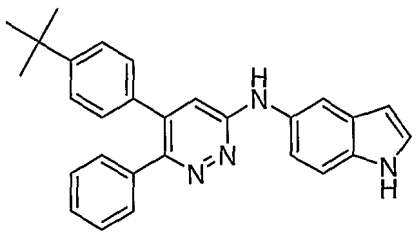
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、４－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－クロロ－３－フェニルピリダジン（９５ｍｇ、０．３ミリモル）および６－アミノベンゾチアゾール（４４ｍｇ、０．３ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）により、この表題化合物を白色の結晶性固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４３７（Ｍ＋１）。ＭＰ：２９３－２９５℃。

【０３３７】

（実施例７９）

【０３３８】

【化１３０】

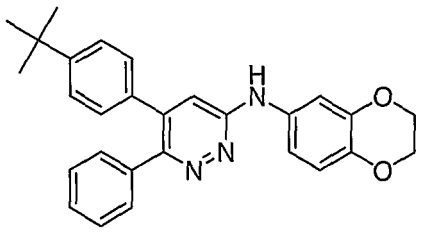


［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニル－ピリダジン－３－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）－アミン

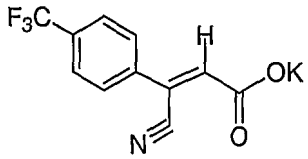
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例７８（ｄ）の４－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－クロロ－３－フェニルピリダジン（９５ｍｇ、０．３ミリモル）および５－アミノインドール（３９ｍｇ、０．３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、この表題化合物を淡黄色の結晶性固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４１９（Ｍ＋１）。ＭＰ：１３８－１４０℃。

【０３３９】

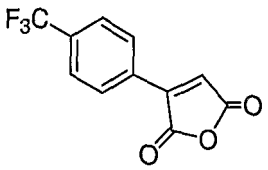
（実施例８０）
【０３４０】
【化１３１】



［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］－ジオキシン－６－イル）アミン
実施例５（ｂ）の製造に使用した手順に類似して、実施例７８（ｄ）の４－（４－ｔ－ブチル－フェニル）－６－クロロ－３－フェニルピリダジン（１５５ｍｇ、０．５ミリモル）および１，４－ベンゾジオキサン－６－アミン（８０ｍｇ、０．５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）により、この生成物を淡黄色の結晶性固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４３８（Ｍ＋１）。
【０３４１】
（実施例８１）
【０３４２】
【化１３２】



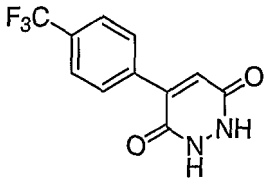
（ａ）カリウム（Ｚ）－３－（４－トリフルオロメチルフェニル）－３－シアノプロペノエート
（Ｄａｎ、Ｗ．Ｄ．ａｎｄ　Ｂｌｕｍ、Ｄ．Ｍ．Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．１９９３、５８、７９１６－７９１７の手順に類似して）
グリオキシル酸一水和物（１１１．８６ｇ、１．２２モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）をメタノール（１．６Ｌ）中の炭酸カリウム（２８４．４ｇ、２．０６モル）の懸濁液に攪拌しながら、そして水浴により冷却しながら小分けして添加した。次に、この淡褐色懸濁液に４－トリフルオロメチルフェニルアセトニトリル（１５０ｇ、０．８１モル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を小分けして添加し、この混合物を室温で５時間攪拌し、そしてこの生成した稠密な固体沈澱を濾過し、そしてジクロロメタンにより洗浄した。この濾液を６００ｍＬの容積まで濃縮することによって、更なる量の固体の沈澱を生じ、これを濾過し、そしてジクロロメタンにより洗浄した。この固体を組み合せ、次に冷水（４Ｌ）に懸濁して、過剰の炭酸カリウムを除去した。この沈澱を濾過し、水により洗浄し、そして風乾して、この表題化合物を白色固体として得、更なる精製をせずに次の段階で使用した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２７９（Ｍ）。
【０３４３】
【化１３３】



（ｂ）４－トリフルオロメチルフェニルマレイン酸無水物
（Ｄａｎ、Ｗ．Ｄ．ａｎｄ　Ｂ１ｕｍ、Ｄ．Ｍ．Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．１９９３、５８、７９１６－７９１７の手順に類似して）
カリウム（Ｚ）－３－（４－トリフルオロメチルフェニル）－３－シアノプロペノエート（１００ｇ、３５８ミリモル）を濃硫酸（４５ｍＬ）を含有する８８％ギ酸（６００ｍＬ、Ａｌｄｒｉｃｈ）に溶解し、そしてこの混合物を還流で３時間加熱した。次に、この反応混合物を冷却し、そして氷水（１Ｌ）の中に注いだ。この生成した固体を濾過し、水により洗浄し、そして風乾して、この表題化合物を淡黄色固体として得、更なる精製をせずに次の段階で使用した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２４３（Ｍ＋１）。

【０３４４】

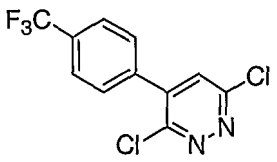
【化１３４】



（ｃ）４－（４－トリフルオロメチルフェニル）－１，２－ジヒドロピリダジン－３，６－ジオン
（Ａｕｇｕｓｔｉｎ、Ｍ．　ａｎｄ　Ｒｅｉｎｅｍａｎｎ、Ｐ．Ｚ．Ｃｈｅｍ．１９７３、１３、１２－１３の手順に類似して）
室温で攪拌しながら４－トリフルオロメチルフェニルマレイン酸無水物（５７．２ｇ、２３５．８ミリモル）を水（３２５ｍＬ）と酢酸（８８ｍＬ）の混合物に添加し、続いてヒドラジン水和物（１１．４４ｍＬ、２３５．８ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を滴加した。次に、この生成した淡黄色懸濁液に濃硫酸（１７７ｍＬ）を攪拌し、そして氷浴中で冷却しながら滴加し、稠密なペーストを形成した。この反応混合物を攪拌しながら１００－１１５℃で３時間加熱し、次に氷浴中で冷却した。この濾液が中性のｐＨを示すまで、この沈澱を水により洗浄し、次にジエチルエーテル（２×１００ｍＬ）により洗浄し、風乾して、この表題化合物を白色固体として得、更なる精製をせずに次の段階で使用した。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２５７（Ｍ＋１）。

【０３４５】

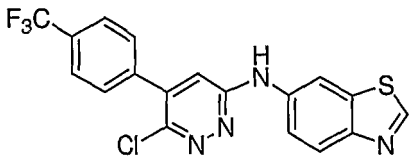
【化１３５】



（ｄ）３，６－ジクロロ－４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン
（Ａｕｇｕｓｔｉｎ、Ｍ．　ａｎｄ　Ｒｅｉｎｅｍａｎｎ、Ｐ．Ｚ．Ｃｈｅｍ．１９７３、１３、１２－１３の手順に類似して）
４－（４－トリフルオロメチルフェニル）－１，２－ジヒドロピリダジン－３，６－ジオン（２５．６ｇ、１００ミリモル）とオキシ塩化リン（１９２ｍＬ）の混合物を窒素雰囲気下で攪拌しながら還流で２時間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そして強力に攪拌しながら水と砕いた氷の混合物（２．６Ｌ）の中に小分けして注いだ。白色沈澱として分離した生成物を濾過し、水（３×５０ｍＬ）により洗浄し、真空下で乾燥し、そしてジオキサン／メタノールから再結晶して、この表題化合物を白色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：２９３（Ｍ＋１）。

【０３４６】

【化１３６】



（ｅ）ベンゾチアゾール－６－イル－［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン

（ＪＰ０２１６９５７９の手順に類似して）

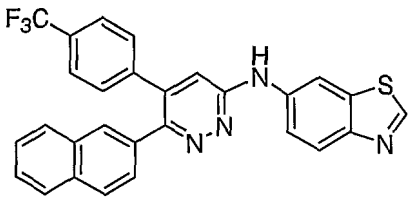
１－ブタノール（６ｍＬ）中の３，６－ジクロロ－４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン（１．４６５ｇ、５ミリモル）と６－アミノベンゾチアゾール（０．７５１ｇ、５ミリモル、Ｌａｎｃａｓｔｅｒ）の溶液に３７％塩酸（０．４９ｍＬ、５ミリモル）を添加し、そしてこの混合物を撹拌しながら窒素雰囲気下で７５℃で１８時間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そして酢酸エチル（２００ｍＬ）と水（３００ｍＬ）により希釈し、そして６０℃で１５分間撹拌した。この混合物を室温まで冷却し、この有機層を分離し、次に１Ｎ塩酸（２×５０ｍＬ）と水（５０ｍＬ）により洗浄し、Na_2SO_4の上で乾燥し、そして真空中で濃縮した。この残渣を酢酸エチル／ヘキサン（２：３）でのシリカゲルクロマトグラフィによりこの表題化合物を黄色固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０７（Ｍ＋１）、ＭＰ：２０６．３℃（分解しながら）。

【０３４７】

（実施例８２）

【０３４８】

【化１３７】



ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－ナフチル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン

$(Ph_3P)_2PdCl_2$（０．０２６ｇ、０．０３８ミリモル、Ｓｔｒｅｍ）を実施例８１（ｅ）のベンゾチアゾール－６－イル－［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン（０．２０３ｇ、０．５ミリモル）、２－ナフタレンボロン酸（０．１２９ｇ、０．７５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）、Na_2CO_3（０．０５３ｇ、０．５ミリモル）、ジメトキシエタン（１．４ｍＬ）、ＥｔＯＨ（０．４ｍＬ）および水（０．６ｍＬ）の混合物に添加した。この反応混合物を撹拌しながら窒素下で電子レンジ中１２０℃で１５分間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そして酢酸エチル（５０ｍＬ）により希釈し、１Ｎ　ＮａＯＨ（２０ｍＬ）と水（２×２０ｍＬ）により洗浄し、そしてNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、真空中で濃縮した。この残渣を酢酸エチル／ヘキサン（１：１）でのシリカゲルクロマトグラフィにより精製して、この表題化合物を黄色の非晶質固体として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４９９（Ｍ＋１）。

【０３４９】

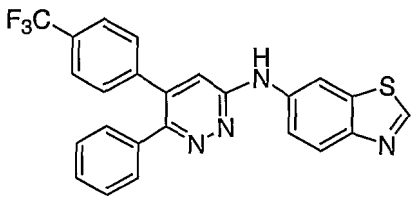
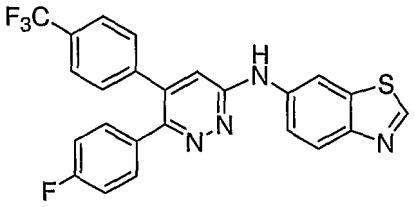
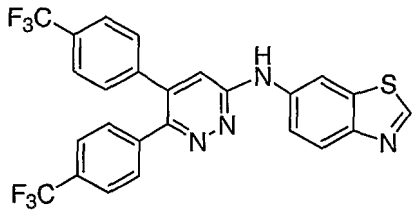
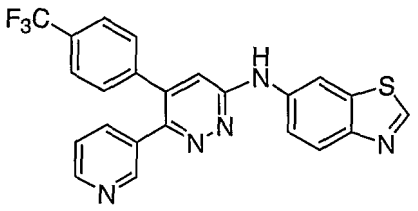
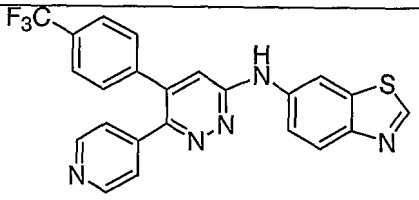
追加例

