(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2017-519801
(P2017-519801A)
(43)公表日　平成29年7月20日(2017.7.20)

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
A61K 31/496	(2006.01)	A61K	31/496	4C076
A61K 47/34	(2017.01)	A61K	47/34	4C086
A61P 33/10	(2006.01)	A61P	33/10	
A61K 31/4545	(2006.01)	A61K	31/4545	

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 132 頁）

(21)出願番号　特願2017-500885(P2017-500885)
(86)(22)出願日　平成27年7月10日(2015.7.10)
(85)翻訳文提出日　平成29年3月2日(2017.3.2)
(86)国際出願番号　PCT/EP2015/065870
(87)国際公開番号　WO2016/005577
(87)国際公開日　平成28年1月14日(2016.1.14)
(31)優先権主張番号　14176737.6
(32)優先日　平成26年7月11日(2014.7.11)
(33)優先権主張国　欧州特許庁(EP)

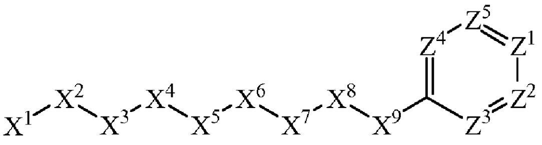
(71)出願人　510000976
インターベット　インターナショナル　ベー．　フェー．
オランダ国、５８３１・アー・エヌ・ボックスメール、ウイム・ドウ・コルベルストラート・３５
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100119253
弁理士　金山　賢教
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉　道明
(74)代理人　100129713
弁理士　重森　一輝

最終頁に続く

(54)【発明の名称】犬糸状虫に対する駆虫薬の使用

(57)【要約】
本発明は、犬糸状虫感染を治療するための薬剤として有用な化合物および塩に関するものである。本発明は、処置を必要とする動物に対して当該化合物および塩を投与することを含む治療に関するものでもある。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
犬糸状虫感染の治療に使用される、構造において下記式（Ｉ）に相当する化合物または該化合物の塩。
【化１】



(I);

［式中、

Ｘ^{1}は、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルケニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルキニル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニル、５員ヘテロアリール、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

前記Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルケニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－アルキニル、シクロペンチル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニル、および５員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く、

前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

Ｘ^{2}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－は、アルキルで置換されていても良く、

前記－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ

${}_2$－、－ＣＨ${}_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ${}_2$－、－ＣＨ${}_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）${}_2$－ＣＨ${}_2$－、および－ＣＨ${}_2$－Ｓ（Ｏ）${}_2$－は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{3}は連結基であり、

前記連結基は炭化水素であり、

前記連結基は１以上の窒素原子を含み、

前記炭化水素における炭素の１以上は、独立にハロゲン、アルキル、アルコキシ、およびオキソからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く、

前記連結基は、Ｘ^{2}をＸ^{4}に連結する３から６個の原子の少なくとも一つの鎖を含み、前記鎖原子の１から２個が窒素であり、

前記連結基は、Ｘ^{2}およびＸ^{4}を連結する３個未満の原子の鎖を含まず；

Ｘ^{4}は、結合、－ＣＨ${}_2$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）－、および－Ｓ（Ｏ）${}_2$－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ${}_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良く；

Ｘ^{5}は、結合、－ＣＨ${}_2$－、および炭素環からなる群から選択され、

前記－ＣＨ${}_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良く；

Ｘ^{6}は、結合、－ＣＨ${}_2$－、および炭素環からなる群から選択され、

前記－ＣＨ${}_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良く；

Ｘ^{7}は、－ＣＨ${}_2$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）${}_2$－、－ＮＨ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ${}_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良く、

いずれの－ＮＨ－も、置換可能な位置で、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基によって置換されていても良く、

そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

Ｘ^{8}は、ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニルまたはピロリジニルからなる群から選択され、

前記ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニルまたはピロリジニルは、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^4－Ｘ^5－Ｘ^6－Ｘ^{7}は、Ｘ^{3}からＸ^{8}を連結する３個未満の原子の鎖を含まず；

Ｘ^{9}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）${}_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－は、置換可能な位置で、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基によって置換されていても良く、

そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノスルホニル、アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アル

キルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く、

前記アミノスルホニルは、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Z^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}はそれぞれ独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される、

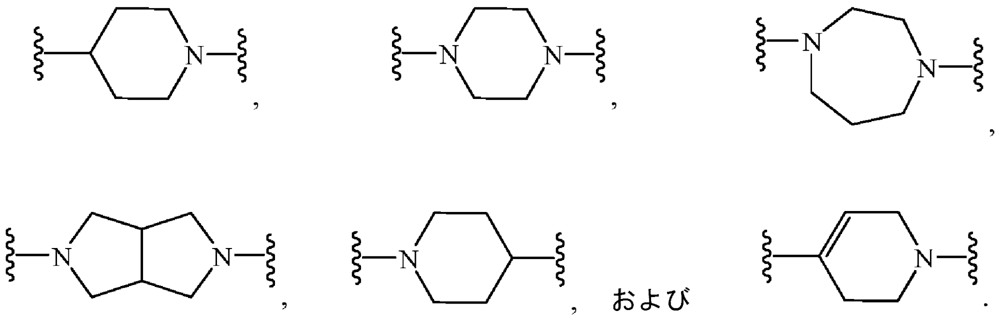
前記ＣＨは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Z^{1}、Z^{2}、Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}のうちの一つのみがＮであることができる。］

【請求項２】

X^{3}が、

【化２】

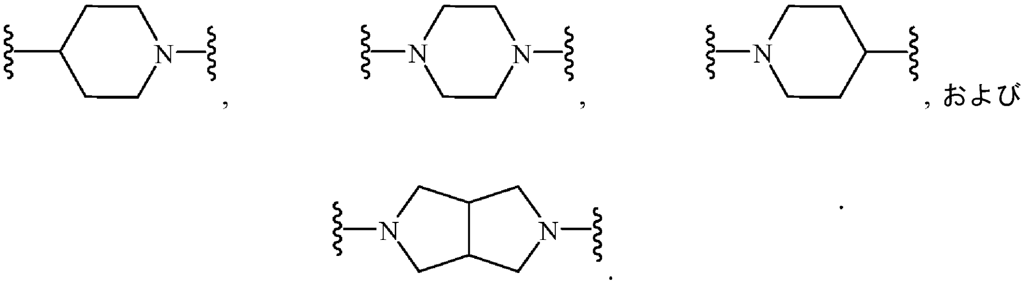


からなる連結基の群から選択される、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１に記載の化合物または該化合物の塩。

【請求項３】

X^{3}が、

【化３】



からなる連結基の群から選択される、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１に記載の化合物または該化合物の塩。

【請求項４】

X^{1}が、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよび$C_{3}-C_{6}$－アルキルからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールが、１以上のアルキルによって置換されていても良く、

前記アルキルが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールが、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリール、シアノおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、

前記アルキルおよびアルコキシが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

前記アリールアルコキシが、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；

前記フェニルが、オルト位で１個もしくは２個の独立に選択されるハロゲンによって置換されていても良く；

X^2が、結合、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；

X^4が、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－が、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^5が、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

X^6が、結合、－ＣＨ$_2$－およびシクロアルキルからなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－が、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^7が、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－が、アルキルで置換されていても良く；

X^8がピペリジニルまたはピロリジニルであり；

Z^1が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルが、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

Z^2が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨが、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Z^3およびZ^4が、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；

Z^5がＣＨである、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から３のいずれか１項に記載の化合物または該化合物の塩。

【請求項５】

X^1が、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリール、およびC_3－C_6－アルキルからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールが、１以上のアルキルによって置換されていても良く、

前記アルキルが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールが、メタおよびパラ位で、アルキル、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、アリールアルコキシおよびシアノからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、

前記アルキルが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

前記アリールアルコキシが、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；

前記フェニルが、オルト位で、１以上のハロゲンによって置換されていても良く；

X^2が、結合、－Ｃ（Ｏ）－、および－ＣＨ$_2$－Ｏ－からなる群から選択され；

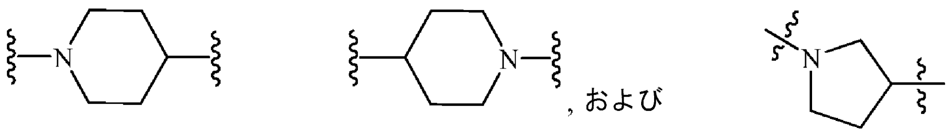
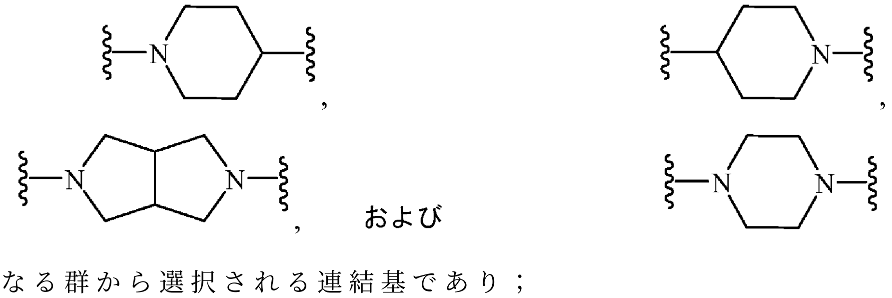
X^4が、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－が、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^5が、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

X^6が、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－が、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても

良く；
X^{7}が、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、Ｓ（Ｏ）$_{2}$、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－が、アルキルで置換されていても良く；
X^{8}が、
【化４】

からなる群から選択され；
X^{9}が、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；
Z^{1}が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルファニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールが、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Z^{2}が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨが、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Z^{3}およびZ^{4}が、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；
Z^{5}がＣＨである、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から３のいずれか１項に記載の化合物または該化合物の塩。
【請求項６】
X^{1}が、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールが、１以上のアルキルによって置換されていても良く、
前記アルキルが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールが、メタおよびパラ位で、アルキル、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、およびアリールアルコキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、
前記アルキルが、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシが、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
X^{2}が、結合および－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－からなる群から選択され；
X^{3}が、
【化５】

からなる群から選択される連結基であり；
X^{4}が、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；
X^{5}が、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}が、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され、

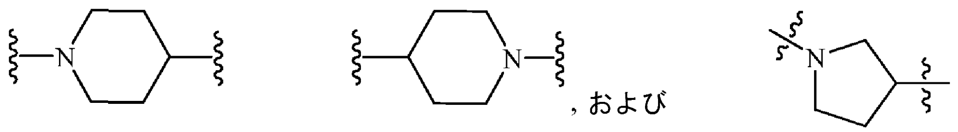
前記－ＣＨ$_{2}$－が、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{7}が、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－が、アルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{8}が、

【化６】



からなる群から選択され；

Ｘ^{9}が、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；

Ｚ^{1}が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニルおよび５員ヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニルおよび５員ヘテロアリールが、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

Ｚ^{2}が、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨが、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

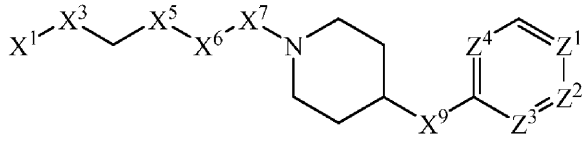
Ｚ^{3}およびＺ^{4}が、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；

Ｚ^{5}がＣＨである、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から３のいずれか１項に記載の化合物または該化合物の塩。

【請求項７】

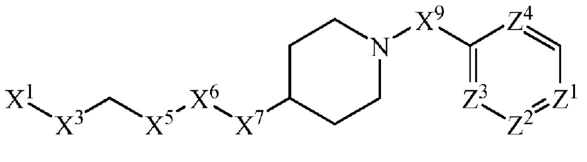
下記のものである、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から３のいずれか１項に記載の化合物または該化合物の塩。

【化７】



(I-8)

および



(I-9),

［式中、

Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位で、アルキルおよびアリールアルコキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良

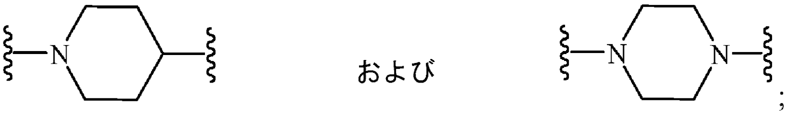
く、

前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{3}は、

【化８】



からなる群から選択される連結基であり；

Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}は－ＣＨ$_2$－であり、

前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され；

Ｘ^{9}は、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；

Ｚ^{1}はＣＨであり、

前記ＣＨは、ニトロ、シアノ、アルキル、アルキルスルファニルおよびアルキルスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルキルおよびアルキルスルファニルは、１以上のハロゲンで置換されていても良く；

Ｚ^{2}はＣＨであり、

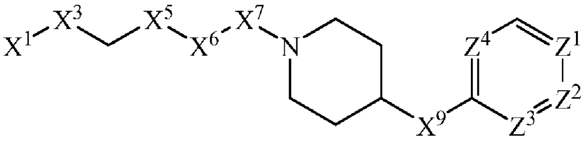
前記ＣＨは、アルキル、シアノ、アルコキシおよびハロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。］

【請求項８】

構造において下記のものに相当する、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項７に記載の化合物または該化合物の塩。

【化９】



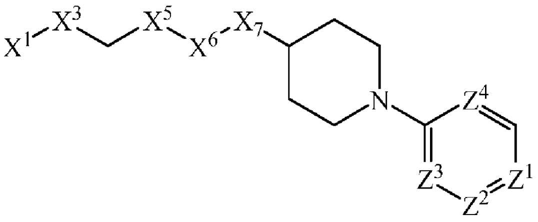
(I-8)

［式中、Ｘ^{9}は－ＮＨ－および－Ｏ－からなる群から選択される。］

【請求項９】

構造において下記のものに相当する、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項７に記載の化合物または該化合物の塩。

【化１０】

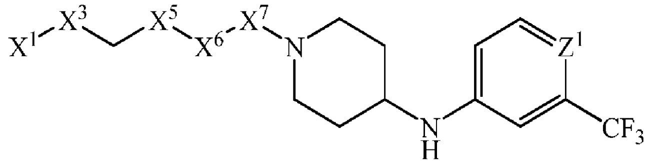


(I-9).

【請求項１０】

下記のものである、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１に記載の化合物または塩。

【化１１】



［式中、

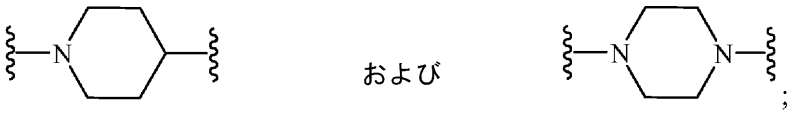
Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは、１以上の独立に選択されるハロアルキルで置換されていても良く；

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位で、１以上の独立に選択されるハロアルキルによって置換されていても良く；

Ｘ^{3}は、

【化１２】



からなる群から選択される連結基であり；

Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}は－ＣＨ$_{2}$－であり、

前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

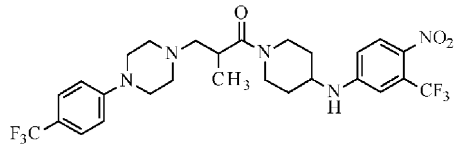
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－および－Ｃ（Ｓ）からなる群から選択され；

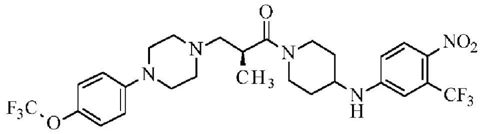
Ｚ^{1}は、ニトロおよびシアノからなる群から選択される置換基で置換されていても良いＣＨである。］

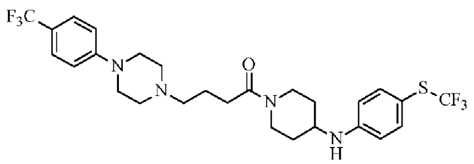
【請求項１１】

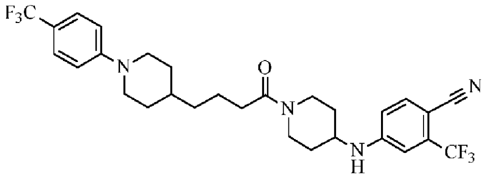
下記のものからなる群から選択される、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１に記載の化合物または該化合物の塩。

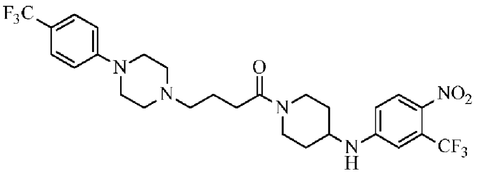
【化１３】

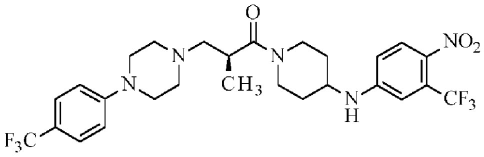

,

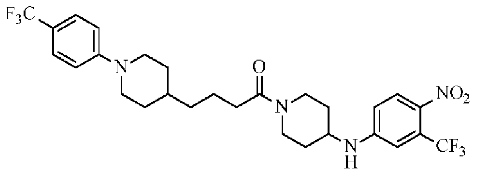

,

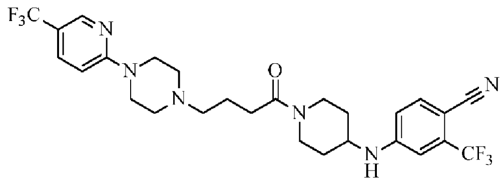

,

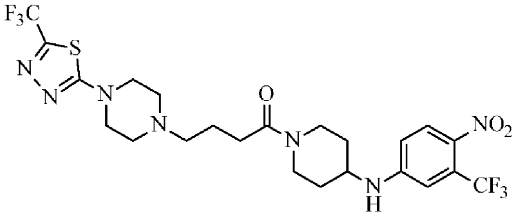

,


,

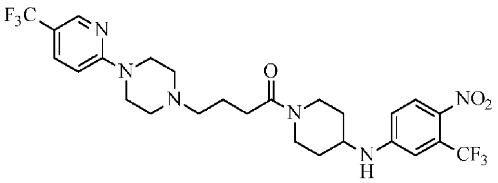

,


,

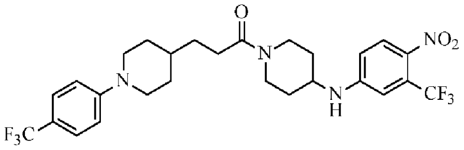

,



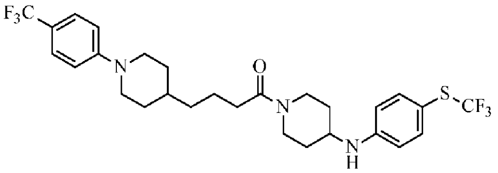
,



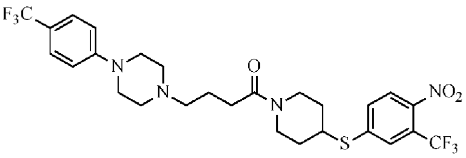
,



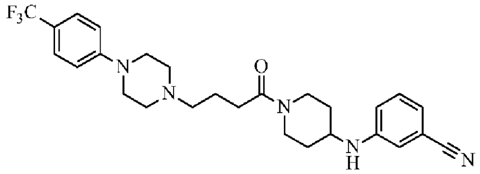
,



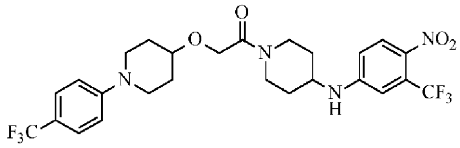
,



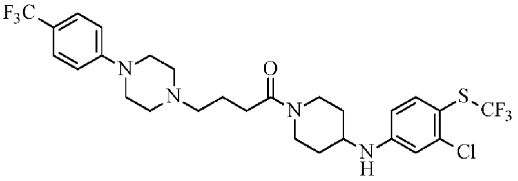
,



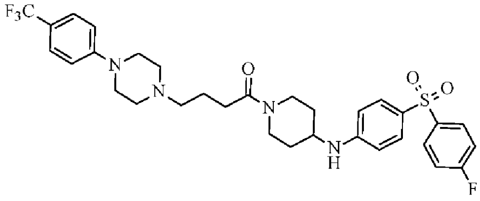
,



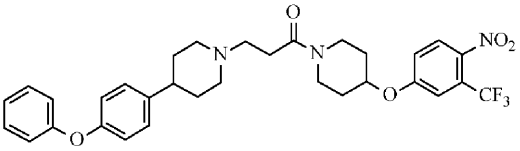
,



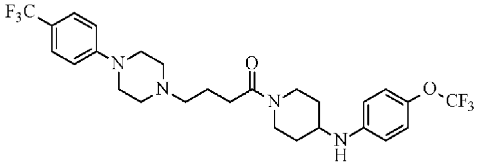
,



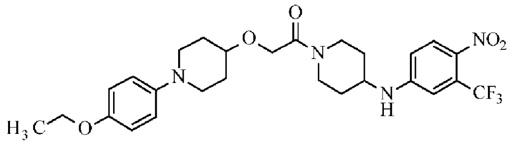
,



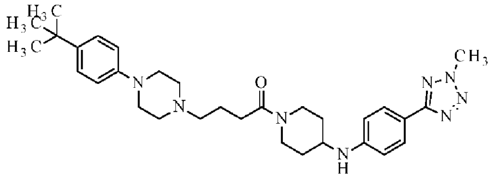
,

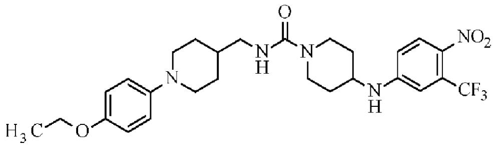


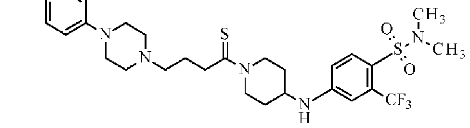
,



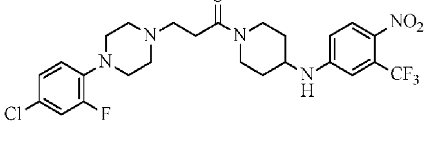
,







および

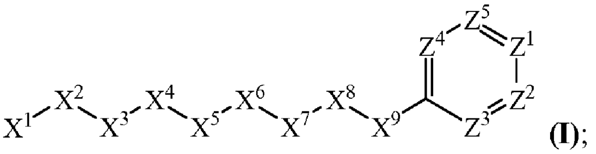


【請求項１２】

犬糸状虫感染の治療で使用される、構造において下記式（Ｉ）に相当する化合物または

該化合物の塩。

【化１４】



［式中、

Ｘ１は、フェニル、５員ヘテロアリールおよび６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは、アルキルによって置換されていても良く、

前記アルキルは、ハロゲンで置換されていても良く、

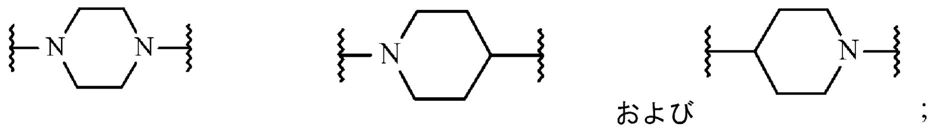
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、アルキル、アルコキシおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、

前記アルキルおよびアルコキシ置換基は、ハロゲンで置換されていても良く；

Ｘ２は結合であり；

Ｘ３は、

【化１５】



からなる連結基の群から選択され；

Ｘ４は、結合、－ＣＨ２－および－Ｏ－からなる群から選択され；

Ｘ５は、結合および－ＣＨ２－からなる群から選択され；

Ｘ６は、結合および－ＣＨ２－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ２－は、アルキルで置換されていても良く；

Ｘ７は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され；

Ｘ８はピペリジニルであり；

Ｘ４－Ｘ５－Ｘ６－Ｘ７は、Ｘ３をＸ８に連結する３個未満の原子の鎖を含まず；

Ｘ９は、－Ｏ－、－Ｓ－および－ＮＨ－からなる群から選択され；

Ｚ１はＣＨであり、

前記ＣＨは、ニトロ、シアノ、アミノスルホニル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニルおよびヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルコキシ、アルキルスルファニルおよびアリールスルホニルは、１以上のハロゲンで置換されていても良く、

前記アミノスルホニルは、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｚ２はＣＨであり、

前記ＣＨは、シアノ、ハロゲンおよびハロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Ｚ３、Ｚ４、およびＺ５はＣＨである。］

【請求項１３】

前記化合物または塩が犬糸状虫の幼虫および／またはミクロフィラリアに対して活性である、犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から１２のいずれか１項に記載の化合物または塩。

【請求項１４】
対象動物、特にはイヌに対して、請求項１から１２のいずれか１項に記載の化合物または塩を投与することを含む、犬糸状虫感染の治療方法。
【請求項１５】
前記化合物または塩を、賦形剤および有効成分からなる群から選択される少なくとも一つの他の成分と組み合わせて投与する、請求項１４に記載の方法。
【請求項１６】
犬糸状虫感染の治療に使用される請求項１から１２のいずれか１項に記載の少なくとも一つの化合物または塩、ならびに
賦形剤、有効成分、前記化合物もしくは塩を賦形剤または有効成分と組み合わせるための説明書、前記化合物もしくは塩を賦形剤もしくは有効成分と組み合わせるための装置、前記化合物もしくは塩を動物に投与するための説明書、前記化合物もしくは塩を動物に投与するための装置、および診断手段からなる群から選択される少なくとも一つの他の構成要素を含むキット。
【請求項１７】
前記賦形剤がポリマーもしくはグラフトコポリマーの固体分散体を含む請求項１６に記載のキット。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、犬糸状虫に対する薬剤として有用な化合物および塩に関する。本発明はまた、治療を必要とする動物への当該化合物およびそれのエンを投与することを含む治療に関するものでもある。
【背景技術】
【０００２】
犬糸状虫感染は、糸状虫生物である犬糸状虫によって引き起こされる。少なくとも７０種類の蚊が中間宿主として働き得る。すなわち、ヤブカ属、ハマダラカ属およびイエカ属は媒介生物として働く最も一般的な属である。多くの野生動物種およびコンパニオン動物で、開存性（ｐａｔｅｎｔ）感染が可能である。野生動物保菌者には、オオカミ、コヨーテ、キツネ、カリフォルニアハイイロアザラシ（Ｃａｌｉｆｏｒｎｉａ　ｇｒａｙ　ｓｅａｌｓ）、アシカおよびアライグマなどがある。コンパニオン動物において、犬糸状虫感染は、主としてイヌで診断され、それより頻度は低いがネコおよびフェレットでも診断される。犬糸状虫病は、米国、カナダ、オーストラリア、ラテンアメリカおよび南ヨーロッパなどの温帯、亜熱帯もしくは熱帯気候のほとんどの国で報告されている。コンパニオン動物において、感染リスクは屋外で飼っているイヌおよびネコで最大であるが、屋内または屋外のあらゆるイヌまたはネコが感染し得る。
【０００３】
蚊媒介生物種は、感染宿主を食物としながらミクロフィラリア（新生幼虫段階）を獲得する。蚊が摂取すると、ミクロフィラリアの第一幼虫段階（Ｌ１）への発達が起こる。次に、それらは活発に脱皮して、環境温度に応じて１から４週間以内に第２幼虫段階（Ｌ２）に入り、蚊体内で再度感染第３段階（Ｌ３）に入る。成熟すると、感染幼虫は蚊の下唇に移動する。蚊が摂食すると、感染幼虫は少量の血リンパとともに下唇の先端から飛び出して宿主皮膚上に到達する。幼虫は咬創内に移動して、それのライフサイクルの哺乳動物部分を開始する。イヌ科および他の感受性の宿主では、感染幼虫（Ｌ３）は３から１２日以内に脱皮して第４段階（Ｌ４）に入る。皮下組織、腹部および胸部に約２ヶ月間留まった後、Ｌ４幼虫は第５０日から７０日に最終脱皮をして若い成虫となり、初期感染後約７０日から１２０日で心臓および肺動脈に到達する。
【発明の概要】
【０００４】
唯一の入手可能な犬糸状虫成虫駆除剤はメラルソミン・２塩酸塩であり、それは両性の

成熟（成体）および未成熟犬糸状虫に対して有効である．犬糸状虫感染は、マクロライド予防によって予防可能である。動物の飼育状況とは無関係に、重大な結果に至る可能性があることから通年予防が勧められる。マクロライド系予防薬イベルメクチン、ミルベマイシンオキシム、モキシデクチン、およびセラメクチンの製剤は、イヌの全ての種類に処方されて安全および有効である。イベルメクチン／ピランテルパモエート（鈎虫および回虫）およびミルベマイシン（鈎虫、回虫および鞭虫）も、腸内線虫の抑制も提供する。承認された用量で、ミルベマイシンはミクロフィラリアを急速に殺し、高ミクロフィラリア濃度に直面すると、ショック反応が生じ得る。従って、ミルベマイシンは、多数のミクロフィラリアを有するイヌにおける予防剤として緊密にモニタリングしながら投与しなければならない。ネコ用のイベルメクチンは、月１回経口で２４μｇ／ｋｇで安全かつ有効である。セラメクチンおよびイミダクロプリド／モキシデクチンの組み合わせの製剤はイヌおよびネコの両方用にラベル表示される。

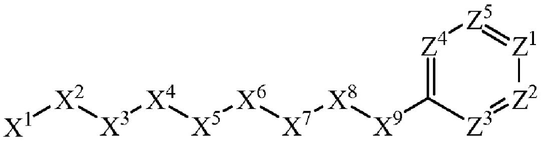
【０００５】

特に既存薬剤に対する抵抗性の可能性のゆえに、犬糸状虫（当該生物の非成虫動物段階を含む）に対して活性であり、それによる感染を治療するのに用いることができる（その治療は感染を予防したり、感染を治療的に軽減することができる）新たな薬剤を見出すことが常に必要とされている。

【０００６】

すなわち、本発明は、犬糸状虫感染を治療するのに用いることができる化合物（およびそれの塩）に関する。その化合物は、構造的に下記式Ｉに相当する。

【化１】



(I);

【０００７】

式（Ｉ）において、X^1は、C_3－C_6－アルキル、C_3－C_6－アルケニル、C_3－C_6－アルキニル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニル、５員ヘテロアリール、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールからなる群から選択される。前記C_3－C_6－アルキル、C_3－C_6－アルケニル、C_3－C_6－アルキニル、シクロペンチル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニル、および５員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、ア

リールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

【０００８】

X^2は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択される。前記－ＮＨ－は、アルキルで置換されていても良く、前記－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^3は連結基であり、その連結基は炭化水素であり、当該連結基は１以上の窒素原子を含み、前記炭化水素における炭素の１以上は、独立にハロゲン、アルキル、アルコキシおよびオキソからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く、前記連結基はX^2をX^4に連結する３から６個の原子の少なくとも一つの鎖を含み、その鎖原子のうちの１から２個が窒素であり、前記連結基はX^2およびX^4を連結する３個未満の原子の鎖を含まない。

【０００９】

X^4は、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）－、および－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【００１０】

X^5は、結合、－ＣＨ$_2$－、および炭素環からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【００１１】

X^6は、結合、－ＣＨ$_2$－、および炭素環からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【００１２】

X^7は、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＮＨ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良く、いずれの－ＮＨ－も、置換可能な位置でアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基によって置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

【００１３】

X^8は、ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニル、およびピロリジニルからなる群から選択され、前記ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニルまたはピロリジニルは、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^4－X^5－X^6－X^7は、X^3をX^8にを連結する３個未満の原子の鎖を含まない。

【００１４】
Ｘ^{9}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－は、置換可能な位置でアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基によって置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

【００１５】
Ｚ^{1}はＮおよびＣＨからなる群から選択され、前記ＣＨは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノスルホニル、アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、前記アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く、前記アミノスルホニルは、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良い。

【００１６】
Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、前記ＣＨは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。

【００１７】
Ｚ^{3}、Ｚ^{4}、およびＺ^{5}は、それぞれ独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され、前記ＣＨは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；Ｚ^{1}、Ｚ^{2}、Ｚ^{3}、Ｚ^{4}、およびＺ^{5}のうちの一つのみがＮであることができる。

【００１８】
本発明は、一部において、動物における疾患、特には犬糸状虫感染の治療方法に関するものでもある。当該方法は、動物に少なくとも一つの本発明の化合物またはそれの塩を投与することを含む。

【００１９】
本発明はまた、部分的に、キットに関するものでもある。そのキットは、容器（バイアル、袋、箱、小袋、注射器、ブリスタなど）に入れた少なくとも一つの本発明の化合物もしくは塩を含む。さらに、当該キットは、少なくとも一つの他の成分、例えば別の成分（例えば、賦形剤または有効成分、すなわちいずれかの医学的用途に好適である成分、好ましくは駆虫薬成分）、説明書および／または前記化合物もしくは塩を別の成分と組み合わせるための装置、説明書および／または当該化合物もしくは塩を投与するための装置、および／または診断手段を含む。

【００２０】
指摘しておくべき点として、本発明で使用される化合物は、アナプロセファラ（Ａｎａｐｌｏｃｅｐｈａｌａ）属種；ディピリジウム（Ｄｉｐｙｌｉｄｉｕｍ）属種；ジフィロボツリム（Ｄｉｐｈｙｌｌｏｂｏｔｈｒｉｕｍ）属種；エキノコックス（Ｅｃｈｉｎｏｃｏｃｃｕｓ）属種；モニエジア（Ｍｏｎｉｅｚｉａ）属種；テニア（Ｔａｅｎｉａ）属種；ジクロコエリウム（Ｄｉｃｒｏｃｏｅｌｉｕｍ）属種；ファシオラ（Ｆａｓｃｉｏｌａ）属種；パラムフィストムム（Ｐａｒａｍｐｈｉｓｔｏｍｕｍ）属種；スキストソマ（Ｓｃｈｉｓｔｏｓｏｍａ）属種；アンシロストマ（Ａｎｃｙｌｏｓｔｏｍａ）属種；アネカトール（Ａｎｅｃａｔｏｒ）属種；アスカリジア（Ａｓｃａｒｉｄｉａ）属種；アスカリ

ス（Ａｓｃａｒｉｓ）属種；ブルギア（Ｂｒｕｇｉａ）属種；ブノストムム（Ｂｕｎｏｓｔｏｍｕｍ）属種；カピラリア（Ｃａｐｉｌｌａｒｉａ）属種；チャベルチア（Ｃｈａｂｅｒｔｉａ）属種；クーペリア（Ｃｏｏｐｅｒｉａ）属種；シアトストムム（Ｃｙａｔｈｏｓｔｏｍｕｍ）属種；シリコシクルス（Ｃｙｌｉｃｏｃｙｃｌｕｓ）属種；シリコドントフォルス（Ｃｙｌｉｃｏｄｏｎｔｏｐｈｏｒｕｓ）属種；シリコステファヌス（Ｃｙｌｉｃｏｓｔｅｐｈａｎｕｓ）属種；クラテロストムム（Ｃｒａｔｅｒｏｓｔｏｍｕｍ）属種；ジクチオカウルス（Ｄｉｃｔｙｏｃａｕｌｕｓ）属種；ジペタロネマ（Ｄｉｐｅｔａｌｏｎｅｍａ）属種；ジロフィラリア（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ）属種；ドラクンクルス（Ｄｒａｃｕｎｃｕｌｕｓ）属種；エンテロビウス（Ｅｎｔｅｒｏｂｉｕｓ）属種；フィラロイデス（Ｆｉｌａｒｏｉｄｅｓ）属種；ハブロネマ（Ｈａｂｒｏｎｅｍａ）属種；ハエモンクス（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ）属種；ヘテラキス（Ｈｅｔｅｒａｋｉｓ）属種；ヒオストロギルス（Ｈｙｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）属種；メタストロギルス（Ｍｅｔａｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）属種；メウレリウス（Ｍｅｕｌｌｅｒｉｕｓ）属種；ネカトール（Ｎｅｃａｔｏｒ）属種；ネマトジルス（Ｎｅｍａｔｏｄｉｒｕｓ）属種；ニッポストロンギルス（Ｎｉｐｐｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）属種；エソファゴストムム（Ｏｅｓｏｐｈａｇｏｓｔｏｍｕｍ）属種；オンコセルカ（Ｏｎｃｈｏｃｅｒｃａ）属種；オステルタギア（Ｏｓｔｅｒｔａｇｉａ）属種；オキシウリス（Ｏｘｙｕｒｉｓ）属種；パラスカリス（Ｐａｒａｓｃａｒｉｓ）属種；ステファヌルス（Ｓｔｅｐｈａｎｕｒｕｓ）属種；ストロンギルス（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）属種；シンガムス（Ｓｙｎｇａｍｕｓ）属種；トキソカラ（Ｔｏｘｏｃａｒａ）属種；ストロンギロイデス（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｏｉｄｅｓ）属種；テラドルサギア（Ｔｅｌａｄｏｒｓａｇｉａ）属種；トキサスカリス（Ｔｏｘａｓｃａｒｉｓ）属種；トリチネラ（Ｔｒｉｃｈｉｎｅｌｌａ）属種；トリクリス（Ｔｒｉｃｈｕｒｉｓ）属種；トリコストロンギルス（Ｔｒｉｃｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）属種；トリオドントフォルス（Ｔｒｉｏｄｏｎｔｏｐｈｏｒｏｕｓ）属種；ウンシナリア（Ｕｎｃｉｎａｒｉａ）属種およびウケレリア（Ｗｕｃｈｅｒｅｒｉａ）属種からなる群から選択される１以上の蠕虫によって引き起こされる蠕虫感染を治療するのに用いることもできる。

【００２１】

本願人らの発明のさらなる利点については、本明細書を読むことで当業者には明らかになろう。

【発明を実施するための形態】

【００２２】

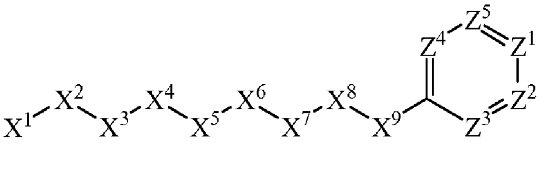
好ましい実施形態についてのこの詳細な説明は、本願人らの発明、それの原理およびそれの実際の適用を当業者に知らせることで、特定用途の必要条件に最も適し得るように、当業者が本発明を多くの形態で適合および適用可能とすることのみを目的とするものである。この詳細な説明およびそれの具体例は、本発明の好ましい実施形態を示すものであるが、説明のみを目的としたものである。従って、本発明は、本明細書に記載の好ましい実施形態に限定されるものではなく、多様な形で改変可能である。

【００２３】

Ｉ．本発明での使用のための化合物

本発明での使用のための化合物は、構造において、下記式（Ｉ）に相当する。

【化２】



(I).

【００２４】

式（Ｉ）における置換基は、下記のように定義される。

【００２５】

Ａ．Ｘ^{1}の好ましい実施形態

Ｘ^{1}は、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニル、５員ヘテロアリール、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールからなる群から選択される。

【００２６】

前記Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、シクロペンチル、５員複素環アルキル、５員複素環アルケニルおよび５員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

【００２７】

前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

【００２８】

一部の実施形態において、前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、および６員ヘテロアリールは、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によってメタ位およびパラ位で置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、６員ヘテロアリールは、１以上の独立に選択されるハロゲンによってオルト位で置換されていても良い。

【００２９】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}はＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキルである。

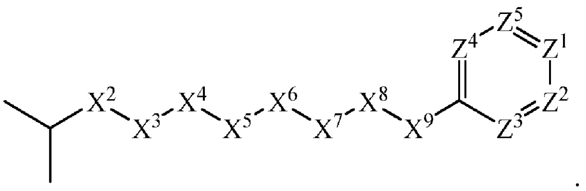
【００３０】

一部の実施形態において、X^1はＣ$_3$－Ｃ$_4$－アルキルである。

【００３１】

一部の実施形態において、X^1はＣ$_3$－アルキルである。一部のそのような実施形態において、X^1はイソプロピルである。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

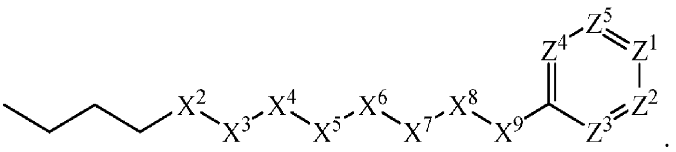
【化３】



【００３２】

一部の実施形態において、X^1はＣ$_4$－アルキルである。一部のそのような実施形態において、X^1はブチルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

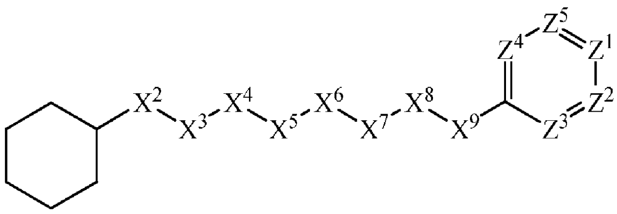
【化４】



【００３３】

一部の実施形態において、X^1はＣ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキルである。一部のそのような実施形態において、例えば、X^1はＣ$_6$－シクロアルキル（すなわち、シクロヘキシル）である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化５】



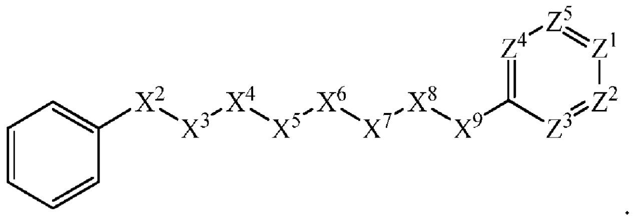
【００３４】

一部の実施形態において、X^1は、フェニルハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基でメタ位およびパラ位で置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記フェニルも、１以上の独立に選択されるハロゲンによってオルト位で置換されていても良い。

【００３５】

一部の実施形態において、X^1はフェニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化６】



【００３６】

一部の実施形態において、X^1は、１個の置換基で置換されたフェニルである。

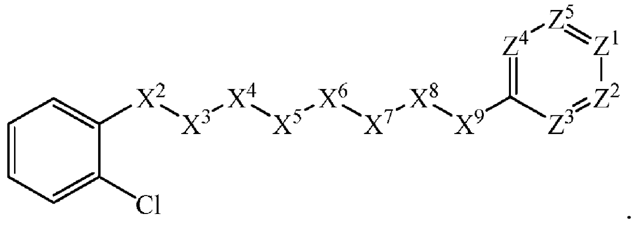
【００３７】

一部の実施形態において、X^1は、オルト位で１個の置換基で置換されたフェニルである。

【００３８】

一部の実施形態において、X^1は、オルト位で１個のハロゲン置換基で置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、X^1は、オルト位で１個のクロロで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

【化７】



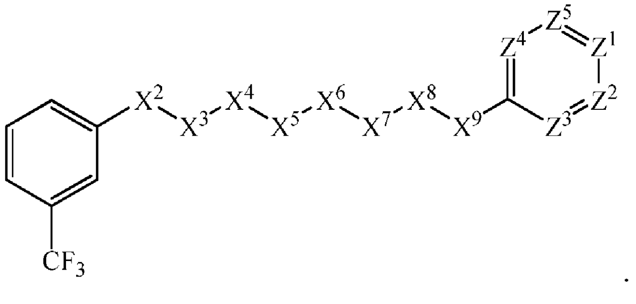
【００３９】

一部の実施形態において、X^1は、メタ位で１個の置換基で置換されたフェニルである。

【００４０】

一部の実施形態において、X^1は、メタ位でハロアルキルで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、X^1は、メタ位でトリフルオロメチルで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

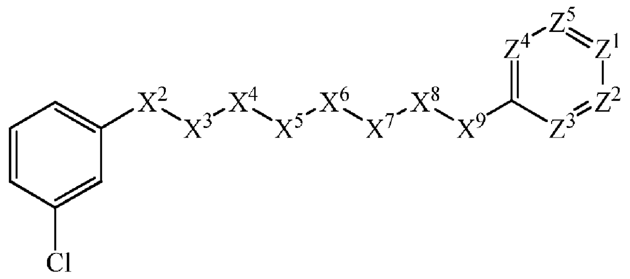
【化８】



【００４１】

他のそのような実施形態において、X^1は、メタ位でクロロで置換されたフェニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

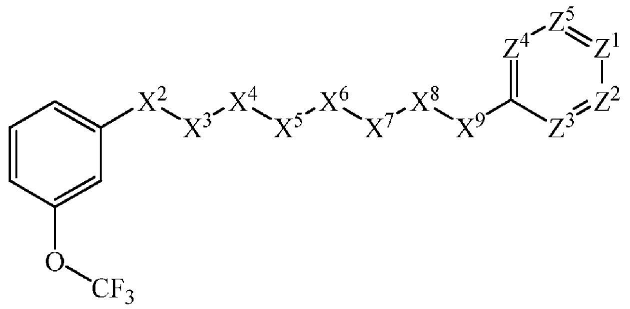
【化９】



【００４２】

他のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、メタ位でハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、フルオロ－Ｃ$_{1}$－アルコキシ（すなわち、－ＯＣＦ$_{3}$）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

【化１０】



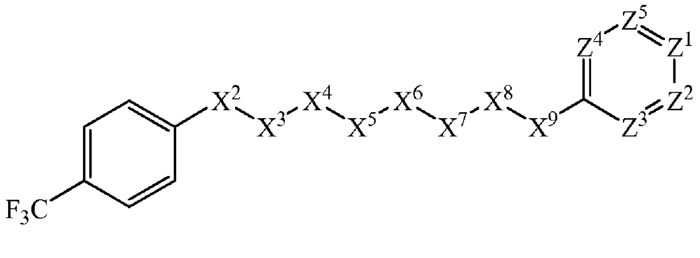
【００４３】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位で１個の置換基で置換されたフェニルである。

【００４４】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、パラ位でトリフルオロメチル（すなわち、－ＣＦ$_{3}$）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

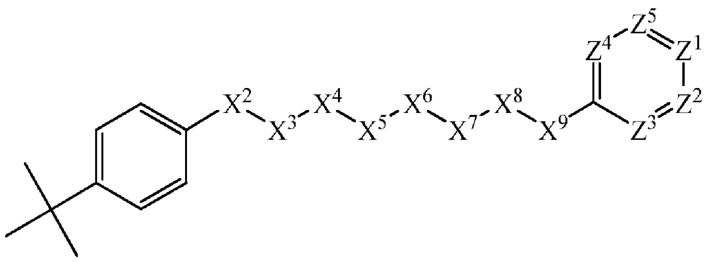
【化１１】



【００４５】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、パラ位でｔｅｒｔ－ブチルで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

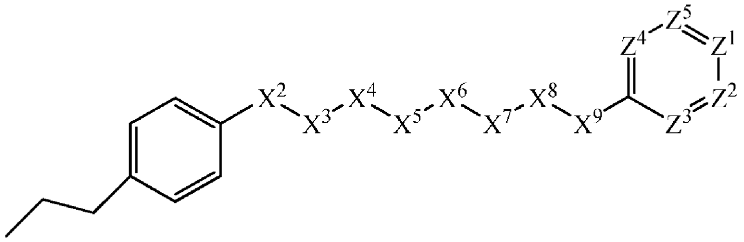
【化１２】



【００４６】

他のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でＣ$_3$－アルキル（すなわちプロピル）で置換されたフェニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

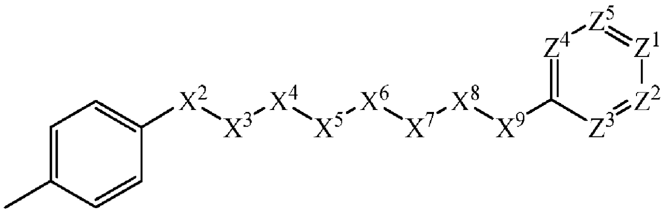
【化１３】



【００４７】

さらに他のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でＣ$_1$－アルキル（すなわちメチル）で置換されたフェニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

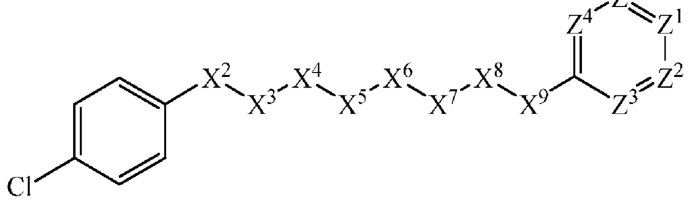
【化１４】



【００４８】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でハロで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、パラ位でクロロで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

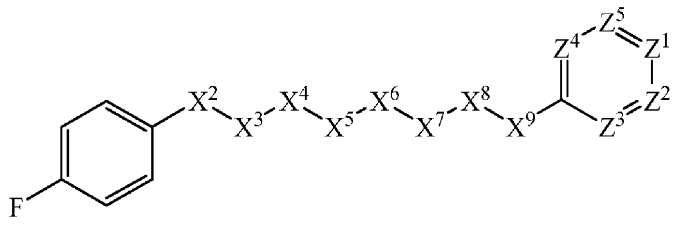
【化１５】



【００４９】

他のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でフルオロで置換されたフェニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

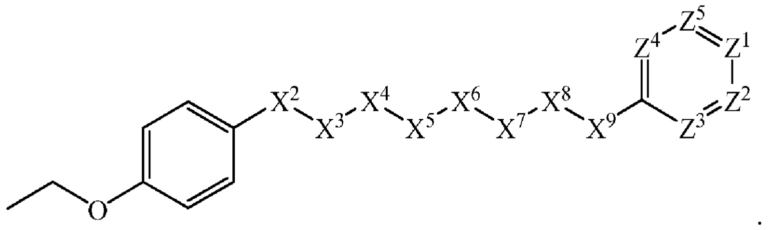
【化１６】



【００５０】

一部の実施形態において、X^1は、C_1－C_6－アルコキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、X^1は、パラ位でC_2－アルコキシ（すなわちエトキシ）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

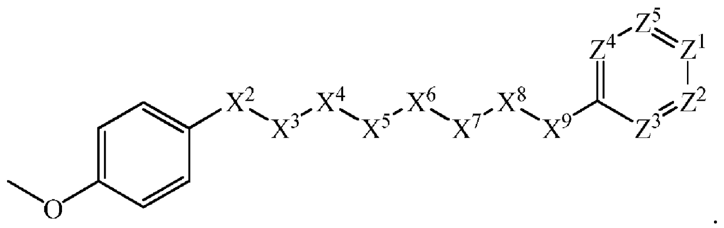
【化１７】



【００５１】

一部のそのような実施形態において、例えば、X^1は、パラ位でC_1－アルコキシ（すなわちメトキシ）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

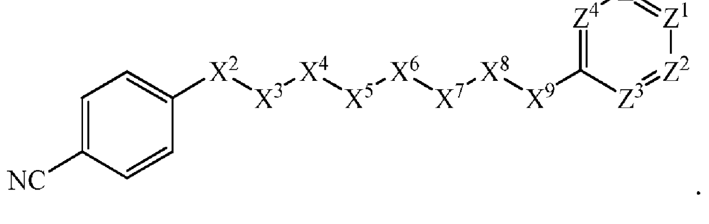
【化１８】



【００５２】

一部の実施形態において、X^1は、パラ位でシアノで置換されたフェニルである。それらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

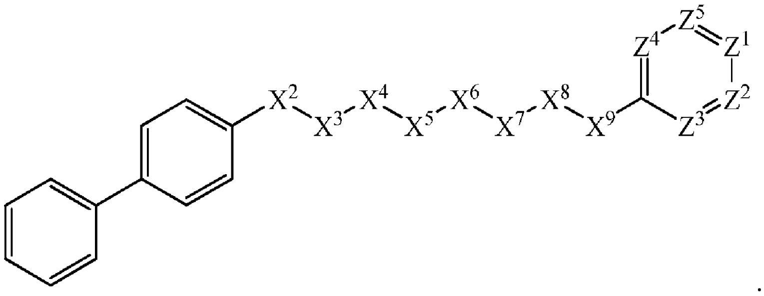
【化１９】



【００５３】

一部の実施形態において、X^1は、パラ位でアリールで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、X^1は、パラ位でフェニルで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

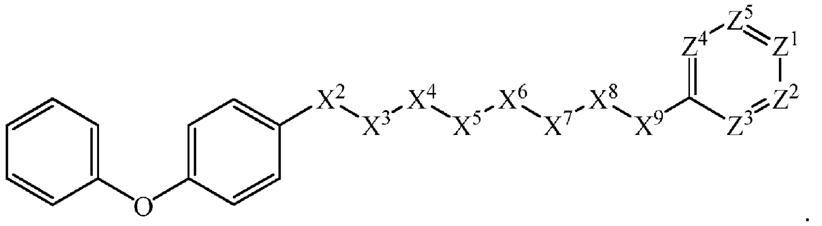
【化２０】



【００５４】

一部の実施形態において、Ｘ[1]は、パラ位でアリールオキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ[1]は、パラ位でフェノキシで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

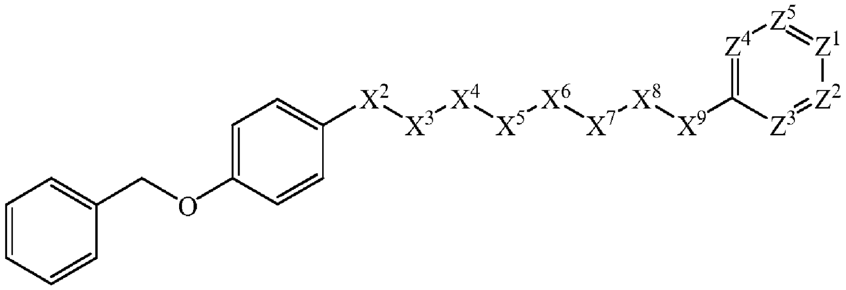
【化２１】



【００５５】

一部の実施形態において、Ｘ[1]は、パラ位でアリール－C_1－C_6－アルコキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ[1]は、パラ位でフェニルメトキシで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

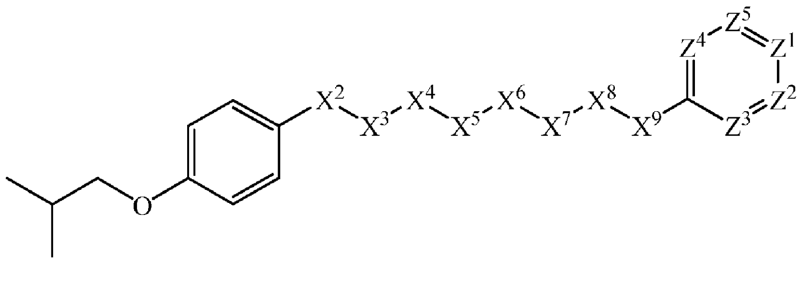
【化２２】



【００５６】

一部の実施形態において、Ｘ[1]は、C_1－C_6－アルコキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ[1]は、C_4－アルコキシ（すなわち、イソブチルオキシ）でパラ置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

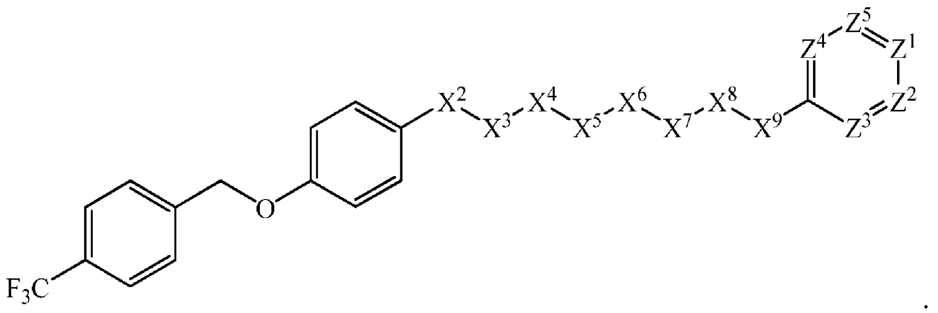
【化２３】



【００５７】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、ハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル－アリール－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシで置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、トリフルオロ－Ｃ$_{1}$－アルキルフェニル－Ｃ$_{1}$－アルコキシ（すなわち、トリフルオロメチルフェニルメトキシ）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

【化２４】



【００５８】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、２個の置換基で置換されたフェニルである。

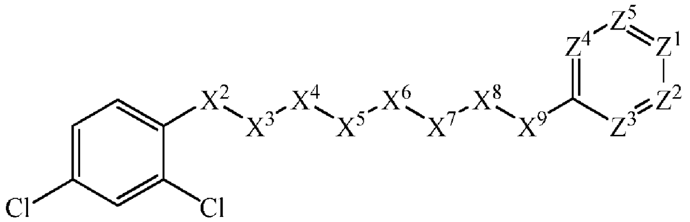
【００５９】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、オルトおよびパラ位で置換されたフェニルである。

【００６０】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、オルトおよびパラ位で２個の独立に選択されるハロ置換基によって置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、２個のクロロ置換基で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

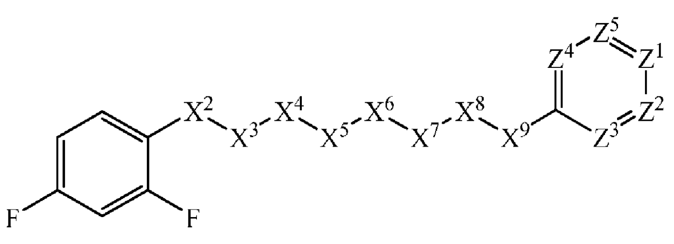
【化２５】



【００６１】

他のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、２個のフルオロ置換基で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

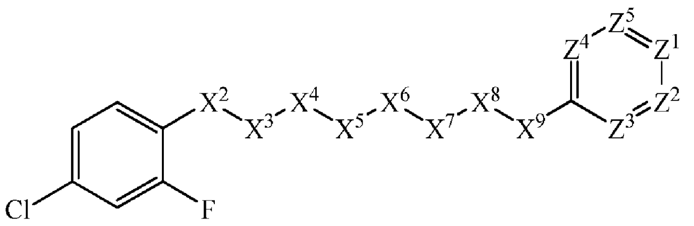
【化２６】



【００６２】

さらに他のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、オルト位でフルオロおよびパラ位でクロロで置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

【化２７】



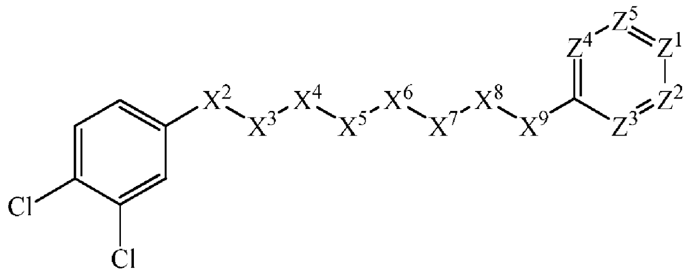
【００６３】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、メタおよびパラ位で置換されたフェニルである。

【００６４】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、メタおよびパラ位で置換されたフェニルである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、２個のクロロ置換基で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

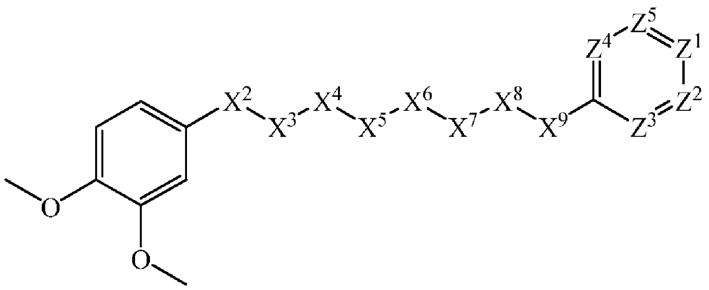
【化２８】



【００６５】

他のそのような実施形態において、例えば、Ｘ^{1}は、２個の独立に選択されるＣ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ置換基で置換されたフェニルである。例えば、Ｘ^{1}は、２個のＣ$_1$－アルコキシ置換基（すなわち、メトキシ）で置換されたフェニルである。そのような実施形態は、下記式によって包含される。

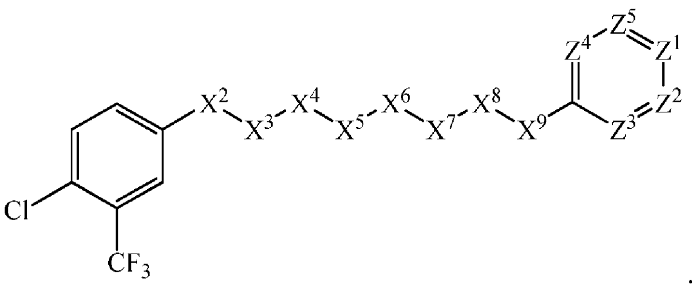
【化２９】



【００６６】

他のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

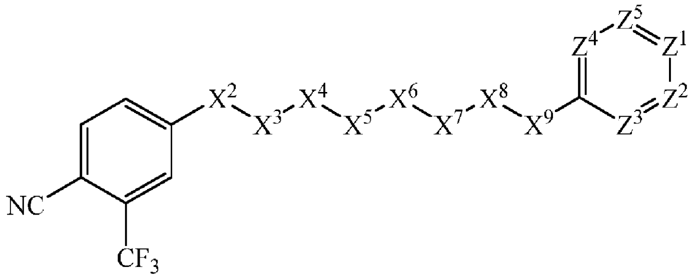
【化３０】



【００６７】

さらに他のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

【化３１】



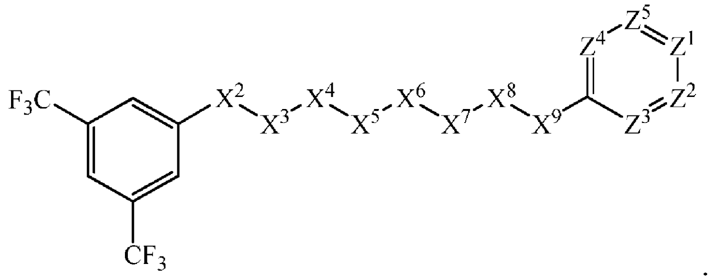
【００６８】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、両方のメタ位で置換されたフェニルである。

【００６９】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、２個のハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル置換基で置換されたフェニルである。例えば、一部のそのような実施形態は、下記式によって包含される。

【化３２】



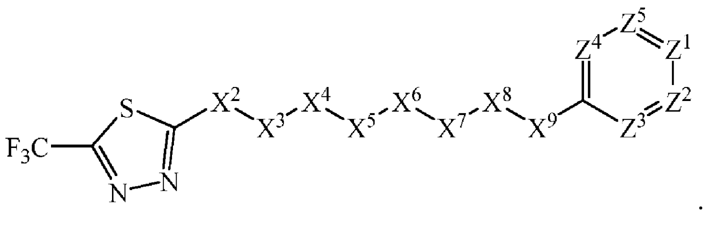
【００７０】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良い５員ヘテロアリールである。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

【００７１】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、ハロアルキル置換基で置換されていても良い置換されていても良いチアジアゾイルである。一部のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、トリフルオロメチルで置換されたチアジアゾイルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化３３】



【００７２】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良い６員ヘテロアリールである。前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリール、アリールオキシ、アリールアルコキシ、アリールスルファニル、アリールアルキルスルファニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールスルファニル、およびヘテロアリールアルキルスルファニル置換基は、独立にハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルスルファニル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記シクロヘキシル、フェニル、６員複素環アルキル、６員複素環アルケニル、６員ヘテロアリールは、１以上の独立に選択されるハロゲンによってオルト位で置換されていても良い。

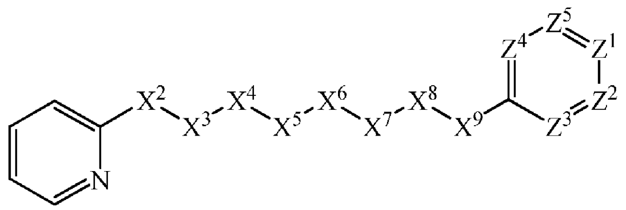
【００７３】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、置換されていても良いピリジニルである。

【００７４】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、２－ピリジニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

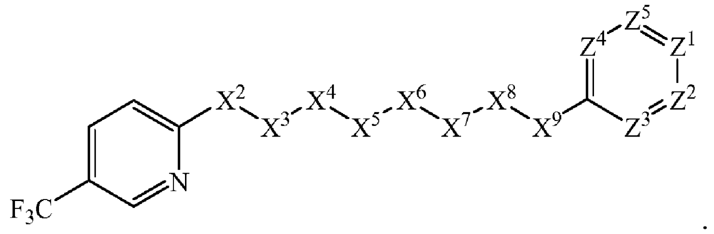
【化３４】



【００７５】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、ハロアルキルで置換された２－ピリジニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

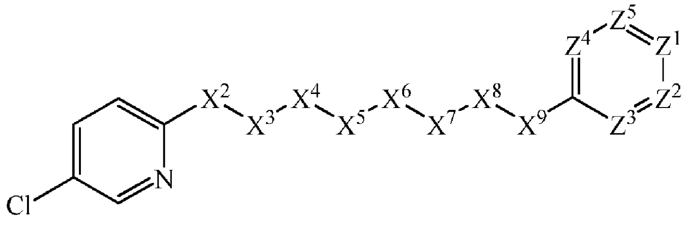
【化３５】



【００７６】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、パラ位でクロロで置換された２－ピリジニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化３６】

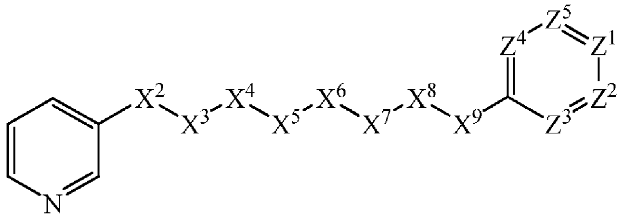


【００７７】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、３－ピリジニルである。そのような実施形態におい

て、当該化合物は、下記式によって包含される。

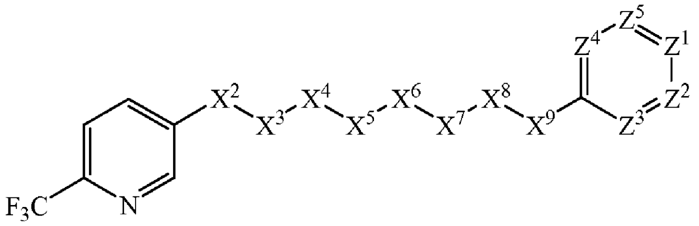
【化３７】



【００７８】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、ハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで置換された３－ピリジニルである。そのような実施形態において、例えば、当該化合物は、下記式によって包含される。

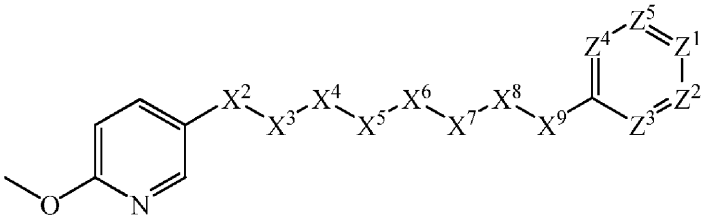
【化３８】



【００７９】

一部の実施形態において、Ｘ^{1}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシで置換された３－ピリジニルである。そのような実施形態において、例えば、当該化合物は、下記式によって包含される。

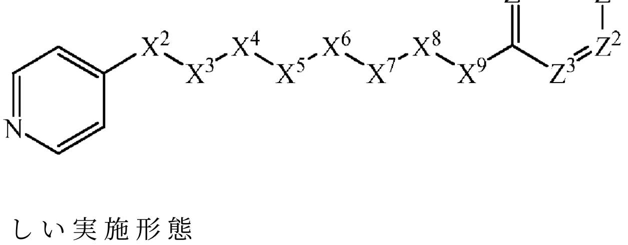
【化３９】



【００８０】

さらに他のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は、４－ピリジニルである。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化４０】



【００８１】

Ｂ．Ｘ^{2}の好ましい実施形態

Ｘ^{2}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、および－ＣＨ$_{2}$－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－からなる群から選択される。ここで、前記－ＮＨ－は、アルキルで置換されていても良い。前記－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－

、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良い。

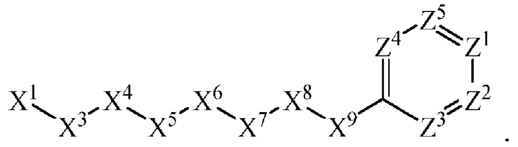
【００８２】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群から選択される。ここで、前記－ＮＨ－は、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換されていても良い。前記－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｃ（Ｏ）－、－Ｏ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－ＮＨ－、－Ｓ－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＣＨ$_2$－、および－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）$_2$－は、１以上の独立に選択されるＣ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換されていても良い。

【００８３】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、単結合である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

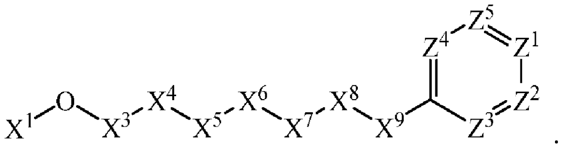
【化４１】



【００８４】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｏ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

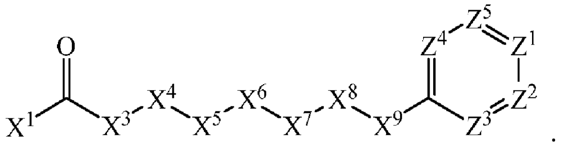
【化４２】



【００８５】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｃ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

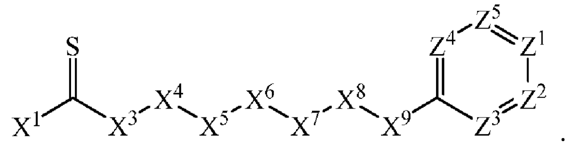
【化４３】



【００８６】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｃ（Ｓ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

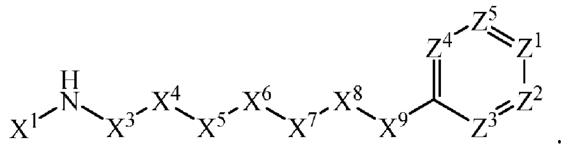
【化４４】



【００８７】

一部の実施形態において、Ｘ ^{2} は、－ＮＨ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

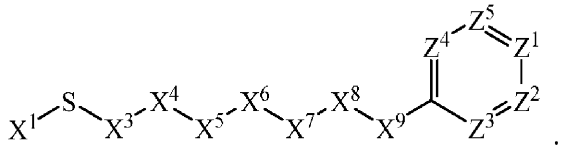
【化４５】



【００８８】

一部の実施形態において、Ｘ ^{2} は、－Ｓ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

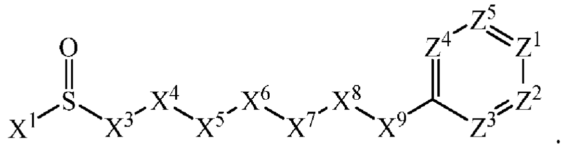
【化４６】



【００８９】

一部の実施形態において、Ｘ ^{2} は、－Ｓ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

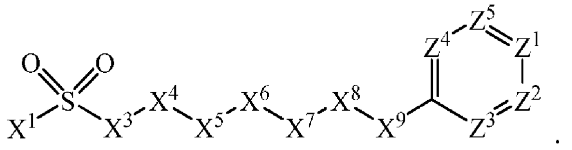
【化４７】



【００９０】

一部の実施形態において、Ｘ ^{2} は、－Ｓ（Ｏ） $_2$ －である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

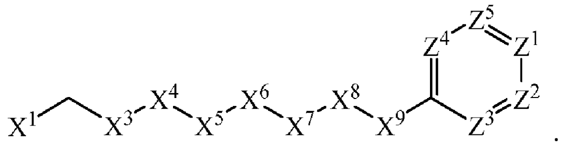
【化４８】



【００９１】

一部の実施形態において、Ｘ ^{2} は、－ＣＨ $_2$ －である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

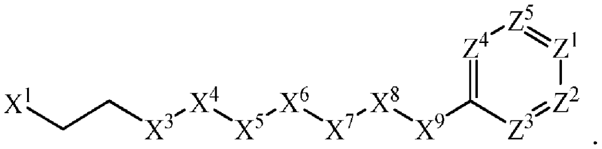
【化４９】



【００９２】

一部の実施形態において、X^2は、$-CH_2CH_2-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

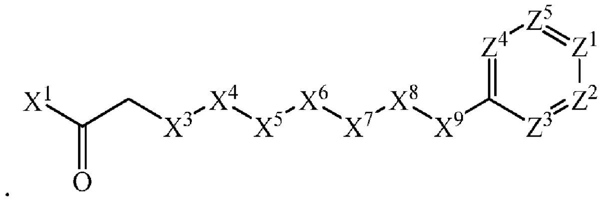
【化５０】



【００９３】

一部の実施形態において、X^2は、$-C(O)-CH_2-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

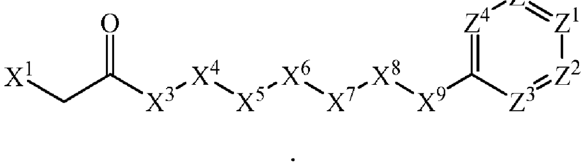
【化５１】



【００９４】

一部の実施形態において、X^2は、$-CH_2-C(O)-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

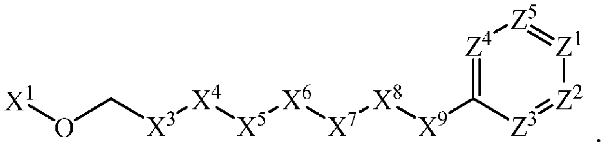
【化５２】



【００９５】

一部の実施形態において、X^2は、$-O-CH_2-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

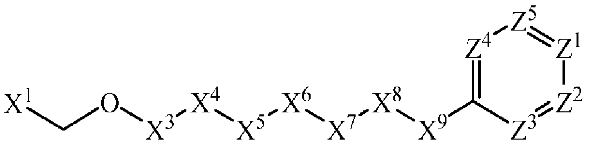
【化５３】



【００９６】

一部の実施形態において、X^2は、$-CH_2-O-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

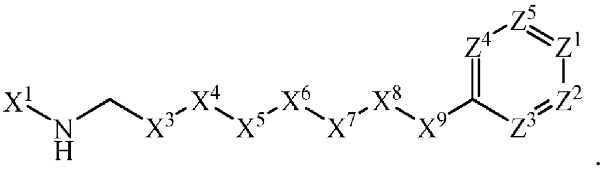
【化５４】



【００９７】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－ＮＨ－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

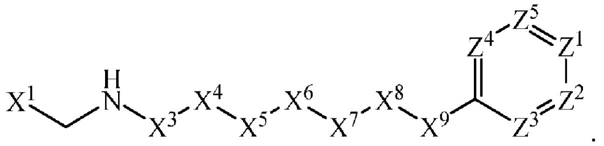
【化５５】



【００９８】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－ＣＨ$_2$ＮＨ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

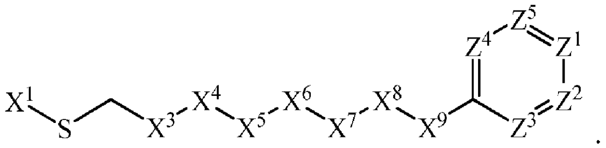
【化５６】



【００９９】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｓ－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

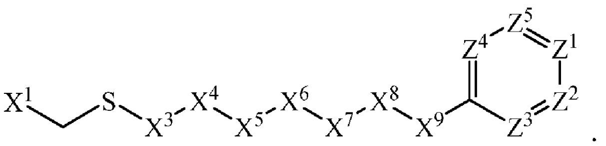
【化５７】



【０１００】

一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－ＣＨ$_2$－Ｓ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

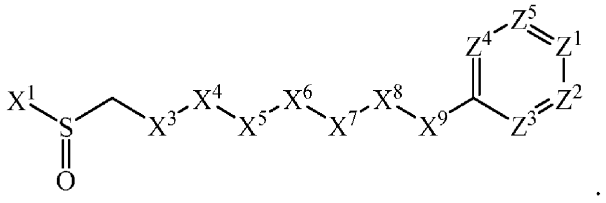
【化５８】

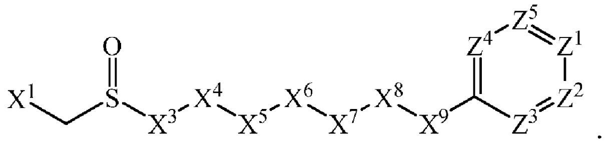


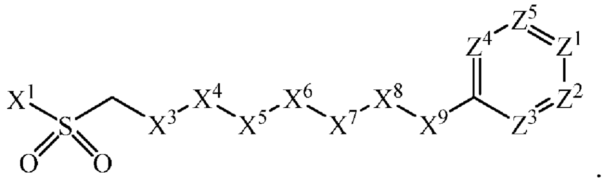
【０１０１】

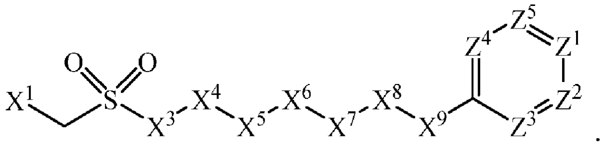
一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｓ（Ｏ）－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化５９】



【０１０２】
一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－ＣＨ$_{2}$－Ｓ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化６０】


【０１０３】
一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化６１】


【０１０４】
一部の実施形態において、Ｘ^{2}は、－ＣＨ$_{2}$－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化６２】


【０１０５】
Ｃ．Ｘ^{3}の好ましい実施形態
Ｘ^{3}は、連結基である。その連結基は、炭化水素基であるが、ただし（ａ）当該連結基は１以上の窒素原子を含み、（ｂ）前記炭化水素における炭素の１以上は独立にオキソ、ハロゲン、ヒドロキシ、アルキル、およびアルコキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記連結基は、Ｘ^{2}をＸ^{4}に架橋する３から６個の原子の少なくとも一つの鎖を含む。鎖原子の１から２個が窒素である。その連結基は、Ｘ^{2}およびＸ^{4}を架橋する３個未満の原子の鎖を持たない。
【０１０６】
一部の実施形態において、連結基は、炭化水素基であり、ただし（ａ）当該連結基は１以上の窒素原子を含み、（ｂ）前記炭化水素における炭素の１以上は独立にオキソ、ハロゲン、アルキル、およびアルコキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記連結基は、Ｘ^{2}をＸ^{4}に架橋する３から５個の原子の少なくとも一つの鎖を含む。鎖原子の１から２個が窒素である。その連結基は、Ｘ^{2}およびＸ^{4}を架橋する３個未満の原子の鎖を持たない。
【０１０７】
一部の実施形態において、連結基は、炭化水素基であり、ただし（ａ）当該連結基は１以上の窒素原子を含み、（ｂ）前記炭化水素における炭素の１以上は独立にオキソ、ハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、およびＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。
【０１０８】
一部の実施形態において、連結基は、炭化水素基であり、ただし（ａ）当該連結基は１