スキーム２で上述したか、あるいはこれらを若干改変した手順に従って、そして当業者になじみのある手順に従って、次の実施例品を市販の６－アミノベンゾチアゾールから製

造した：

【０３５０】

【表４】

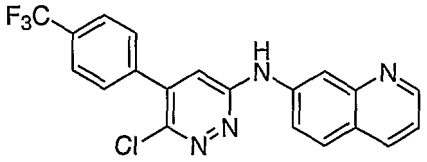
実施例	構造	MS (ESI, 陽イオン) m/z	融点℃
83		449 (M+1)	272
84		467 (M+1)	269
85		517 (M+1)	243
86		450 (M+1)	非晶質固体
87		450 (M+1)	非晶質固体

【０３５１】

（実施例８８）

【０３５２】

【化１３８】



［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］－［キノリン－７－イル］アミン

（ＷＯ１７８２７０の手順に類似して）

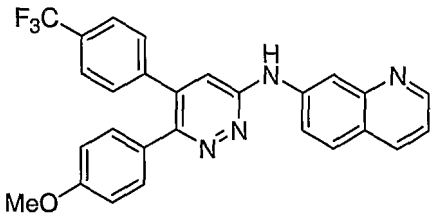
実施例８１（ｄ）の３，６－ジクロロ－４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン（２．０ｇ、６．８ミリモル）、７－アミノ－キノリン（９８４ｍｇ、６．８ミリモル）および$ZnCl_2$（９８０ｍｇ、３．４ミリモル）の混合物を攪拌しながら電子レンジ中２２０℃で２０分間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、第２の部分の３，６－ジクロロ－４－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリダジン（２．０ｇ、６．８ミリモル）を添加し、そしてこの混合物を電子レンジ中２２０℃で４０分間再度加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そしてＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）により希釈し、そしてH_2O（３×）により洗浄した。この有機層をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そしてこの溶媒を真空中で蒸発させた。ＭｅＯＨ：CH_2Cl_2（１：３９）により溶離する合成用薄層クロマトグラフィによりこの残渣を精製して、この表題化合物を淡黄色粉末として得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４０１（Ｍ＋１）。

【０３５３】

（実施例８９）

【０３５４】

【化１３９】

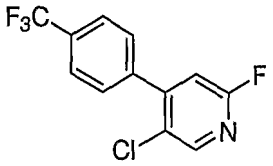


［６－（４－メトキシフェニル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］－［キノリン－７－イル］アミン

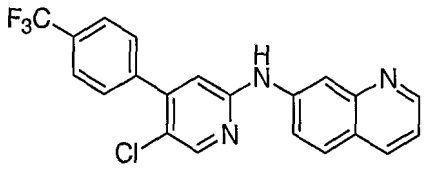
ジオキサン（２ｍＬ）中の実施例８８の［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］－［キノリン－７－イル］アミン（１００ｍｇ、０．３ミリモル）の溶液に４－メトキシフェニルボロン酸（４６ｍｇ、０．３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加し、続いて２Ｍ　Na_2CO_3水溶液（０．２ｍＬ、０．４ミリモル）と$Pd[PPh_3]_4$（３５ｍｇ、０．０３ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）を添加した。この混合物をN_2により掃気し、そしてN_2雰囲気下１００℃で２４時間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、更なる量の２Ｍ　Na_2CO_3水溶液（０．２ｍＬ、０．４ミリモル）、４－メトキシフェニル－ボロン酸（４６ｍｇ、０．３ミリモル）および$Pd[PPh_3]_4$（３５ｍｇ、０．０３ミリモル）を添加し、そしてこの混合物を攪拌しながらN_2雰囲気下で１００℃で４時間加熱した。この反応混合物を室温まで冷却し、そしてＥｔＯＡｃ（５０ｍＬ）により希釈し、そして５％Na_2CO_3により洗浄した。この有機層をNa_2SO_4の上で乾燥し、濾過し、そしてこの溶媒を真空中で蒸発させた。この残渣をＭｅＯＨ：CH_2Cl_2（１：１９）により溶離するカラムクロマトグラフィにより精製して、この表題化合物を黄褐色結晶性固体として得る。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：４７３（Ｍ＋１）。ＭＰ：２１５－２１７℃。

【０３５５】

（実施例９０）
【０３５６】
【化１４０】

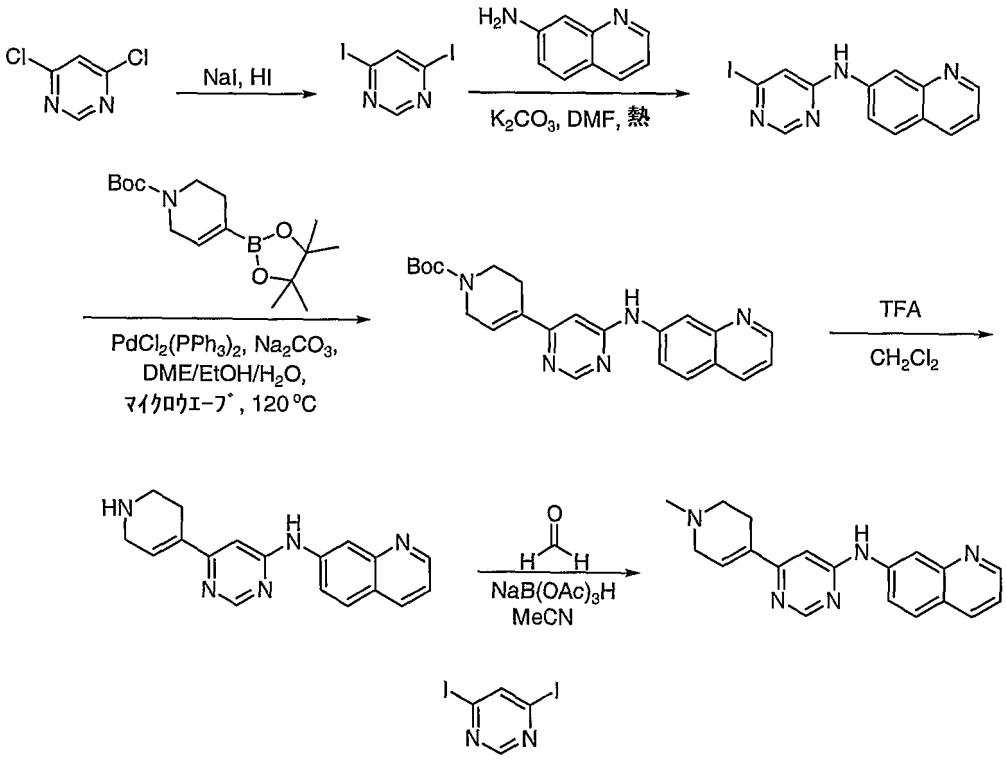


５－クロロ－２－フルオロ－４－（４－トリフルオロメチル－フェニル）－ピリジン
トルエン（１０ｍＬ）中で５－クロロ－２－フルオロ－４－ヨードピリジン（０．６４ｇ、２．５ミリモル、Ａｓｙｍｃｈｅｍ）、４－（トリフルオロメチル）－ベンゼンボロン酸（０．５２ｇ、２．８ミリモル、Ａｖｏｃａｄｏ）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）－パラジウム（０）（０．２９ｇ、０．２５ミリモル、Ａｌｄｒｉｃｈ）および炭酸ナトリウム水溶液（１０ｍＬの水中０．２９ｇ）を用い、実施例５（ａ）に類似してこの化合物を製造した。ＩＳＣＯ精製（ＥｔＯＡｃ／ヘキサン＝３０分間で１：９９から１：９）の後、この表題化合物を白色固体として単離した。ＭＳｍ／ｚ：２７６（Ｍ＋１）。
【０３５７】
【化１４１】



［５－クロロ－４－（４－トリフルオロメチル－フェニル）－ピリジン－２－イル］－キノリン－７－イル－アミン
電子レンジによりＳｍｉｔｈ　Ｓｙｎｔｈｅｓｉｚｅｒ（Ｐｅｒｓｏｎａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ）中で１８０℃で２０分間、実施例６（ｄ）に述べた方法によりこの化合物を５－クロロ－２－フルオロ－４－（４－トリフルオロメチル－フェニル）－ピリジンと７－アミノキノリンから製造することができた。フラッシュクロマトグラフィを用いて、この生成物を単離する。
【０３５８】
（実施例９１）
【０３５９】

【化１４２】

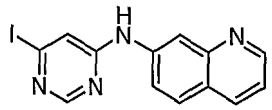


（ａ）４，６－ジヨード－ピリミジン

４，６－ジクロロ－ピリミジン（１．０ｇ、６．７０ミリモル）、ＮａＩ（１．３６ｇ、９．００ミリモル）、およびヨウ化水素酸（２０ｍＬ、１５１．４ミリモル）の混合物を４０℃で１時間加熱し、そして室温で更に２０時間攪拌した。この反応混合物を１０ＮＮａＯＨ水溶液（１８ｍＬ）により塩基性とした。この生成した沈澱を濾過し、水により洗浄し、そして高真空下で乾燥して、淡黄色固体を得た。ＭＳ（ＥＳＩ、陽イオン）ｍ／ｚ：３３２（Ｍ＋１）。

【０３６０】

【化１４３】

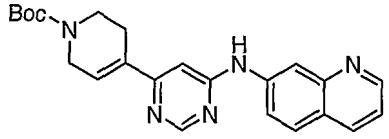


（ｂ）（６－ヨード－ピリミジン－４－イル）－キノリン－７－イル－アミン

この化合物を４，６－ジヨード－ピリミジンと７－アミノキノリンからK_2CO_3とＤＭＦの存在下で製造することができた。

【０３６１】

【化１４４】



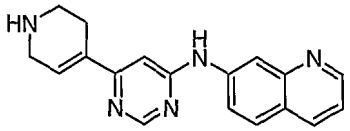
（ｃ）４－［６－（キノリン－７－イルアミノ）－ピリミジン－４－イル］－３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－カルボン酸ｔ－ブチルエステル

この化合物を（６－ヨード－ピリミジン－４－イル）－キノリン－７－イル－アミンと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）－

３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－カルボン酸ｔ－ブチルエステルからＳｕｚｕｋｉカップリング反応により製造することができた。

【０３６２】

【化１４５】

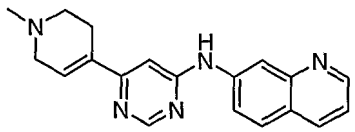


（ｄ）キノリン－７－イル－［６－（１，２，３，６－テトラヒドロ－ピリジン－４－イル）－ピリミジン－４－イル］－アミン

この化合物を４－［６－（キノリン－７－イルアミノ）－ピリミジン－４－イル］－３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－カルボン酸ｔ－ブチルエステルからＴＦＡとCH_2Cl_2の存在下で製造することができた。