以上の窒素原子を含み、（ｂ）前記炭化水素における炭素の１以上はオキソで置換されていても良い。

【０１０９】
一部の実施形態において、連結基は、炭化水素基であり、ただし（ａ）当該連結基は１以上の窒素原子を含み、（ｂ）炭化水素中の１個の炭素がオキソで置換されている。

【０１１０】
一部の実施形態において、連結基は、１以上の窒素原子を含む以外は炭化水素基である。

【０１１１】
一部の実施形態において、連結基は１個以下の窒素原子を含む。

【０１１２】
他の実施形態において、連結基は２個以下および２個以上の窒素原子を含む。

【０１１３】
一部の実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する３から６個の原子の少なくとも一つの鎖を含む。

【０１１４】
一部の実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する少なくとも一つの３原子鎖を含む。

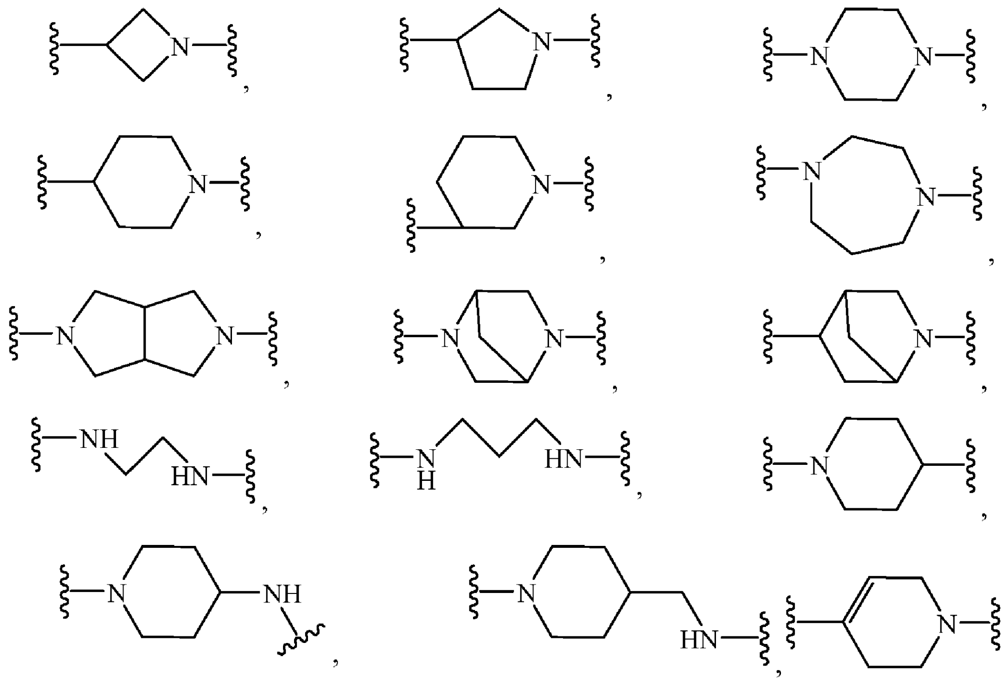
【０１１５】
一部の実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する少なくとも一つの４原子鎖を含む。一部のそのような実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する４未満の原子の鎖を持たない。

【０１１６】
一部の実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する少なくとも一つの５原子鎖を含む。一部のそのような実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する５未満の原子の鎖を持たない。

【０１１７】
一部の実施形態において、X^3は、表Ｉに示したものからなる連結基の群から選択される。

【０１１８】
表Ｉ
X^3連結基の例

【化６３】



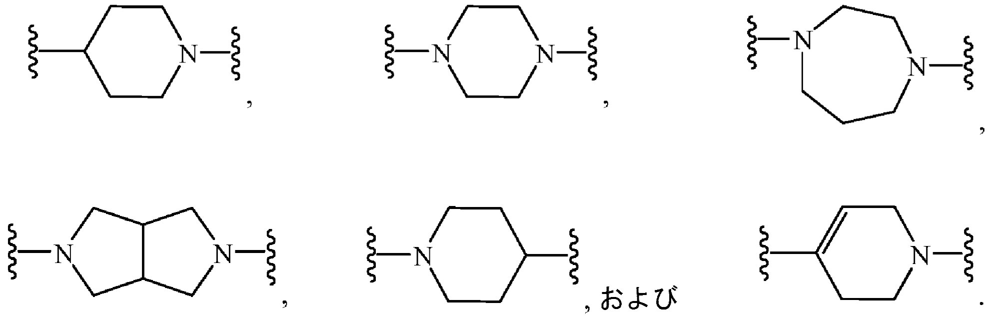
【０１１９】

そのような基はいずれも、独立にハロゲン、C_1-C_6－アルキル、C_1-C_6－アルコキシ、オキソ、およびチオカルボニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

【０１２０】

一部の実施形態において、X^3は、下記のものからなる群から選択される。

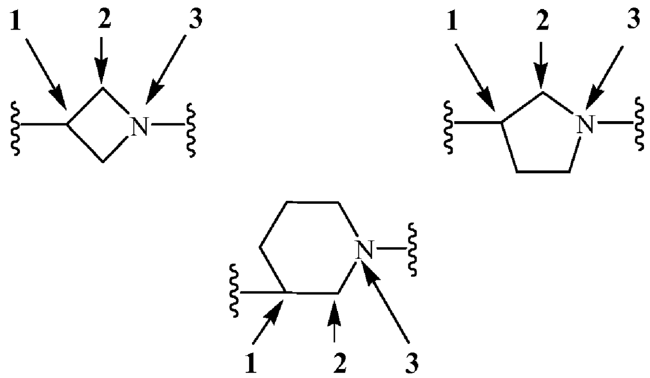
【化６４】

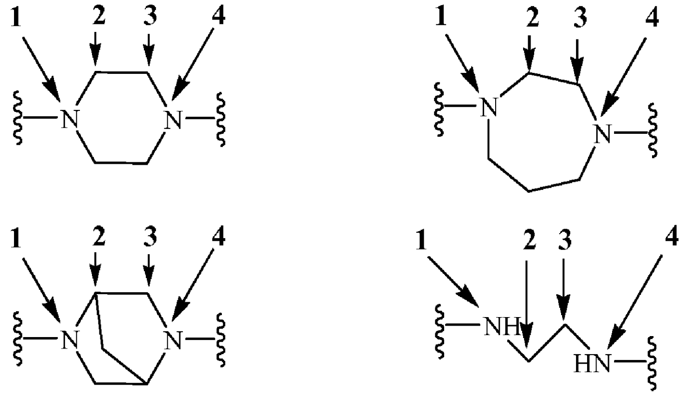


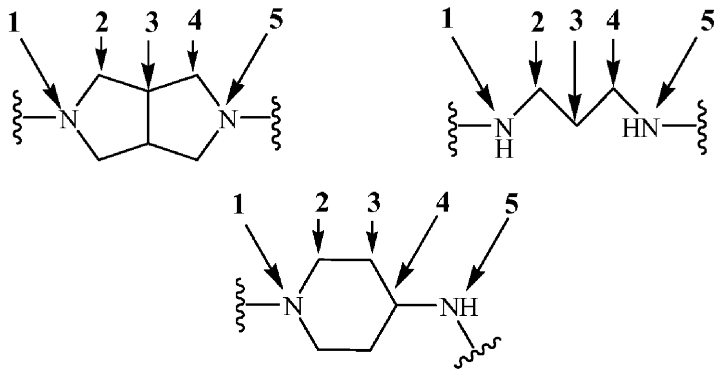
【０１２１】

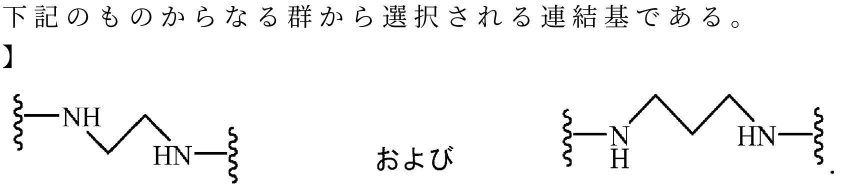
一部の実施形態において、連結基は、X^2をX^4に架橋する少なくとも一つの３原子鎖を含む。説明すると、下記のものは、そのような連結基を例示する表Ｉからの構造の一部である。

【化６５】



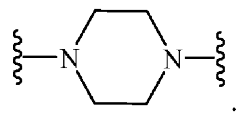
【０１２２】
一部の実施形態において、連結基は、Ｘ ^{2} をＸ ^{4} に架橋する少なくとも一つの４原子鎖を含む。説明すると、下記のものは、そのような連結基を例示する表Ｉからの構造の一部である。
【化６６】


【０１２３】
一部の実施形態において、連結基は、Ｘ ^{2} をＸ ^{4} に架橋する少なくとも一つの５原子鎖を含む。説明すると、下記のものは、そのような連結基を例示する表Ｉからの構造の一部である。
【化６７】


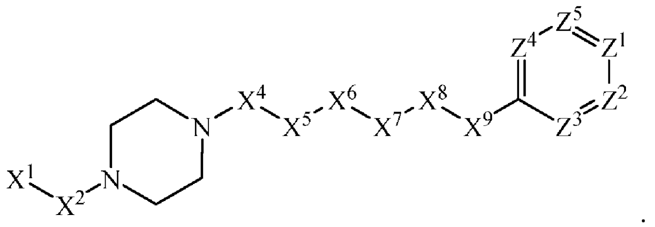
【０１２４】
一部の実施形態において、表Ｉにおける構造は、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルやオキソで置換されていない。
【０１２５】
一部の実施形態において、Ｘ ^{3} は環を含まない。一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{6} は、下記のものからなる群から選択される連結基である。
【化６８】


【０１２６】
そのような基はいずれも、独立にＣ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルおよびオキソからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。
【０１２７】
一部の実施形態において、Ｘ ^{3} は、表Ｉにおける単環もしくは二環構造の一つである。その環は、独立にハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシ、オキソ、およびチオカルボニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。

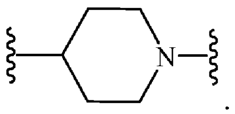
【０１２８】
一部の実施形態において、Ｘ^{3}は表Ｉにおける４から７員単環構造の一つである。その環は、独立にハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシ、オキソ、およびチオカルボニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。
【０１２９】
一部の実施形態において、Ｘ^{3}は表Ｉにおける４から７員単環構造の一つである。その環は、独立にハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシ、およびオキソからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。
【０１３０】
一部の実施形態において、Ｘ^{3}は表Ｉにおける４から７員単環構造の一つである。その環は、独立にＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルおよびオキソからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。
【０１３１】
一部の実施形態において、Ｘ^{3}は
【化６９】



【０１３２】
である。
【０１３３】
それらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化７０】

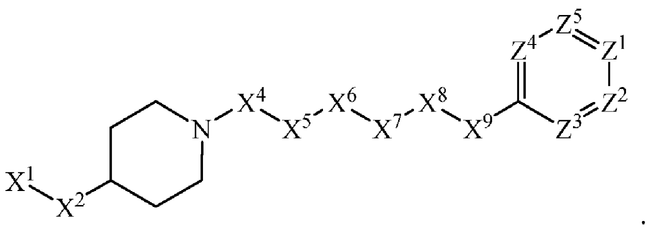


【０１３４】
一部の実施形態において、Ｘ^{3}は
【化７１】



【０１３５】
である。
【０１３６】
そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

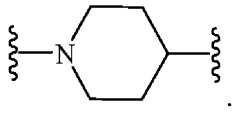
【化７２】



【０１３７】

一部の実施形態において、Ｘ^{3}は

【化７３】



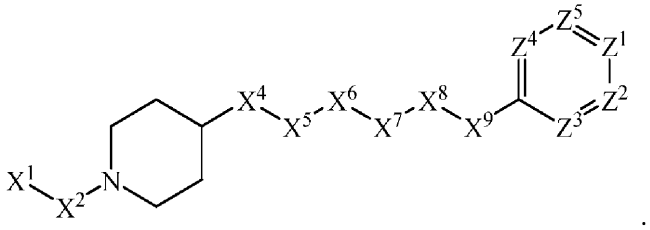
【０１３８】

である。

【０１３９】

そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

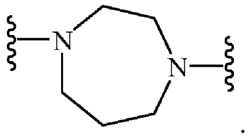
【化７４】



【０１４０】

一部の実施形態において、Ｘ^{3}は、

【化７５】



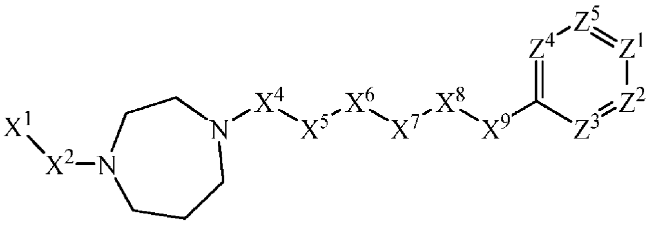
【０１４１】

である。

【０１４２】

そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

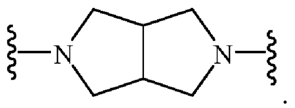
【化７６】



【０１４３】

一部の実施形態において、Ｘ^{3}は、

【化７７】



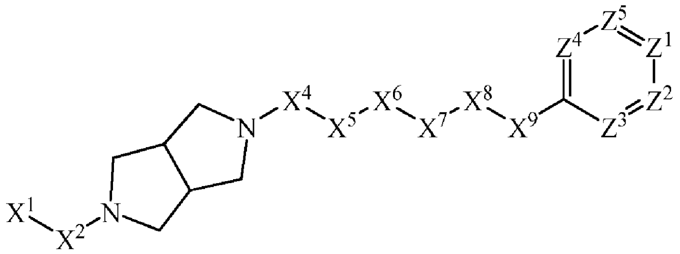
【０１４４】

である。

【０１４５】

そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

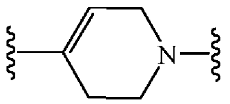
【化７８】



【０１４６】

一部の実施形態において、Ｘ ^{3} は、

【化７９】



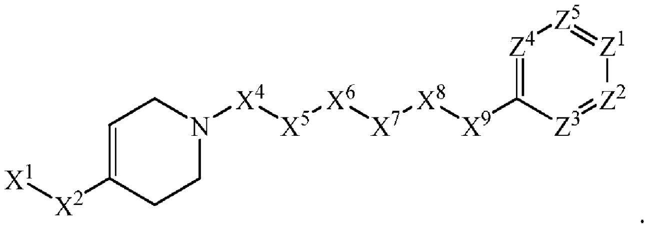
【０１４７】

である。

【０１４８】

そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８０】



【０１４９】

一部の実施形態において、前記連結基における１以上の炭素原子が、独立にハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシ、オキソ、およびチオカルボニルからなる群から選択される１個もしくは２個の置換基で置換されている。

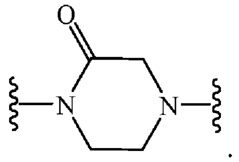
【０１５０】

一部の実施形態において、前記連結基における１以上の炭素原子が、独立にハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシ、およびオキソからなる群から選択される１個もしくは２個の置換基で置換されている。

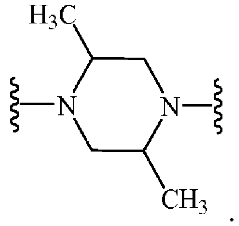
【０１５１】

一部の実施形態において、Ｘ ^{3} は表Ｉにおける単環もしくは二環構造の一つであり、その環構造中の環原子の１個もしくは２個が独立にメチルおよびオキソからなる群から選択される置換基で置換されている。説明すると、一部の実施形態において、環原子はオキソ置換基で置換されている。そのような例における連結基は、例えば

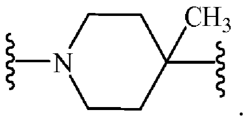
【化８１】



【０１５２】
であることができる。
【０１５３】
他の実施形態において、例えば、環原子の１個もしくは２個がメチルで置換されている。説明すると、そのような例における連結基は、例えば
【化８２】

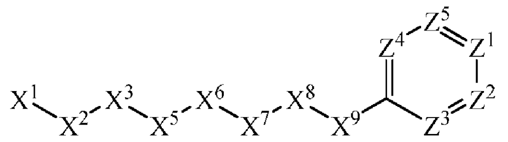


【０１５４】
であることができる。
【０１５５】
さらに説明すると、連結基はあるいは、例えば
【化８３】



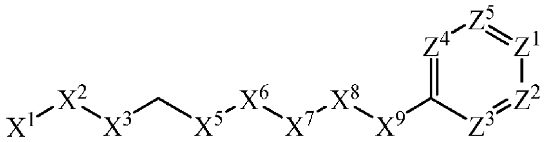
【０１５６】
であることができる。
【０１５７】
Ｄ．$Ｘ^{4}$の好ましい実施形態
$Ｘ^{4}$は、結合、－$ＣＨ_{2}$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）－、および－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－からなる群から選択される。前記－$ＣＨ_{2}$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１５８】
一部の実施形態において、$Ｘ^{4}$は、結合、－$ＣＨ_{2}$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）－、および－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－からなる群から選択される。前記－$ＣＨ_{2}$－は、独立に$Ｃ_{1}$－$Ｃ_{6}$－アルキル、$Ｃ_{2}$－$Ｃ_{6}$－アルケニル、および$Ｃ_{3}$－$Ｃ_{6}$－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１５９】
一部の実施形態において、$Ｘ^{4}$は、結合、－$ＣＨ_{2}$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）－、および－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－からなる群から選択される。前記－$ＣＨ_{2}$－は、独立に$Ｃ_{1}$－$Ｃ_{6}$－アルキル、$Ｃ_{2}$－$Ｃ_{6}$－アルケニル、および$Ｃ_{3}$－$Ｃ_{6}$－シクロアルキルからなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１６０】
一部の実施形態において、$Ｘ^{4}$は単結合である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８４】



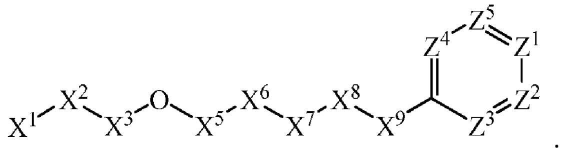
【０１６１】
一部の実施形態において、Ｘ ^{4} は－ＣＨ $_{2}$ －である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８５】



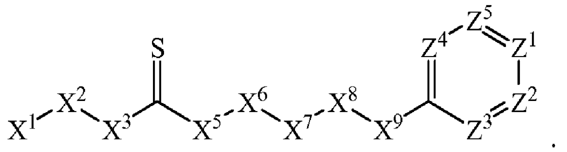
【０１６２】
一部の実施形態において、Ｘ ^{4} は－Ｏ－である。それらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８６】



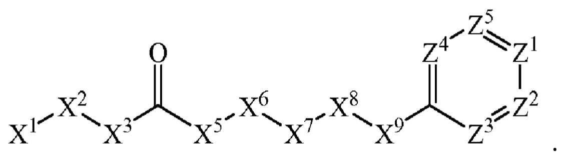
【０１６３】
一部の実施形態において、Ｘ ^{4} は－Ｃ（Ｓ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８７】



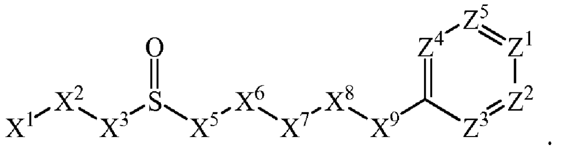
【０１６４】
一部の実施形態において、Ｘ ^{4} は－Ｃ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化８８】

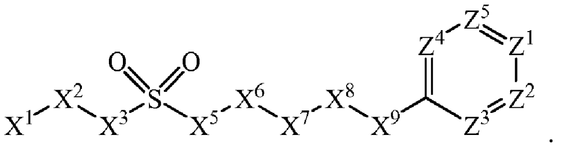


【０１６５】
一部の実施形態において、Ｘ ^{4} は－Ｓ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

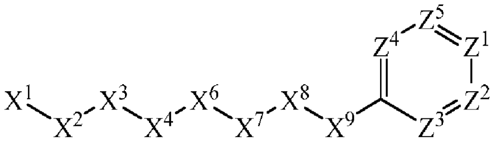
【化８９】



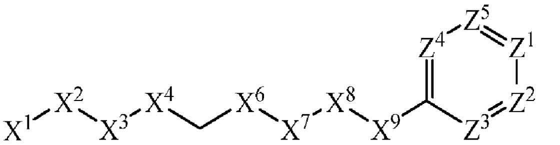
【０１６６】
一部の実施形態において、Ｘ^{4}は－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化９０】



【０１６７】
Ｅ．Ｘ^{5}の好ましい実施形態
Ｘ^{5}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－、および炭素環からなる群から選択される。前記－ＣＨ$_{2}$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１６８】
一部の実施形態において、Ｘ^{5}は結合、－ＣＨ$_{2}$－、および炭素環からなる群から選択される。前記－ＣＨ$_{2}$－は、独立にＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、およびＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１６９】
Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択される。前記－ＣＨ$_{2}$－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１７０】
一部の実施形態において、Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択される。前記－ＣＨ$_{2}$－は、独立にＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、およびＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。
【０１７１】
一部の実施形態において、Ｘ^{5}は単結合である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化９１】

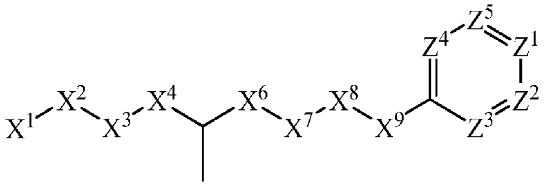


【０１７２】
一部の実施形態において、Ｘ^{5}は－ＣＨ$_{2}$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。
【化９２】



【０１７３】
一部の実施形態において、Ｘ^{5}は、２個以下の独立に選択されるＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで置換された－ＣＨ$_{2}$－である。例えば、一部の実施形態において、Ｘ^{5}は、Ｃ$_{1}$－アルキル（すなわち、メチル）で置換された－ＣＨ$_{2}$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

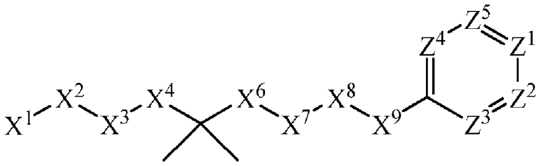
【化９３】



【０１７４】

他の実施形態において、X^{5}は、２個のC_{1}－アルキル（すなわち、メチル）基で置換された$-CH_{2}-$である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

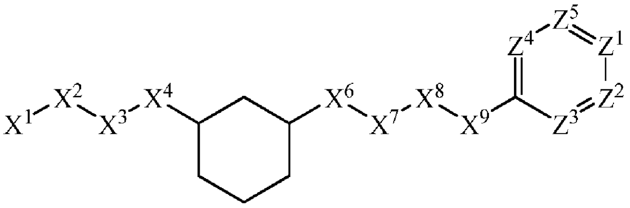
【化９４】



【０１７５】

一部の実施形態において、X^{5}は炭素環である。例えば、一部のそのような実施形態において、X^{5}はC_{6}－シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化９５】



【０１７６】

Ｆ．X^{6}の好ましい実施形態

X^{6}は、結合、$-CH_{2}-$、および炭素環からなる群から選択される。前記$-CH_{2}-$は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【０１７７】

一部の実施形態において、X^{6}は、結合、$-CH_{2}-$、および炭素環からなる群から選択される。前記$-CH_{2}-$は、独立に$C_{1}-C_{6}$－アルキル、$C_{2}-C_{6}$－アルケニル、および$C_{1}-C_{6}$－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【０１７８】

X^{6}は、結合および$-CH_{2}-$からなる群から選択される。前記$-CH_{2}-$は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

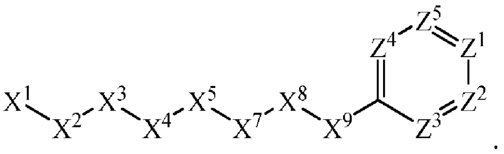
【０１７９】

一部の実施形態において、X^{6}は、結合および$-CH_{2}-$からなる群から選択される。前記$-CH_{2}-$は、独立に$C_{1}-C_{6}$－アルキル、$C_{2}-C_{6}$－アルケニル、および$C_{1}-C_{6}$－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。

【０１８０】

一部の実施形態において、X^{6}は単結合である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

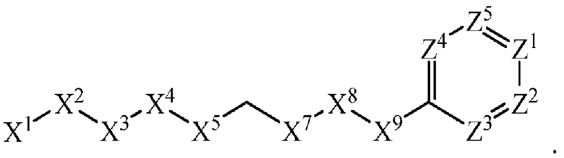
【化９６】



【０１８１】

一部の実施形態において、Ｘ^{6}は－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

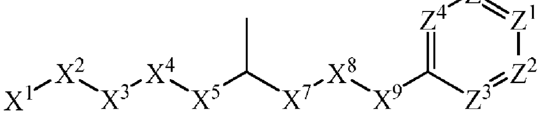
【化９７】



【０１８２】

一部の実施形態において、Ｘ^{6}は、２個以下の独立に選択されるＣ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換された－ＣＨ$_2$－である。例えば、一部の実施形態において、Ｘ^{6}は、Ｃ$_1$－アルキル（すなわち、メチル）で置換された－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

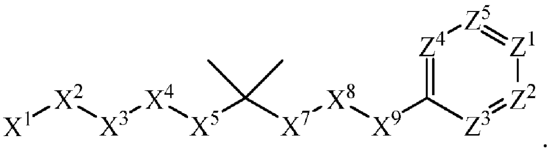
【化９８】



【０１８３】

他の実施形態において、Ｘ^{5}は、２個のＣ$_1$－アルキル（すなわち、メチル）基で置換された－ＣＨ$_2$－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

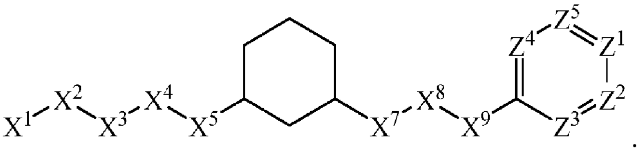
【化９９】



【０１８４】

一部の実施形態において、Ｘ^{6}は炭素環である。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｘ^{6}はＣ$_6$－シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化１００】



【０１８５】

Ｇ．Ｘ^{7}の好ましい実施形態

Ｘ^{7}は、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＮＨ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ

）－、および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択される。前記－CH_2－は、独立にアルキル、アルケニル、および炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。前記－ＮＨ－は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

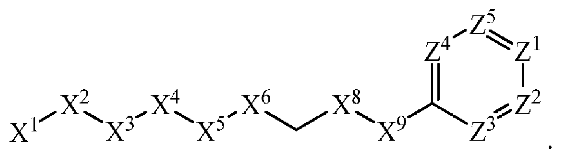
【０１８６】

一部の実施形態において、X^7は、－CH_2－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－ＮＨ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択される。前記－CH_2－は、独立にC_1－C_6－アルキル、C_2－C_6－アルケニル、およびC_3－C_6－炭素環からなる群から選択される２個以下の置換基で置換されていても良い。前記－ＮＨ－は、C_1－C_6－アルキル、C_2－C_6－アルケニル、C_2－C_6－アルキニル、C_1－C_6－アルコキシ－C_1－C_6－アルキル、C_3－C_6－炭素環、およびC_3－C_6－炭素環－C_1－C_6－アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

【０１８７】

一部の実施形態において、X^7は－CH_2－である。一部のそのような実施形態において、例えば、X^7は－CH_2－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

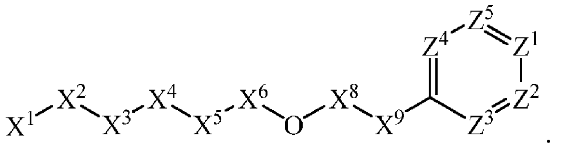
【化１０１】



【０１８８】

一部の実施形態において、X^7は－Ｏ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

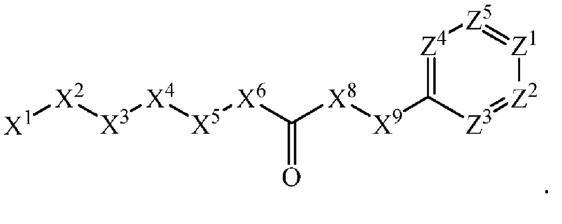
【化１０２】



【０１８９】

一部の実施形態において、X^7は－Ｃ（Ｏ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

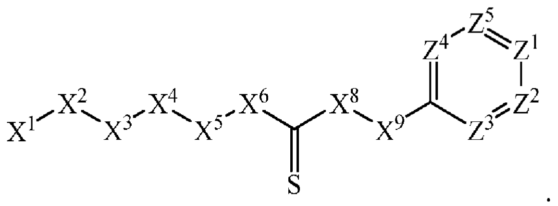
【化１０３】



【０１９０】

一部の実施形態において、X^7は－Ｃ（Ｓ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

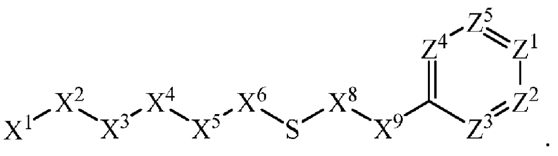
【化１０４】



【０１９１】

一部の実施形態において、Ｘ ^{7} は－Ｓ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

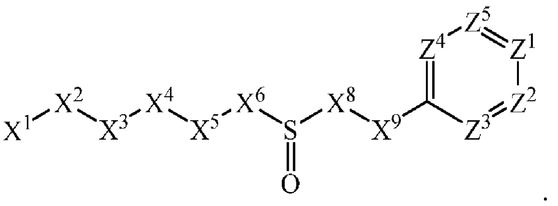
【化１０５】



【０１９２】

一部の実施形態において、Ｘ ^{7} は－Ｓ（Ｏ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

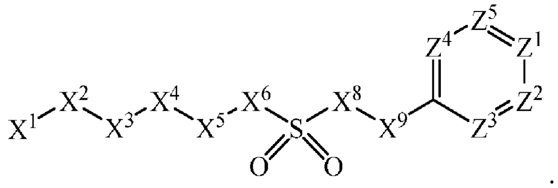
【化１０６】



【０１９３】

一部の実施形態において、Ｘ ^{7} は－Ｓ（Ｏ） $_{2}$ －である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

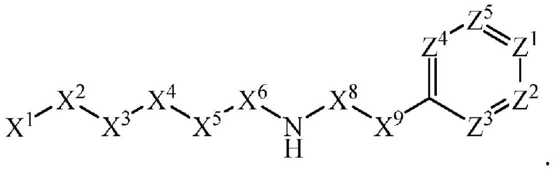
【化１０７】



【０１９４】

一部の実施形態において、Ｘ ^{7} は－ＮＨ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

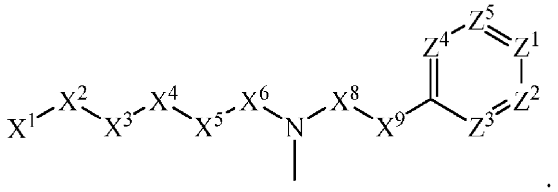
【化１０８】



【０１９５】

一部の実施形態において、Ｘ ^{7} は、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルで置換された－ＮＨ－である。一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{7} は、Ｃ $_{1}$ －アルキル（すなわち、メチル）で置換された－ＮＨ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

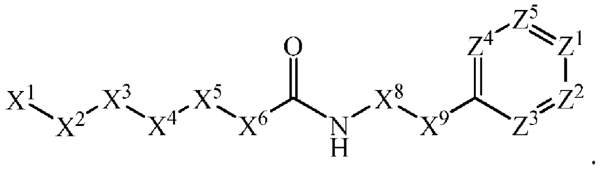
【化１０９】



【０１９６】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

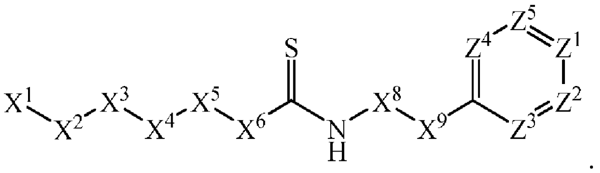
【化１１０】



【０１９７】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

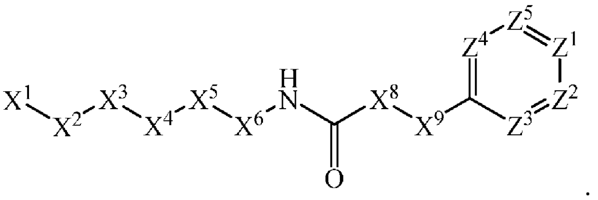
【化１１１】



【０１９８】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

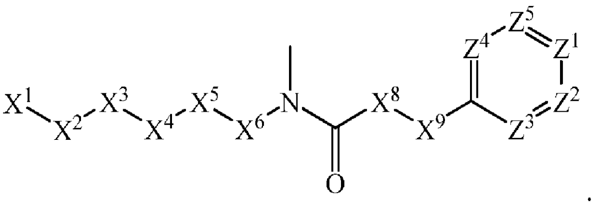
【化１１２】



【０１９９】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は、メチルで置換された－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

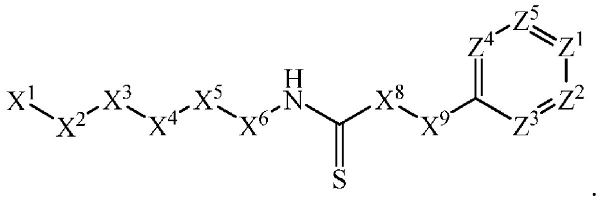
【化１１３】



【０２００】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

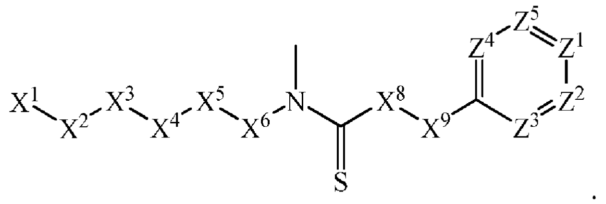
【化１１４】



【０２０１】

一部の実施形態において、Ｘ^{7}は、メチルで置換された－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－である。これらの実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化１１５】

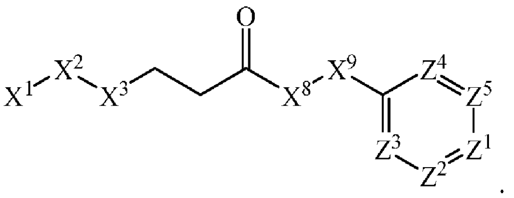


【０２０２】

Ｈ．Ｘ^4、Ｘ^5、Ｘ^6、およびＸ^{7}の好ましい実施形態

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

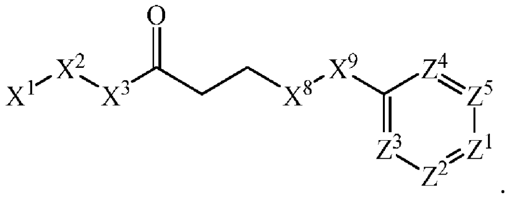
【化１１６】



【０２０３】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

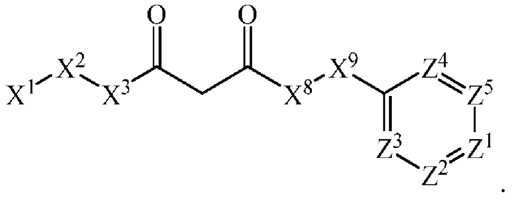
【化１１７】



【０２０４】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

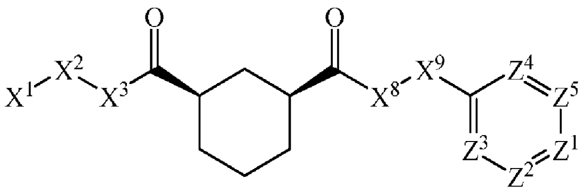
【化１１８】



【０２０５】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

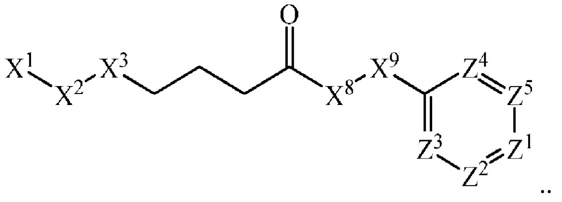
【化１１９】



【０２０６】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

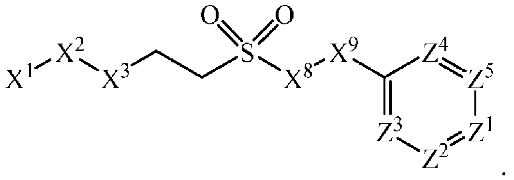
【化１２０】



【０２０７】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

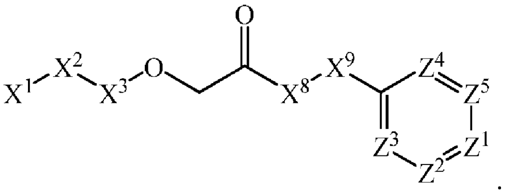
【化１２１】



【０２０８】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

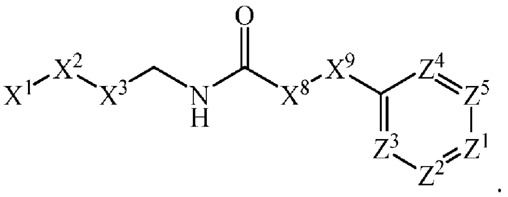
【化１２２】



【０２０９】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

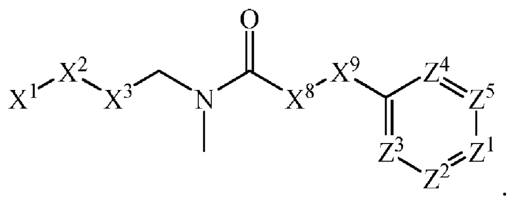
【化１２３】



【０２１０】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

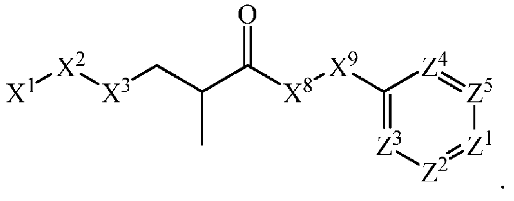
【化１２４】



【０２１１】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

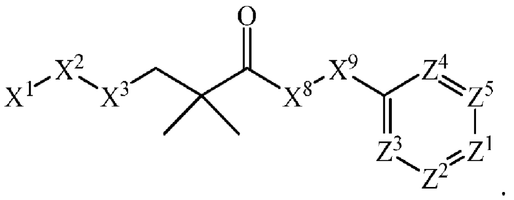
【化１２５】



【０２１２】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

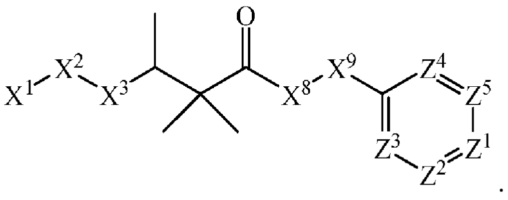
【化１２６】



【０２１３】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

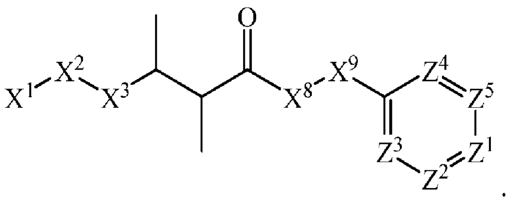
【化１２７】



【０２１４】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

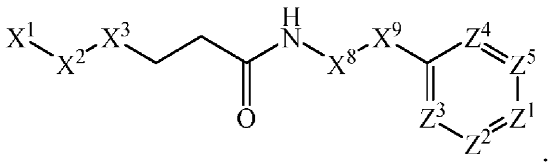
【化１２８】



【０２１５】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

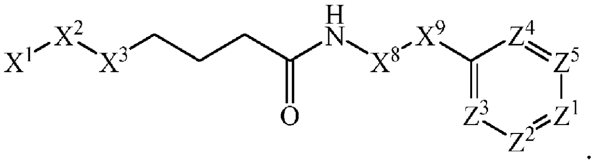
【化１２９】



【０２１６】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

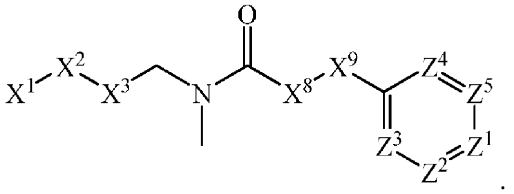
【化１３０】



【０２１７】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

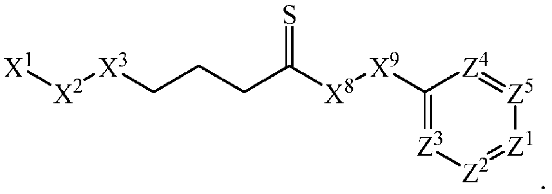
【化１３１】



【０２１８】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

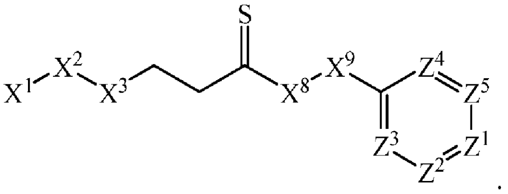
【化１３２】



【０２１９】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

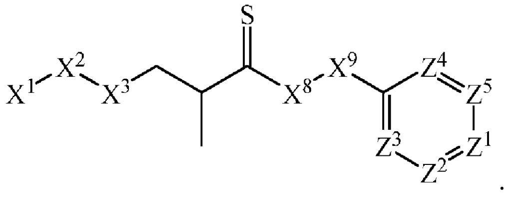
【化１３３】



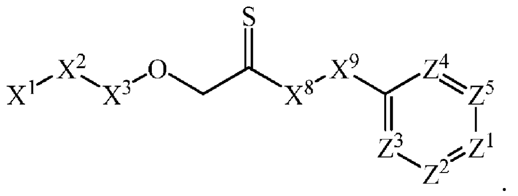
【０２２０】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。