【０３６３】

【化１４６】



（ｅ）［６－（１－メチル－１，２，３，６－テトラヒドロ－ピリジン－４－イル）－ピリミジン－４－イル］－キノリン－７－イル－アミン

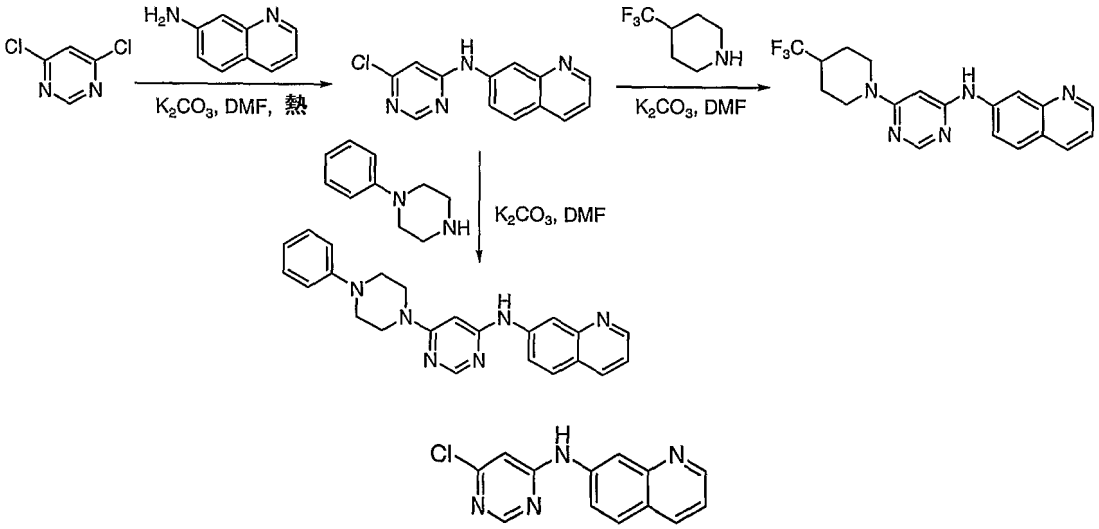
この化合物をキノリン－７－イル－［６－（１，２，３，６－テトラヒドロ－ピリジン－４－イル）－ピリミジン－４－イル］－アミンとホルムアルデヒドからナトリウムトリアセトキシボロハイドライドとＭｅＣＮの存在下で製造することができた。

【０３６４】

（実施例９２）

【０３６５】

【化１４７】

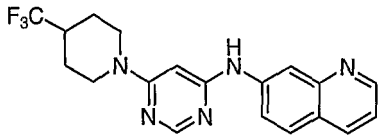


（ａ）（６－クロロ－ピリミジン－４－イル）－キノリン－７－イル－アミン

この化合物を４，６－ジクロロ－ピリミジンと７－アミノキノリンからK_2CO_3とＤＭＦの存在下で製造することができた。

【０３６６】

【化１４８】

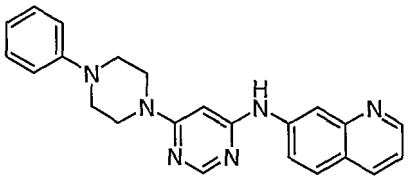


（ｂ）キノリン－７－イル－［６－（４－トリフルオロメチル－ピペリジン－１－イル）－ピリミジン－４－イル］－アミン

この化合物を（６－クロロ－ピリミジン－４－イル）－キノリン－７－イル－アミンと４－トリフルオロメチル－ピペリジンからK_2CO_3とＤＭＦの存在下で製造することができた。

【０３６７】

【化１４９】



（ｃ）［６－（４－フェニル－ピペラジン－１－イル）－ピリミジン－４－イル］－キノリン－７－イル－アミン

この化合物を（６－クロロ－ピリミジン－４－イル）－キノリン－７－イル－アミンと１－フェニル－ピペラジンからK_2CO_3とＤＭＦの存在下で製造することができた。

【０３６８】

初代後根神経節ニューロン中のカプサイシン誘起のCa^{2+}流入

１９日目の胚の（Ｅ１９）後根神経節（ＤＲＧ）を時間を決めて妊娠した、末期に麻酔されたＳｐｒａｇｕｅ－Ｄａｗｌｅｙラット（Ｃｈａｒｌｅｓ Ｒｉｖｅｒ、Ｗｉｌｍｉｎｇｔｏｎ、ＭＡ）から切り取り、そして５％熱不活性化したウマ血清（Ｌｉｆｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ）を含有する氷冷したＬ－１５媒体（Ｌｉｆｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ、Ｇｒａｎｄ Ｉｓｌａｎｄ、ＮＹ）中に捕集した。次に、パパイン解離系（Ｗｏｒｔｈｉｎｇｔｏｎ ＢｉｏＣｈｅｍｉｃａｌ Ｃｏｒｐ．、Ｆｒｅｅｈｏｌｄ、ＮＪ）を用いて、このＤＲＧを単一の細胞懸濁液の中に解離した。この解離した細胞を２００×ｇで５分間ペレットとし、そして１ｍｇ／ｍＬオボムコイドインヒビター、１ｍｇ／ｍＬオバルブミンおよび０．００５％ＤＮａｓｅを含有するＥＢＳＳに再懸濁した。１０ｍｇ／ｍＬオボムコイドインヒビター、１０ｍｇ／ｍＬオバルブミンを含有する勾配溶液から細胞懸濁液を２００×ｇで６分間遠心分離して、細胞破片を除去し；そして８８μｍのナイロンメッシュ（Ｆｉｓｈｅｒ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ、Ｐｉｔｔｓｂｕｒｇｈ、ＰＡ）により濾過して、いかなる塊りも除去した。細胞数を血球計数器により求め、そして細胞をポリオルニチン１００μｇ／ｍＬ（Ｓｉｇｍａ）およびマウスラミニン１μｇ／ｍＬ（Ｌｉｆｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ）被覆の９６穴のプレートに完全媒体中10×10^3細胞／穴で播種した。この完全な媒体は、最少の必須媒体（ＭＥＭ）およびＨａｍのＦ１２（１：１）、ペニシリン（１００Ｕ／ｍＬ）、およびストレプトマイシン（１００μｇ／ｍＬ）、および神経成長因子（１０ｎｇ／ｍＬ）、１０％熱不活性化ウマ血清（Ｌｉｆｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ）を含むものであった。この培養物を３７℃、５％CO_2および１００％湿度で保持した。非ニューロン性細胞の成長を制御するために、５－フルオロ－２’－デオキシウリジン（７５μＭ）およびウリジン（１８０μＭ）をこの媒体に含めた。カプサイシン刺激（０．０１～１０μＭの範囲の）を用いるか、あるいは酸刺激（ｐＨ４．１で緩衝した３０ｍＭ Ｈｅｐｅｓ／Ｍｅｓの添加）により、これらの細胞検定においてＶＲ１の活性化を得ることができた。また、化合物を検定フォーマットにおいて試験して、ＶＲ１での作用薬の性質を評価することができた。放射性カルシウム（

$^{45}Ca^{2+}$：Ａｍｅｒｓｈａｍ　ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）の細胞による取り込みの関数として、ＶＲ１の活性化を追跡する。

【０３６９】

カプサイシン拮抗薬検定：

培養３日目のＥ－１９ＤＲＧ細胞をＨＢＳＳ（ＢＳＡ０．１ｍｇ／ｍＬおよび１ｍＭ　ＨｅｐｅｓによりｐＨ７．４で栄養補給したＨａｎｋｓ緩衝生理食ブライン溶液）中で一連の濃度のＶＲ１拮抗薬と共に室温で１５分間インキュベーションする。次に、０．１ｍｇ／ｍＬ　ＢＳＡ、１５ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ、ｐＨ７．４、およびＨａｍＦ１２中１０μＣｉ／ｍＬ$^{45}Ca^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ　ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）を含有する活性化緩衝液中でＶＲ１作用薬のカプサイシン（５００ｎＭ）に細胞を室温で２分間曝露した。

【０３７０】

次の化合物は酸拮抗薬検定において１０ｍＭ未満のＩＣ５０値を示した：

（１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インダゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－６－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イル）アミン；

（１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］アミン；

（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－（６－フェニルピリミジン－４－イル）アミン；

（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－（トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル）アミン；

（２－クロロピリジン－３－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－クロロキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－クロロキノリン－８－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－メトキシキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］－アミン；

（２－メチルアミノキノリン－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン二塩酸塩；

（２－メチルベンゾチアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（２Ｒ）－｛６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２Ｈ，３Ｈ－ベンゾ［１，４］ジオキシン－２－イル｝メタノール；

（３，４－ジクロロフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３，４－ジメチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－クロロ－２－メチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メタンスルホニルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メチルベンゾ［ｄ］イソチアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（３－メチルスルファニルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（４－クロロ－３－トリフルオロメチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（４－クロロフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（５，６，７，８－テトラヒドロ［１，８］ナフチリジン－２－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（５－クロロ－２－メチルフェニル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
（６－メトキシピリジン－３－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
［（２－モルホリン－４－イル）キノリン－７－イル］－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン塩酸塩；
［２－アミノ－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン塩酸塩；
［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニル－ピリダジン－３－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）－アミン；
［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（２－アミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－６－イルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－クロロピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－４－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（３－メトキシフェニル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ナフタレン－１－イルアミン；

［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］フェニルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニルピリミジン－４－イル）キノリン－３－イルアミン；
｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
｛７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－イル｝メタノール；
｛スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
１－｛３，３－ジメチル－６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２，３－ジヒドロインドール－１－イル｝エタノン；
２－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－８－オール；
２－｛５－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ピリジン－２－イルオキシ｝エタノール；
３，４－ジヒドロ－７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－キノリン－２－オン；
４－メチル－７－｛［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミノ｝キノリン－２－オール、塩酸塩；
６－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ナフタレン－１－オン；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イルアミノ）－１，３－ジヒドロインドール－２－オン；
ベンゾチアゾール－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５，６－ビス－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－シクロヘキシルメチルアミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－ナフチル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－フルオロフェニル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－フェニル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－３－イル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－４－イル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル｝アセトアミド；

Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ベンゾチアゾール－２－イル｝アセトアミド；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］フェニル｝アセトアミド；
$Ｎ^{4}$－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２，４－ジアミン；
$Ｎ^{4}$－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン；
$Ｎ^{4}$－ベンゾチアゾール－６－イル－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－２，４－ジアミン塩酸塩；
$Ｎ^{7}$－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，７－ジアミン；
$Ｎ^{8}$－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，８－ジアミン；
ナフタレン－１－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ナフタレン－２－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｏ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
フェニル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｐ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－３－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；キノリン－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－８－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；および
キノリル－７－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン。

【０３７１】

酸拮抗薬検定：
３０ｍＭ Ｈｅｐｅｓ／Ｍｅｓ緩衝液（最終検定ｐＨ５）中の$^{45}Ｃａ^{2+}$の添加に先立って、化合物をＥ－１９ＤＲＧ細胞と共に室温で２分間予備インキュベーションし、次に化合物の洗い流しに先立って更に２分間放置する。$^{45}Ｃａ^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）の最終濃度は１０μＣｉ／ｍＬである。

【０３７２】

作用薬検定：
化合物の洗い流しに先立って、化合物をＥ－１９ＤＲＧ細胞と共に室温で２分間$^{45}Ｃａ^{2+}$の存在下でインキュベーションする。最終の$^{45}Ｃａ^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）は１０μＣｉ／ｍＬである。

【０３７３】

化合物の洗い流しおよび分析：
官能（ｆｕｎｃｔｉｏｎａｌ）検定の直後にＥＬＸ４０５プレート洗浄器（Ｂｉｏ－Ｔｅｋ Ｉｎｓｔｒｕｍｅｎｔｓ Ｉｎｃ．）を用いて、検定プレートを洗浄する。ＰＢＳ、０．１ｍｇ／ｍＬ ＢＳＡにより３×洗浄。洗浄の間に吸引。Ｍｉｃｒｏ ＢｅｔａＪｅｔ（Ｗａｌｌａｃ Ｉｎｃ．）を用いてプレートを読む。次に、適切な計算アルゴリズ