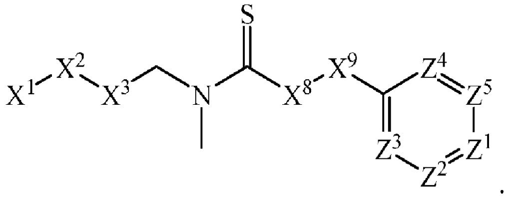
【化１３４】



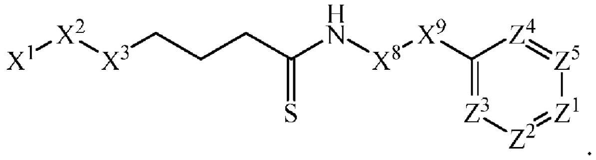
【０２２１】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。
【化１３５】



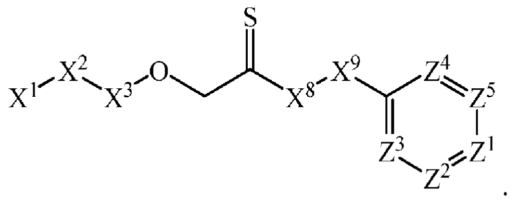
【０２２２】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。
【化１３６】



【０２２３】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。
【化１３７】



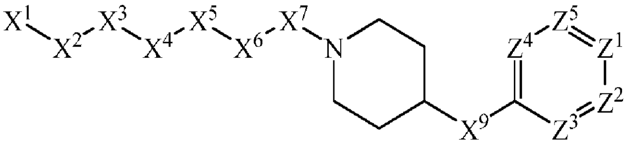
【０２２４】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当する。
【化１３８】



【０２２５】
Ｉ．Ｘ^{8}の好ましい実施形態
Ｘ^{8}は、ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニル、およびピロリジニルからなる群から選択される。前記ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニルまたはピロリジニルは、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良い。
【０２２６】
一部の実施形態において、Ｘ^{8}は、ピペリジニルまたはピロリジニルである。前記ピペリジニルまたはピロリジニルは、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良い。
【０２２７】
一部の実施形態において、Ｘ^{8}は、ピペリジニルまたはピロリジニルである。前記ピペリジニルまたはピロリジニルは、１以上の独立に選択されるＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで置換されていても良い。
【０２２８】
一部の実施形態において、Ｘ^{8}は、１以上の独立に選択されるＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルで

置換されていても良いピペリジニルである。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{8} はピペリジニルである。一部のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

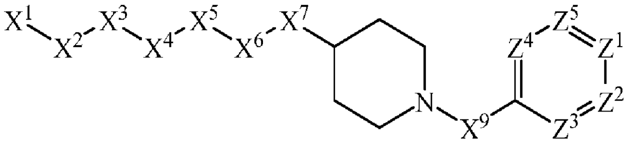
【化１３９】



【０２２９】

他のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

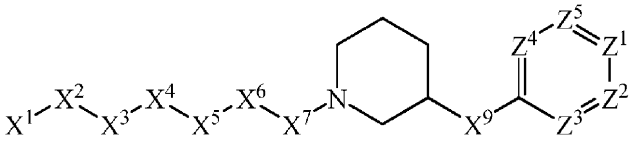
【化１４０】



【０２３０】

一部の実施形態において、Ｘ ^{8} は、１以上の独立に選択されるＣ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルで置換されていても良いピペリジニルである。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{8} はピペリジニルである。一部のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

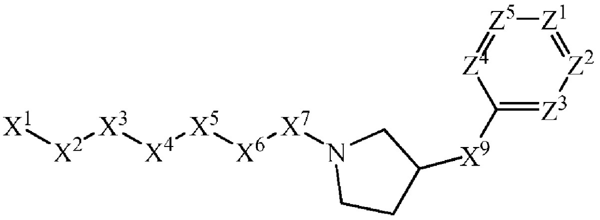
【化１４１】



【０２３１】

一部の実施形態において、Ｘ ^{8} は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良いピロリジニルである。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{8} はピロリジニルである。一部のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

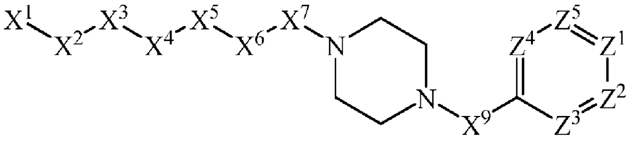
【化１４２】



【０２３２】

一部の実施形態において、Ｘ ^{8} は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良いピペラジニルである。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ ^{8} はピペラジニルである。一部のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

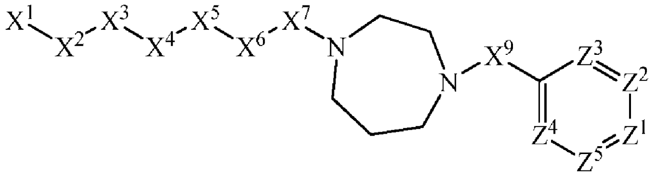
【化１４３】



【０２３３】

一部の実施形態において、Ｘ^{8}は、１以上の独立に選択されるアルキルで置換されていても良いホモピペラジニルである。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ^{8}はホモピペラジニルである。一部のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化１４４】



【０２３４】

Ｊ．Ｘ^{9}の好ましい実施形態

Ｘ^{9}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－、好ましくは－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－からなる群から選択される。ここで、前記－ＮＨ－は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

【０２３５】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は、結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－、好ましくは－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－からなる群から選択される。ここで、前記－ＮＨ－は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－炭素環、およびＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－炭素環－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

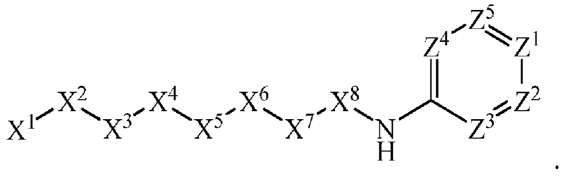
【０２３６】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は結合とは異なる。

【０２３７】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$－アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシＣ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－炭素環、およびＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－炭素環－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い－ＮＨ－である。そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。説明すると、一部のそのような実施形態において、Ｘ^{1}は－ＮＨ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

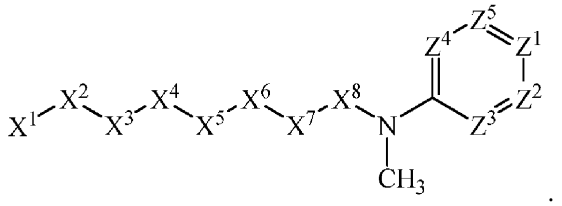
【化１４５】



【０２３８】

他のそのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

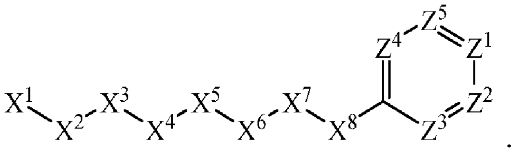
【化１４６】



【０２３９】

一部の実施形態において、例えば、Ｘ^{9}は単結合である。ここで、当該化合物は、下記式によって包含される。

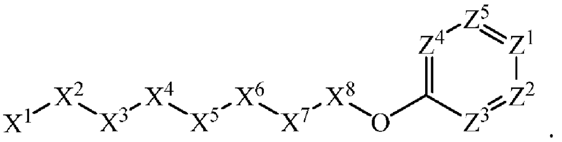
【化１４７】



【０２４０】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は－Ｏ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

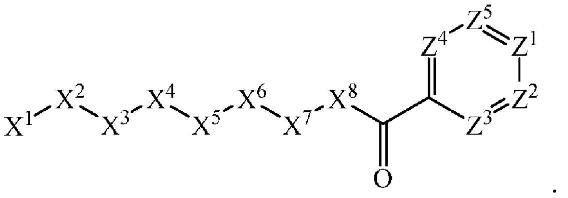
【化１４８】



【０２４１】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は－Ｃ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

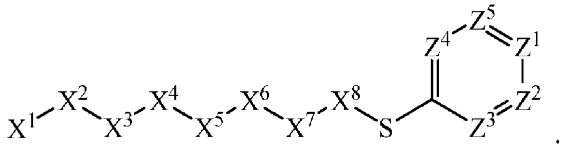
【化１４９】



【０２４２】

一部の実施形態において、Ｘ^{9}は－Ｓ－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

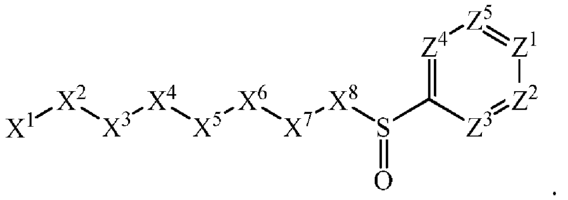
【化１５０】



【０２４３】

一部の実施形態において、Ｘ ^{9} は－Ｓ（Ｏ）－である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

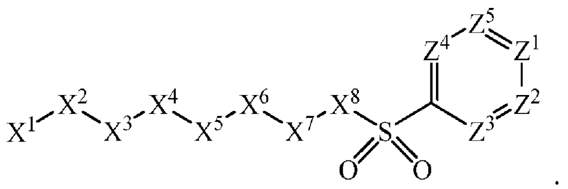
【化１５１】



【０２４４】

一部の実施形態において、Ｘ ^{9} は－Ｓ（Ｏ） $_{2}$ －である。そのような実施形態において、当該化合物は、下記式によって包含される。

【化１５２】



【０２４５】

Ｋ．Ｚ ^{1} 、Ｚ ^{2} 、Ｚ ^{3} 、Ｚ ^{4} 、およびＺ ^{5} の好ましい実施形態

Ｚ ^{1} は、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノスルホニル、アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記アミノスルホニルは、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良い。

【０２４６】

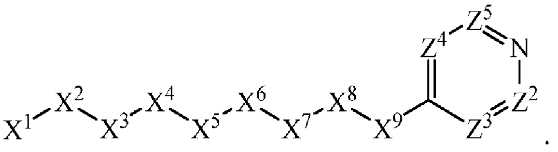
一部の実施形態において、Ｚ ^{1} は、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノスルホニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシ、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシカルボニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルスルファニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルスルフィニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。前記Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシ、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルコキシカルボニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルスルファニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキルスルフィニル、Ｃ $_{1}$ －Ｃ $_{6}$ －アルキ

ルスルホニル、アリール、アリールスルファニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリールスルフィニル、およびヘテロアリールスルホニルは、独立にハロゲンおよびC_1-C_6－アルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記アミノスルホニルは、２個以下の独立に選択されるC_1-C_6－アルキルで置換されていても良い。

【０２４７】

一部の実施形態において、Z^1はＮである。そのような実施形態は、下記構造によって包含される。

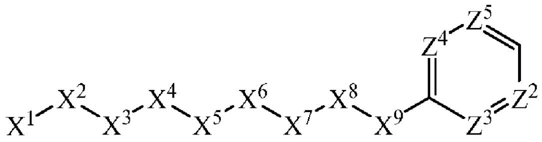
【化１５３】



【０２４８】

一部の実施形態において、Z^1は、置換されていても良いＣＨである。一部のそのような実施形態において、例えば、Z^1はＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

【化１５４】



【０２４９】

他の実施形態において、Z^1は、アルキルスルホニル、アルコキシ、シアノ、ハロアルキル、ハロゲン、ニトロ、ハロアリールスルホニル、ハロアルキルスルファニル、ハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、５員ヘテロアリール、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、およびジアルキルアミノスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されたＣＨであり、前記５員ヘテロアリールはC_1-C_6－アルキルで置換されていても良い。

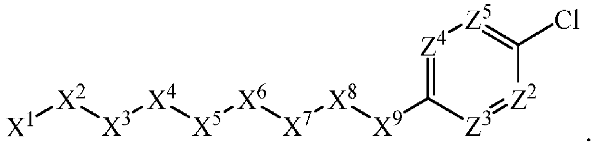
【０２５０】

一部の実施形態において、Z^1は、電子吸引性置換基で置換されたＣＨである。そのような置換基には、例えば、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ハロ－C_1-C_6－アルキル、ハロ－C_1-C_6－アルコキシ、およびハロ－C_1-C_6－アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、およびジアルキルアミノスルホニルなどがある。

【０２５１】

一部の実施形態において、Z^1は、ハロゲンで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Z^1は、クロロで置換されたＣＨである。これらの実施形態は、下記構造によって包含される。

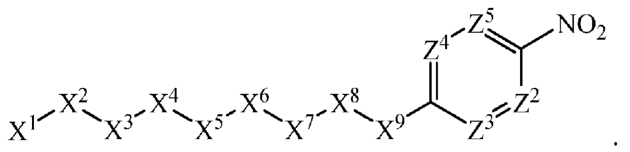
【化１５５】



【０２５２】

一部の実施形態において、Z^1は、ニトロで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

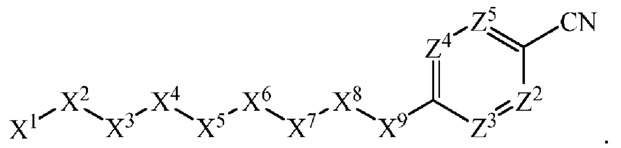
【化１５６】



【０２５３】

一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、シアノで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

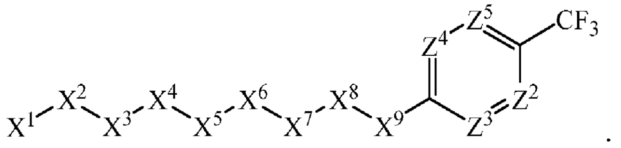
【化１５７】



【０２５４】

一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、トリフルオロ－Ｃ$_1$－アルキル（すなわち、トリフルオロメチル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

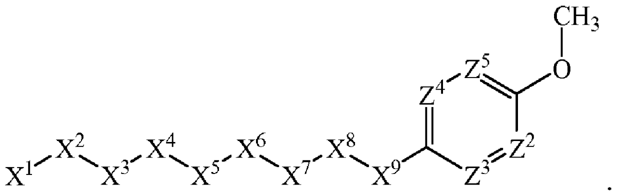
【化１５８】



【０２５５】

一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_1$－アルコキシ（すなわち、メトキシ）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

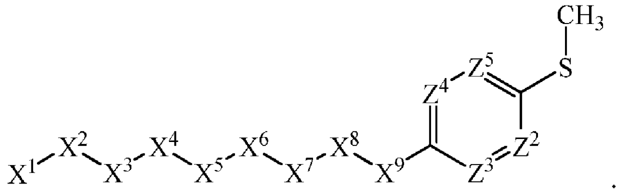
【化１５９】

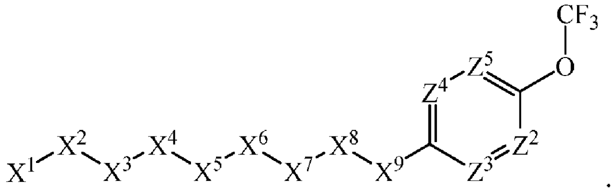


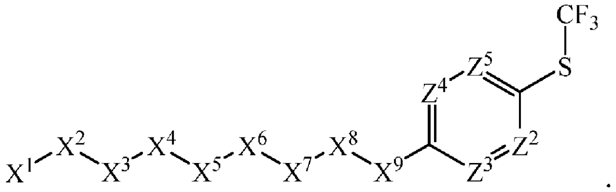
【０２５６】

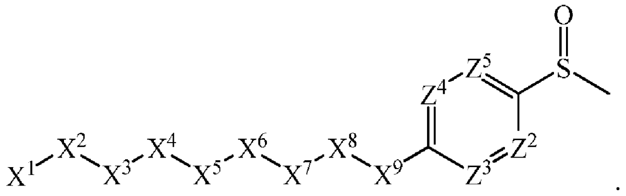
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は。Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_1$－アルキルスルファニル（すなわち、メチルスルフィニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

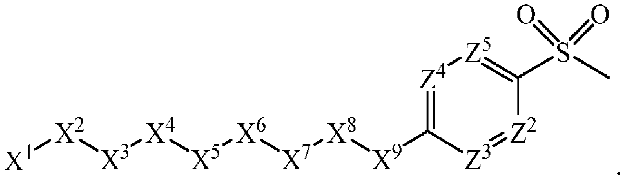
【化１６０】



【０２５７】
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、ハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルコキシで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、フルオロ－Ｃ$_{1}$－アルコキシで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１６１】


【０２５８】
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、ハロ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルスルファニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、フルオロ－Ｃ$_{1}$－アルキルスルファニルで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１６２】


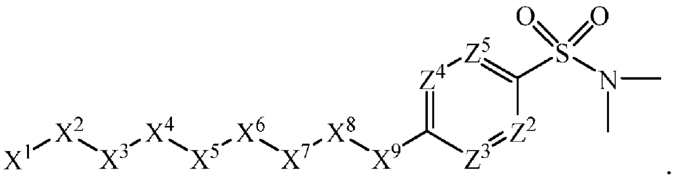
【０２５９】
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルスルフィニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_{1}$－アルキルスルフィニル（すなわち、メチルスルフィニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１６３】


【０２６０】
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルスルホニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、Ｃ$_{1}$－アルキルスルホニル（すなわち、メチルスルホニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１６４】


【０２６１】
一部の実施形態において、Ｚ^{1}は、ジ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－アルキルアミノスルホニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{1}は、ジ－Ｃ$_{1}$－ア

ルキルアミノスルホニル（すなわち、ジメチルアミノスルホニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

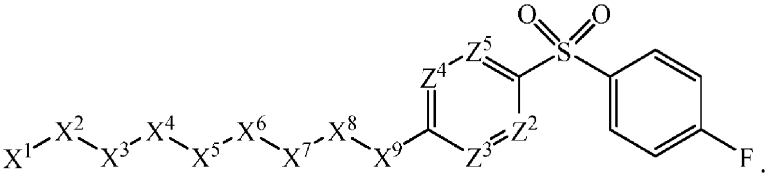
【化１６５】



【０２６２】

一部の実施形態において、Z^1は、ハロアリールスルホニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Z^1は、４－フルオロ－フェニル－スルホニルで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

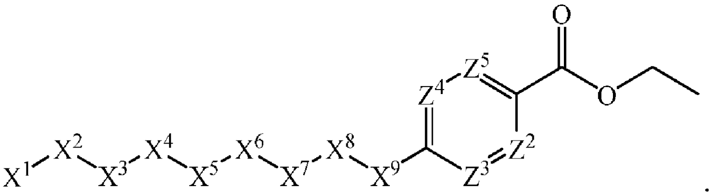
【化１６６】



【０２６３】

一部の実施形態において、Z^1は、C_1－C_6－アルコキシカルボニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Z^1は、C_2－アルコキシカルボニル（すなわち、エトキシカルボニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

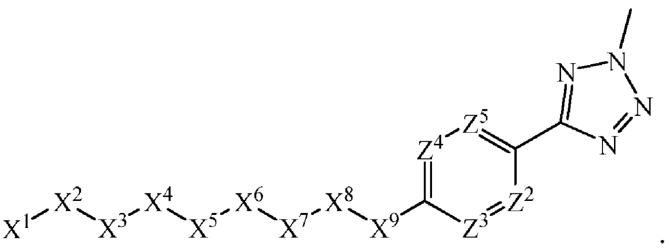
【化１６７】



【０２６４】

一部の実施形態において、Z^1は、C_1－C_6－アルキルで置換されていても良いヘテロアリールで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Z^1は、メチルテトラゾイルで置換されたＣＨであり、下記構造によって包含される。

【化１６８】



【０２６５】

Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。

【０２６６】

一部の実施形態において、Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、シアノ、ハロゲン、ニトロ、C_1－C_6－アルキル、C_1－C_6－アルコキシ、ハロ

－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－スルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。

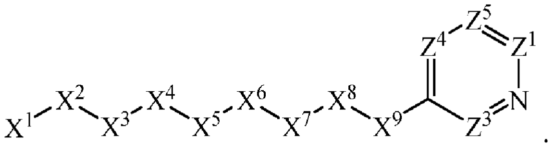
【０２６７】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、シアノ、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－スルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。

【０２６８】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

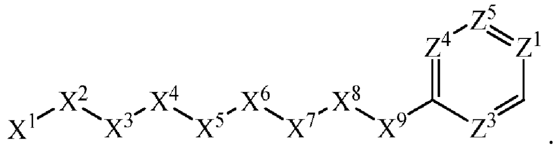
【化１６９】



【０２６９】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}は、シアノ、ハロゲン、ニトロ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、およびハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されたＣＨである。一部のそのような実施形態において、例えば、Ｚ^{2}はＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

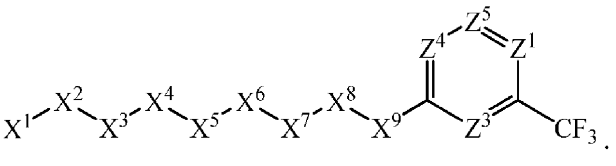
【化１７０】



【０２７０】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}は、ハロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{2}は、フルオロ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルで置換されたＣＨである。説明すると、Ｚ^{2}は、例えば、トリフルオロメチルで置換されたＣＨであることができることで、当該化合物は下記構造によって包含される。

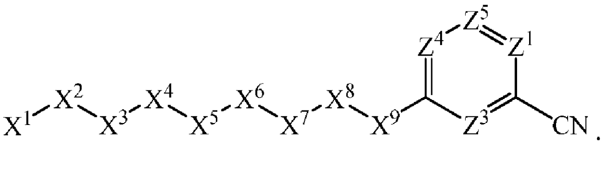
【化１７１】



【０２７１】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}は、シアノで置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

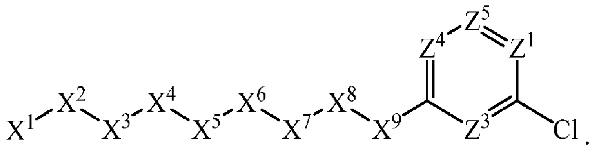
【化１７２】



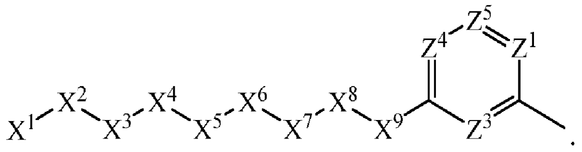
【０２７２】

一部の実施形態において、Ｚ^{2}は、ハロゲンで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ^{2}は、クロロで置換されたＣＨである。これらの実施形

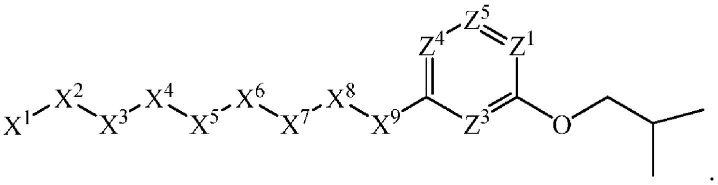
態は、下記構造によって包含される。
【化１７３】



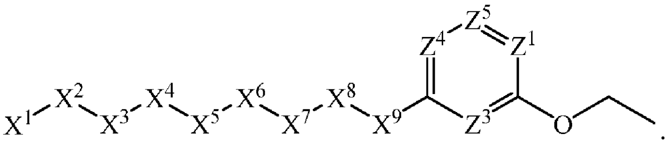
【０２７３】
一部の実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_1$ －Ｃ $_6$ －アルキルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_1$ －アルキル（すなわち、メチル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７４】



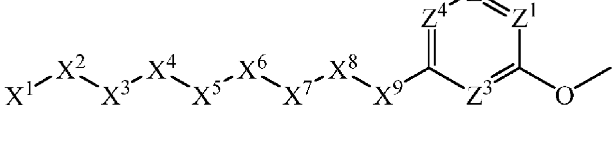
【０２７４】
一部の実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_1$ －Ｃ $_6$ －アルコキシで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_4$ －アルコキシ（例えば、イソブトキシ）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７５】



【０２７５】
他のそのような実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_2$ －アルコキシ（例えば、エトキシ）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７６】

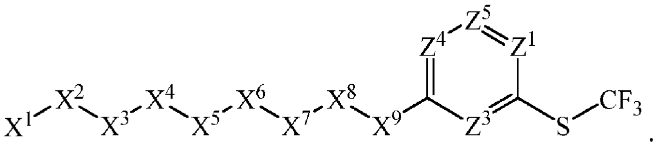


【０２７６】
さらに他のそのような実施形態において、Ｚ ^{2} は、Ｃ $_1$ －アルコキシ（例えば、メトキシ）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７７】

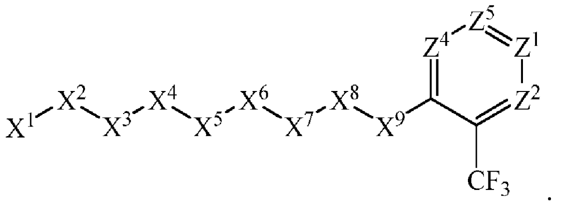


【０２７７】
一部の実施形態において、Ｚ ^{2} は、ハロ－Ｃ $_1$ －Ｃ $_6$ －アルキルスルファニルで置換されたＣＨである。例えば、一部のそのような実施形態において、Ｚ ^{2} は、フルオロ－Ｃ $_1$

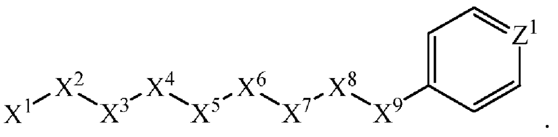
－C_6－アルキルスルファニル（例えば、トリフルオロメチルスルファニル）で置換されたＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７８】



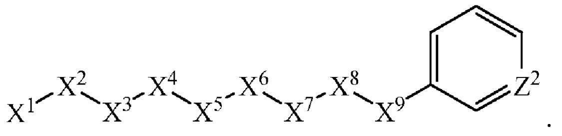
【０２７８】
Z^3、Z^4、およびZ^5のそれぞれは、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。
【０２７９】
一部の実施形態において、Z^3、Z^4、およびZ^5のそれぞれは、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。前記ＣＨは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C_1－C_6－アルキル、C_1－C_6－アルコキシ、C_1－C_6－アルキルスルファニル、ハロ－C_1－C_6－アルキル、ハロ－C_1－C_6－アルコキシ、およびハロ－C_1－C_6－アルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良い。
【０２８０】
一部の実施形態において、Z^3はハロ－C_1－C_6－アルキルである。例えば、一部のそのような実施形態において、Z^3はトリフルオロメチルである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１７９】



【０２８１】
一部の実施形態において、Z^2、Z^3、Z^4、およびZ^5はそれぞれＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１８０】

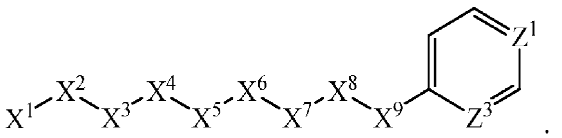


【０２８２】
一部の実施形態において、Z^1、Z^3、Z^4、およびZ^5はそれぞれＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。
【化１８１】



【０２８３】
一部の実施形態において、Z^2、Z^4、およびZ^5は、それぞれＣＨである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

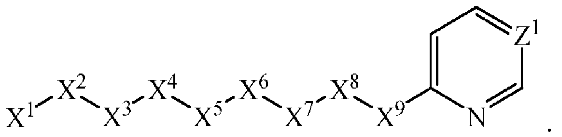
【化１８２】



【０２８４】

一部の実施形態において、Ｚ２、Ｚ４、およびＺ５は、それぞれＣＨであり、Ｚ３はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

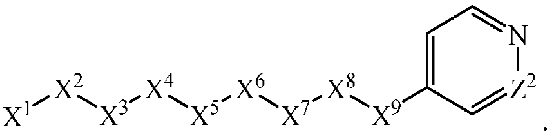
【化１８３】



【０２８５】

一部の実施形態において、Ｚ３、Ｚ４、およびＺ５は、それぞれＣＨであり、Ｚ１はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

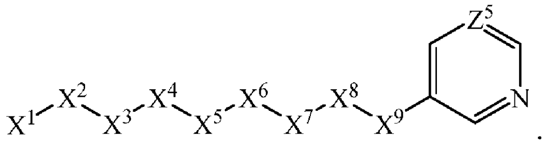
【化１８４】



【０２８６】

一部の実施形態において、Ｚ１、Ｚ３、およびＺ４は、それぞれＣＨであり、Ｚ２はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

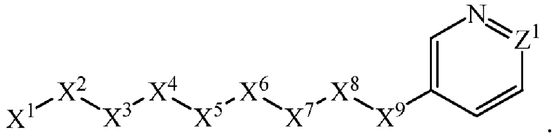
【化１８５】



【０２８７】

一部の実施形態において、Ｚ２、Ｚ４、およびＺ５は、それぞれＣＨであり、Ｚ５はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

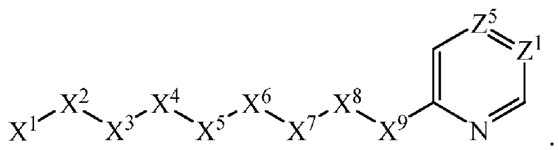
【化１８６】



【０２８８】

一部の実施形態において、Ｚ２およびＺ４は、それぞれＣＨであり、Ｚ３はＮである。そのような実施形態は、下記の構造によって包含される。

【化１８７】



【０２８９】

Ｌ．Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、およびＺ５の好ましい実施形態

一部の実施形態において、Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、およびＺ５でＮであるものはない。一部のそのような実施形態において、Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、およびＺ５がそれらが

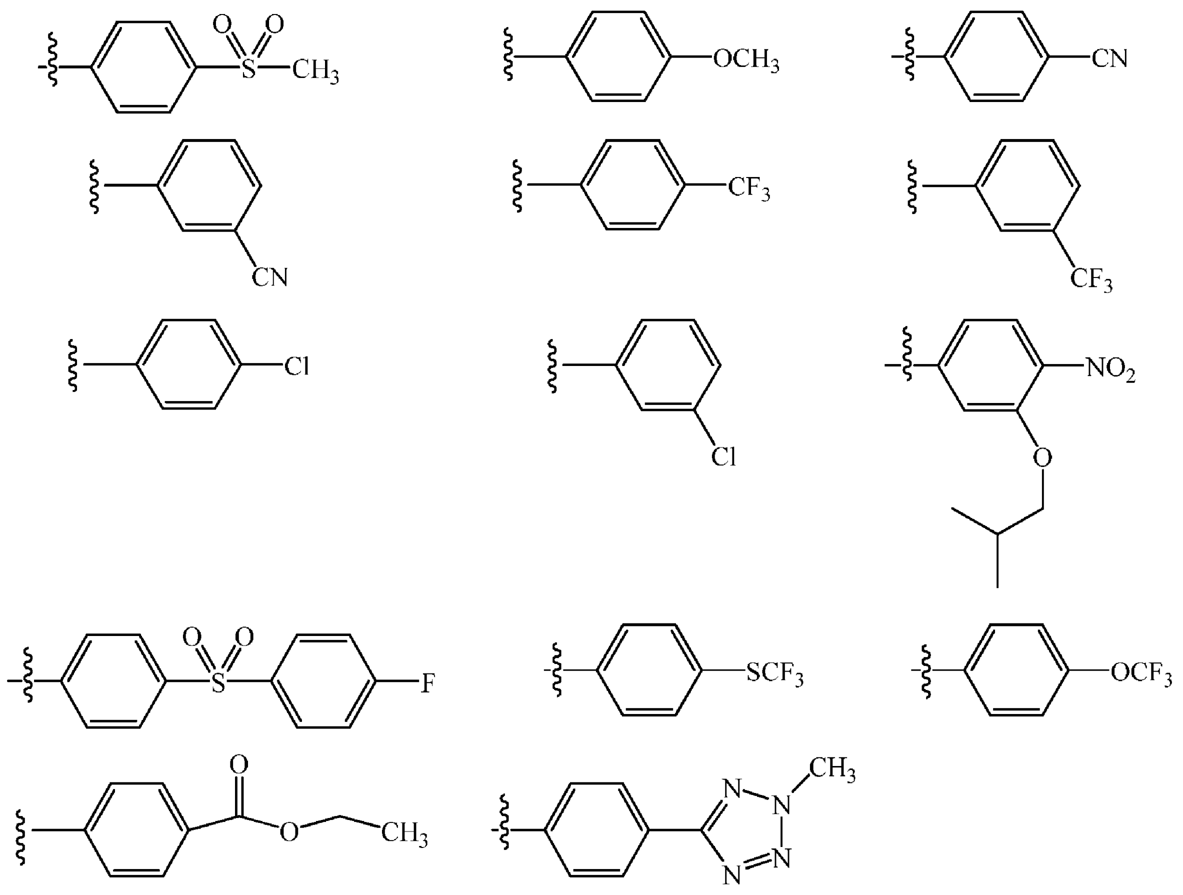
結合している原子とともに６員環を形成しており、Z^1、Z^2、Z^3、Z^4、およびZ^5のうち置換されたＣＨであるのは一つのみである。表ＩＩに、そのような基の例を示してある。

【０２９０】

表ＩＩ

Z^1、Z^2、Z^3、Z^4、およびZ^5の例

【化１８８】



【０２９１】

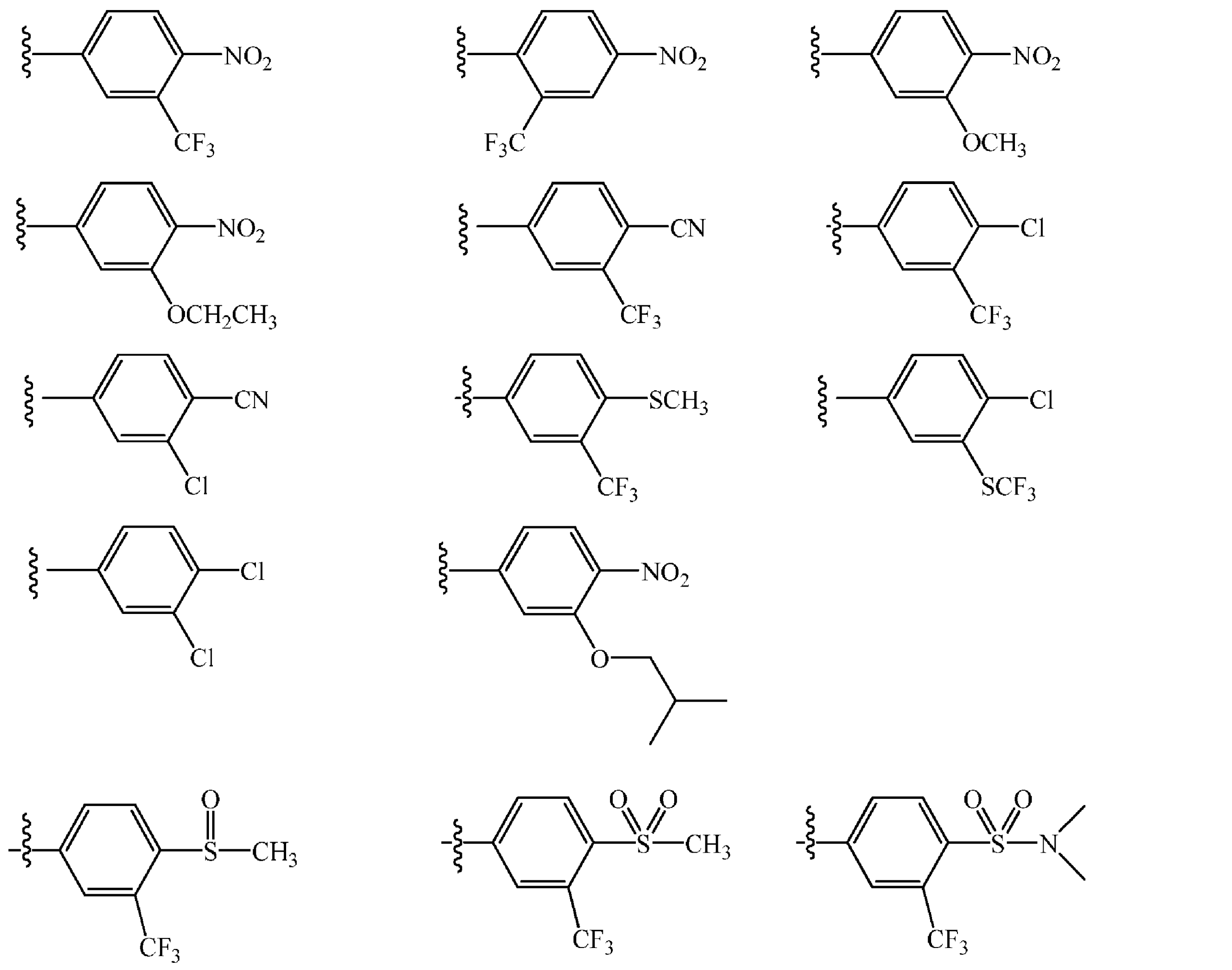
他のそのような実施形態において、Z^1、Z^2、Z^3、Z^4、およびZ^5のうち置換されたＣＨであるのは二つのみである。表ＩＩＩに、そのような基の例を示してある。