ムを用いて、化合物活性を計算する。
【０３７４】
^{45}カルシウム$^{2+}$検定プロトコル
ＣＭＶプロモーター下でヒトＶＲ１またはラットＶＲ１のいずれかを安定に発現するチャイニーズハムスター卵巣細胞株を用いて、化合物を検定することができる。細胞を成長媒体中で培養し、トリプシンを用いて７０％密度で定常的に継代し、そして化合物の評価の２４時間前に検定プレート中に撒いた。
【０３７５】
可能な成長媒体：
ＤＭＥＭ、高グルコース（Ｇｉｂｃｏ　１１９６５－０８４）。
１０％透析血清（Ｈｙｃｌｏｎｅ　ＳＨ　３００７９．０３）。
１×非必須アミノ酸（Ｇｉｂｃｏ　１１１４０－０５０）。
１×グルタミン－Ｐｅｎ－Ｓｔｒｅｐ（Ｇｉｂｃｏ　１０３７８－０１６）。
ゲネチシン、４５０μｇ／ｍＬ（Ｇｉｂｃｏ　１０１３１－０３５）。
【０３７６】
化合物を１００％ＤＭＳＯ中で希釈し、そして数ログ単位の濃度［４０μＭ～２ｐＭ］にわたって活性について試験することができた。評価に先立って、化合物をＨＢＳＳ緩衝液（ｐＨ７．４）０．１ｍｇ／ｍＬ　ＢＳＡに更に希釈してもよい。検定における最終のＤＭＳＯ濃度は０．５～１％である。各検定プレートを緩衝液のみおよび既知の拮抗薬化合物（カプサゼピンまたは記述のＶＲ１拮抗薬の１つのいずれか）によりコントロールすることができた。
【０３７７】
カプサイシン刺激（０．１～１μＭの範囲の）を用いるか、あるいは酸刺激（ｐＨ４．１で緩衝した３０ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ／Ｍｅｓの添加）により、これらの細胞検定においてＶＲ１の活性化を得ることができた。また、化合物を検定フォーマットにおいて試験して、ＶＲ１での作用薬の性質を評価することができた。
【０３７８】
カプサイシン拮抗薬検定：
^{45}Ｃａ$^{2+}$とカプサイシンの添加に先立って、化合物を細胞（ヒトあるいはラットのいずれかのＶＲ１を発現する）と共に室温で２分間予備インキュベーションし、次に化合物の洗い流しに先立って更に２分間放置する。カプサイシン（２００ｎＭ）をＨＡＭのＦ１２、０．１ｍｇ／ｍＬ　ＢＳＡ、１５ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ中ｐＨ７．４で添加することができる。添加した最終の^{45}Ｃａ$^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ　ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）は１０μＣｉ／ｍＬである。
【０３７９】
酸拮抗薬検定：
３０ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ／Ｍｅｓ緩衝液（最終検定ｐＨ５）中の^{45}Ｃａ$^{2+}$の添加に先立って、化合物を細胞（ヒトあるいはラットのいずれかのＶＲ１を発現する）と共に室温で２分間予備インキュベーションし、次に化合物の洗い流しに先立って更に２分間放置することができる。添加した最終の^{45}Ｃａ$^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ　ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）は１０μＣｉ／ｍＬである。
【０３８０】
作用薬検定：
化合物の洗い流しに先立って、化合物を細胞（ヒトあるいはラットのいずれかのＶＲ１を発現する）と共に^{45}Ｃａ$^{2+}$の存在下で２分間インキュベーションすることができる。添加した最終の^{45}Ｃａ$^{2+}$（Ａｍｅｒｓｈａｍ　ＣＥＳ３－２ｍＣｉ）は１０μＣｉ／ｍＬである。
【０３８１】
化合物洗い流しおよび分析：
機能検定の直後にＥＬＸ４０５プレート洗浄器（Ｂｉｏ－Ｔｅｋ　Ｉｎｓｔｒｕｍｅｎ

ｔｓ　Ｉｎｃ．）を用いて、検定プレートを洗浄する。洗浄の間に吸引しながら、ＰＢＳ、０．１ｍｇ／ｍＬ　ＢＳＡにより３×洗浄することができる。次に、ＭｉｃｒｏＢｅｔａ　Ｊｅｔ（Ｗａｌｌａｃ　Ｉｎｃ．）を用いて、プレートを読むことができ、そして適切な計算アルゴリズムを用いて、化合物活性を計算することができた。

【０３８２】

有用な核酸配列およびタンパク質を、参照により本明細書に全体で組み込まれる米国特許第６，３３５，１８０号、第６，４０６，９０８号および第６，２３９，２６７号に見出すことができる。

【０３８３】

バニロイド受容体疾患、例えば急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性膀胱障害、乾癬、炎症性成分を含む皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性痛みおよび関連痛覚過敏および異痛症、神経因性痛みおよび関連痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性の持続痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷または機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸または血管の領域での内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害の治療のために、慣用の医薬的に許容できるキャリア、補助剤、およびビヒクルを含有する投与単位製剤で本発明の化合物を経口的、非経口的、吸入噴霧により、直腸的、あるいは局所的に投与してもよい。用語「非経口」は、本明細書で使用されるように、皮下、静脈内、筋肉内、胸骨内、点滴法あるいは腹腔内を含む。

【０３８４】

疾患および障害の治療は、本明細書では、例えば痛み、炎症などの予防的治療を必要と考えられる被験者（すなわち、動物、好ましくは哺乳動物、最も好ましくはヒト）に、本発明の化合物、これらの医薬的な塩、またはこれらの医薬組成物を予防的に投与することも含むように意図されている。

【０３８５】

バニロイド受容体仲介の疾患、ガン、および／または高血糖症を本発明の化合物および／または本発明の組成物により治療するための投与計画は、疾患のタイプ、年齢、体重、性別、患者の医学的な状態、状態の重篤度、投与経路、および使用される特定の化合物を含む種々の因子に基づく。このように、この投与計画は広範に変わり得るが、標準的な方法を用いて定常的な方法で決定可能である。体重１キログラム１日当り約０．０１ｍｇから３０ｍｇの、好ましくは約０．１ｍｇから１０ｍｇ／ｋｇの、更に好ましくは約０．２５ｍｇから１ｍｇ／ｋｇのオーダーの投与レベルが本明細書に開示されている使用のすべての方法に有用である。

【０３８６】

本発明の薬学的に活性な化合物は、ヒトおよび他の哺乳動物を含む患者に投与するための薬剤を製造するための薬学の慣用の方法により加工可能である。

【０３８７】

経口投与に対しては、この医薬組成物は、例えばカプセル、錠剤、懸濁液、または液体の形であってもよい。この医薬組成物は、好ましくは与えられた量の活性成分を含有する投与単位の形で作製される。例えば、これらは、約１から２０００ｍｇの、好ましくは約１から５００ｍｇの、更に好ましくは約５から１５０ｍｇの活性成分の量を含有してもよい。患者の状態および他の因子に依りヒトまたは他の哺乳動物に対する好適な日量は広範に変わり得るが、定常的な方法を用いて決定可能である。

【０３８８】

この活性成分は、生理食ブライン、デクストロース、または水を含む好適なキャリアと共の組成物として注射により投与されてもよい。この１日の非経口投与計画は、約０．１

から約３０ｍｇ／全体重のｋｇ、好ましくは約０．１から約１０ｍｇ／ｋｇ、そして更に好ましくは約０．２５ｍｇから１ｍｇ／ｋｇである。

【０３８９】

既知の方法により好適な分散あるいは湿潤剤および懸濁剤を用いて、注射用製剤、例えば無菌の注射用水性あるいは油性懸濁液を製剤してもよい。この無菌注射用製剤は、また、非毒性の非経口的に許容できる希釈剤または溶媒中の、例えば１，３－ブタンジオール中の溶液として無菌の注射用溶液または懸濁液であってもよい。使用してもよい許容できるビヒクルおよび溶媒のなかには、水、Ｒｉｎｇｅｒ溶液、および等張性の塩化ナトリウム溶液がある。加えて、無菌の不揮発性オイルが溶媒または懸濁媒体として慣用的に使用される。この目的で、合成のモノ－あるいはジグリセリドを含んで任意の無刺激の不揮発性オイルを使用してもよい。加えて、オレイン酸などの脂肪酸が注射用の製剤で使用される。

【０３９０】

通常の温度で固体であるが、直腸温度で液体であり、それゆえ直腸中で融解し、そして薬剤を放出する好適な非刺激性の賦型剤、例えばココアバターおよびポリエチレングリコールとこの薬剤を混合することにより、この薬剤の直腸投与用の座薬を製造することができる。

【０３９１】

本発明の化合物の活性成分の好適な局所的用量は０．１ｍｇから１５０ｍｇであり、１日１から４回、好ましくは１から２回投与される。局所的投与に対しては、この活性成分は、この製剤の０．００１％から１０％ｗ／ｗ、例えば重量で１％から２％を占めてもよく、１０％ｗ／ｗもの多くを占めてもよいが、好ましくはこの製剤の５％ｗ／ｗ以下、そして更に好ましくは０．１％から１％を占めてもよい。

【０３９２】

局所的投与に好適な製剤は、皮膚からの浸透に好適な液体あるいは半液体の製剤（例えば、塗布薬、ローション、軟膏、クリーム、またはペースト）および眼、耳、または鼻への投与に好適な点滴薬を含む。

【０３９３】

投与のために、本発明の化合物は、投与の指示された経路に適切な１つ以上の補助剤と通常合体される。この化合物は、ラクトース、スクロース、でん粉粉末、アルカン酸のセルロースエステル、ステアリン酸、タルク、ステアリン酸マグネシウム、酸化マグネシウム、リン酸および硫酸のナトリウムおよびカルシウム塩、アカシア、ゼラチン、アルギン酸ナトリウム、ポリビニルピロリジン、および／またはポリビニルアルコールと混和され、そして慣用の投与用に錠剤化またはカプセル化されてもよい。別法として、本発明の化合物を生理食ブライン、水、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、エタノール、トウモロコシ油、ピーナッツ油、綿実油、ごま油、トラガカントガム、および／または種々の緩衝液に溶解してもよい。他の補助剤および投与方式は医薬業界でよく知られている。このキャリアまたは希釈剤は、時間遅延材料、例えば単独あるいはワックスと一緒のグリセリルモノステアレートまたはグリセリルジステアレート、または当分野でよく知られた他の材料を含んでもよい。

【０３９４】

この医薬組成物は、固体の形（顆粒、粉末または座薬を含む）あるいは液体の形（例えば、溶液、懸濁液、または乳化液）で構成されてもよい。この医薬組成物は殺菌などの慣用の医薬的な操作にかけられてもよく、かつ／または慣用の補助剤、例えば保存剤、安定剤、湿潤剤、乳化剤、緩衝液などを含有してもよい。

【０３９５】

経口投与用の固体剤形は、カプセル、錠剤、ピル、粉末、および顆粒を含んでもよい。このような固体剤形においては、この活性化合物は、少なくとも１つの不活性の希釈剤、例えばスクロース、ラクトース、またはでん粉と混和されてもよい。このような剤形は、また、通常の実施におけるように、不活性希釈剤以外の更なる物質、例えばステアリン酸

マグネシウムなどの潤滑剤も含んでもよい。カプセル、錠剤、およびピルの場合には、この剤形は、また、緩衝剤も含んでもよい。加えて、錠剤およびピルは腸溶性コーティング付きで製造可能である。