【０２９２】

表ＩＩＩ

Z^1、Z^2、Z^3、Z^4、およびZ^5の例

【化１８９】



【０２９３】

一部の実施形態において、Z^{1}、Z^{2}、Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}のうちの少なくとも一つがＮである。

【０２９４】

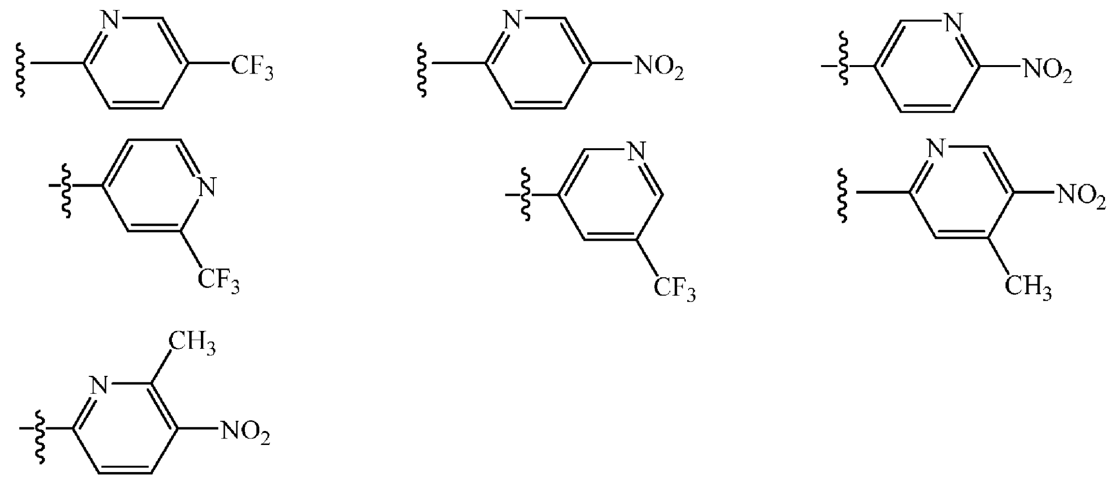
一部の実施形態において、Z^{1}、Z^{2}、Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}のうちの二つが、それぞれＮである。他の実施形態において、Z^{1}、Z^{2}、Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}のうちの一つのみがＮである。表ＩＶに、そのような基の例を示してある。

【０２９５】

表ＩＶ

Z^{1}、Z^{2}、Z^{3}、Z^{4}、およびZ^{5}の例

【化１９０】

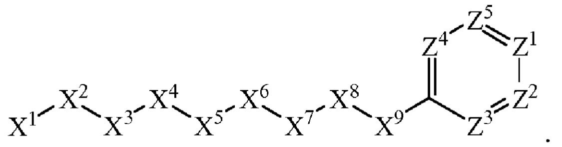


【０２９６】

Ｍ．各種の具体的な好ましい実施形態の例

本発明の一部の実施形態において、その化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化１９１】



【０２９７】

一部のそのような実施形態において、

Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびアルキルからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは、ハロアルキルで置換されており；

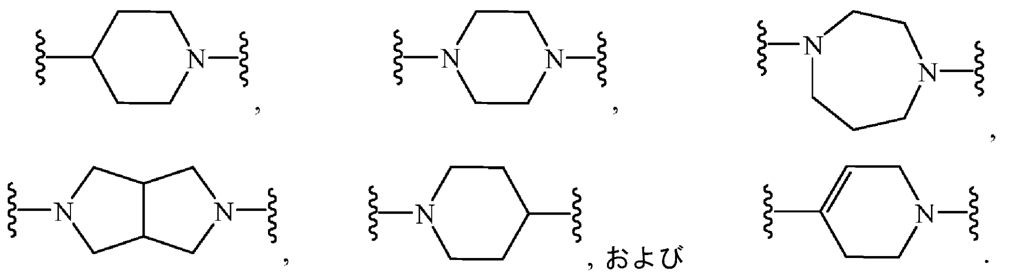
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、独立にアルキル、ハロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、フェニルアルコキシ、アリール、シアノおよびフェノキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

前記フェニルアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{2}は、結合、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；

Ｘ^{3}は、

【化１９２】



【０２９８】

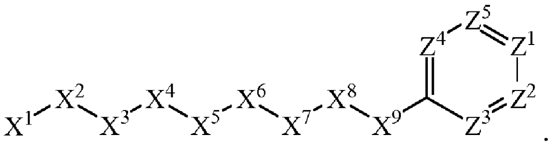
からなる群から選択され；

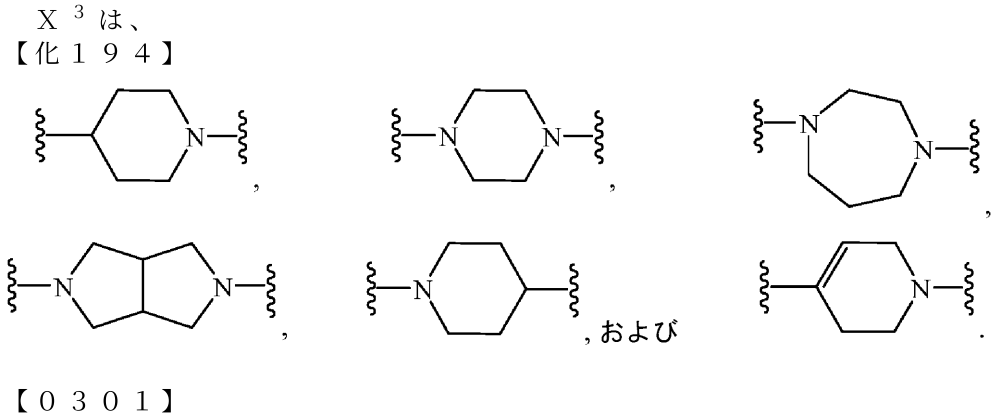
Ｘ^{4}は、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}は、結合、－ＣＨ$_2$－およびシクロアルキルからなる群から選択され、前記－ＣＨ

$_2$－は２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され；
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－は、アルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{8}は、ピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニル、およびピロリジニルからなる群から選択され；
Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Ｚ^3、Ｚ^4、およびＺ^{5}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。

【０２９９】
本発明の一部の実施形態において、前記化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化１９３】


【０３００】
一部のそのような実施形態において、
Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびアルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、ハロアルキルで置換され；
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、独立にアルキル、ハロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、フェニルアルコキシ、アリール、シアノおよびフェノキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
前記フェニルアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{2}は、結合、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；
Ｘ^{3}は、
【化１９４】


【０３０１】

からなる群から選択され；

X^4は、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^5は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

X^6は、結合、－ＣＨ$_2$－およびシクロアルキルからなる群から選択され、前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^7は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－は、アルキルで置換されていても良く；

X^8は、ピペリジニルまたはピロリジニルであり；

Z^1は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

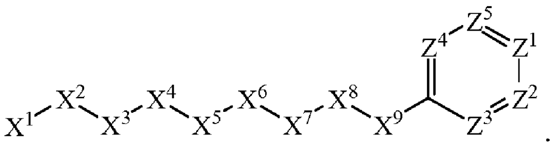
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、およびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Z^3、Z^4、およびZ^5は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。

【０３０２】

本発明の一部の実施形態において、前記化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化１９５】



【０３０３】

一部のそのような実施形態において

当該化合物は、鏡面対称面を持たない。

【０３０４】

一部のそのような実施形態において、

X^9は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良い。

【０３０５】

一部のそのような実施形態において、

X^9は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３０６】

一部のそのような実施形態において、
X^4、X^5、X^6のうちの少なくとも一つが結合と異なり、$-CH_2-$と異なり、またはX^7が$-CH_2-$と異なる。
【０３０７】
一部のそのような実施形態において、
X^4、X^5、X^6のうちの少なくとも一つが結合と異なり、$-CH_2-$と異なり、またはX^7が$-CH_2-$と異なり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。
【０３０８】
一部のそのような実施形態において、
X^1は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびC_3-C_6−アルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、１以上のアルキルによって置換されていても良く；
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、アルキル、ハロゲン、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリール、シアノおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によってメタおよびパラ位で置換されていても良く、
前記アルキルおよびアルコキシは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
前記フェニルは、オルト位で１個もしくは２個の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
X^2は、結合、$-CH_2-O-$、$-C(O)-$、$-N(H)-$および$-C(S)-$からなる群から選択され；
X^4は、結合、$-CH_2-$、$-O-$、および$-C(O)-$からなる群から選択され、
前記$-CH_2-$は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^5は、結合および$-CH_2-$からなる群から選択され；
X^6は、結合、$-CH_2-$およびシクロアルキルからなる群から選択され、
前記$-CH_2-$は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^7は、$-C(O)-$、$-C(S)-$、$-NH-C(O)-$、$-C(O)-NH-$、$-C(S)-NH-$、$-S(O)_2-$および$-C(O)-NH-$からなる群から選択され、
前記$-NH-C(O)-$および$-NH-C(S)-$は、アルキルで置換されていても良く；
X^8は、ピペリジニルまたはピロリジニルであり；
X^9は、$-O-$、$-C(O)-$、$-S-$、$-S(O)-$、$-S(O)_2-$、および$-NH-$からなる群から選択され、前記$-NH-$はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
Z^1は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；
Ｚ^{5}はＣＨである。
【０３０９】
一部のそのような実施形態において、
Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、１以上のアルキルによって置換されていても良く；
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリール、シアノおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く；
前記アルキルおよびアルコキシは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
前記フェニルは、オルト位で１個もしくは２個の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
Ｘ^{2}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；
Ｘ^{4}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；
Ｘ^{6}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－およびシクロアルキルからなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－は、アルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{8}は、ピペリジニルまたはピロリジニルであり；
Ｘ^{9}は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；
Ｚ^{5}はＣＨであり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。
【０３１０】
一部のそのような実施形態において、
Ｘ^{1}は、ハロゲン、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルオキシ、（Ｃ$_{1}$

－C_6）ハロアルキル、（C_1－C_6）ハロアルキルオキシ、フェニルオキシ、ハロフェニルオキシ、ベンジルオキシおよびハロベンジルオキシ、好ましくは（C_1－C_6）アルキル、（C_1－C_6）アルキルオキシ、（C_1－C_6）ハロアルキル、（C_1－C_6）ハロアルキルオキシによって置換されているフェニル、ピリジルおよびチアジアゾイルからなる群から選択され；

X^2は結合であり；

X^3はピペラジニルであり；

X^4は－CH_2－であり；

X^5は－CH_2－および－CH（C_1－C_6）アルキルからなる群から選択され；

X^6は－CH_2－および結合からなる群から選択され；

X^7はCOまたはCSであり；

X^8はピペリジニルであり；

X^9はNHまたはS、好ましくはNHであり；

Z^1は、C－NO_2、C－CN、C－S－（C_1－C_6）アルキルおよびC－S－（C_1－C_6）ハロアルキル、好ましくはC－NO_2またはC－CNからなる群から選択され；

Z^2はC－CF_3またはCHであり；

Z^3はCHまたはNであり；

Z^4はCHであり；

Z^5はCHである。

【０３１１】

一部のそのような実施形態において、

X^1は、ハロゲン、（C_1－C_6）アルキル、（C_1－C_6）アルキルオキシ、（C_1－C_6）ハロアルキル、（C_1－C_6）ハロアルキルオキシ、フェニルオキシ、ハロフェニルオキシ、ベンジルオキシおよびハロベンジルオキシ、好ましくは（C_1－C_6）アルキル、（C_1－C_6）アルキルオキシ、（C_1－C_6）ハロアルキル、（C_1－C_6）ハロアルキルオキシによって置換されたフェニル、ピリジルおよびチアジアゾイルからなる群から選択され；

X^2は結合であり；

X^3はピペラジニルであり；

X^4は－CH_2－であり；

X^5は、－CH_2－および－CH（C_1－C_6）アルキルからなる群から選択され；

X^6は、－CH_2－および結合からなる群から選択され；

X^7はCOまたはCSであり；

X^8はピペリジニルであり；

X^9はNHまたはS、好ましくはNHであり；

Z^1は、C－NO_2、C－CN、C－S－（C_1－C_6）アルキルおよびC－S－（C_1－C_6）ハロアルキル、好ましくはC－NO_2またはC－CNからなる群から選択され；

Z^2はC－CF_3またはCHであり；

Z^3はCHまたはNであり；

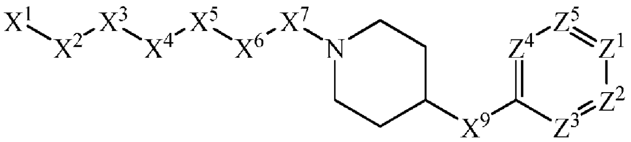
Z^4はCHであり；

Z^5はCHであり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３１２】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化１９６】



【０３１３】

一部のそのような実施形態において、

当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３１４】

一部のそのような実施形態において、

X^9は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも１以上の独立に選択されるハロゲン、で置換されていても良い。

【０３１５】

一部のそのような実施形態において、

X^9は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３１６】

一部のそのような実施形態において、

X^4、X^5、X^6のうちの少なくとも一つが結合と異なり、－ＣＨ$_2$－と異なり、またはX^7は－ＣＨ$_2$－と異なる。

【０３１７】

一部のそのような実施形態において、

X^4、X^5、X^6のうちの少なくとも一つが結合と異なり、－ＣＨ$_2$－と異なり、またはX^7は－ＣＨ$_2$－と異なり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３１８】

一部のそのような実施形態において、

X^1は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびＣ$_3$－Ｃ$_6$－アルキルからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは１以上のアルキルによって置換されていても良く、

前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリール、シアノおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く；

前記アルキルおよびアルコキシは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；

前記フェニルは、オルト位で１個もしくは２個の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

X^2は、結合、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；

X^4は、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

X^5は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

X^6は、結合、－ＣＨ$_2$－およびシクロアルキルからなる群から選択され；
前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^7は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－は、アルキルで置換されていても良く；
X^9は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
Z^1は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Z^3およびZ^4は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；
Z^5はＣＨである。
【０３１９】
一部のそのような実施形態において、
X^1は、フェニル、５員ヘテロアリール、６員ヘテロアリールおよびＣ$_3$－Ｃ$_6$－アルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、１以上のアルキルによって置換されていても良く；
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリール、シアノおよびアリールオキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、
前記アルキルおよびアルコキシは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
前記フェニルは、オルト位で１個もしくは２個の独立に選択されるハロゲンによって置換されていても良く；
X^2は、結合、－ＣＨ$_2$－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｈ）－および－Ｃ（Ｓ）－からなる群から選択され；
X^4は、結合、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^5は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；
X^6は、結合、－ＣＨ$_2$－およびシクロアルキルからなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^7は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－および－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－および－ＮＨ－Ｃ（Ｓ）－は、アルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{9}は、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、および－ＮＨ－からなる群から選択され、前記－ＮＨ－はアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、炭素環、および炭素環アルキルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、そのような置換基はいずれも、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；

Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリール、アミノスルホニルおよびアルコキシカルボニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールおよびアミノスルホニルは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；

Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルスルファニルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択され；

Ｚ^{5}はＣＨであり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

【０３２０】

一部のそのような実施形態において、

Ｘ^{1}は、ハロゲン、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルオキシ、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキルオキシ、フェニルオキシ、ハロフェニルオキシ、ベンジルオキシおよびハロベンジルオキシ、好ましくは（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルオキシ、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキルオキシによって置換されたフェニル、ピリジルおよびチアジアゾイルからなる群から選択され；

Ｘ^{2}は結合であり；

Ｘ^{3}はピペラジニルであり；

Ｘ^{4}は－ＣＨ$_{2}$－であり；

Ｘ^{5}は、－ＣＨ$_{2}$－および－ＣＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルからなる群から選択され；

Ｘ^{6}は、－ＣＨ$_{2}$－および結合からなる群から選択され；

Ｘ^{7}はＣＯまたはＣＳであり；

Ｘ^{8}はピペリジニルであり；

Ｘ^{9}はＮＨまたはＳ、好ましくはＮＨであり；

Ｚ^{1}は、Ｃ－ＮＯ$_{2}$、Ｃ－ＣＮ、Ｃ－Ｓ－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルおよびＣ－Ｓ－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、好ましくはＣ－ＮＯ$_{2}$またはＣ－ＣＮからなる群から選択され；

Ｚ^{2}はＣ－ＣＦ$_{3}$またはＣＨであり；

Ｚ^{3}はＣＨまたはＮであり；

Ｚ^{4}はＣＨであり；

Ｚ^{5}はＣＨである。

【０３２１】

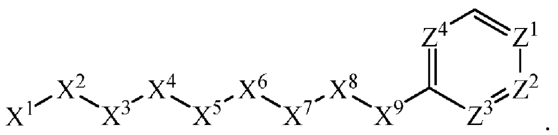
一部のそのような実施形態において、

Ｘ^{1}は、ハロゲン、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルオキシ、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキルオキシ、フェニルオキシ、ハロフェニルオキシ、ベンジルオキシおよびハロベンジルオキシ、好ましくは（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルオキシ、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキルオキシによって置換されたフェニル、ピリジルおよびチアジアゾイルからなる群から選択され；

Ｘ^{2}は結合であり；
Ｘ^{3}はピペラジニルであり；
Ｘ^{4}は－ＣＨ$_{2}$－であり；
Ｘ^{5}は、－ＣＨ$_{2}$－および－ＣＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルからなる群から選択され；
Ｘ^{6}は、－ＣＨ$_{2}$－および結合からなる群から選択され１
Ｘ^{7}はＣＯまたはＣＳであり；
Ｘ^{8}はピペリジニルであり；
Ｘ^{9}はＮＨまたはＳ、好ましくはＮＨであり；
Ｚ^{1}は、Ｃ－ＮＯ$_{2}$、Ｃ－ＣＮ、Ｃ－Ｓ－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキルおよびＣ－Ｓ－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）ハロアルキル、好ましくはＣ－ＮＯ$_{2}$またはＣ－ＣＮからなる群から選択され；
Ｚ^{2}はＣ－ＣＦ$_{3}$またはＣＨであり；
Ｚ^{3}はＣＨまたはＮであり；
Ｚ^{4}はＣＨであり；
Ｚ^{5}はＣＨであり、当該化合物は鏡面対称面を持たない。

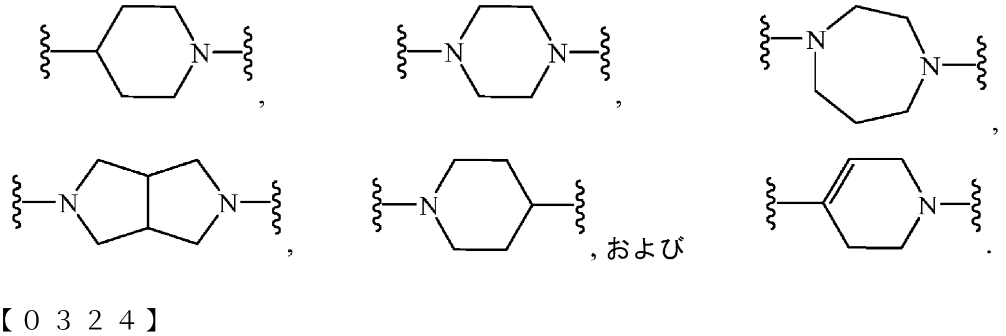
【０３２２】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化１９７】



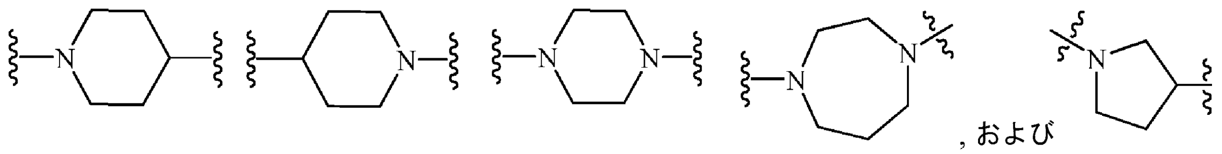
【０３２３】
一部のそのような実施形態において、
Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリール、およびＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、によって１以上のアルキル置換されていても良く、
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、アリールアルコキシおよびシアノからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
前記フェニルは、オルト位で１以上のハロゲンで置換されていても良く；
Ｘ^{2}は、結合、－Ｃ（Ｏ）－、および－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－からなる群から選択され；
Ｘ^{3}は、

【化１９８】

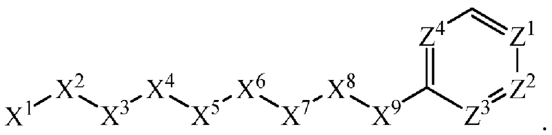


【０３２４】
からなる群から選択され；
Ｘ^{4}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても

良く；
X^5は、結合および－CH_2－からなる群から選択され；
X^6は、結合および－CH_2－からなる群から選択され、
前記－CH_2－は、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
X^7は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、Ｓ（Ｏ）$_2$、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－は、アルキルで置換されていても良く；
X^8は、
【化１９９】

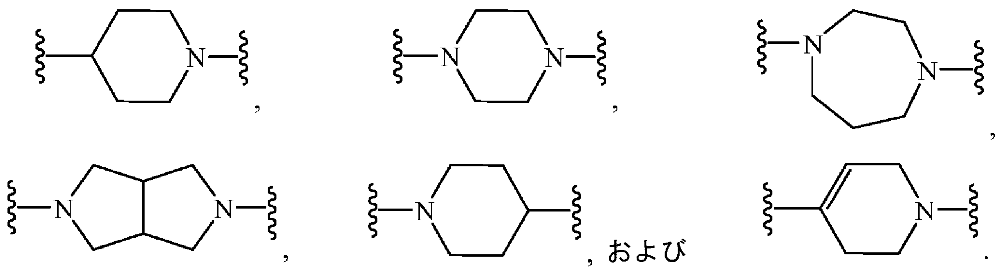


【０３２５】
からなる群から選択され；
X^9は、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；
Z^1は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルファニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Z^2は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Z^3およびZ^4は独立に、ＮおよびＣＨからなる群から選択される。
【０３２６】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２００】

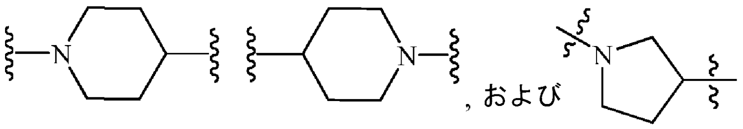


【０３２７】
一部のそのような実施形態において、
X^1は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリール、およびC_3－C_6－アルキルからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールは、１以上のアルキルによって置換されていても良く、
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く、
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位でアルキル、ハロゲン、アリールオキシ、アルコキシ、アリールアルコキシおよびシアノからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く、
前記アルキルは、１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていても良く；
前記アリールアルコキシは、１以上のハロアルキルで置換されていても良く；
前記フェニルは、オルト位で１以上のハロゲンによって置換されていても良く；

Ｘ^{2}は、結合、－Ｃ（Ｏ）－、および－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－からなる群から選択され；
Ｘ^{3}は、
【化２０１】

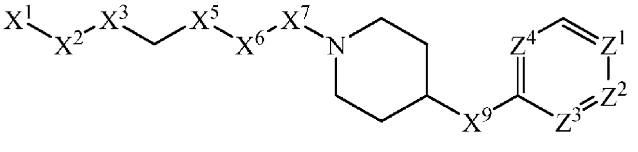


【０３２８】
からなる群から選択され；
Ｘ^{4}は、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、および－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；
Ｘ^{6}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され、
前記－ＣＨ$_{2}$－は、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、Ｓ（Ｏ）$_{2}$、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－は、アルキルで置換されていても良く；
Ｘ^{8}は、
【化２０２】



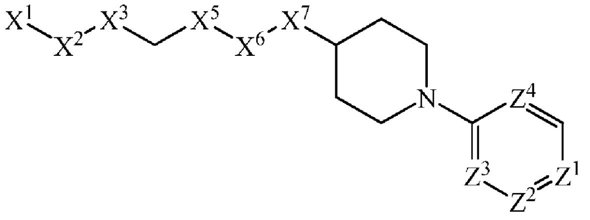
【０３２９】
からなる群から選択され；
Ｘ^{9}は、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；
Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルファニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、
前記アルキル、アルコキシ、アルキルスルファニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、および５員ヘテロアリールは、独立にハロゲンおよびアルキルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、ハロアルキルおよびハロアルキルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{3}およびＺ^{4}は独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。
【０３３０】
一部の実施形態において、当該化合物またはそれの塩は、下記のものからなる群から選択される構造に相当する。

【化２０３】



(I-8)

および



(I-9),

【０３３１】

Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

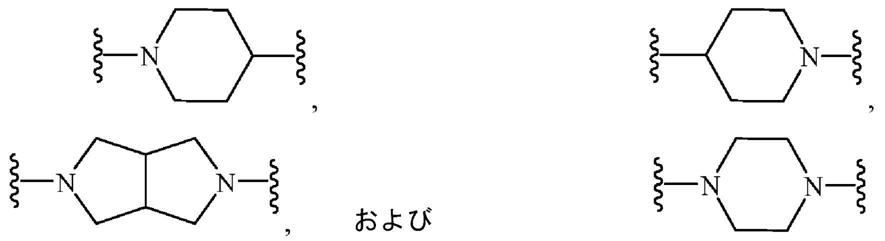
前記５員ヘテロアリールは、トリフルオロメチルで置換されており、

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、メタおよびパラ位で、アルキル、トリフルオロメチル、ハロゲン、フェノキシ、アルコキシ、およびトリフルオロメチルフェニルアルコキシからなる群から選択される１以上の置換基によって置換されていても良く；

Ｘ^{2}は、結合および－ＣＨ$_2$－Ｏ－からなる群から選択され；

Ｘ^{3}は、

【化２０４】



【０３３２】

からなる群から選択される連結基であり；

Ｘ^{5}は結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}は、結合および－ＣＨ$_2$－からなる群から選択され、

前記－ＣＨ$_2$－は、２個以下の置換基独立に選択されるアルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）－、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され、

前記－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－は、アルキルで置換されていても良く；

Ｘ^{9}は、結合、－ＮＨ－、および－Ｏ－からなる群から選択され；

Ｚ^{1}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

前記ＣＨは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アルキルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、アルキルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニルおよび５員－ヘテロアリールからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、

前記５員ヘテロアリールは、Ｃ$_1$－Ｃ$_3$－アルキルで置換されていても良く；

Ｚ^{2}は、ＮおよびＣＨからなる群から選択され、

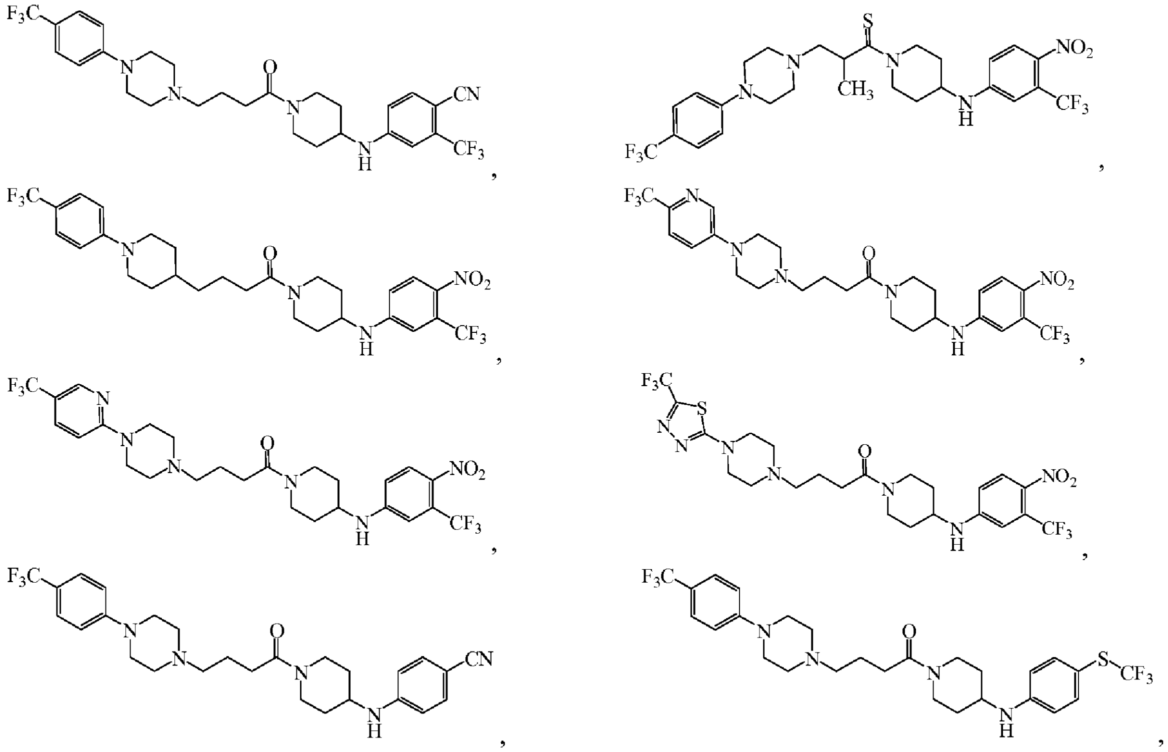
前記ＣＨは、アルキル、ハロゲン、シアノ、アルコキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメチルスルファニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；

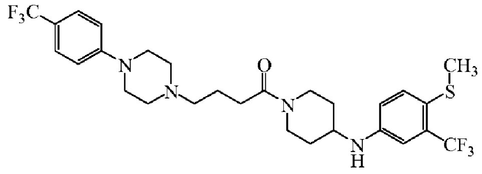
Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。

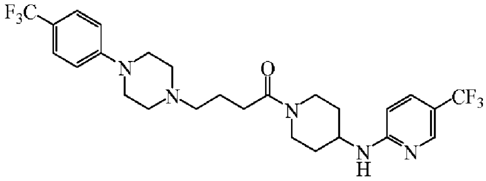
【０３３３】

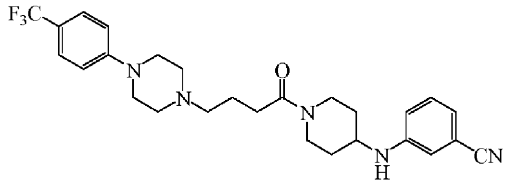
これらの実施形態によって包含される化合物には、例えば下記のものなどがある。

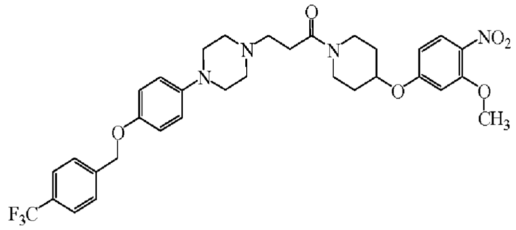
【化２０５】

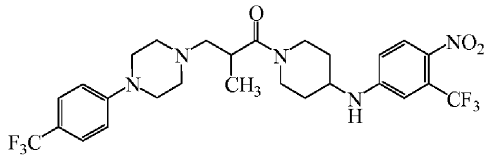


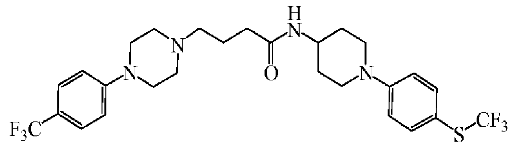

,

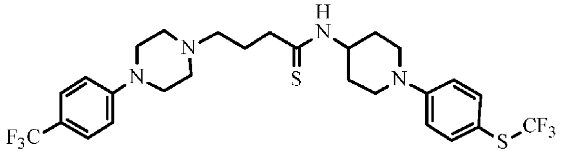

,

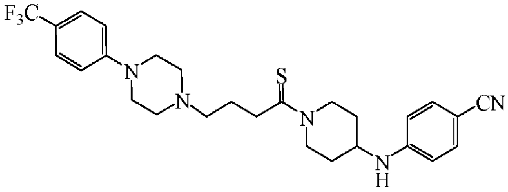

,

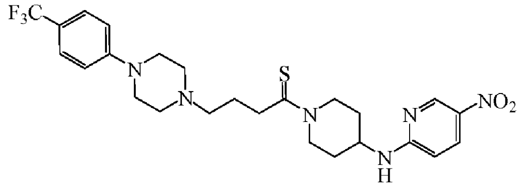

,

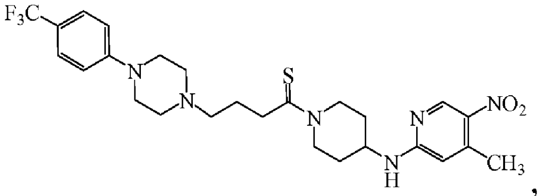

,

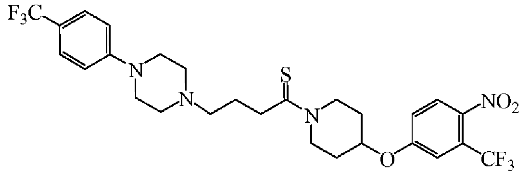

,

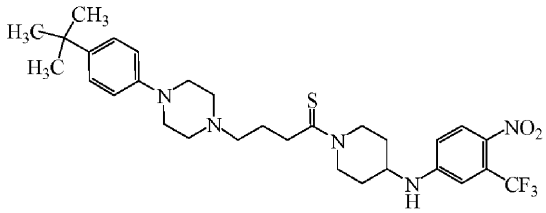

,

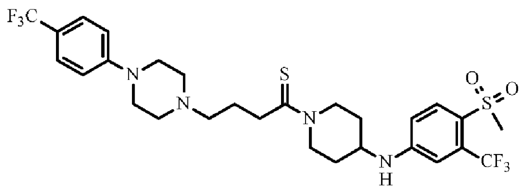

,

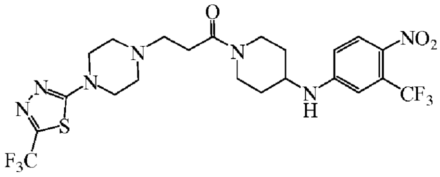

,

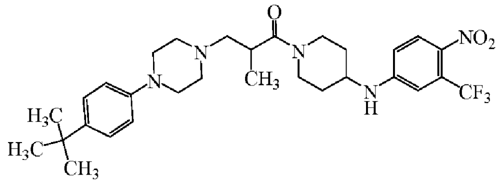

,

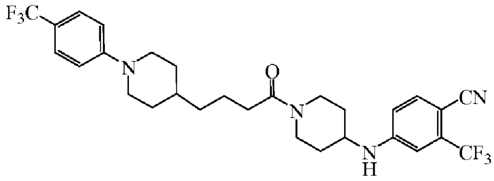

,

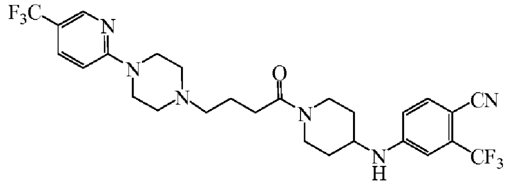

,

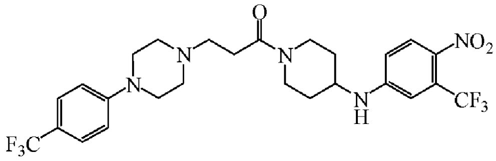

,

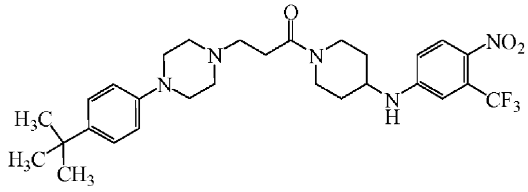

,

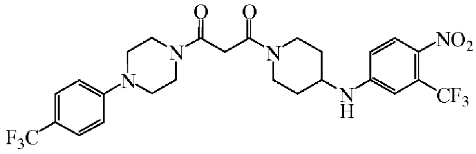

,

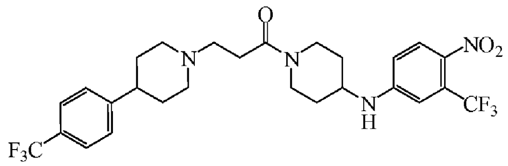

,

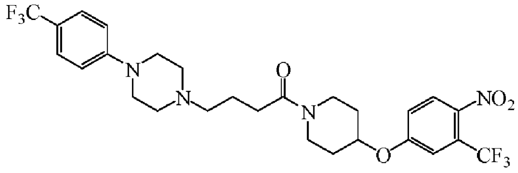

,

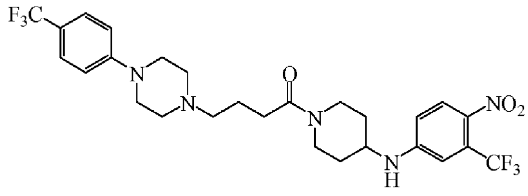

,

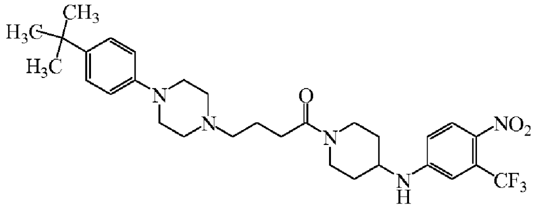

,

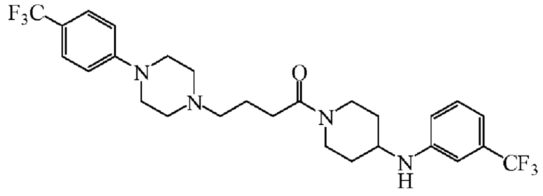

,

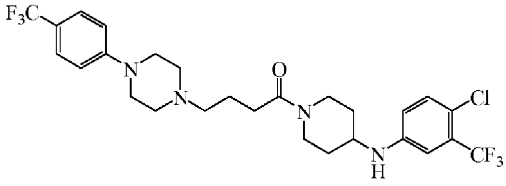

,

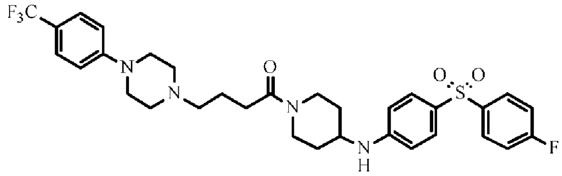

,

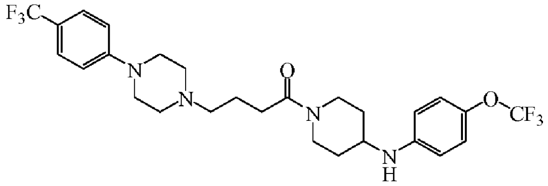

,

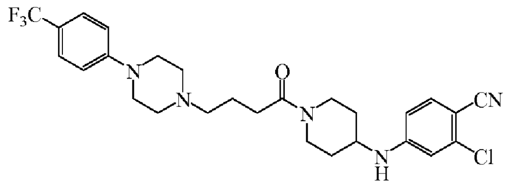

,

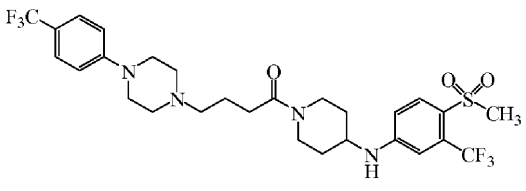

,

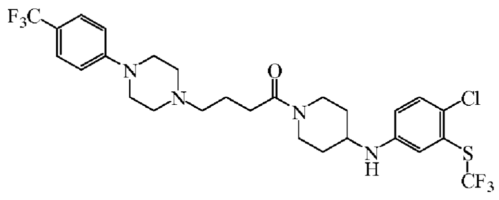
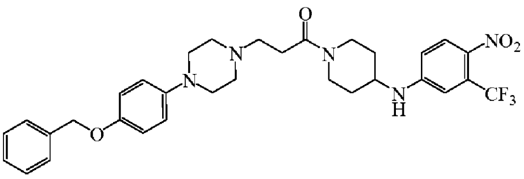
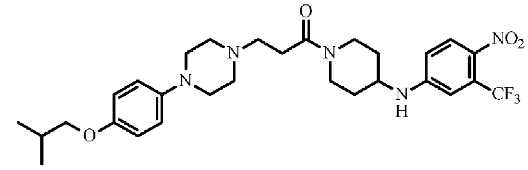
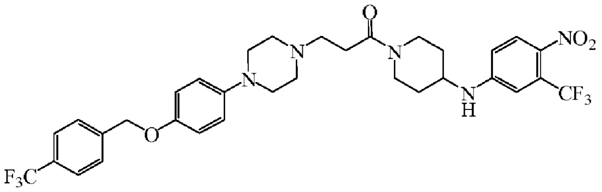
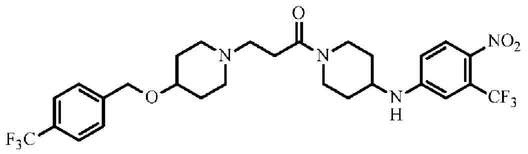
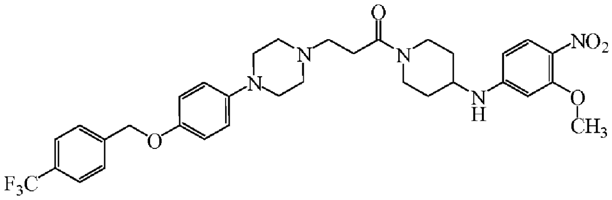
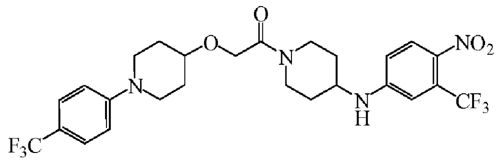
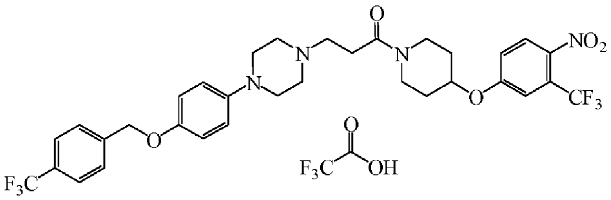
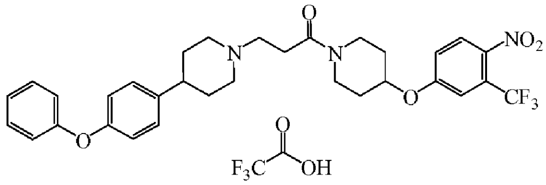
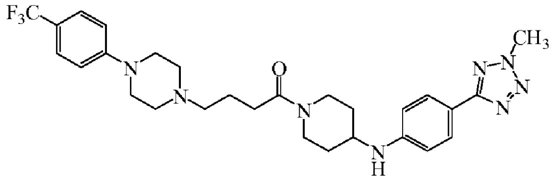
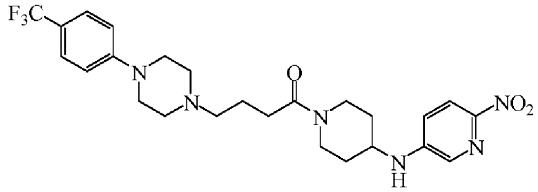
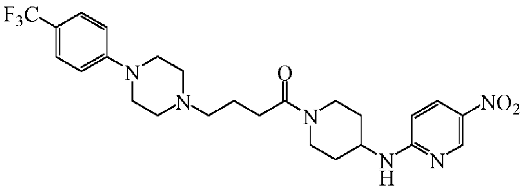
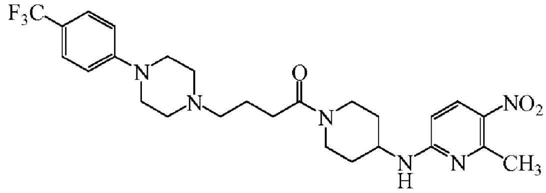
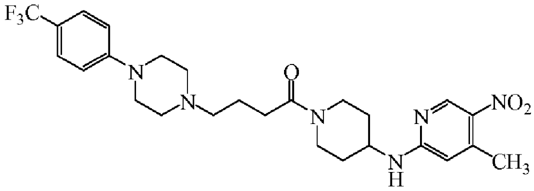