【０３９６】

経口投与用の液体剤形は、当分野で普通に使用される不活性希釈剤、例えば水を含有する医薬的に許容できる乳化液、溶液、懸濁液、シロップ、およびエリクシールを含んでもよい。このような組成物は、また、補助剤、例えば湿潤剤、甘味剤、風味剤および芳香剤も含んでもよい。

【０３９７】

本発明の化合物は１つ以上の不斉炭素原子を保有することができ、したがって光学異性体の形、並びにこれらのラセミあるいは非ラセミ混合物の形で存在することが可能である。慣用の方法によるこのラセミ混合物の分割により、例えば光学活性な酸または塩基により処理することによるジアステレオマー塩の形成により、この光学異性体を得ることができる。適切な酸の例は、酒石酸、ジアセチル酒石酸、ジベンゾイル酒石酸、ジトルオイル酒石酸、およびカンファースルホン酸であり、次にジアステレオマーの混合物を結晶化により分離し、続いてこれらの塩から光学活性塩基を遊離させる。光学異性体を分離する異なる方法は、このエナンチオマーの分離を最大とするのに最適に選択されるキラルクロマトグラフィカラムの使用を伴う。なお別の使用可能な方法は、本発明の化合物と光学的に純粋な酸とを活性化された形または光学的に純粋なイソシアネートで反応させることによる共有結合のジアステレオアイソマー分子の合成を伴う。この合成されたジアステレオアイソマーは、慣用の手段、例えばクロマトグラフィ、蒸留、結晶化または昇華により分離し、次に加水分解して、エナンチオマー的に純粋な化合物を生成可能である。同様に、活性な出発材料を使用することにより、本発明の光学活性化合物を得ることができる。これらの異性体は遊離酸、遊離塩基、エステルまたは塩の形であってもよい。

【０３９８】

同様に、本発明の化合物は異性体、すなわち同一の分子式であるが、原子が相互に異なる配置である化合物として存在してもよい。特に、本発明の化合物のアルキレン置換基は、通常、そして好ましくはこれらの基の各々に対する定義中に示すように分子の中に配置、挿入され、左から右に読む。しかしながら、ある場合には、当業者ならば、これらの置換基が分子中で他の原子に対して向きが逆転している本発明の化合物を製造することが可能であることを認識する。すなわち、挿入対象の置換基は分子の中に逆の配置で挿入されていることを除いて上記に述べたものと同一であってもよい。当業者ならば、本発明の化合物のこれらの異性体の形は本発明の範囲内に含まれるとみなされるべきであることを認識する。

【０３９９】

本発明の化合物は無機あるいは有機酸から誘導される塩の形で使用可能である。この塩は、限定するものではないが次のものを含む：アセテート、アジペート、アルギネート、シトレート、アスパルテート、ベンゾエート、ベンゼンスルホネート、バイサルフェート、ブチレート、カンファーエート、カンファースルホネート、ジグルコネート、シクロペンタンプロピオネート、ドデシルサルフェート、エタンスルホネート、グルコヘプタノエート、グリセロホスフェート、ヘミサルフェート、ヘプタノエート、ヘキサノエート、フマレート、塩酸塩、ヒドロブロミド、ヒドロヨーディド、２－ヒドロキシエタンスルホネート、ラクテート、マレエート、メタンスルホネート、ニコチネート、２－ナフタレンスルホネート、オキサレート、パルモエート、ペクチネート、ペルサルフェート、２－フェニルプロピオネート、ピクレート、ピバレート、プロピオネート、スクシネート、タートレート、チオシアネート、トシレート、メシレート、およびウンデカノエート。また、この塩基性窒素含有基は、低級アルキルハライド、例えばメチル、エチル、プロピル、およびブチルクロリド、ブロミドおよびヨーディド；ジメチル、ジエチル、ジブチル、およびジアミルサルフェートのようなジアルキルサルフェート、長鎖ハライド、例えばデシル、ラウリル、ミリスチルおよびステアリルクロリド、ブロミドおよびヨーディド、ベンジル

およびフェネチルブロミドのようなアラルキルハライド、およびその他などの試剤により四級化可能である。水あるいは油の溶解性あるいは分散性の生成物がそれにより得られる。

【０４００】

医薬的に許容できる酸付加塩を形成するのに使用可能な酸の例は、無機酸、例えば塩酸、硫酸およびリン酸および有機酸、例えばシュウ酸、マレイン酸、コハク酸およびクエン酸を含む。他の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属、例えばナトリウム、カリウム、カルシウムまたはマグネシウムとの塩、または有機塩基との塩を含む。

【０４０１】

また、本発明の範囲の中に本発明の化合物の代謝的に易動性のエステルまたはプロドラッグ形を含むカルボン酸またはヒドロキシル含有基の医薬的に許容できるエステルも含まれる。代謝的に易動性のエステルは、例えば血液レベルの増加を生じ、そしてこの化合物の対応する非エステル化形の効能を引き延ばし得るものである。プロドラッグ形は、投与したままではこの分子の活性な形にないが、あるインビボ活性または代謝、例えば酵素による、あるいは加水分解による解裂などの生体変化の後治療的に活性となるものである。エステルを含むプロドラッグの一般的な議論については、Ｓｖｅｎｓｓｏｎ ａｎｄ Ｔｕｎｅｋ Ｄｒｕｇ Ｍｅｔａｂｏｌｉｓｍ Ｒｅｖｉｅｗｓ １６５（１９８８） ａｎｄ Ｂｕｎｄｇａａｒｄ Ｄｅｓｉｇｎ ｏｆ Ｐｒｏｄｒｕｇｓ，Ｅｌｓｅｖｉｅｒ（１９８５）を参照のこと。マスクされたカルボキシレートアニオンの例は、種々のエステル、例えばアルキル（例えば、メチル、エチル）、シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）、アラルキル（例えば、ベンジル、ｐ－メトキシベンジル）、およびアルキルカルボニルオキシアルキル（例えば、ピバロイルオキシメチル）を含む。アミンはアリールカルボニルオキシメチル置換の誘導体としてマスクされてきており、これはエステラーゼによりインビボで解裂され、遊離の薬剤とホルムアルデヒドを放出する（Ｂｕｎｇａａｒｄ Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．２５０３（１９８９））。また、酸性ＮＨ基、例えばイミダゾール、イミド、インドールなどを含有する薬剤もＮ－アシルオキシメチル基によりマスクされてきた（Ｂｕｎｄｇａａｒｄ Ｄｅｓｉｇｎ ｏｆ Ｐｒｏｄｒｕｇｓ，Ｅｌｓｅｖｉｅｒ（１９８５））。ヒドロキシ基はエステルとエーテルとしてマスクされてきた。ＥＰ０３９，０５１（Ｓｌｏａｎ ａｎｄ Ｌｉｔｔｌｅ、４／１１／８１）は、マンニヒ－塩基ヒドロキサム酸プロドラッグ、これらの製造および使用を開示している。本発明の化合物のエステルは、例えば、このメチル、エチル、プロピル、およびブチルエステル、並びに酸性部分とヒドロキシル含有部分の間で形成される他の好適なエステルを含み得る。代謝的に易動性のエステルは、例えばメトキシメチル、エトキシメチル、イソ－プロポキシメチル、α－メトキシエチル基、例えばα－（（C_1－C_4）アルキルオキシ）エチル、例えば、メトキシエチル、エトキシエチル、プロポキシエチル、イソ－プロポキシエチルなど；２－オキソ－１，３－ジオキソレン－４－イルメチル基、例えば５－メチル－２－オキソ－１，３，ジオキソレン－４－イルメチルなど；C_1－C_3アルキルチオメチル基、例えばメチルチオメチル、エチルチオメチル、イソプロピルチオメチルなど；アシルオキシメチル基、例えばピバロイルオキシメチル、α－アセトキシメチルなど；エトキシカルボニル－１－メチル；またはα－アシルオキシ－α－置換メチル基、例えばα－アセトキシエチルを含み得る。

【０４０２】

更には、本発明の化合物は結晶性固体として存在することができ、普通の溶媒、例えばエタノール、Ｎ，Ｎ－ジメチル－ホルムアミド、水などから結晶化可能である。本発明の化合物の結晶形は、多形、親化合物の溶媒和物および／または水和物またはこれらの医薬的に許容できる塩として存在し得る。同様に、このような形はすべて本発明の範囲内に入るとみなされる。

【０４０３】

本発明の化合物を単独の活性な医薬剤として投与することができるが、これらは、本発明の１つ以上の化合物または他の薬剤と組み合わせても使用可能である。組み合わせ物と

して投与する場合には、この治療剤は同一の時間または異なる時間に与えられる別々の組成物として製剤可能であるか、あるいはこの治療剤は単一の組成物として投与可能である。

【０４０４】

以上説明した内容は本発明を単に例示するものであり、そして本発明を開示された化合物に限定することを意図するものではない。当業者に明白である変形および変更は、添付の請求の範囲に定義されている本発明の範囲および本質内にあることを意図されている。

【０４０５】

以上説明した記述から、当業者ならば本発明の本質的な特徴を容易に確かめることができ、そして本発明の精神および範囲から逸脱することなく、本発明の種々の変更および改変を行って、本発明を種々の使用および条件に合わせることができる。

【手続補正書】

【提出日】平成15年11月17日(2003.11.17)

【手続補正１】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

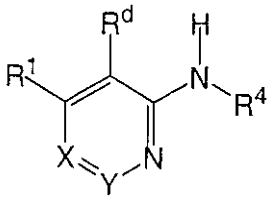
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項１】

式

【化１】



を有する化合物またはこれらの任意の医薬的に許容できる塩であって：

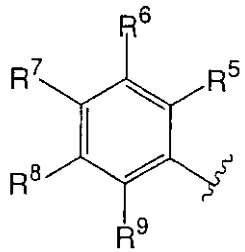
Ｘは＝Ｎ－または＝Ｃ（Ｒ^{2}）－であり；

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

ｎは独立に、各場合において、０、１または２であり、

Ｒ^{1}は

【化２】



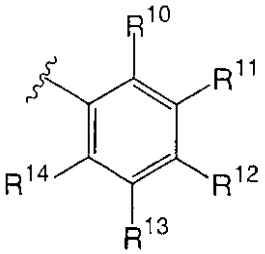
であるか；

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

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

Ｒ^{2}は、独立に、各場合においては、Ｒ^{10}、Ｒ^{10}から選択される０、１または２個の置換基により置換されるＣ$_{1-8}$アルキル、Ｒ^{10}から独立に選択される０、１、２ま

たは３個の置換基により置換される－（ＣＨ$_2$）$_n$フェニル、または
　Ｎ、ＯおよびＳから独立に選択される１、２または３個のヘテロ原子を含有する飽和あるいは不飽和の５または６員のヘテロ環であって、前記環構成員の２個以下がＯまたはＳであり、前記ヘテロ環がフェニル環と場合によっては縮合し、且つ前記ヘテロ環または縮合フェニル環がＲ^{10}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換されているものであり；
　Ｒ^{3}は、独立に、各場合においては、Ｈ、ハロ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＣ$_{1-3}$アルキル、－Ｎ（Ｃ$_{1-3}$アルキル）Ｃ$_{1-3}$アルキル、またはＣ$_{1-3}$アルキルであり；Ｘが＝Ｃ（Ｒ^2）－であり、且つＹが＝Ｃ（Ｒ^3）－である場合には、Ｒ^{2}およびＲ^{3}の少なくとも１つはＨ以外であり；
　Ｒ^{4}は
【化３】



であるか；あるいは
　Ｒ^{4}がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接して縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がＲ^e、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－ＯＲ^f、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$Ｒ^e、－ＯＣ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－ＯＣ$_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^e、－ＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^e、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}および－ＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；且つ不飽和炭素原子は＝Ｏにより更に置換されてもよく；且つ前記ヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がＨ、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＯＲ^f、Ｒ^e、－Ｃ$_{1-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^e、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^f、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ$_{1-3}$アルキルＮＲ^{a}Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{c}または－Ｃ$_{1-3}$アルキルＲ^{c}により置換されるものであるか；あるいは
　Ｒ^{4}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、－Ｓ（＝Ｏ）$_n$Ｒ^e、－ＯＣ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－ＯＣ$_{1-6}$アルキルＣ（＝Ｏ）ＯＲ^e、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^e、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^e、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{e}および－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}から独立に選択される１、２または３個の置換基により置換されるナフチルであるが；どの場合にもＲ^{4}は３，５－ジトリフルオロメチルフェニルまたは３－トリフルオロメチル－４－フルオロフェニル、－フェニル－（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－フェニル－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$アルキル）、－フェニル－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}または－フェニル－Ｎ（Ｒ^a）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）ではないものであり；
　Ｒ^{5}は独立に、各場合において、Ｒ^f、Ｒ^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－ＯＲ^e、－ＯＲ^g、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f、－ＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{a}Ｒ^g、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^f、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^f

、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－OC（＝O）NR^eR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、または３個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいは

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

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

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

R^7は独立に、各場合において、H、非環状C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-6}アルキル、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－S（C_{1-6}アルキル）であるか；あるいは

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

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

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

R^9は独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）NR^aR^f、－C（＝O）NR^aR^g、－NR^fC（＝O）R^e、－NR^fC（＝O）R^g、－NR^fC（＝O）NR^aR^f、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－S（＝O）$_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－OC（＝O）NR^aR^f、R^{10}から独立に選択される０、１、２、または３個の置換基により置換されるフェニル環であるか；あるいは

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

R^9は単一の窒素原子を含有する飽和あるいは不飽和の４または５員のヘテロ環であっ

て、前記環がハロ、C_{1-2}ハロアルキルおよびC_{1-3}アルキルから独立に選択される０、１または２個の置換基により置換され；R^5、R^6、R^7、R^8およびR^9の少なくとも１つがC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^a、－C_{1-8}アルキルOR^a、－C_{1-6}アルキルNR^aR^aまたは－Ｓ（C_{1-6}アルキル）であり；

R^{10}は独立に、各場合において、Ｈ、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択されるか；あるいは

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

$R^a R^a$、－$NR^a C_{2-6}$アルキル$NR^a R^a$および$NR^a C_{2-6}$アルキルOR^aから選択される０、１、２または３個の基により置換されるC_{1-4}アルキルであり；

R^{11}は独立に、各場合において、H、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）$NR^a R^a$、－C（＝NR^a）$NR^a R^a$、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）$NR^a R^a$、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキル$NR^a R^a$、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$$NR^a R^a$、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）$NR^a R^a$、－$NR^a R^a$、－N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）$NR^a R^a$、－N（$R^a$）C（＝$NR^a$）$NR^a R^a$、－N（$R^a$）S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）S（＝O）$_2$$NR^a R^a$、－$NR^a C_{2-6}$アルキル$NR^a R^a$および－$NR^a C_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択されるか；あるいは

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

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

R^{10}およびR^{11}は一緒になってOおよびS原子の組み合わせが２以下である限り、N、OおよびSから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素であ

る飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋であって、前記架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、$-OR^f$、－ＯＣ（＝Ｏ）R^e、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^f、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、$-SR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、$-NR^aR^f$、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）R^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）OR^e、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^f、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2R^e$、－Ｎ（R^f）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^f$、$-NR^fC_{2-6}$アルキルNR^aR^fおよび$-NR^fC_{2-6}$アルキルOR^fから選択される０、１または２個の置換基により置換されているものであり；

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

R^{12}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６または７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０または１１員の二環式の環であって、前記環が０または１個のベンゾ基並びにＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する０または１個の飽和あるいは不飽和の５、６または７員のヘテロ環と縮合し；前記環の炭素原子が０、１または２個のオキソ基により置換された、前記環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、$-OR^a$、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、$-SR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、$-NR^aR^a$、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキルNR^aR^aおよび$-NR^aC_{2-6}$アルキルOR^aから選択される０、１、２または３個の基により置換されているか；あるいは

R^{12}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（C_{1-8}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）NR^aR^a、－Ｃ（＝NR^a）NR^aR^a、$-OR^a$、－ＯＣ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）NR^aR^a、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^a）Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、$-SR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_2NR^aR^a$、－Ｓ（＝Ｏ）$_2$Ｎ

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

R^{13}は独立に、各場合において、H、C_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）N$R^a$$R^a$、－C（＝NR^a）N$R^a$$R^a$、－O$R^a$、－OC（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）N$R^a$$R^a$、－OC（＝O）N（$R^a$）S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－O$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^a$、－O$C_{2-6}$アルキルO$R^a$、－S$R^a$、－S（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2NR^a$$R^a$、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）N$R^a$$R^a$、－N$R^a$$R^a$、－N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）C（＝O）N$R^a$$R^a$、－N（$R^a$）C（＝NR^a）N$R^a$$R^a$、－N（$R^a$）S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）S（＝O）$_2NR^a$$R^a$、－N$R^a$$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^a$および－N$R^a$$C_{2-6}$アルキルO$R^a$から選択されるか；あるいは

R^{13}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６または７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０または１１員の二環式の環であって、前記環が０または１個のベンゾ基並びにＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する０または１個の飽和あるいは不飽和の５、６または７員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が０、１または２個のオキソ基により置換され、前記環がC_{1-8}アルキル、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）N$R^a$$R^a$、－C（＝NR^a）N$R^a$$R^a$、－O$R^a$、－OC（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－OC（＝O）N$R^a$$R^a$、－OC（＝O）N（$R^a$）S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－O$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^a$、－O$C_{2-6}$アルキルO$R^a$、－S$R^a$、－S（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2NR^a$$R^a$、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）O（$C_{1-8}$アルキル）、－S（＝O）$_2$N（$R^a$）C（＝O）N$R^a$$R^a$、－N$R^a$$R^a$、－N（$R^a$）C（＝O）（$C_{1-8}$アルキル）、－N（$R^a$）

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

Ｒ^{13}はＣ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されているＣ$_{1-4}$アルキルであり；

Ｒ^{14}は独立に、各場合において、Ｈ、Ｃ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択されるか；あるいは

Ｒ^{14}はＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５、６または７員の単環式あるいは６、７、８、９、１０または１１員の二環式の環であって、前記環が０または１個のベンゾ基並びにＮ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する０または１個の飽和あるいは不飽和の５、６または７員のヘテロ環と縮合し、前記環の炭素原子が０、１または２個のオキソ基により置換され、前記環がＣ$_{1-8}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＲ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}、－ＳＲ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）Ｏ（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$（Ｃ$_{1-8}$アルキル）、－Ｎ（Ｒ^{a}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{a}、－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{a}および－ＮＲ^{a}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{a}から選択される０、１、２または３個の基により置換されているか；あるいは

R^{14}はC_{1-4}ハロアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、－C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－C（＝O）NR^aR^a、－C（＝NR^a）NR^aR^a、－OR^a、－OC（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－OC（＝O）NR^aR^a、－OC（＝O）N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^a、－OC_{2-6}アルキルOR^a、－SR^a、－S（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2NR^aR^a$、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－S（＝O）$_2$N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－NR^aR^a、－N（R^a）C（＝O）（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）O（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）C（＝O）NR^aR^a、－N（R^a）C（＝NR^a）NR^aR^a、－N（R^a）S（＝O）$_2$（C_{1-8}アルキル）、－N（R^a）S（＝O）$_2NR^aR^a$、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^aおよび－NR^aC_{2-6}アルキルOR^aから選択される０、１、２または３個の基により置換されているC_{1-4}アルキルであり；ここで、R^{10}、R^{11}、R^{12}、R^{13}およびR^{14}の少なくとも１つはH以外であり；

R^aは独立に、各場合において、H、フェニル、ベンジルまたはC_{1-6}アルキルであり；

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

ヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］オキサジアゾール、２，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、４，５－ジヒドロ－［１，２，４］チアジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］オキサジアゾール、２，３－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール、［１，４，２］オキサチアゾール、［１，３，４］オキサチアゾール、１，３，５－トリアザペルヒドロイン、１，２，４－トリアザペルヒドロイン、１，４，２－ジチアザペルヒドロイン、１，４，２－ジオキサアザペルヒドロイン、１，３，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，２，５－オキサジアザペルヒドロイン、１，３，４－チアジアザペルヒドロイン、１，３，５－チアジアザペルヒドロイン、１，２，５－チアジアザペルヒドロイン、１，３，４－オキサジアザペルヒドロイン、１，４，３－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，２－オキサチアザペルヒドロイン、１，４，５，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリダジン、１，２，３，６－テトラヒドロピリダジン、１，２，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン、１，４，５，６－テトラヒドロピリミジン、１，２，３，６－テトラヒドロピラジン、１，２，３，４－テトラヒドロピラジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２］チアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］オキサジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］オキサジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３］チアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，４］チアジン、１，２，３，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，２，３，４－テトラヒドロ－［１，３，５］トリアジン、２，３，４，５－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、１，４，５，６－テトラヒドロ－［１，２，４］トリアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］ジチアジン、２，３－ジヒドロ－［１，４，２］ジオキサジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，３，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］オキサジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］オキサジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］オキサジアジン、５，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，３］チアジアジン、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－４Ｈ－［１，３，４］チアジアジン、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－［１，２，５］チアジアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，３］オキサチアジン、５，６－ジヒドロ－［１，４，２］オキサチアジン、２，３－ジヒドロ

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

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

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

R^dは水素または$-CH_3$であり；

R^eは独立に、各場合においては、ハロ、シアノ、ニトロ、$-C(=O)R^b$、$-C(=O)OR^b$、$-C(=O)NR^aR^a$、$-C(=NR^a)NR^aR^a$、$-OR^a$、$-OC(=O)R^b$、$-OC(=O)NR^aR^a$、$-OC(=O)N(R^a)S(=O)_2R^b$、$-OC_{2-6}$アルキルNR^aR^a、$-OC_{2-6}$アルキルOR^a、$-SR^a$、$-S(=O)R^b$、$-S(=O)_2R^b$、$-S(=O)_2NR^aR^a$、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)R^b$、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)OR^b$、$-S(=O)_2N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=O)R^b$、$-N(R^a)C(=O)OR^b$、$-N(R^a)C(=O)NR^aR^a$、$-N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$、$-N(R^a)S(=O)_2R^b$、$-N(R^a)S(=O)_2NR^aR^a$、$-NR^aC_{2-6}$アルキル$NR^aR^a$および$-NR^aC_{2-6}$アルキル$OR^a$から選択される

０、１、２、３または４個の置換基により置換されるＣ$_{1-9}$アルキルであって；且つ前記Ｃ$_{1-9}$アルキルはＲ^{g}から独立に選択される０または１個の基により更に置換されているものであり；