,

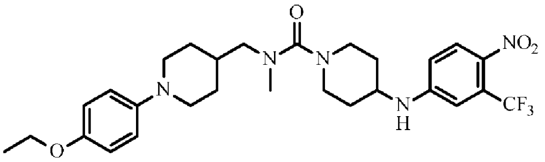
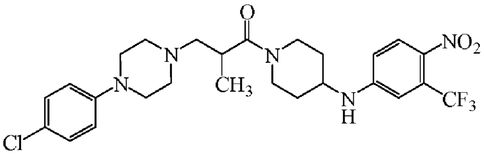
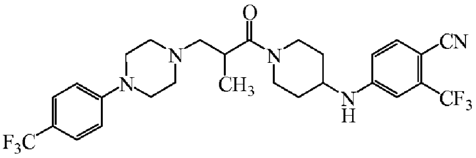
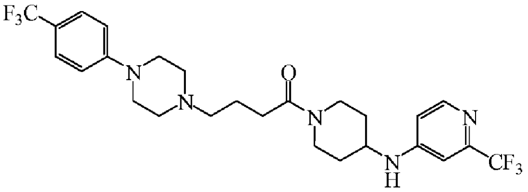
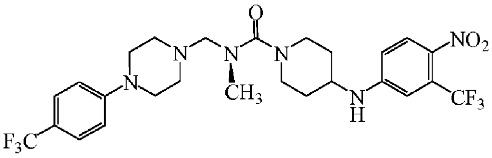
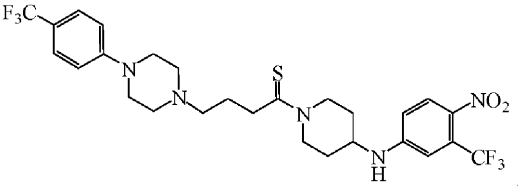
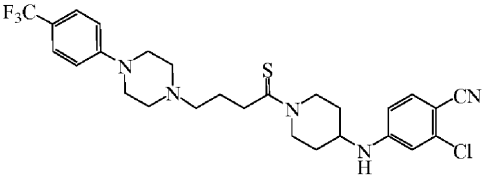
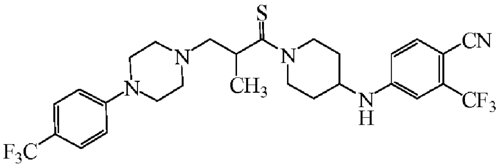
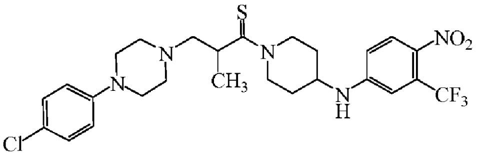
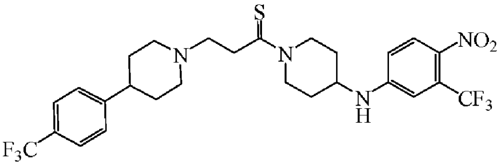
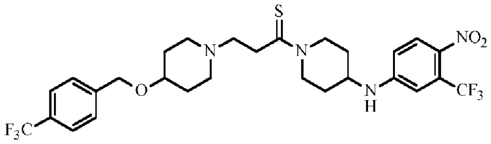
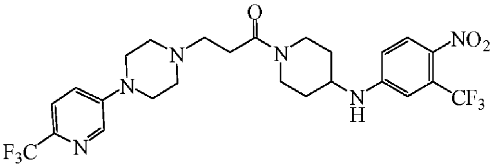
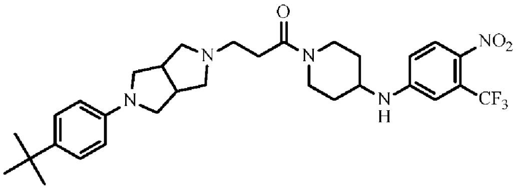
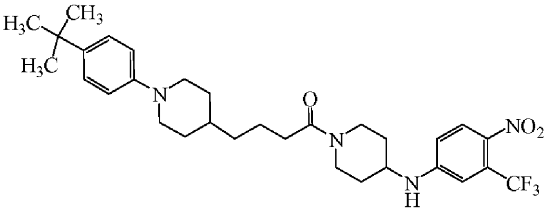
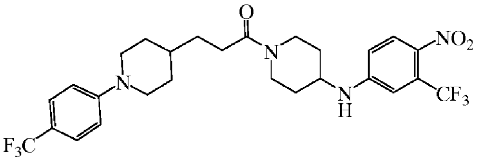
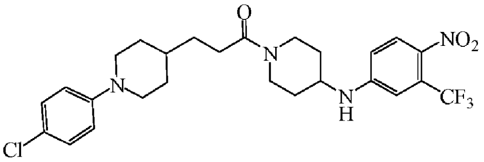

,

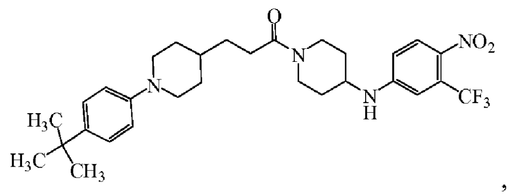

,

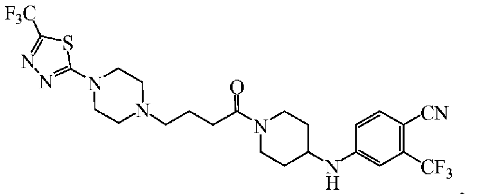

,

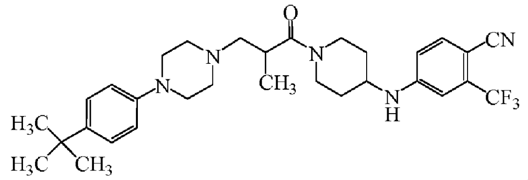

,

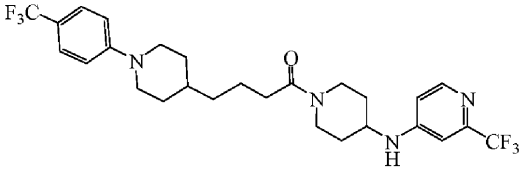

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

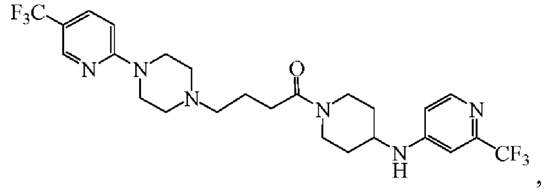

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

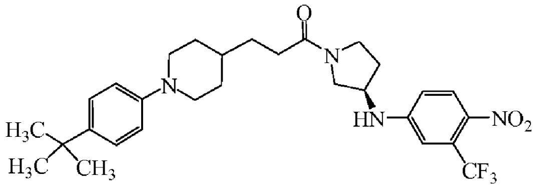

,

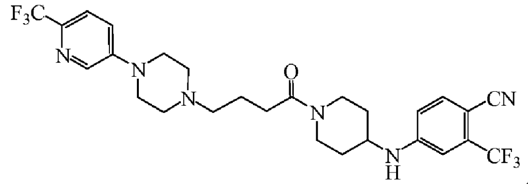

,

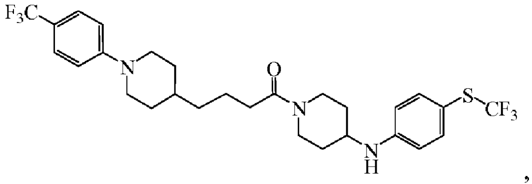

,

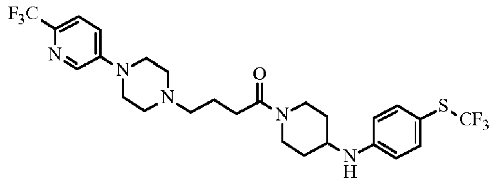

,

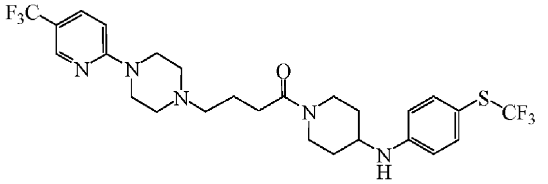

,


,

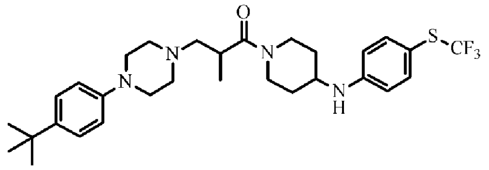

,


,


,



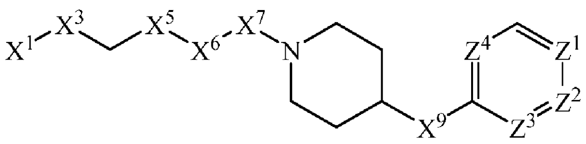
および


.

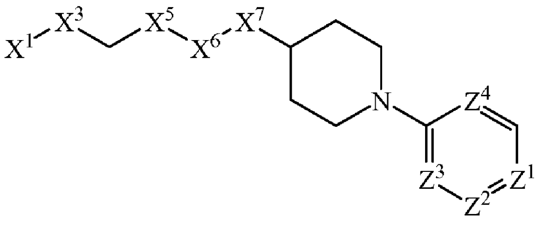
【０３３４】

一部の実施形態において、当該化合物またはそれの塩は、下記のものからなる群から選択される構造に相当する。

【化２０６】


(I-8)

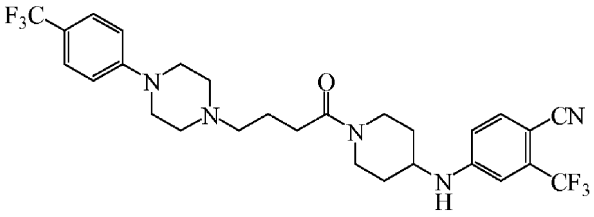
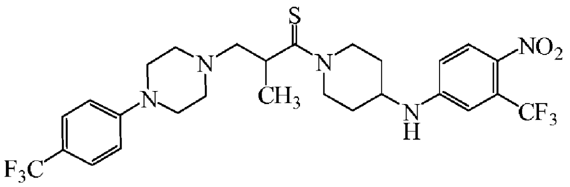
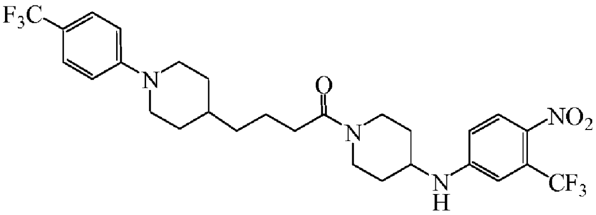
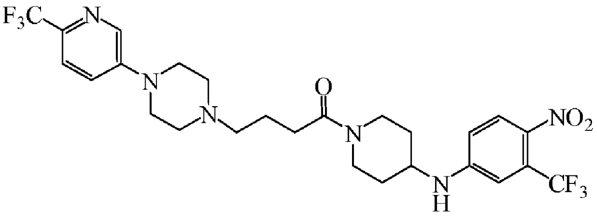
および

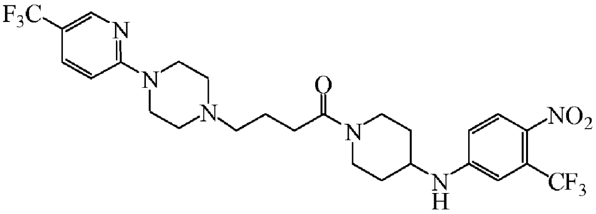
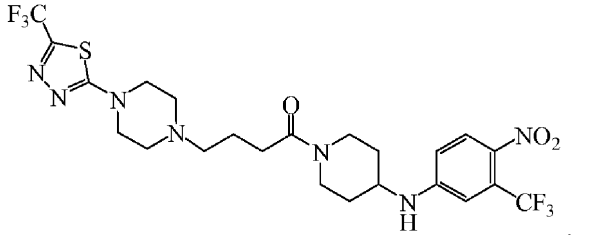
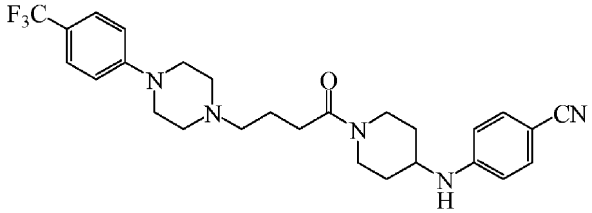
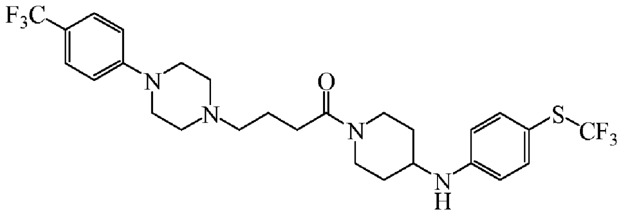
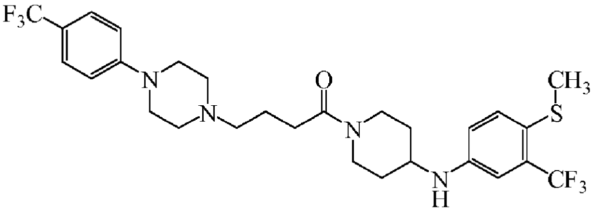
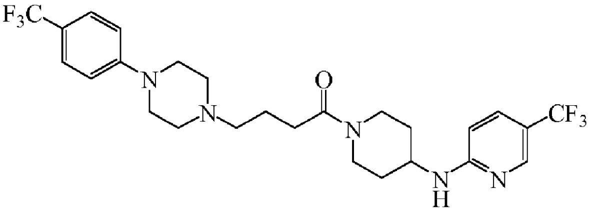

(I-9),

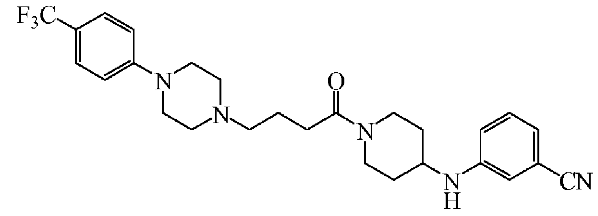
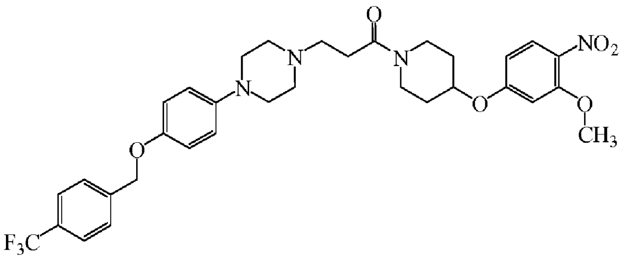
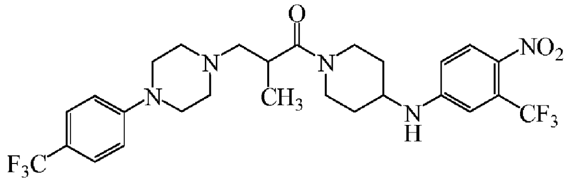
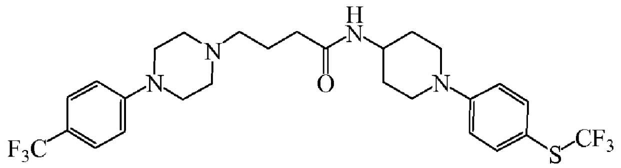
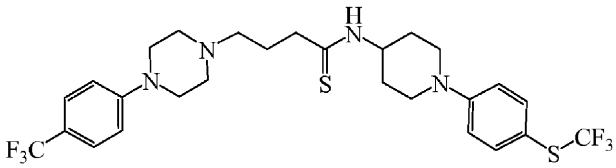
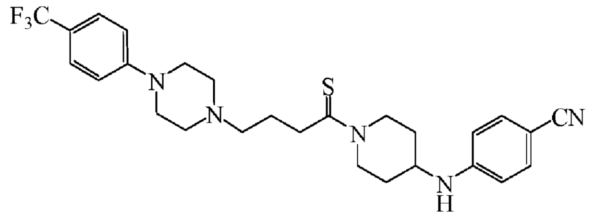
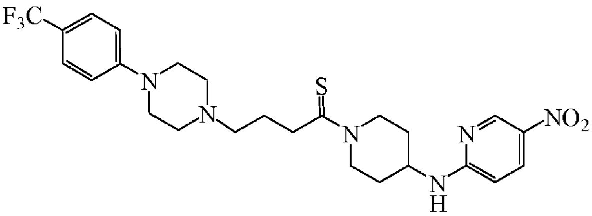
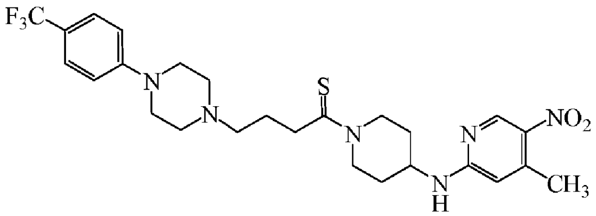
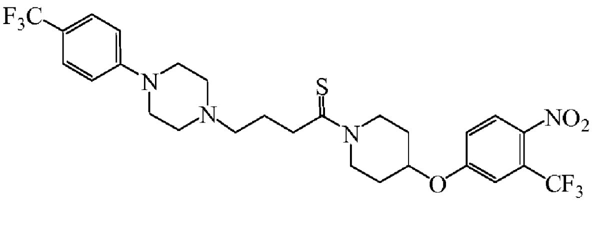
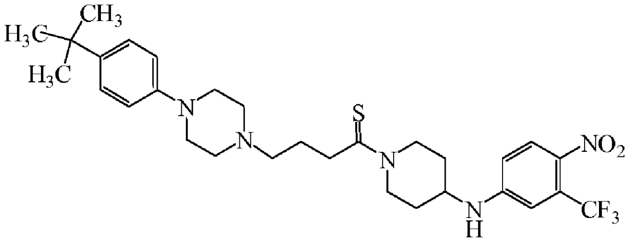
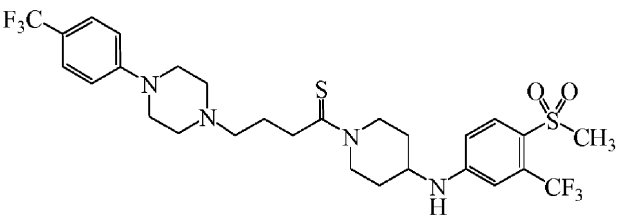
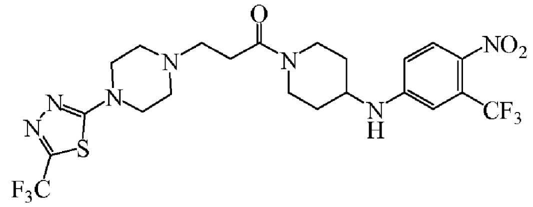
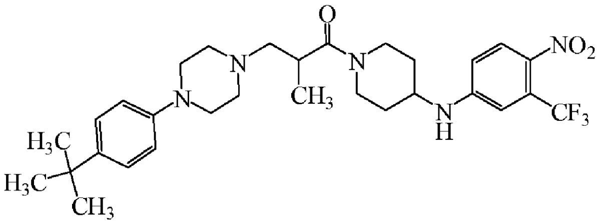
【０３３５】
Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、
前記５員ヘテロアリールはトリフルオロメチルで置換されており；
前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、パラ位でＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、トリフルオロメチル、およびトリフルオロフェニル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルコキシからなる群から選択される置換基によって置換されていても良く；
Ｘ^{3}は、
【化２０７】

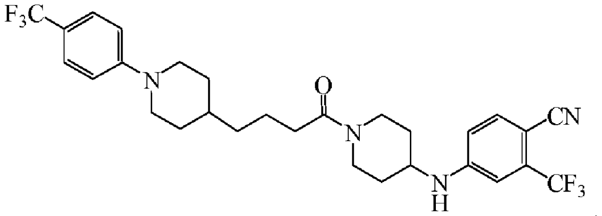
【０３３６】
からなる群から選択される連結基であり；
Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；
Ｘ^{6}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキルで置換されていても良い－ＣＨ$_{2}$－であり；
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｓ）、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、および－Ｃ（Ｓ）－ＮＨ－からなる群から選択され；
Ｘ^{9}は、－ＮＨ－および－Ｏ－からなる群から選択され；
Ｚ^{1}はＣＨであり、
前記ＣＨは、ニトロ、シアノ、アルキル、アルキルスルファニルおよびアルキルスルホニルからなる群から選択される置換基で置換されていても良く、
前記アルキルおよびアルキルスルファニルは、１以上のハロゲンで置換されていても良く；
Ｚ^{2}はＣＨであり、
前記ＣＨは、トリフルオロメチルおよびＣ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルコキシからなる群から選択される置換基で置換されていても良く；
Ｚ^{3}およびＺ^{4}は、独立にＮおよびＣＨからなる群から選択される。
【０３３７】
これらの実施形態によって包含される化合物には、例えば下記のものなどがある。

【化２０８】


,

,

,



,

,

,

,

,

,

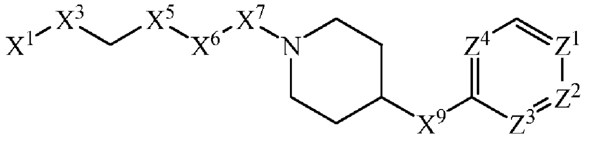

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,



.

【０３３８】

一部の実施形態において、当該化合物またはそれの塩は、構造において、下記のものに相当する。

【化２０９】



(I-8),

【０３３９】

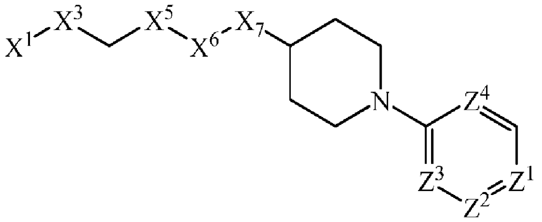
式中、

Ｘ^{9}は、－ＮＨ－および－Ｏ－からなる群から選択される。

【０３４０】

一部の実施形態において、当該化合物またはそれの塩は、構造において、下記のものに相当する。

【化２１０】

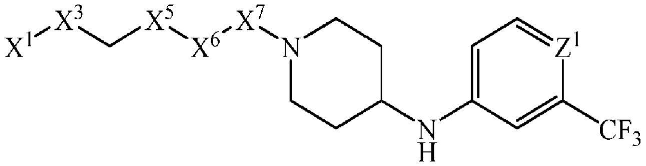


(I-9).

【０３４１】

一部の実施形態において、当該化合物またはそれの塩は、構造において、下記のものに相当する。

【化２１１】



【０３４２】

Ｘ^{1}は、フェニル、５員ヘテロアリール、および６員ヘテロアリールからなる群から選択され、

前記５員ヘテロアリールは、トリフルオロメチルで置換されており；

前記フェニルおよび６員ヘテロアリールは、パラ位でトリフルオロメチルによって置換されており；

Ｘ^{3}は、

【化２１２】

【０３４３】

からなる群から選択される連結基であり；

Ｘ^{5}は、結合および－ＣＨ$_{2}$－からなる群から選択され；

Ｘ^{6}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキルで置換されていても良い－ＣＨ$_{2}$－であり；

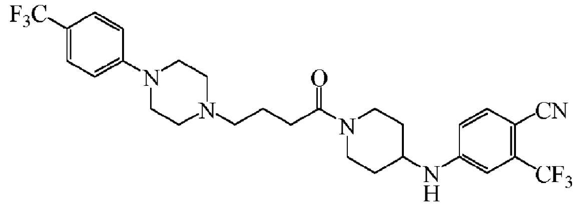
Ｘ^{7}は、－Ｃ（Ｏ）－および－Ｃ（Ｓ）からなる群から選択され；

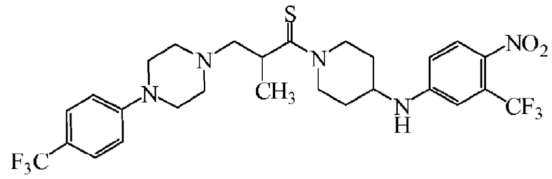
Ｚ^{1}は、ニトロおよびシアノからなる群から選択される置換基で置換されていても良いＣＨである。

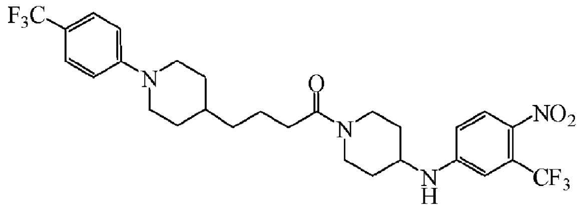
【０３４４】

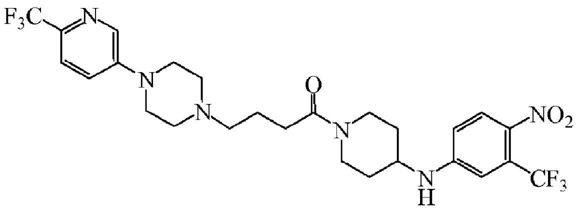
これらの実施形態によって包含される化合物には、例えば下記のものなどがある。

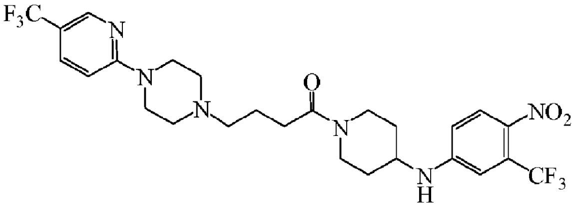
【化２１３】

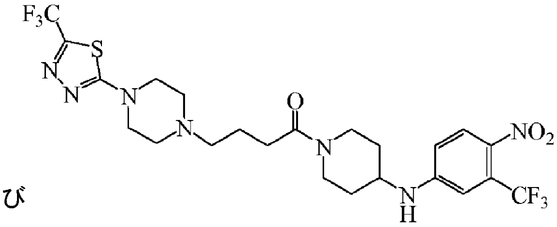
,

,

,

,

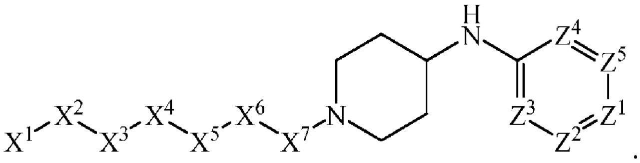
,および

.

【０３４５】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

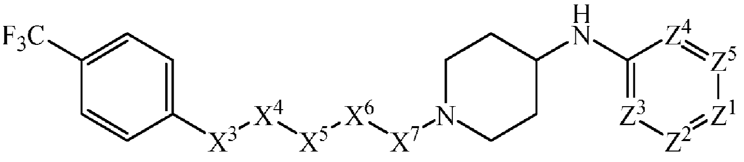
【化２１４】

.

【０３４６】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

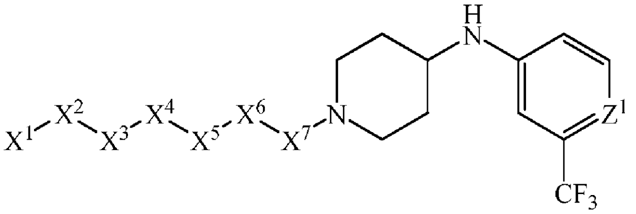
【化２１５】

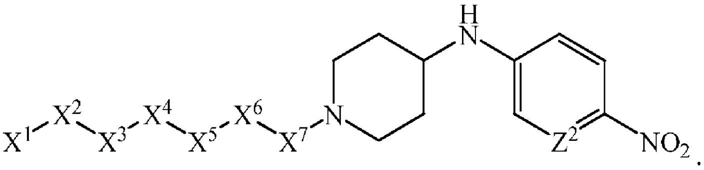
.

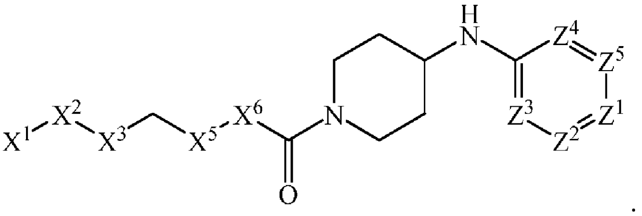
【０３４７】

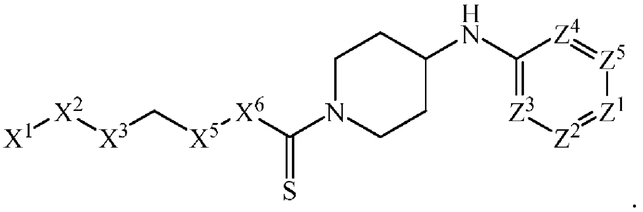
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

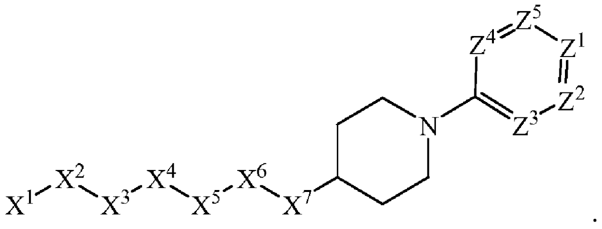
【化２１６】

.