Ｒ^{f}は独立に、各場合においては、Ｒ^{e}またはＨであり；

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

【請求項２】

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

【請求項３】

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

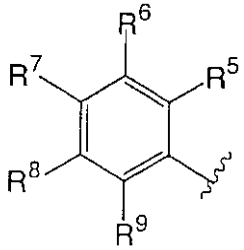
【請求項４】

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

【請求項５】

Ｒ^{1}が

【化４】



である、請求項１に記載の化合物。

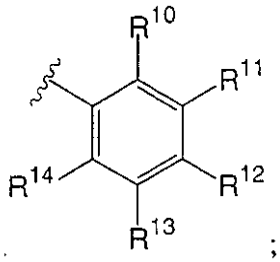
【請求項６】

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

【請求項７】

Ｒ^{4}が

【化５】



；

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

【請求項８】

Ｒ^{4}がＯ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環であって、ＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される０、１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３または４個の原子の架橋と場合によっては隣接し

て縮合し、前記ヘテロ環および架橋の炭素原子がR^e、C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、オキソ、－OR^f、－$S(=O)_nR^e$、－OC_{1-4}ハロアルキル、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－OC_{1-6}アルキル$C(=O)OR^e$、－NR^aR^f、－NR^aC_{1-4}ハロアルキル、－NR^aC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^aC_{2-6}アルキルOR^f、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)OR^e$、－$OC(=O)R^e$、－$C(=O)NR^aR^f$および－$NR^aC(=O)R^e$から独立に選択される０、１、２または３個の置換基により置換され；且つ不飽和炭素原子が＝Ｏにより更に置換されてもよく；且つ前記ヘテロ環および架橋中の任意の使用可能な窒素原子がＨ、－C_{1-6}アルキルOR^f、R^e、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－C_{1-3}アルキル$C(=O)OR^e$、－C_{1-3}アルキル$C(=O)NR^aR^f$、－C_{1-3}アルキル$OC(=O)R^e$、－C_{1-3}アルキル$NR^aC(=O)R^e$、－$C(=O)R^c$または－C_{1-3}アルキルR^cにより置換されるものである、請求項１に記載の化合物。

【請求項９】

R^5が独立に、各場合において、R^f、R^g、ハロ、ニトロ、シアノ、－OR^e、－OR^g、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－NR^aR^f、－NR^aR^g、－NR^fC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－NR^fC_{2-6}アルキルOR^f、ナフチル、－CO_2R^e、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)NR^aR^f$、－$C(=O)NR^aR^g$、－$NR^fC(=O)R^e$、－$NR^fC(=O)R^g$、－$NR^fC(=O)NR^aR^f$、－$NR^fCO_2R^e$、－C_{1-8}アルキルOR^f、－C_{1-6}アルキルNR^aR^f、－$S(=O)_nR^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^aS(=O)_2R^e$、－$OC(=O)NR^aR^f$、R^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換されるフェニル環であり；あるいはR^5がR^{10}から独立に選択される０、１、２、あるいは３個の置換基により置換され、Ｏ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有する飽和あるいは不飽和の５あるいは６員のヘテロ環である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１０】

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

【請求項１１】

R^{10}およびR^{11}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｎ、ＯおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、前記架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)OR^e$、－$C(=O)NR^aR^f$、－$C(=NR^a)NR^aR^f$、－OR^f、－$OC(=O)R^e$、－$OC(=O)NR^aR^f$、－$OC(=O)N(R^f)S(=O)_2R^e$、－OC_{2-6}アルキルNR^aR^f、－OC_{2-6}アルキルOR^f、－SR^f、－$S(=O)R^e$、－$S(=O)_2R^e$、－$S(=O)_2NR^aR^f$、－$S(=O)_2N(R^f)C(=O)R^e$、－$S(=O)_2N(R^f)C(=O)OR^e$、－$S(=O)_2N(R^f)C(=O)NR^aR^f$、－$NR^aR^f$、－$N(R^f)C(=O)R^e$、－$N(R^f)C(=O)OR^e$、－$N(R^f)C(=O)NR^aR^f$、－$N(R^f)C(=NR^a)NR^aR^f$、－$N(R^f)S(=O)_2R^e$、－$N(R^f)S(=O)_2NR^aR^f$、－$NR^fC_{2-6}$アルキル$NR^aR^f$および－$NR^fC_{2-6}$アルキル$OR^f$から選択される０、１または２個の置換基により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１２】

R^{10}およびR^{11}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、前記架橋が＝Ｏ、R^e、ハロ、シアノ、ニトロ、－$C(=O)R^e$、－$C(=O)OR^e$、－$C(=O)NR^aR^f$、－$C(=NR^a)NR^aR^f$、－OR^f、－$OC(=O)R^e$、－$OC(=O)NR^aR^f$、－

ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}、－ＳＲ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}および－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}から選択される０、１または２個の置換基により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１３】

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

【請求項１４】

Ｒ^{11}およびＲ^{12}が一緒になってＯおよびＳ原子の組み合わせが２以下である限り、Ｏ、ＮおよびＳから選択される１、２または３個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３あるいは４個の原子の架橋であって、前記架橋が＝Ｏ、Ｒ^{e}、ハロ、シアノ、ニトロ、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＲ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－ＯＣ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＯＣ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}、－ＳＲ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＯＲ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝Ｏ）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｃ（＝ＮＲ^{a}）ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$Ｒ^{e}、－Ｎ（Ｒ^{f}）Ｓ（＝Ｏ）$_{2}$ＮＲ^{a}Ｒ^{f}、－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＮＲ^{a}Ｒ^{f}および－ＮＲ^{f}Ｃ$_{2-6}$アルキルＯＲ^{f}から選択される０、１または２個の置換基により置換されているものであり；ここで、Ｒ^{3}がＮＨ$_{2}$である場合には、－Ｒ^{11}－Ｒ^{12}は－Ｃ＝Ｃ－Ｃ＝Ｎ－またはこれらのいかなる置換物でもない、請求項１に記載の化合物。

【請求項１５】

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

（R^f）C（＝O）R^e、－N（R^f）C（＝O）OR^e、－N（R^f）C（＝O）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）C（＝N$R^a$）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2$$R^e$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2NR^a$$R^f$、－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^f$および－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルO$R^f$から選択される０、１または２個の置換基により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１６】

R^{11}およびR^{12}が一緒になってＮ、ＯおよびＳから選択される１または２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、前記架橋がR^e、－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）N$R^a$$R^f$、－C（＝N$R^a$）N$R^a$$R^f$、－O$R^f$、－OC（＝O）$R^e$、－OC（＝O）N$R^a$$R^f$、－OC（＝O）N（$R^f$）S（＝O）$_2$$R^e$、－O$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^f$、－O$C_{2-6}$アルキルO$R^f$、－S$R^f$、－S（＝O）$R^e$、－S（＝O）$_2$$R^e$、－S（＝O）$_2NR^a$$R^f$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）$R^e$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）O$R^e$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）N$R^a$$R^f$、－N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）C（＝O）$R^e$、－N（$R^f$）C（＝O）O$R^e$、－N（$R^f$）C（＝O）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）C（＝N$R^a$）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2$$R^e$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2NR^a$$R^f$、－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^f$または－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルO$R^f$により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１７】

R^{11}およびR^{12}が一緒になってＯ、ＮおよびＳから選択される１または２個の原子を含有し、残りの原子が炭素である飽和あるいは不飽和の３個の原子の架橋であって、前記架橋が－C（＝O）R^e、－C（＝O）OR^e、－C（＝O）N$R^a$$R^f$、－C（＝N$R^a$）N$R^a$$R^f$、－OC（＝O）N$R^a$$R^f$、－OC（＝O）N（$R^f$）S（＝O）$_2$$R^e$、－O$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^f$、－O$C_{2-6}$アルキルO$R^f$、－S$R^f$、－S（＝O）$R^e$、－S（＝O）$_2$$R^e$、－S（＝O）$_2NR^a$$R^f$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）$R^e$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）O$R^e$、－S（＝O）$_2$N（$R^f$）C（＝O）N$R^a$$R^f$、－N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）C（＝O）$R^e$、－N（$R^f$）C（＝O）O$R^e$、－N（$R^f$）C（＝O）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）C（＝N$R^f$）N$R^a$$R^f$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2$$R^e$、－N（$R^f$）S（＝O）$_2NR^a$$R^f$、－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルN$R^a$$R^f$または－N$R^f$$C_{2-6}$アルキルO$R^f$により置換されている、請求項１に記載の化合物。

【請求項１８】

（１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インダゾール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－５－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－６－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

（１Ｈ－インドール－７－イル）－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イル）アミン；

（１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－４－イル）－［６－（４－トリフルオロメチル）フェニル］ピリミジン－４－イル］アミン；

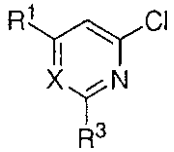
（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）－（６－フェニルピリミジン－４－イル）アミン；

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

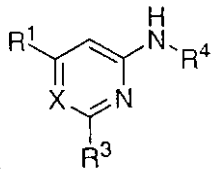
［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（２－アミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－６－イルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－クロロピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）－２－メチルピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－４－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－５－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（１Ｈ－インドール－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－（３－メトキシフェニル）アミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ナフタレン－１－イルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］フェニルアミン；
［６－（４－ｔ－ブチルフェニルピリミジン－４－イル）キノリン－３－イルアミン；
｛１’－アセチルスピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
｛７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－インドール－２－イル｝メタノール；
｛スピロ［シクロプロパン－１，３’－インドリン－６’－イル］｝－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
１－｛３，３－ジメチル－６－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－２，３－ジヒドロインドール－１－イル｝エタノン；
２－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－８－オール；
２－｛５－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ピリジン－２－イルオキシ｝エタノール；
３，４－ジヒドロ－７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－キノリン－２－オン；
４－メチル－７－｛［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミノ｝キノリン－２－オール，ヒドロクロリド；
６－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ナフタレン－１－オン；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］キノリン－２－オール；
７－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル］ピリミジン－４－イルアミノ］－１，３－ジヒドロインドール－２－オン；
ベンゾチアゾール－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５－（４－ｔ－ブチルフェニル）－６－フェニルピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［５，６－ビス－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；

ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－シクロヘキシルメチルアミノ－４－トリフルオロメチルフェニル）－ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（２－ナフチル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－フルオロフェニル）－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－クロロ－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－フェニル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－３－イル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
ベンゾチアゾール－６－イル－［６－ピリジン－４－イル－５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリダジン－３－イル］アミン；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル｝アセトアミド；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］ベンゾチアゾール－２－イル｝アセトアミド；
Ｎ－｛４－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イルアミノ］フェニル｝アセトアミド；
N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２，４－ジアミン；
N^4－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］ベンゾチアゾール－２，４－ジアミン；
N^4－ベンゾチアゾール－６－イル－６－（４－ｔ－ブチルフェニル）ピリミジン－２，４－ジアミン塩酸塩；
N^7－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，７－ジアミン；
N^8－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］キノリン－２，８－ジアミン；
ナフタレン－１－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ナフタレン－２－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｏ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
フェニル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
ｐ－トリル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－３－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－５－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；
キノリン－６－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；