【０３４８】
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２１７】


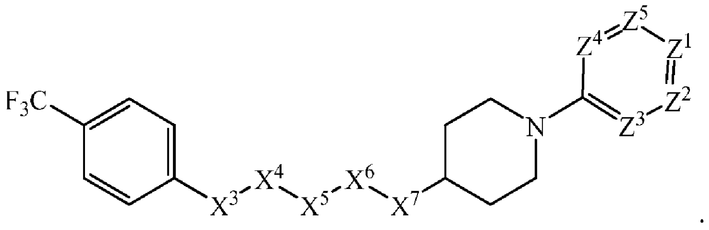
【０３４９】
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２１８】


【０３５０】
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２１９】


【０３５１】
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２２０】


【０３５２】
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

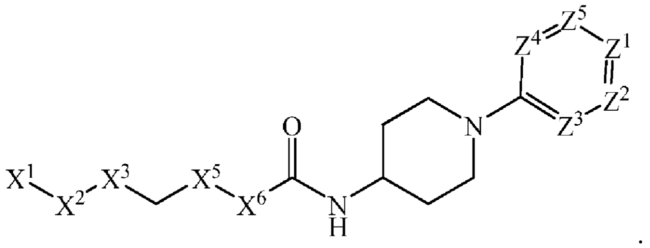
【化２２１】



【０３５３】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

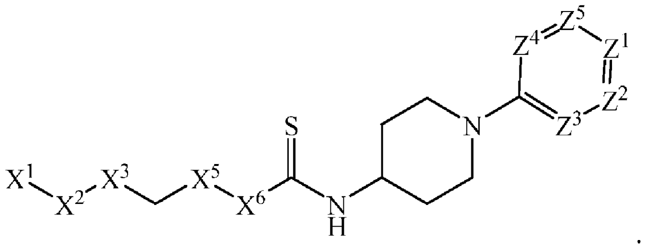
【化２２２】



【０３５４】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

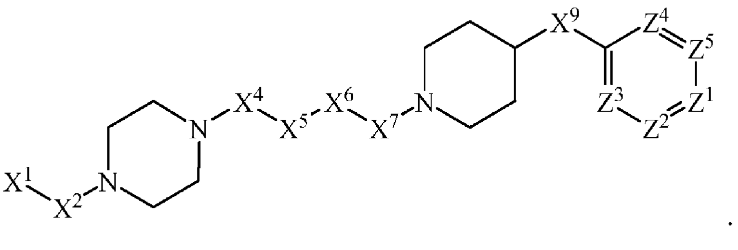
【化２２３】



【０３５５】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

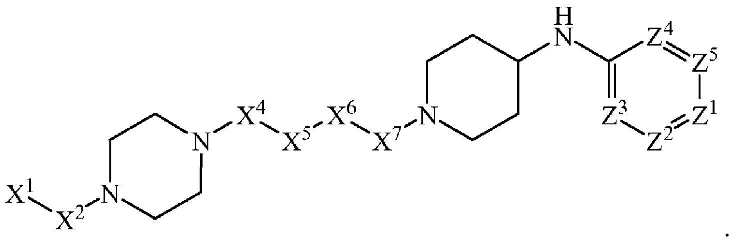
【化２２４】



【０３５６】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

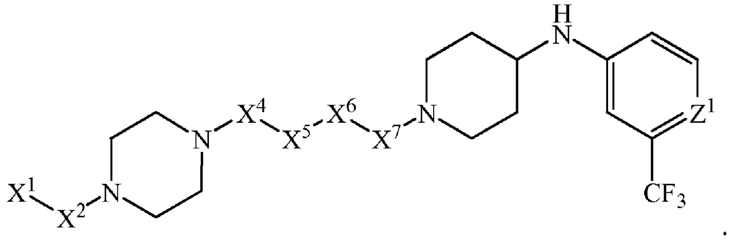
【化２２５】



【０３５７】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

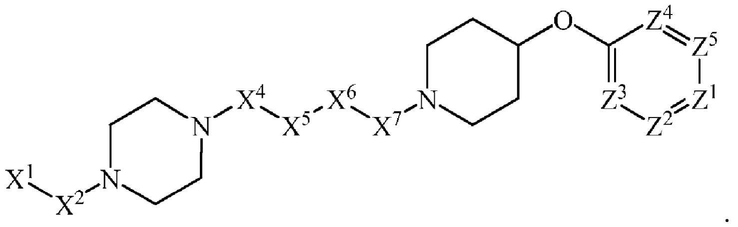
【化２２６】



【０３５８】

本発明の他の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

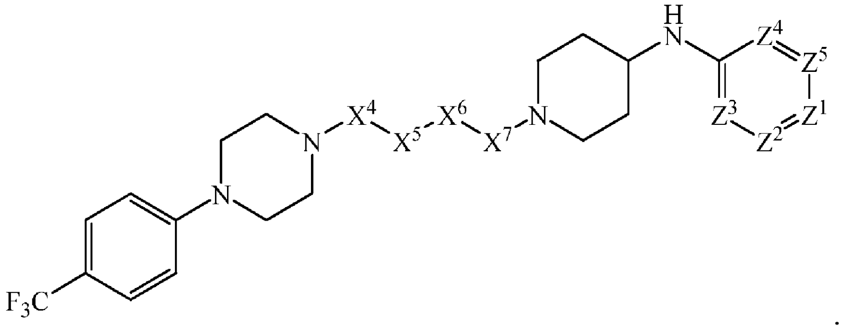
【化２２７】



【０３５９】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

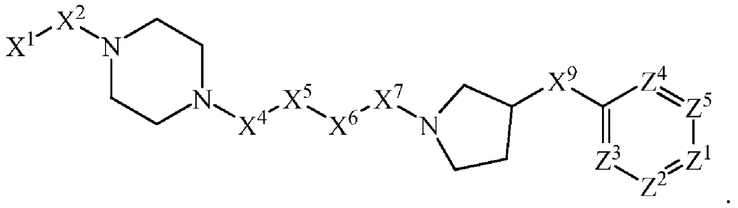
【化２２８】



【０３６０】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

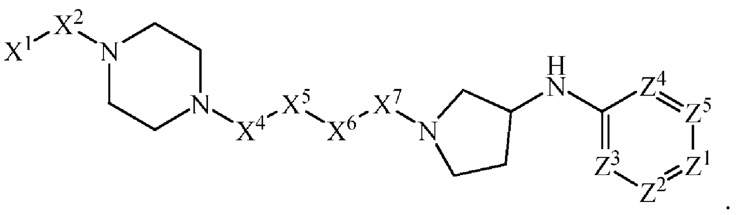
【化２２９】



【０３６１】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

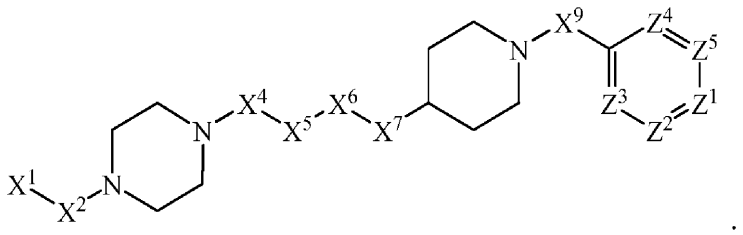
【化２３０】



【０３６２】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

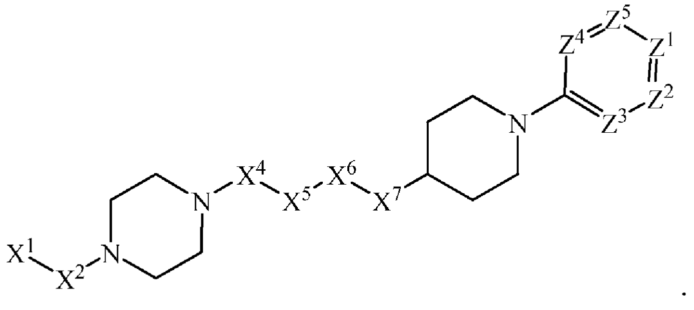
【化２３１】



【０３６３】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

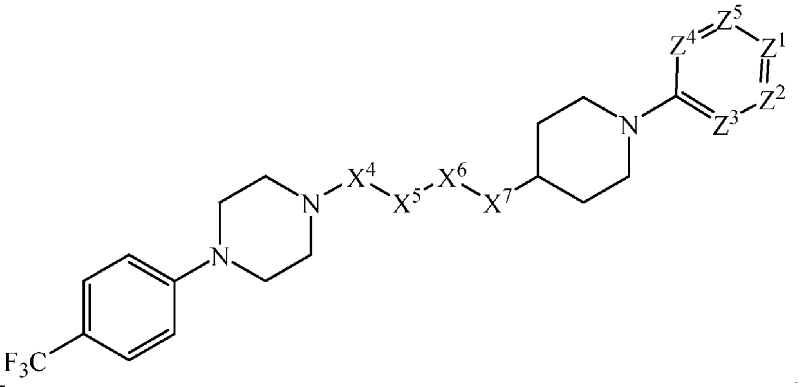
【化２３２】



【０３６４】

本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

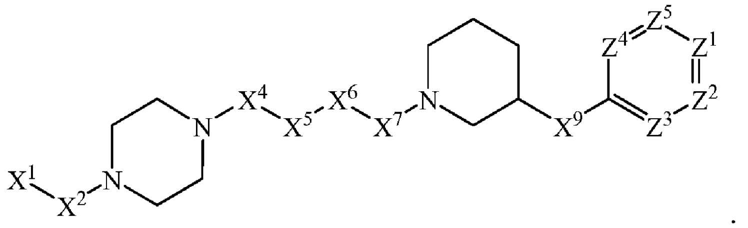
【化２３３】



【０３６５】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

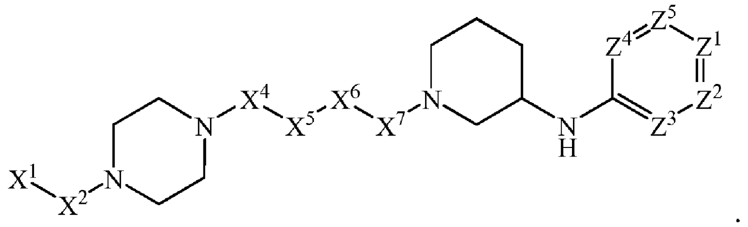
【化２３４】



【０３６６】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

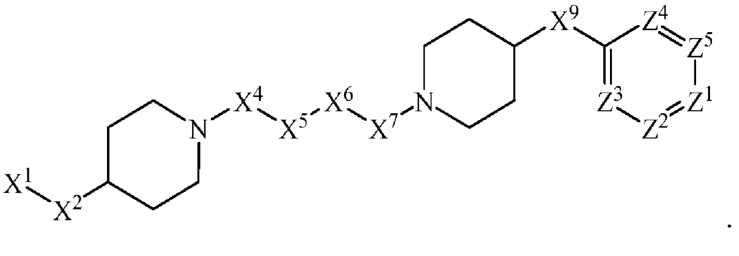
【化２３５】



【０３６７】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

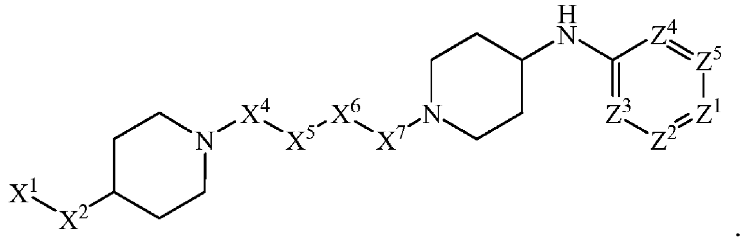
【化２３６】



【０３６８】

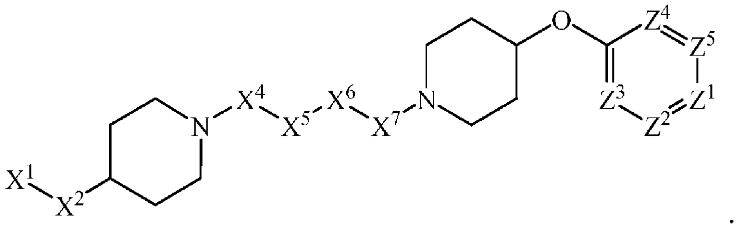
本発明の一部のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化２３７】



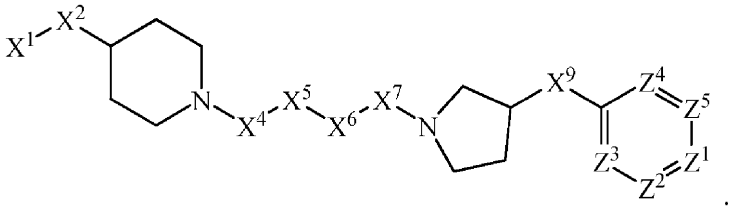
【０３６９】
本発明の他のそのような実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化２３８】



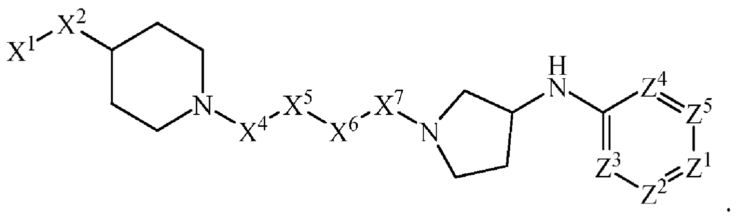
【０３７０】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化２３９】



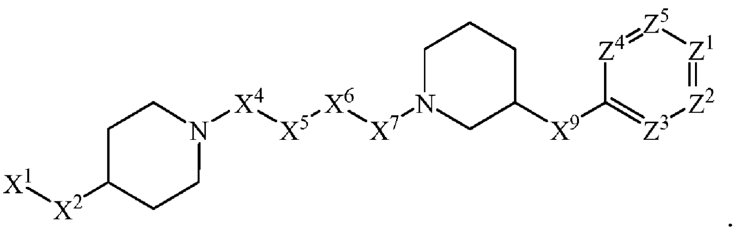
【０３７１】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

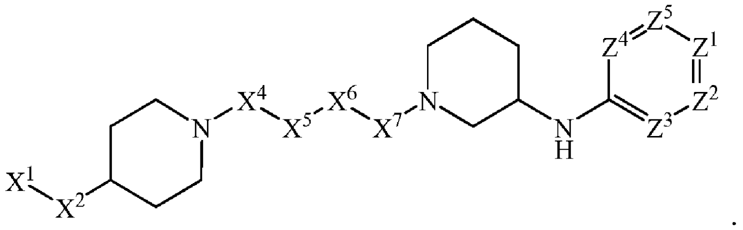
【化２４０】

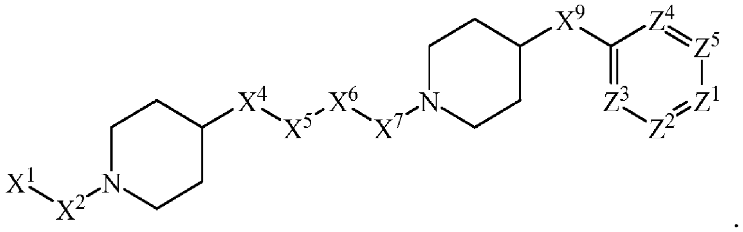


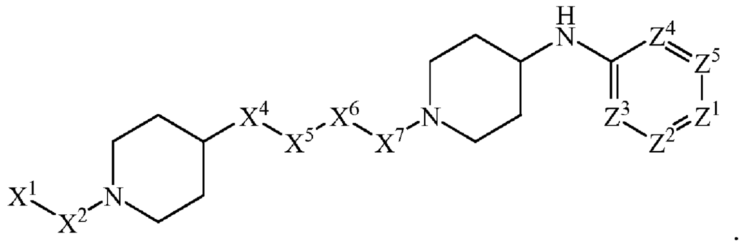
【０３７２】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

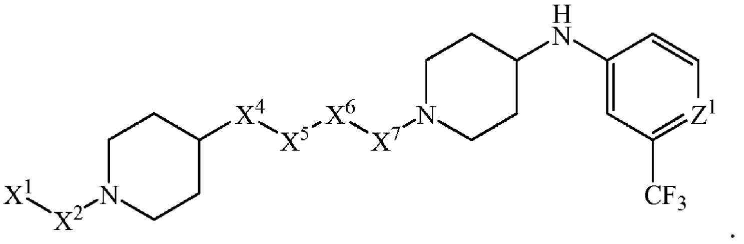
【化２４１】



【０３７３】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２４２】


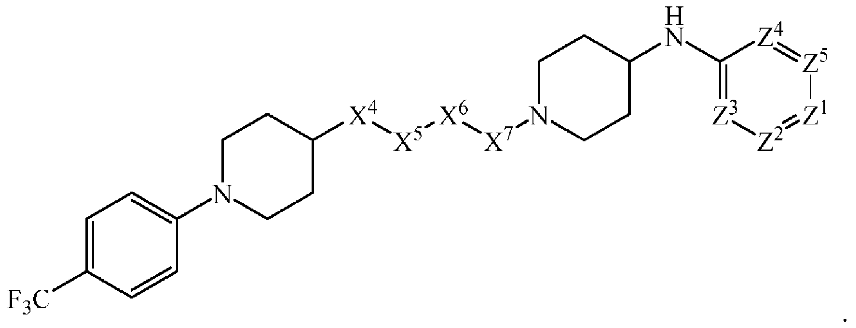
【０３７４】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２４３】


【０３７５】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２４４】


【０３７６】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。
【化２４５】


【０３７７】
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

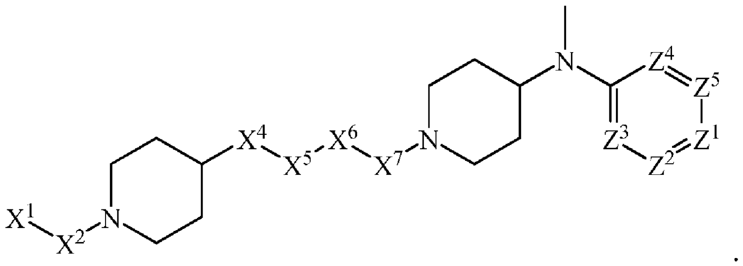
【化２４６】



【０３７８】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

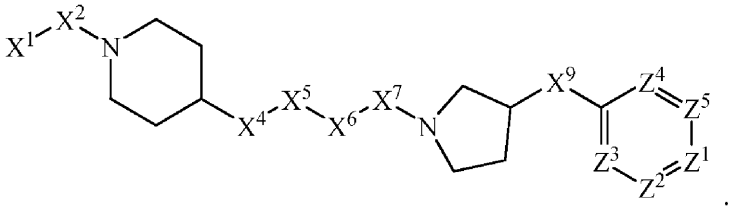
【化２４７】



【０３７９】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

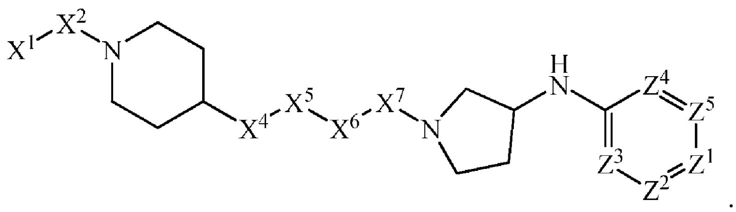
【化２４８】



【０３８０】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

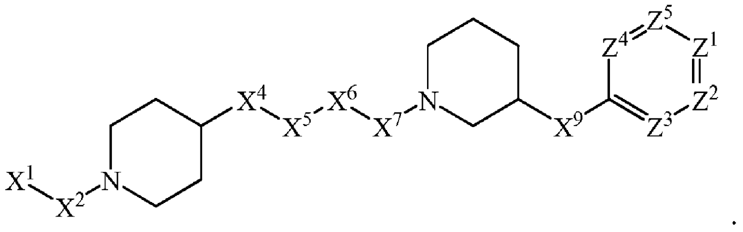
【化２４９】



【０３８１】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

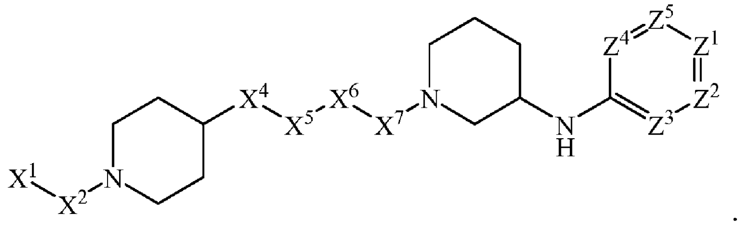
【化２５０】



【０３８２】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

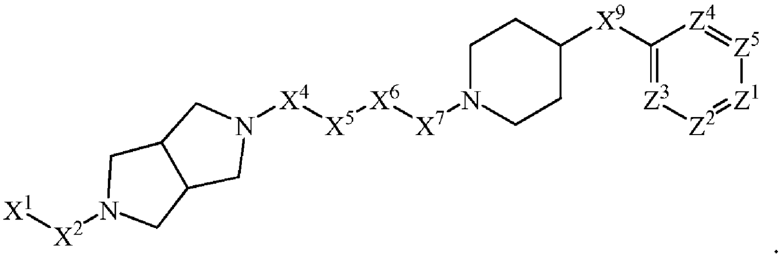
【化２５１】



【０３８３】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

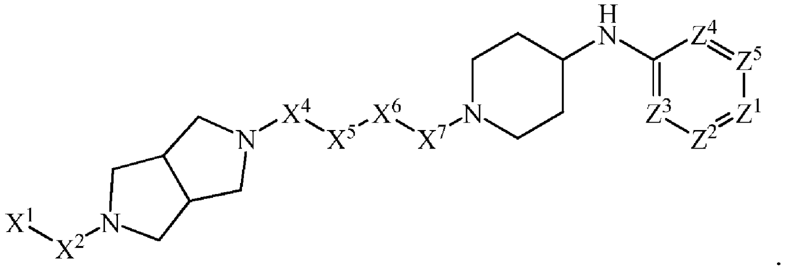
【化２５２】



【０３８４】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

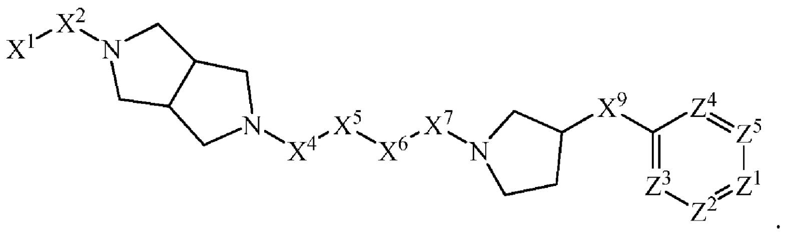
【化２５３】



【０３８５】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

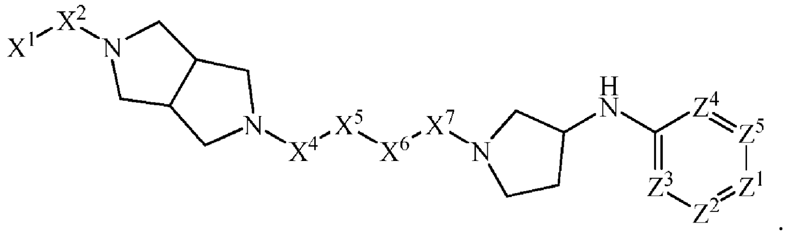
【化２５４】



【０３８６】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

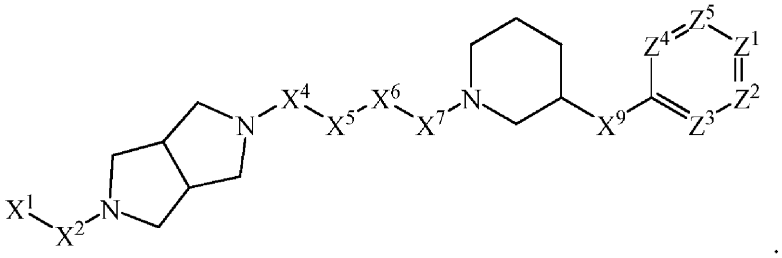
【化２５５】



【０３８７】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

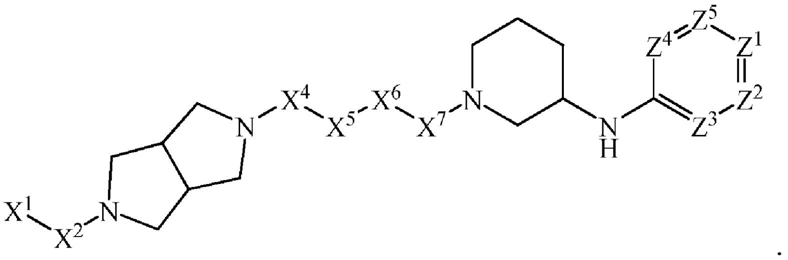
【化２５６】



【０３８８】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

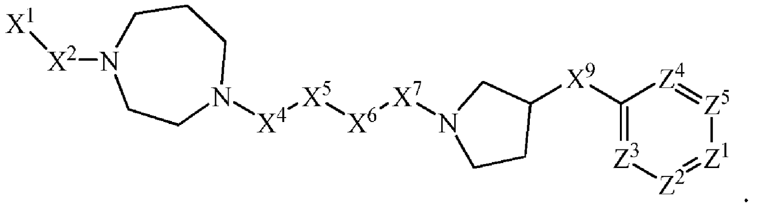
【化２５７】



【０３８９】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

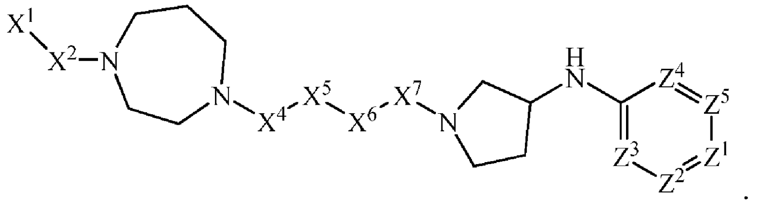
【化２５８】



【０３９０】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

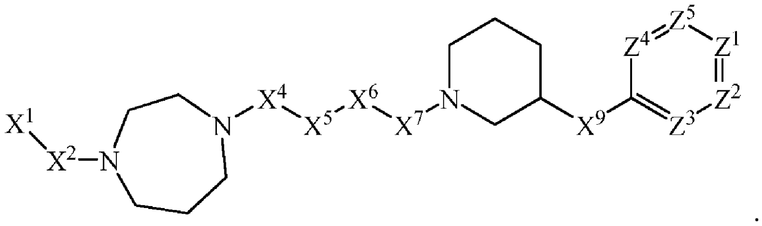
【化２５９】



【０３９１】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

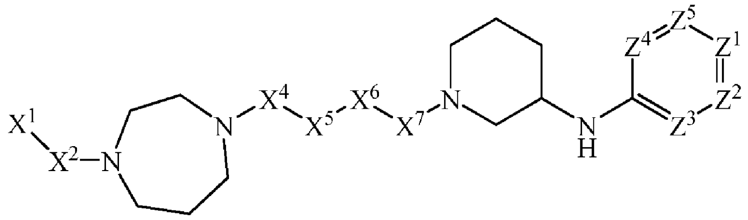
【化２６０】



【０３９２】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

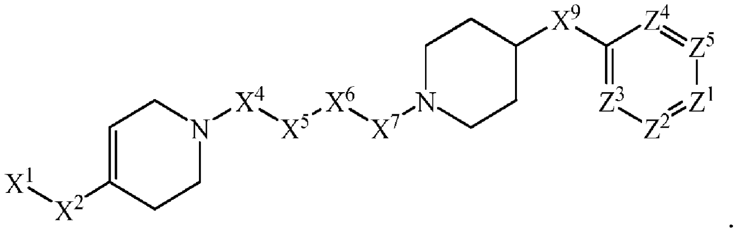
【化２６１】



【０３９３】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

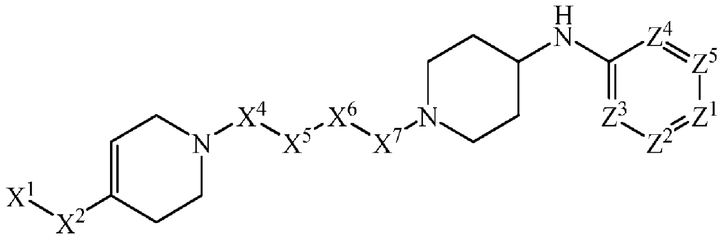
【化２６２】



【０３９４】

本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化２６３】

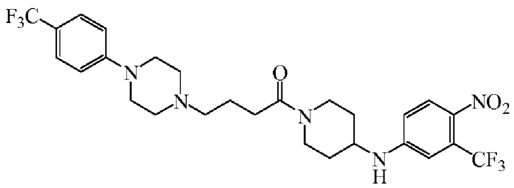
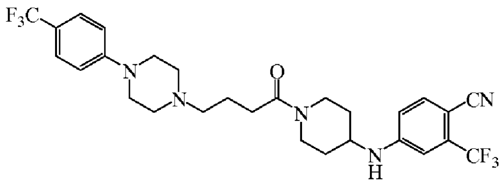
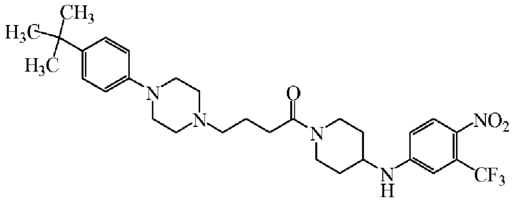
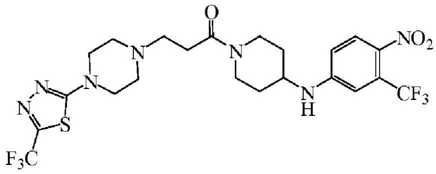
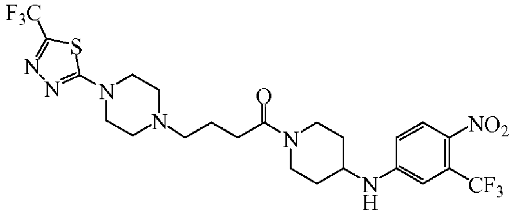
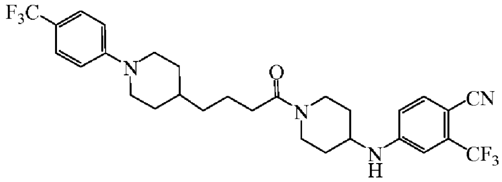
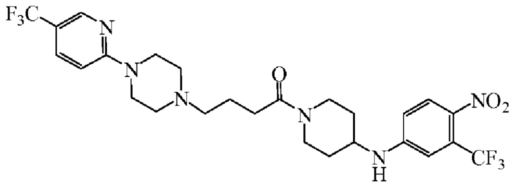
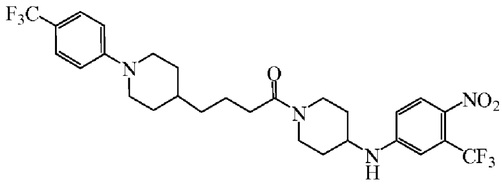
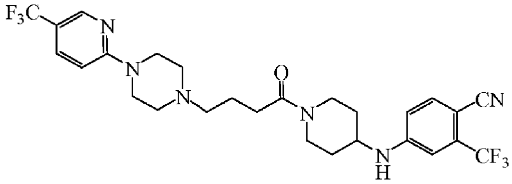
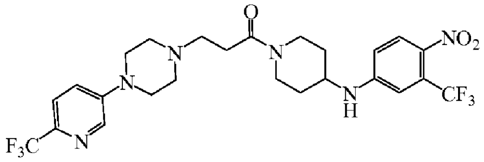
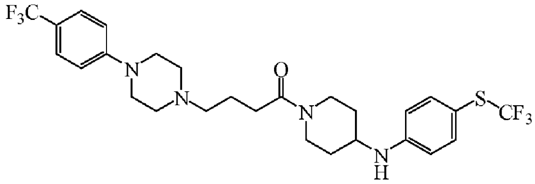
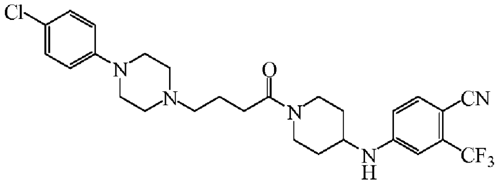
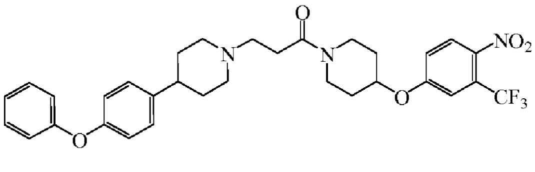
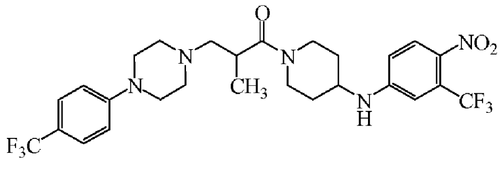
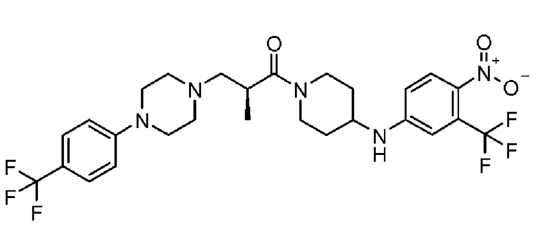


.

【０３９５】

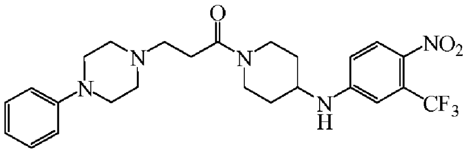
本発明の一部の実施形態において、当該化合物は、構造において下記式に相当するものと定義される。

【化２６４】

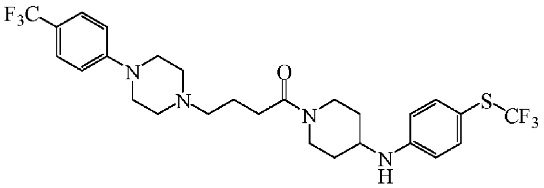

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,
および


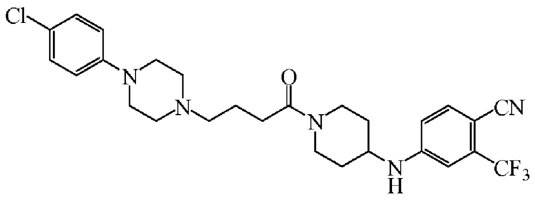
【０３９６】
他の実施形態において、当該化合物は、下記のものからなる群から選択される。

【化２６５】

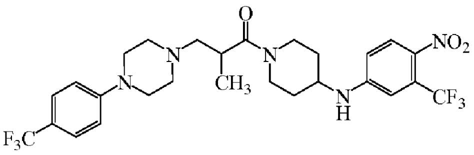


,

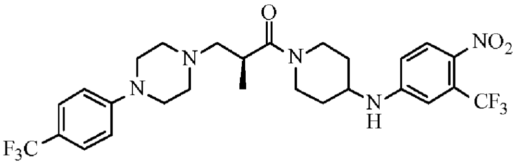




,



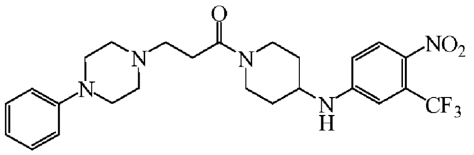
, および



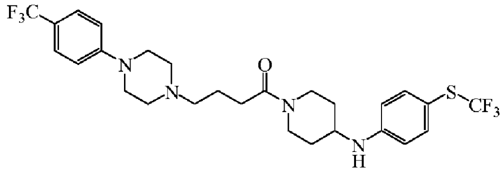
【０３９７】

他の実施形態において、当該化合物は、下記のものからなる群から選択される。

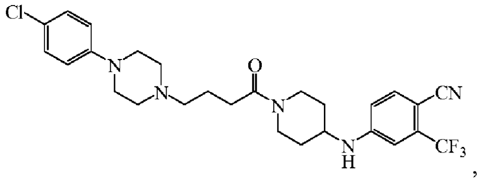
【化２６６】



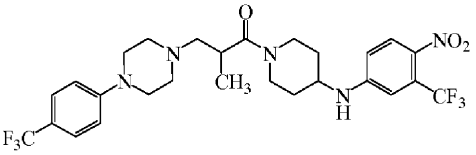
,



,



, および

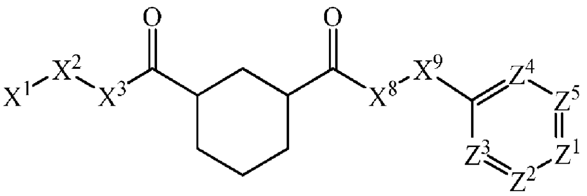


【０３９８】

Ｎ．異性体

一部の実施形態において、本発明で使用される化合物は、２以上の立体配座構造または幾何構造を有する可能性がある。例えば、下記の化合物は、シスまたはトランス配置を有することができる。

【化２６７】

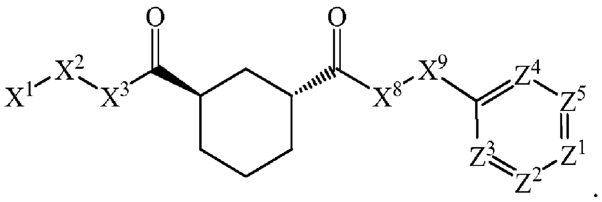


.

【０３９９】

一部の実施形態において、この化合物はトランス配置を有することで、当該化合物は下記式によって包含されることになる。

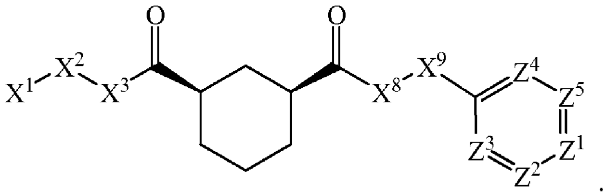
【化２６８】



【０４００】

他の実施形態において、当該化合物はシス配置を有することで、当該化合物は下記式によって包含されることになる。

【化２６９】



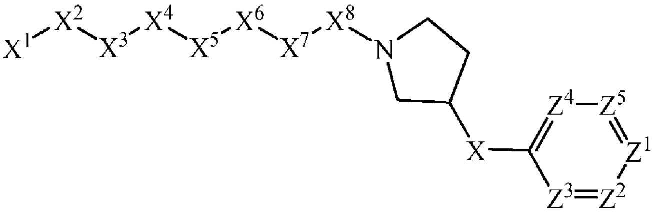
【０４０１】

別段の断りがない限り、特定の立体配座を示さない化合物構造は、その化合物の全ての可能な立体配座異性体の組成物、ならびに全てより少ない可能な立体配座異性体を含む組成物を包含するものである。

【０４０２】

一部の実施形態において、本発明で使用される化合物はキラル化合物である。例えば、下記の化合物はＲまたはＳ配置を有することができる。

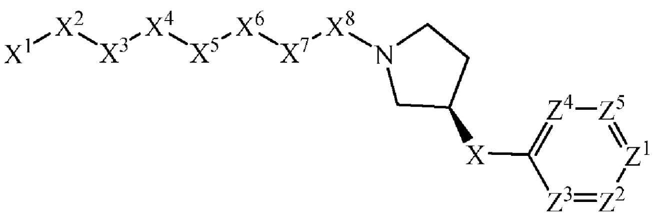
【化２７０】



【０４０３】

一部の実施形態において、この化合物は一方のエナンチオマーであることで、当該化合物は、下記式によって包含されるようになる。

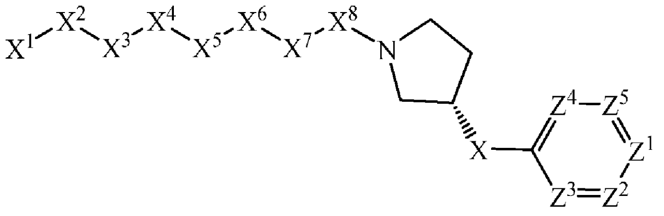
【化２７１】



【０４０４】

一部の実施形態において、この化合物は他方のエナンチオマーであることで、当該化合物は、下記式によって包含されるようになる。

【化２７２】



【０４０５】

一部の実施形態において、本発明で使用される化合物は、非キラル化合物である。

【０４０６】

別段の断りがない限り、特定のエナンチオマーを示さないキラル化合物構造は、当該化合物の全ての可能なエナンチオマー、ジアステレオマーおよび立体異性体の組成物、ならびに全てより少ない可能なエナンチオマー、ジアステレオマーおよび立体異性体（ラセミ混合物を含む）を含む組成物を包含するものである。

【０４０７】

ＩＩ．本発明での使用のための化合物の塩

異なる温度および湿度における医薬安定性などの塩の物理特性；結晶性；および／または水、油もしくは他の溶媒に対する所望の溶解度のうちの１以上のゆえに、上記化合物の塩が有利である可能性がある。場合により、塩を、化合物の単離、精製および／または分割における補助体として用いることができる。酸および塩基塩は、代表的には、例えば、当該技術分野の各種公知の方法を用いて、化合物をそれぞれ酸または塩基と混合することによって生成することができる。当該化合物の塩を治療効果を得るべくイン・ビボで（すなわち動物に）投与することを意図している限りにおいて、その塩は好ましくは医薬として許容されるものである。

【０４０８】

概して、酸付加塩は、遊離塩基化合物を約化学量論量の無機もしくは有機酸と反応させることで製造することができる。医薬として許容される塩を製造するのに多くの場合で好適な無機酸の例には、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硝酸、炭酸、硫酸およびリン酸などがある。医薬として許容される塩を製造するのに多くの場合で好適な有機酸の例には、例えば、脂肪族、脂環式、芳香族、芳香脂肪族、複素環、カルボン酸およびスルホン酸類の有機酸などがある。多くの場合で好適な有機酸の具体例には、コリン酸、ソルビン酸、ラウリン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、ギ酸、プロピオン酸、コハク酸、グリコール酸、グルコン酸、ジグルコン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、アスコルビン酸、グルクロン酸、マレイン酸、フマル酸、ピルビン酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、アリールカルボン酸（例えば安息香酸）、アントラニル酸、メシル酸、ステアリン酸、サリチル酸、ｐ－ヒドロキシ安息香酸、フェニル酢酸、マンデル酸、エンボニン酸（パモ酸）、アルキルスルホン酸（例えばエタンスルホン酸）、アリールスルホン酸（例えばベンゼンスルホン酸）、パントテン酸、２－ヒドロキシエタンスルホン酸、スルファニル酸、シクロヘキシルアミノスルホン酸、β－ヒドロキシ酪酸、ガラクタル酸、ガラクツロン酸、アジピン酸、アルギン酸、酪酸、樟脳酸、カンファースルホン酸、シクロペンタンプロピオン酸、ドデシル硫酸、グリコヘプタン酸、グリセロホスホン酸、ヘプタン酸、ヘキサン酸、ニコチン酸、２－ナフタルスルホン酸、シュウ酸、パルモ酸、ペクチン酸、３－フェニルプロピオン酸、ピクリン酸、ピバル酸、チオシアン酸、トシル酸およびウンデカン酸などがある。一部のそのような実施形態において、例えば、当該塩基は、トリフルオロ酢酸塩、メシル酸塩またはトシル酸塩を含む。他の実施形態において、当該塩は塩酸塩を含む。

【０４０９】

概して、塩基付加塩は、遊離酸化合物を約化学量論量の無機もしくは有機塩基と反応させることで製造することができる。塩基付加塩の例には、例えば、金属塩および有機塩などがあり得る。金属塩には、例えば、アルカリ金属（Ｉａ族）塩、アルカリ土類金属（Ｉ

Ｉａ族）塩、および他の生理的に許容される金属塩などがある。そのような塩は、アルミニウム、カルシウム、リチウム、マグネシウム、カリウム、ナトリウム、および亜鉛から製造することができる。例えば、遊離酸化合物を水酸化ナトリウムと混合して、そのような塩基付加塩を生成することができる。有機塩は、トリメチルアミン、ジエチルアミン、Ｎ，Ｎ'－ジベンジルエチレンジアミン、クロロプロカイン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、エチレンジアミン、メグルミン（Ｎ－メチルグルカミン）、およびプロカインなどのアミンから製造することができる。塩基性窒素含有基は、$Ｃ_1$－$Ｃ_6$－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ライド、ブロミドおよびヨージド）、硫酸ジアルキル（例えば、硫酸ジメチル、ジエチル、ジブチル、およびジアミル）、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ライド、ブロミドおよびヨージド）、アリールアルキルハライド（例えば、ベンジルおよびフェネチルブロミド）およびその他などの薬剤で四級化することができる。

【０４１０】

ＩＩＩ．本発明の化合物および塩を用いる治療法

本発明によれば、当該化合物およびそれの塩が犬糸状虫による感染を治療するのに特に有用であることが発見された。本発明の化合物および塩を、広範囲の動物、特別には哺乳動物、例えばオオカミ、コヨーテ、キツネおよびアライグマなどの野生動物ならびにイヌ、ネコおよびフェレットなどのコンパニオン動物を治療するのに用いることが可能であることが想到される。