キノリン－８－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン；および
キノリル－７－イル－［６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピリミジン－４－イル］アミン
から選択される、請求項１に記載の化合物。
【請求項１９】
請求項１、２または３のいずれか一項に記載の化合物および医薬的に許容できる希釈剤あるいはキャリアを含む医薬組成物。
【請求項２０】
請求項１から１８のいずれか一項に記載の化合物の医薬としての使用。
【請求項２１】
急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、一般的な炎症、関節炎、リューマチ性疾患、変形性関節炎、炎症性腸障害、炎症性眼障害、炎症性あるいは不安定性の膀胱障害、乾癬、炎症性成分を含む皮膚愁訴、慢性炎症性状態、炎症性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、交感神経性持続性痛み、求心路遮断症候群、喘息、上皮性組織損傷あるいは機能障害、単純ヘルペス、呼吸、尿生殖器、胃腸あるいは血管性の領域における内臓運動性障害、創傷、火傷、アレルギー性皮膚反応、そう痒症、白斑、一般的な胃腸障害、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、下痢、壊死性剤により誘起される胃病変、毛髪成長、血管運動性あるいはアレルギー性鼻炎、気管支障害または膀胱障害を治療するための医薬の製造における、請求項１から１８のいずれか一項に記載の化合物の使用。
【請求項２２】
急性、炎症性および神経因性の痛み、歯痛、一般的な頭痛、片頭痛、群発性頭痛、混合血管性および非血管性症候群、緊張性頭痛、神経因性の痛みおよび関連の痛覚過敏および異痛症、糖尿病性神経障害痛み、灼熱痛、並びに交感神経性持続性痛みを治療するための医薬の製造における、請求項１から１８のいずれか一項に記載の化合物の使用。
【請求項２３】
急性、炎症性および神経因性の痛みを治療するための医薬の製造における、請求項１から１８のいずれか一項に記載の化合物の使用。
【請求項２４】
【化６】



とR^4NH_2とを反応させて、
【化７】



を形成する工程を含む、請求項１に記載の化合物を製造する方法。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/US 03/16655

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A61K31/501 A61K31/506 A61P25/00 C07D417/12 C07D405/12
C07D403/12 C07D401/12 C07D239/42 C07D471/04 C07D417/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A61K A61P

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02 36586 A (ASTRAZENECA AB ;KEMP LUCIUS (US); MCCAULEY JOHN (US); HOSTETLER GR) 10 May 2002 (2002-05-10) examples, e.g. 102 page 9, line 3 - line 8; claims 1,3,4 ---	1-9
X	US 3 707 560 A (ANGELIS GERALD GEORGE DE ET AL) 26 December 1972 (1972-12-26) col. 6, l. 35-50 column 16, line 50 -column 24, line 65; claim 1 ---	1-6,9
P,X	EP 1 300 399 A (KOWA CO) 9 April 2003 (2003-04-09) claims 1,8,9,11; examples 42,44	1-6,9
X	& WO 02 004427 A 17 January 2002 (2002-01-17) ---	
	-/--	

[X] Further documents are listed in the continuation of box C.

[X] Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
3 September 2003	18/09/2003

Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31–70) 340–3016	Johnson, C

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/US 03/16655

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication,where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2 691 655 A (BYROM RUSSELL PETER ET AL) 12 October 1954 (1954-10-12) column 1, line 12 - line 23; examples 7-9,16,20	1-5,9
X	HAJDUK, P.J. ET AL.: "Novel inhibitors of Erm methyltransferases from NMR and parallel synthesis" J. MED. CHEM., vol. 42, no. 19, 1999, pages 3852-3859, XP002253246 Scheme 1 examples 29,30; table 4	1-5,9
X	WO 02 12198 A (ORTHO MCNEIL PHARM INC) 14 February 2002 (2002-02-14) claims 1,58	1-5
P,X	US 2002/137755 A1 (BILODEAU MARK T ET AL) 26 September 2002 (2002-09-26) examples page 5, right-hand column, paragraph 180; claims 1,10,23	1-6

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

International Application No. PCT/US 03/16655

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

Continuation of Box I.2

Claims Nos.: 1-6 (all part)

The initial phase of the search revealed a very large number of documents relevant to the issue of novelty. So many documents were retrieved that it is impossible to determine which parts of the claim(s) may be said to define subject-matter for which protection might legitimately be sought (Article 6 PCT). The cited documents are only a representative selection of those found. For these reasons, a meaningful search over the whole breadth of the claim(s) is impossible. Consequently, a complete search has only been performed for claims 7 and 8, i.e. the specific medical use of the compounds of claim 1.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims, relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). The applicant is advised that the EPO policy when acting as an International Preliminary Examining Authority is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report or during any Chapter II procedure.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 03/16655

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

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

2. ☒ Claims Nos.: 1-6 (all part)
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
see FURTHER INFORMATION sheet PCT/ISA/210

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

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

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

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

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
PCT/US 03/16655

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 0236586	A	10-05-2002	AU	1289402 A	15-05-2002
			EP	1339706 A1	03-09-2003
			WO	0236586 A1	10-05-2002
US 3707560	A	26-12-1972	AT	315856 B	15-05-1974
			AT	316563 B	15-06-1974
			AT	317229 B	26-08-1974
			AT	314540 B	10-04-1974
			AU	465734 B2	09-10-1975
			AU	3425971 A	12-04-1973
			BE	773484 A1	05-04-1972
			CA	988519 A1	04-05-1976
			CA	978531 A2	25-11-1975
			CA	978532 A2	25-11-1975
			CH	542218 A	15-11-1973
			CH	554876 A	15-10-1974
			CH	554875 A	15-10-1974
			CH	554346 A	30-09-1974
			DE	2149249 A1	13-04-1972
			DE	2165962 A1	31-08-1972
			DK	130971 B	12-05-1975
			DK	131858 B	15-09-1975
			ES	395676 A1	16-10-1974
			ES	420209 A1	01-06-1976
			ES	420210 A1	01-06-1976
			ES	420211 A1	16-03-1976
			FI	55502 B	30-04-1979
			FI	773287 A ,B,	02-11-1977
			FR	2110227 A5	02-06-1972
			GB	1373536 A	13-11-1974
			GB	1373535 A	13-11-1974
			JP	56048511 B	16-11-1981
			JP	1121049 C	28-10-1982
			JP	56036468 A	09-04-1981
			JP	57008107 B	15-02-1982
			NL	7113670 A ,B,	07-04-1972
			SE	390304 C	24-03-1977
			SE	390304 B	13-12-1976
			SE	385885 B	26-07-1976
			SE	7410488 A	16-08-1974
			US	3859288 A	07-01-1975
			US	3908012 A	23-09-1975
			US	3895112 A	15-07-1975
			ZA	7106615 A	28-06-1972
EP 1300399	A	09-04-2003	AU	6947401 A	21-01-2002
			CA	2413042 A1	17-01-2002
			EP	1300399 A1	09-04-2003
			NO	20030097 A	09-01-2003
			WO	0204427 A1	17-01-2002
US 2691655	A	12-10-1954	NONE		
WO 0212198	A	14-02-2002	AU	8112001 A	18-02-2002
			BR	0113165 A	15-07-2003
			CA	2419030 A1	14-02-2002
			EP	1313713 A2	28-05-2003
			WO	0212198 A2	14-02-2002

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

[illegible]mation on patent family members

Internal[illegible]al Application No
PCT/US 03/16655

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0212198 A		US 2003008883 A1	09-01-2003
US 2002137755 A1	26-09-2002	AU 3244102 A	18-06-2002
		CA 2429728 A1	13-06-2002
		WO 0245652 A2	13-06-2002

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 1992)

フロントページの続き

(51)Int.Cl.[7]	FI	テーマコード（参考）
Ａ６１Ｋ 31/5377	Ａ６１Ｋ 31/5377	
Ａ６１Ｐ 1/00	Ａ６１Ｐ 1/00	
Ａ６１Ｐ 1/04	Ａ６１Ｐ 1/04	
Ａ６１Ｐ 9/00	Ａ６１Ｐ 9/00	
Ａ６１Ｐ 11/00	Ａ６１Ｐ 11/00	
Ａ６１Ｐ 11/02	Ａ６１Ｐ 11/02	
Ａ６１Ｐ 11/06	Ａ６１Ｐ 11/06	
Ａ６１Ｐ 13/00	Ａ６１Ｐ 13/00	
Ａ６１Ｐ 15/00	Ａ６１Ｐ 15/00	
Ａ６１Ｐ 17/00	Ａ６１Ｐ 17/00	
Ａ６１Ｐ 17/02	Ａ６１Ｐ 17/02	
Ａ６１Ｐ 17/06	Ａ６１Ｐ 17/06	
Ａ６１Ｐ 17/14	Ａ６１Ｐ 17/14	
Ａ６１Ｐ 19/02	Ａ６１Ｐ 19/02	
Ａ６１Ｐ 25/02	Ａ６１Ｐ 25/02 １０１	
Ａ６１Ｐ 25/04	Ａ６１Ｐ 25/04	
Ａ６１Ｐ 25/06	Ａ６１Ｐ 25/06	
Ａ６１Ｐ 27/02	Ａ６１Ｐ 27/02	
Ａ６１Ｐ 29/00	Ａ６１Ｐ 29/00	
Ａ６１Ｐ 37/08	Ａ６１Ｐ 29/00 １０１	
Ｃ０７Ｄ 401/12	Ａ６１Ｐ 37/08	
Ｃ０７Ｄ 401/14	Ｃ０７Ｄ 401/12	
Ｃ０７Ｄ 403/12	Ｃ０７Ｄ 401/14	
Ｃ０７Ｄ 405/12	Ｃ０７Ｄ 403/12	
Ｃ０７Ｄ 417/12	Ｃ０７Ｄ 405/12	
Ｃ０７Ｄ 471/04	Ｃ０７Ｄ 417/12 ＣＳＰ	
	Ｃ０７Ｄ 471/04 １１４	

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IT,LU,MC,NL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明
(72)発明者 ドハーテイー，エリザベス・エム
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３２０、ニユーベリー・パーク、マージヨリー・アベニユー・２８４
(72)発明者 シユ，ジヤワン
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３２０、サウザンド・オークス、ビア・メシータ・５０００
(72)発明者 ステツク，マーキアン
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９３０１５、フイルモア、アラスミス・レイン・９７８
(72)発明者 ノーマン，マーク・エイチ
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６０、サウザンド・オークス、ビーナス・ストリート・１３０

(72)発明者 フオツシユ，クリストフアー・エイチ
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６０、サウザンド・オークス、テインバーウツド・アベニユー・５３３
(72)発明者 チエン，ニン
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６２、サウザンド・オークス、ギリンガム・サークル・２３４２
(72)発明者 チヤクラバルテイ，パーサ・ピー
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９３０６５、シミ・バレー、ヤロー・ドライブ・５２１
(72)発明者 オグニヤノフ，バシル・アイ
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３２０、サウザンド・オークス、ウエスト・マルセロ・アベニユー・９０２
(72)発明者 ペトス，リピング・エイチ
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６０、サウザンド・オークス、ビツグ・クラウド・サークル・３３０９
(72)発明者 ワン，フイ－リン
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６０、サウザンド・オークス、リンメア・ドライブ・８２２
(72)発明者 ワン，シヤンホン
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９３０２１、ムーアパーク、カントリー・スプリングス・コート・１１６２１
(72)発明者 アラサシンガム，プレミラ
アメリカ合衆国、カリフオルニア・９１３６２、サウザンド・オークス、ライムストーン・ドライブ・２７９４

Ｆターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB09 CC61 CC62 CC82 DD06 DD10 DD12 DD14
DD22 DD26 DD31 DD42 DD62 EE01
4C065 AA04 BB09 CC01 DD02 EE02 JJ01 JJ07 KK01 LL01 LL07
PP01 PP14 QQ04
4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 BC42 BC60 BC73 BC80 BC84 CB09
GA02 GA07 GA08 GA10 GA12 MA02 MA05 NA14 ZA01 ZA08
ZA21 ZA33 ZA34 ZA36 ZA59 ZA66 ZA68 ZA81 ZA89 ZA92
ZA96 ZB11 ZB13 ZB15

【要約の続き】