【０４１１】

本発明の化合物および塩は経口投与することができる。例えば、当該化合物または塩を、所期の被投与者飼料に直接もしくはプレミックスの一部として加えることができる。当該化合物または塩はあるいは、例えば、個別の固体製剤（例えば、錠剤、硬もしくは軟カプセル、粒剤、粉剤など）、ペースト、または液体製剤（例えば、液剤、懸濁液、シロップなど）として投与することができる。

【０４１２】

製剤は、１以上の好適な賦形剤を含むことができる。そのような賦形剤には通常、例えば、甘味剤、香味剤、着色剤、保存剤、不活性希釈剤（例えば、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム、乳糖、リン酸カルシウム、リン酸ナトリウム、またはカオリン）、造粒剤および崩壊剤（例えば、トウモロコシデンプンまたはアルギン酸）、結合剤（例えば、ゼラチン、アカシア、またはカルボキシメチルセルロース）、および潤滑剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸またはタルク）などがある。当該化合物は、賦形剤と予混合することができるか、別個のものとして提供して、例えば投与部位で混合することができる（特に、賦形剤の種類、所望の安定性、輸送要件、所望の使いやすさなどに応じて）。特定用途の固体分散物は、ホットメルト抽出、スプレー乾燥およびトップスプレー造粒などの固体分散技術を受けるポリマーまたは、例えばポリエチレングリコール、ポリビニルカプロラクタム、ポリ酢酸ビニルおよび／またはこれらの組み合わせのグラフトコポリマーに基づくものであることができる。そのポリマーは、本発明による使用のための活性化合物用担体として役立ち得る。特に、そのような化合物（約５ｇ）およびポリビニルカプロラクタム－ポリ酢酸ビニル－ポリエチレングリコールグラフトコポリマーなどの固体分散技術を受けるグラフトコポリマー（約１０ｇ）の混合物を約２０分間ホモジナイズする。次に、約２００℃に予熱した抽出装置を用いて、その粉末混合物の抽出を行う。得られた抽出物を冷却して室温とし、ボールミルを用いて約３０分間粉砕して微粉末とする。最終的に、粉末抽出物約１２ｇを単離する。

【０４１３】

液体組成物は通常、例えば、ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、ピロリドン、Ｎ－メチルピロリドン、ポリエチレングリコール、ジエチレングリコール・モノエチルエステル、ジメチルスルホキシド、および乳酸エチルの１以上などの溶媒を含む。溶媒は好ましくは、化合物または塩を通常の貯蔵条件下で安定した状態に保つのに十分な化学特性および量を有する。場合により、組成物が１以上の保存剤を含むことが望ま

しい可能性がある。保存剤が存在することで、例えば組成物をより長期にわたって貯蔵することが可能となる。組成物中の全ての賦形剤が、好ましくは医薬として許容されるものである。

【０４１４】

本発明の化合物および塩は、あるいは、非経口経路によって、例えば直腸投与、吸入（例えば、ミストやエアロゾルによる）、経皮投与（例えば、経皮貼付剤による）、または非経口投与（例えば、皮下注射、静脈注射、筋肉注射など）によって投与することが可能であることは想到される。

【０４１５】

概して、本発明の組成物は、感染部位に治療上有効量の当該化合物もしくは塩を提供する製剤で投与される。「治療上有効量」は、「標的病原体感染を治療」と等しい、標的病原体（複数）感染（その病原体のあらゆる段階であることができる）を予防、改善、抑制もしくは根絶するのに十分な量である。特に犬糸状虫の場合、感染を処置することで、犬糸状虫疾患、すなわち犬糸状虫感染によって生じるあらゆる障害が処置される（すなわち、予防、改善、抑制もしくは治癒される）。概して、治療上有効量は、感染部位での標的病原体を防除するのに有効な濃度を達成するのに必要な量と定義される。感染部位での濃度は好ましくは、少なくとも標的病原体についての当該化合物もしくは塩のＭＩＣ$_{１００}$レベル（最小阻害濃度、すなわち標的病原体の１００％の運動性を阻害する濃度）に等しい。当該化合物または塩を別の有効成分（例えば、１以上の他の駆虫薬）とともに投与する限りにおいて、その用量は好ましくは、他の有効成分の量とともに、治療上有効量を構成する量の当該化合物もしくは塩を含む。

【０４１６】

当該化合物または塩の単回投与は、犬糸状虫感染を治療するのに十分であることができる。代表的にはそのような単一用量が好ましいが、複数用量を用いることが可能であることが想到される。当該化合物または塩を投与する場合、感染を治療するための総用量は約０．０１ｍｇ／ｋｇ（すなわち、体重１ｋｇ当たりの化合物もしくは塩のミリグラム数）より大きい。一部のそのような実施形態において、合計用量は、約０．０１から約１００ｍｇ／ｋｇ、約０．０１から約５０ｍｇ／ｋｇ、約０．１から約２５ｍｇ／ｋｇ、または約１から約２０ｍｇ／ｋｇである。イヌの場合、例えば、その用量は、通常は約１から約１５ｍｇ／ｋｇ、約８から約１２ｍｇ／ｋｇ、または約１０ｍｇ／ｋｇである。他の投与経路について、同じ用量範囲が好適な場合がある。例えば、一部の実施形態において、皮下投与について、同じ用量範囲を用いる。しかしながら、所望の用量は、当該化合物または塩を非経口投与、特には静脈投与する一部の場合で、相対的に少ないものであることができる。例えば、一部のそのような実施形態において、当該用量は約０．０１から約５０ｍｇ／ｋｇ、約０．０１から約１５ｍｇ／ｋｇ、または約０．１から約１０ｍｇ／ｋｇである。イヌの場合、例えば、好適な静脈用量は、約０．０１から約１０ｍｇ／ｋｇ、約０．１から約５ｍｇ／ｋｇ、または約１ｍｇ／ｋｇであることができる。

【０４１７】

当該化合物または塩を注射によって非経口投与する場合、製剤中の当該化合物もしくは塩の濃度は好ましくは、非経口投与に許容される容量での当該化合物もしくは塩の所望の治療上有効量を提供するのに十分である。

【０４１８】

好ましい用量に影響する因子には、例えば、所期の被投与者の種類（例えば、動物種および品種）、年齢、大きさ、性別、飼料、活性および状態；投与経路；投与される特定の組成物の活性、効力、薬物動態および毒性プロファイルなどの薬理などの薬理的考慮事項；および当該化合物もしくは塩が有効成分の組み合わせの一部として投与されるか否かなどがあり得る。従って、当該化合物もしくは塩の好ましい量は変動し得ることから、上記の代表的用量から逸脱することも可能である。そのような用量調節の決定は、当業者の技術の範囲内である。

【０４１９】

本発明は、ａ）本発明による使用のための１以上の化合物とｂ）成分ａ）とは構造的に異なる１以上の活性化合物を含む医薬組成物に有用な組み合わせに関するものでもある。活性化合物ｂ）は好ましくは駆虫薬化合物であり、より好ましくはアベルメクチン類（例えば、イベルメクチン、セラメクチン、ドラメクチン、アバメクチン、およびエピノメクチン）；ミルベマイシン類（モキシデクチンおよびミルベマイシンオキシム）；プローベンズイミダゾール類（例えば、フェバンテル、ネトビミン（ｎｅｔｏｂｉｍｉｎ）およびチオファネート）；ベンズイミダゾール誘導体類、例えばチアゾールベンズイミダゾール誘導体（例えば、チアベンダゾールおよびカンベダゾール）またはカーバメートベンズイミダゾール誘導体（例えば、フェンベンダゾール、アルベンダゾール（オキサイド）、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、パーベンダゾール、オキシベンダゾール、フルベンダゾールおよびトリクラベンダゾール）；イミダゾチアゾール類（例えば、レバミゾールおよびテトラミソール）；テトラヒドロピリミジン（モランテルおよびピランテル）、有機リン酸塩（例えば、トリクロルホン、ハロクソン、ジクロルボスおよびナフタロホス）；サリチルアニリド類（例えば、クロサンテル、オキシクロザニド、ラフォキサニドおよびニクロサミド）；ニトロフェノール系化合物（例えば、ニトロキシニルおよびニトロスカナート）；ベンゾエンジスルフォナミド類（ｂｅｎｚｏｅｎｅｄｉｓｕｌｐｈｏｎａｍｉｄｅｓ）（例えば、クロルスロン）；ピラジナイソキノリン類（ｐｙｒａｚｉｎａｉｓｏｑｕｉｎｏｌｉｎｅｓ）（例えば、プラジカンテルおよびエピシプランテル）；複素環化合物（例えば、ピペラジン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェンおよびフェノチアジン）；ヒ素剤（例えば、チアセタルサミド（ｔｈｉａｃｅｔａｒｓａｍｉｄｅ）、メロルサミン（ｍｅｌｏｒｓａｍｉｎｅ）およびアルセナマイド）；シクロオクタデプシペプチド類（例えば、エモデプシド）；パラヘルクアミド類（ｐａｒａｈｅｒｑｕａｍｉｄｅｓ）（例えば、デルカンテル）；アミノーアセトニトリル化合物（例えば、モネパンテル、ＡＡＤ１５６６）；およびアミジン化合物（例えば、アミダンテルおよびトリベンジミジン）（塩などの全ての医薬として許容される形態を含む）からなる群から選択される。

【０４２０】

想到される併用療法において、本発明で使用される化合物は、他の有効成分の前、同時および／または後に投与することができる。さらに、本発明で使用される化合物は、他の有効成分と同じ組成物で、および／または他の有効成分からの別の組成物で投与することができる。さらに、本発明で使用される化合物および他の有効成分は、同じおよび／または異なる投与経路によって投与することができる。

【０４２１】

実施例

下記の実施例は、説明のみを目的とするものであり、いかなる形でも本開示の残りの部分に限定するものではない。

【０４２２】

実施例１．本発明で使用するために製造される化合物を分析するためのプロトコール

本願人らは、本発明に従って使用される多数の化合物を製造した。各種の分析高速液体クロマトグラフィー（「ＨＰＬＣ」）および質量分析（「ＭＳ」）プロトコールを用いて、同定および純度測定を行い、確認した。これらのプロトコールについて下記で述べる。

【０４２３】

システムＩ

場合により、脱気剤（Ｇ１３７９Ａ）を取り付けたバイナリポンプ（Ｇ１３１２Ａ）、ウェルプレートサンプラー（Ｇ１３６７Ａ）、カラムオーブン（Ｇ１３１６Ａ）、ダイオードアレイ検出器（Ｇ１３１５Ｂ）、ＥＳＩ源を有する質量検出器（Ｇ１９４６ＤＳＬ）および蒸発光検出器（Ｓｅｄｅｘ７５）を有するＨＰＬＣ／ＭＳＤ１１００（Ａｇｉｌｅｎｔ，　Ｓａｎｔａ　Ｃｌａｒａ，　ＣＡ，　ＵＳＡ）を用いて、化合物分析を行った。４種類の異なるカラムおよび検出方法を、このシステムとともに用いた。

【０４２４】

プロトコールＩ－Ａ

このプロトコールに用いたカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ３０ｍｍおよび３．５μｍ充填剤を有するＺｏｒｂａｘ　ＳＢ－Ｃ１８（Ａｇｉｌｅｎｔ）であった。カラムは、３０℃（環境温度）で運転した。注入容量は５．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は８分（平衡化を含む）であった。下記の勾配で２種類の溶離液を用いた。

【表１】

時間 (分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	90	10
0.2	90	10
4.2	2	98
5.5	2	98

【０４２５】

分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は２１０および２５４ｎｍのＵＶ；ＥＳＩ／ＭＳ（１００から１０００ｍ／ｚ）、陽イオン；およびＥＬＳＤ（Ｓｅｄｅｘ７５）であった。

【０４２６】

プロトコールＩ－Ｂ

このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ５０ｍｍ、および３μｍ充填剤を有するＡｔｌａｎｔｉｓ　ｄＣ１８（Ｗａｔｅｒｓ，　Ｍｉｌｆｏｒｄ，　ＭＡ，　ＵＳＡ）であった。カラムは３０℃で運転した。注入容量は２．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は１０分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表２】

時間 (分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	95	5
1.0	95	5
5.0	2	98
7.0	2	98

【０４２７】

分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は、２１０および２５４ｎｍのＵＶ；ＥＳＩ／ＭＳ（１００－１０００ｍ／ｚ）、陽イオン；およびＥＬＳＤ（Ｓｅｄｅｘ７５）であった。

【０４２８】

プロトコールＩ－Ｃ

このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ５０ｍｍおよび３μｍ充填剤を有するＡｔｌａｎｔｉｓ　ｄＣ１８であった。カラムは３０℃で運転した。注入容量は２．０μＬであり、流量は１．５ｍＬ／分であり、運転時間は６分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表３】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	90	10
0.5	90	10
3.0	2	98
4.0	2	98

【０４２９】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は、２１０および２５４ｎｍのＵＶ；ＥＳＩ／ＭＳ（８５－１０００ｍ／ｚ）、陽イオン；およびＥＬＳＤ（Ｓｅｄｅｘ７５）であった。

【０４３０】
プロトコールＩ－Ｄ
このプロトコールに使用されるカラムは、Ｃｈｒｏｍｏｌｉｔｈ　Ｆａｓｔ　Ｇｒａｄｉｅｎｔ、ＲＰ－１８ｅ、直径２ｍｍおよび長さ５０ｍｍであった。カラムは、３５℃で運転した。注入容量は１．０μＬであり、流量は１．２ｍＬ／分であり、運転時間は３．５分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表４】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	90	10
2.0	0	100
2.7	0	100
3.0	90	10

【０４３１】
分析前に、サンプルをＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出（ｄｉｃｔｉｏｎ）方法は、２１０および２５４ｎｍのＵＶ；ＥＳＩ／ＭＳ（１００－１０００ｍ／ｚ）、陽イオン；およびＥＬＳＤ（Ｓｅｄｅｘ７５）であった。

【０４３２】
プロトコールＩ－Ｅ
このプロトコールに使用されるカラムは、Ｃｈｒｏｍｏｌｉｔｈ　Ｆａｓｔ　Ｇｒａｄｉｅｎｔ、ＲＰ－１８ｅ、直径２ｍｍおよび長さ５０ｍｍであった。カラムは３５℃で運転した。注入容量は１．０μＬであり、流量は１．２ｍＬ／分であり、運転時間は３．５分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表５】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	98	2

2.0	2	98
2.5	2	98
3.0	98	2

【０４３３】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は、２１０および２５４ｎｍのＵＶ；ＥＳＩ／ＭＳ（１００－１０００ｍ／ｚ）、陽イオン；およびＥＬＳＤ（Ｓｅｄｅｘ７５）であった。
【０４３４】
システムＩＩ
場合により、脱気剤（Ｇ１３７９Ａ）を取り付けたバイナリポンプ（Ｇ１３１２Ａ）、ウェルプレートサンプラー（Ｇ１３６７Ａ）、カラムオーブン（Ｇ１３１６Ａ）、ダイオードアレイ検出器（Ｇ１３１５Ｂ）、ＡＰＣＩ源を取り付けた質量検出器（Ｇ２４４５ＤＳＬ）、および蒸発光検出器（Ａｌｌｔｅｃｈ　ＥＬＳＤ２０００）を有するＬＣ／ＭＳＤ　Ｔｒａｐ１１００（Ａｇｉｌｅｎｔ，　Ｓａｎｔａ　Ｃｌａｒａ，　ＣＡ，　ＵＳＡ）を用いて、化合物分析を実施した。３種類の異なるカラムおよび検出方法を、このシステムとともに用いた。
【０４３５】
プロトコールＩＩ－Ａ
このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ３０ｍｍ、および３．５μｍ充填剤を有するＺｏｒｂａｘ　ＳＢ－Ｃ１８（Ａｇｉｌｅｎｔ）であった。カラムは３０℃で運転した。注入容量は５．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は８分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。
【表６】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、99.9/0.1(体積比)
0.0	90	10
0.2	90	10
4.2	2	98
5.5	2	98

【０４３６】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は、２１０および２５４ｎｍのＵＶ；およびＡＰＣＩ／ＭＳ（８０－１０００ｍ／ｚ）、陽イオンであった。
【０４３７】
プロトコールＩＩ－Ｂ
このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ５０ｍｍおよび２．５μｍ充填剤を有するＸＢｒｉｄｇｅ　Ｃ１８（Ｗａｔｅｒｓ）であった。カラムは４０℃で運転した。注入容量は２．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は１０分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表７】

時間(分)	溶媒A(%) 水/アンモニア、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル
0.0	75	25
5.0	0	100
7.0	0	100
7.5	75	25

【０４３８】

分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は、２５４および２１０ｎｍのＵＶ；およびＡＰＣＩ／ＭＳ（１００－１５００ｍ／ｚ）、陽イオンであった。

【０４３９】

プロトコールＩＩ－Ｃ

このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ１５０ｍｍ、および３μｍ充填剤を有するＡｌｔａｎｔｉｓ　ｄＣ１８（Ｗａｔｅｒｓ）であった。カラムは４０℃で運転した。注入容量は５．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は１６分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表８】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、 99.9/0.1(体積比)
0.0	98	2
10	0	100
12	0	100
13	98	2

【０４４０】

分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は２５４および２１０ｎｍのＵＶ；およびＡＰＣＩ／ＭＳ（１００－１０００ｍ／ｚ）、陽イオンであった。

【０４４１】

プロトコールＩＩ－Ｄ

このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ５０ｍｍ、および３μｍ充填剤を有するＡｌｔａｎｔｉｓ　ｄＣ１８（Ｗａｔｅｒｓ）であった。カラムは４０℃で運転した。注入容量は５．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であり、運転時間は８分（平衡化を含む）であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。

【表９】

時間(分)	溶媒A(%) 水/ギ酸、99.9/0.1(体積比)	溶媒B(%) アセトニトリル/ギ酸、 99.9/0.1(体積比)
0.0	90	10
10	0	100
12	0	100
13	90	10

【０４４２】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は２５４および２１０ｎｍのＵＶ；およびＡＰＣＩ／ＭＳ（１００－１０００ｍ／ｚ）、陽イオンであった。
【０４４３】
プロトコールＩＩ－Ｅ
このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ１５０ｍｍ、および５μｍ充填剤を有するＰｈｅｎｏｍｅｎｅｘ　（ｇｅｍｉｎｉ）であった。カラムは３５℃で運転した。注入容量は１．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。
【表１０】

時間 (分)	溶媒A(%) 10mMギ酸/アセトニトリル	溶媒B(%) 10mMギ酸/水
0.0	2	98
10.5	98	2
18	98	2

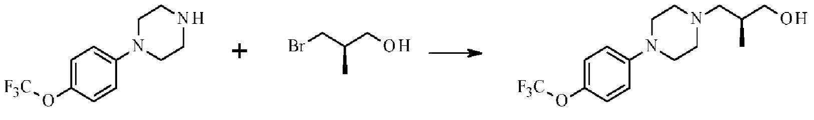
【０４４４】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は３２０および２２０ｎｍのＵＶ；およびＥＳＩ／ＭＳ（１００－８００ｍ／ｚ）、陽イオンおよび陰イオンであった。
【０４４５】
プロトコールＩＩ－Ｆ
このプロトコールに使用されるカラムは、直径４．６ｍｍ、長さ１５０ｍｍ、および５μｍ充填剤を有するＰｈｅｎｏｍｅｎｅｘ　（ｇｅｍｉｎｉ）であった。カラムは３５℃で運転した。注入容量は１．０μＬであり、流量は１．０ｍＬ／分であった。２種類の溶離液を次の勾配で用いた。
【表１１】

時間 (分)	溶媒A(%) 10mMアンモニア/アセトニトリル	溶媒B(%) 10mMアンモニア/水
0.0	2	98
10.5	98	2
18	98	2

【０４４６】
分析前に、サンプルを溶媒ＡおよびＢの１：１混合物で希釈した。検出方法は３２０および２２０ｎｍのＵＶ；およびＥＳＩ／ＭＳ（１００－８００ｍ／ｚ）、陽イオンおよび陰イオンであった。
【０４４７】
例示化合物
本発明で使用される化合物または塩は、ＷＯ２０１０／１１５６８８に記載されている。ＷＯ２０１０／１１５６８８の実施例２から１６８（１２０から２２３頁）は、本発明で使用される化合物の例として、ならびにそれらの製造方法として本願に組み込まれる。同じことが、ＷＯ２０１０／１１５６８８の表ＩＩに例示の実施例１６９から１０３６（２２３から３１８頁）にも当てはまる。
【０４４８】

本発明で使用される化合物の別の例は、本明細書において下記で記載されている。実施例１０３７は下記のように製造される。

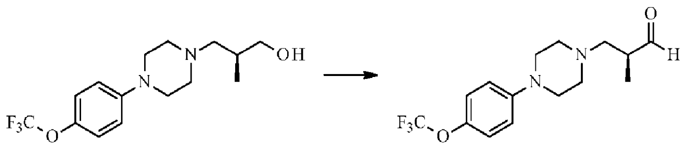
【化２７３】



【０４４９】

１－［４－（トリフルオロメトキシ）フェニル］ピペラジン（４０ｇ；１６２ｍｍｏｌ）、（２Ｒ）－３－ブロモ－２－メチル－プロパン－１－オール（２６．４ｇ；１６６ｍｍｏｌ）およびトリエチルアミン（４５．３ｍＬ；３２５ｍｍｏｌ）をエタノール（３５０ｍＬ）に溶かし、得られた混合物を終夜還流撹拌する。冷却して室温とした後、反応混合物をセライトで濾過し、濾液を減圧下に濃縮する。得られた残留物をジクロロメタン（３００ｍＬ）に溶かし、水で２回洗浄する（それぞれ２００ｍＬ）。有機相を分離し、硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮する。粗生成物をエタノール－水混合物からの再結晶によって精製して、乾燥後に所望の生成物を純粋な形で得る（３１ｇ；９７ｍｍｏｌ）。

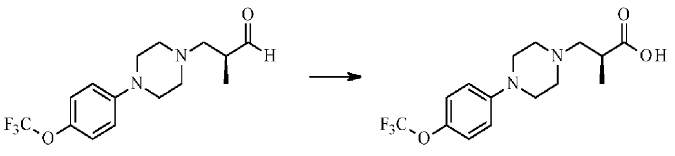
【化２７４】



【０４５０】

２Ｍオキサリルクロライドのジクロロメタン中溶液（７５ｍＬ；１５０ｍｍｏｌ）をジクロロメタン（２００ｍＬ）で希釈し、冷却して－７５℃とする。ジメチルスルホキシド（１４．３ｍＬ；２０１ｍｍｏｌ）を加え、次に（２Ｓ）－２－メチル－３－［４－［４－（トリフルオロメトキシ）フェニル］ピペラジン－１－イル］プロパン－１－オール（３１．５ｇ；１００ｍｍｏｌ）のジクロロメタン（２５０ｍＬ）中溶液を加える。反応混合物を－７５℃で４５分間撹拌し、室温とする。室温で１０分後、水（５００ｍＬ）を加え、有機相を分離し、水で２回洗浄する（それぞれ２５０ｍＬ）。硫酸ナトリウムで脱水後、有機相を減圧下に濃縮することで、所望のアルデヒド（３１ｇ；１００ｍｍｏｌ）を粗生成物として得て、それを次の段階でそのまま用いる。

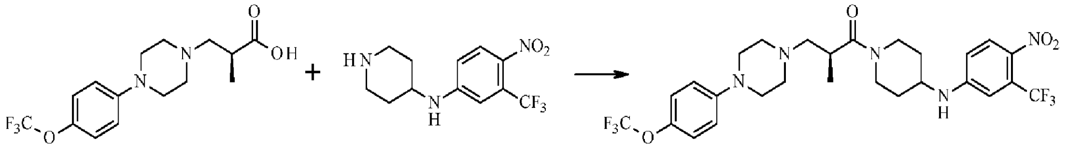
【化２７５】



【０４５１】

（２Ｓ）－２－メチル－３－［４－［４－（トリフルオロメトキシ）フェニル］ピペラジン－１－イル］プロパナール（３１．４ｇ；９９ｍｍｏｌ）をｔｅｒｔ－ブタノール（４８０ｍＬ）および水（１２０ｍＬ）の混合物に懸濁させる。２－メチル－ブテン（３４８ｇ；４．９６ｍｏｌ）を加え、懸濁液を、溶液が得られるまで室温で撹拌する。リン酸二水素ナトリウム（２３．８ｇ；１９９ｍｍｏｌ）を、溶液に５℃で加え、亜塩素酸ナトリウム（１６．８ｇ；１４９ｍｍｏｌ）を等量ずつ２回に分けて加える。反応混合物を室温とし、２．５時間撹拌する。得られた懸濁液を濾過し、沈澱を水で２回洗浄し（それぞれ１００ｍＬ）、５０℃で真空乾燥して、所望の生成物を得る（２０．５ｇ；６２ｍｍｏｌ）。

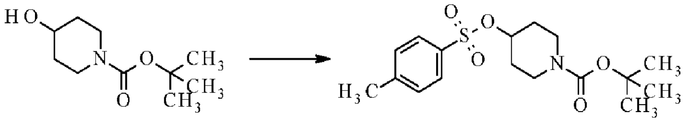
【化２７６】



【０４５２】
（２Ｓ）－２－メチル－３－［４－［４－（トリフルオロメトキシ）フェニル］ピペラジン－１－イル］プロパン酸（１０ｇ；３０ｍｍｏｌ）をジクロロメタン（３００ｍＬ）に懸濁させ；Ｏ－ベンゾトリアゾール－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチル－ウロニウム－ヘキサフルオロ－ホスフェート（１１．６ｇ；３０ｍｍｏｌ）およびジイソプロピルエチルアミン（１０．５ｍＬ、６０ｍｍｏｌ）を加え、得られた混合物を室温で２０分間撹拌する。Ｎ－［４－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル］ピペリジン－４－アミン（９．６ｇ；３３ｍｍｏｌ）を加え、得られた溶液を４時間撹拌する。次に、反応混合物を１Ｍ　ＮａＯＨ水溶液、０．５Ｎ　ＨＣｌ、水およびブラインの順で洗浄する（それぞれ２５０ｍＬ）。有機相を濃縮して、所望の生成物を粗生成物として得る。ジクロロメタンおよびｎ－ペンタンの混合物からの沈澱によって、純粋な形での所望の生成物を得る（１４．６ｇ；２４ｍｍｏｌ）。この化合物１０３７の構造を、プロトコールＩ－Ｅを用いて確認した。計算質量＝６０３；実測質量＝６０３；ＨＰＬＣ保持時間＝１．８５分。

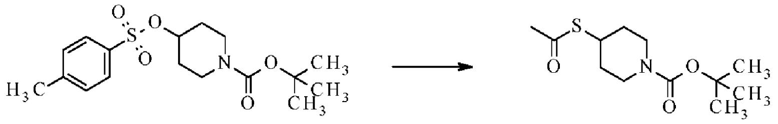
【０４５３】
実施例１０３８は次のように製造する。

【化２７７】



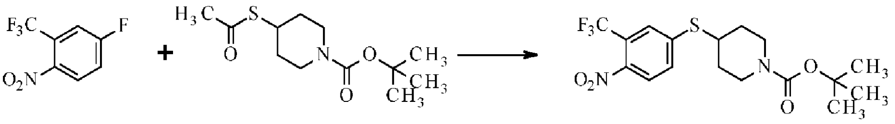
【０４５４】
トシルクロライド（１１．８ｇ、６２ｍｍｏｌ）および４－ヒドロキシピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１０ｇ、５０ｍｍｏｌ）をピリジン（５０ｍＬ）に溶かし、完全な変換が認められるまで室温で撹拌する。反応混合物を減圧下に濃縮する。得られた残留物をジクロロメタン（２００ｍＬ）に取り、有機層を水で洗浄し（７０ｍＬで２回）、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮する。純粋な所望の生成物を、ｎ－ヘプタンからの粗生成物の再結晶後に得る（１５．１ｇ、４３ｍｍｏｌ）。

【化２７８】



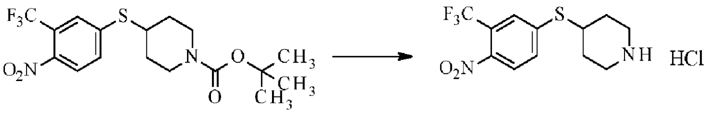
【０４５５】
４－（ｐ－トリルスルホニルオキシ）ピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１５．１ｇ、４３ｍｍｏｌ）およびチオ酢酸カリウム（２３．５ｇ、２０６ｍｍｏｌ）をジメチルホルムアミド（１００ｍＬ）に溶かし、得られた混合物を５０℃で５時間撹拌する。反応混合物を冷却して室温とし、酢酸エチル（５００ｍＬ）で希釈する。有機相を水で洗浄し（１５０ｍＬで３回）、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮する。粗残留物を、ジクロロメタン勾配／ヘキサン（５０から１００％）を用いるシリカゲルでのカラムクロマトグラフィーによって精製する。対象の分画を合わせ、減圧下に濃縮して、所望の生成物を得る。

【化２７９】



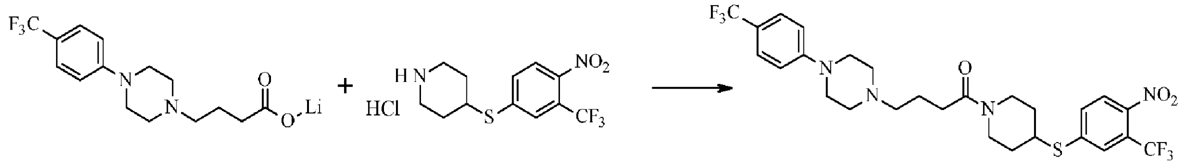
【０４５６】
４－フルオロ－１－ニトロ－２－（トリフルオロメチル）ベンゼン（６２９ｍｇ、３ｍｍｏｌ）、４－アセチルスルファニルピペリジン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（９００ｍｇ、３．５ｍｍｏｌ）および炭酸カリウム（１．３ｇ、９．４ｍｍｏｌ）を水およびアセトニトリルの２：１０混合物（１２ｍＬ）に溶かす。得られた混合物を１００℃で４時間撹拌する。室温まで冷却した後、酢酸エチル（５０ｍＬ）を加える。有機層を水で抽出し（１０ｍＬで２回）、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮する。ジクロロメタンで溶離を行うシリカゲル層での濾過後に、純粋な所望の生成物が得られる。

【化２８０】



【０４５７】
トリフルオロ酢酸（３０％）のジクロロメタン（６ｍＬ）中溶液を、最小量のジクロロメタンに溶かしたｔｅｒｔ－ブチル４－［４－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル］スルファニルピペリジン－１－カルボキシレート（９４０ｍｇ、２，３ｍｍｏｌ）に加える。得られた混合物を室温で２０分間撹拌し、減圧下に濃縮する。残留物を、４Ｍ塩酸／ジオキサン溶液に取る。生成した沈澱を濾過し、ジエチルエーテル（１０ｍＬで３回）で洗い、真空乾燥機で乾燥させて、純粋な形で所望の生成物を得る（７２８ｍｇ、２．１ｍｍｏｌ）。

【化２８１】



【０４５８】
４－［４－［４－（トリフルオロメチル）フェニル］ピペラジン－１－イル］ブタノイルオキシリチウム（０．０５ｍｍｏｌ）およびＯ－ベンゾトリアゾール－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチル－ウロニウム－ヘキサフルオロ－ホスフェート（０．０５ｍｍｏｌ）をテトラヒドロフランおよびジメチルホルムアミドの７：３混合物（１ｍＬ）に溶かす。４－［４－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル］スルファニルピペリジン塩酸塩（０．０５ｍｍｏｌ）およびジイソプロピルエチルアミン（０．１０ｍｍｏｌ）の溶液を加え、得られた混合物を室温で１時間撹拌する。反応混合物を減圧下に濃縮し、分取ＨＰＬＣによって精製する。所望の生成物が、固体として純粋な形で得られる（２３ｍｇ、０．０４ｍｍｏｌ）。それの構造を、プロトコールＩ－Ｅを用いて確認する。計算質量＝５８７；実測質量＝５８８；ＨＰＬＣ保持時間＝１．５８分。

【０４５９】
実施例１０３９．犬糸状虫に対する活性の測定
犬糸状虫感染イヌから回収したミクロフィラリアを、無菌条件下で９６ウェルプレートに蒔いた。犬糸状虫のＬ３幼虫を感染蚊から回収し、脱皮させて化合物試験に必要なＬ４段階とした。Ｌ４幼虫を無菌条件下で９６ウェルプレートに蒔いた。化合物のＤＭＳＯ溶液を寄生生物含有プレートに加えた。化合物を加えた後、寄生生物を３日間インキュベー

トしてから、生存度の評価を行った。殺ミクロフィラリア活性は、半最大有効濃度（EC_{50}）として報告する。Ｌ４幼虫に対する効果は、運動性の完全喪失を生じる最低用量（MIC_{100}）として報告する。

【０４６０】

実施例１０３７、１５６（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５３（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）および４８（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）による化合物は、犬糸状虫ミクロフィラリアに対して１０μＭ未満のEC_{50}値を示した。実施例１０３８、９４２（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６９７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６８９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、５３９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４４４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４１６（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５１（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１４１（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１３４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、８９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６８（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、５４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４５（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、３３（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１２（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）および７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）による化合物は、犬糸状虫ミクロフィラリアに対して５μＭ未満のEC_{50}値を示した。

【０４６１】

実施例１０３８、１５７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５６（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１３４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６８（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）および４５（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）による化合物は、犬糸状虫のＬ４幼虫に対して１０μＭ未満のMIC_{100}値を示した。実施例１０３７、９４２（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６９７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、６８９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、５３９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４４４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４１６（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５３（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１５１（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１４１（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、８９（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、５４（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、３３（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、１７（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）、４８（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）および１２（ＷＯ２０１０／１１５６８８参照）による化合物は、犬糸状虫のＬ４幼虫に対して５μＭ未満のMIC_{100}値を示した。

【０４６２】

定義

「アルキル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には１から約２０個の炭素原子、より代表的には１から約８個の炭素原子、さらにより代表的には１から約６個の炭素原子を含む直鎖もしくは分岐の飽和ヒドロカルビル置換基（すなわち、炭素および水素のみを含む置換基）を意味する。そのような置換基の例には、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソーブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、ペンチル、イソーアミル、ヘキシル、およびオクチルなどがある。

【０４６３】

「アルケニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、１以上の二重結合および代表的には２から約２０個の炭素原子、より代表的には約２から約１０個の炭素原子、さらにより代表的には約２から約８個の炭素原子、さらにより代表的には約２から約６個の炭素原子を含む直鎖もしくは分岐のヒドロカルビル置換基を意味する。そのような置換基の例には、エテニル（ビニル）；２－プロペニル；３－プロペニル；１，４－ペンタジエニル；１，４－ブタジエニル；１－ブテニル；２－ブテニル；３－ブテニル；およびデセニルなどがある。

【０４６４】

「アルキニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、１以上の三重結合および代表的には２から約２０個の炭素原子、より代表的には約２から約８個の炭素原子、さらにより代表的には約２から約６個の炭素原子を含む直鎖もしくは分岐のヒドロカルビル置換基を意味する。そのような置換基の例には、エチニル、２－プロピニル、３－プロピニル、デシニル、１－ブチニル、２－ブチニルおよび３－ブチニルなどがある。

【０４６５】

「炭素環」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には３から１４個の炭素環原子（「環原子」は、一緒に結合して環状部分の環もしくは複数環を形成する原子である。）を含む飽和環状（すなわち、「シクロアルキル」）、部分飽和環状（すなわち、「シクロアルケニル」）、または完全不飽和（すなわち、「アリール」）ヒドロカルビル置換基を意味する。炭素環は、単一環であることができ、それは代表的には３から６個の環原子を含む。そのような単環炭素環の例には、シクロプロパニル、シクロブタニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロペンタジエニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニルおよびフェニルなどがある。炭素環はあるいは、一緒に縮合した複数（代表的には２または３）の環であることができ、例えばナフタレニル、テトラヒドロナフタレニル（「テトラリニル」とも称される）、インデニル、イソインデニル、インダニル、ビシクロデカニル、アントラセニル、フェナントレン、ベンゾナフテニル（「フェナレニル」とも称される）、フルオレニル、デカリニルおよびノルピナニルである。

【０４６６】

「シクロアルキル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には３から１４個の炭素環原子を含む飽和環状ヒドロカルビル置換基を意味する。シクロアルキルは、代表的には３から６個の炭素環原子を含む単一の炭素環であることができる。単一環シクロアルキルの例には、シクロプロピル（または「シクロプロパニル」）、シクロブチル（または「シクロブタニル」）、シクロペンチル（または「シクロペンタニル」）、およびシクロヘキシル（または「シクロヘキサニル」）などがある。シクロアルキルはあるいは、一緒に縮合した複数（代表的には２または３）炭素環であることができ、例えばデカリニルまたはノルピナニルである。

【０４６７】

「アリール」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には６から１４個の炭素環原子を含む芳香族炭素環を意味する。アリールの例には、フェニル、ナフタレニルおよびインデニルなどがある。

【０４６８】

場合により、ヒドロカルビル基（例えば、アルキル、アルケニル、アルキニル、またはシクロアルキル）における炭素原子数は、接頭辞「C_x－C_y－」（ｘは基中の炭素原子の最小数であり、ｙは最大数である。）によって示される。従って、例えば、「C_1－C_6－アルキル」は、１から６個の炭素原子を含むアルキル置換基を指す。さらに説明すると、C_3－C_6－シクロアルキルは、３から６個の炭素環原子を含む飽和ヒドロカルビル環を意味する。

【０４６９】

「水素」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、水素基（または「ヒドリド」）を意味すし、－Ｈとして描くことができる。

【０４７０】

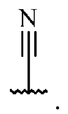
「ヒドロキシ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－ＯＨを意味する。

【０４７１】

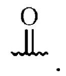
「ニトロ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－NO_2を意味する。

【０４７２】

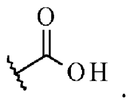
「シアノ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－ＣＮを意味する。
【化２８１】



【０４７３】
「オキソ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、オキソ基を意味し、下記のように描くことができる。
【化２８２】



【０４７４】
「カルボキシ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｃ（Ｏ）－ＯＨを意味する。
【化２８３】



【０４７５】
「アミノ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、$-NH_2$を意味する。
【０４７６】
「ハロゲン」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、を意味する。フッ素基（－Ｆと描くことができる「フルオロ」）、塩素基（－Ｃｌと描くことができる「クロロ」）、臭素基（－Ｂｒと描くことができる「ブロモ」）、またはヨウ素基（－Ｉと描くことができる「ヨード」）。代表的には、フルオロまたはクロロが好ましく、多くの場合でフルオロが特に好ましい。
【０４７７】
置換基が「置換されている」と記載されている場合、その置換基の炭素、窒素、酸素もしくは硫黄上の水素に代えて、非水素置換基となっている。従って、例えば、置換されたアルキル置換基は、アルキル置換基上の水素に代えて、少なくとも一つの非水素置換基となっているアルキル置換基である。説明すると、モノフルオロアルキルはフルオロで置換されたアルキルであり、ジフルオロアルキルは２個のフルオロで置換されたアルキルである。置換基上に複数の置換がある場合、各非水素置換基は同一であっても異なっていても良い（別段の断りがない限り）ことは認識しておくべきである。
【０４７８】
置換基が「置換されていても良い」と記載されている場合、その置換基は（１）置換されていないか、（２）置換されていることができる。ある置換基が特定数までの非水素置換基で置換されていても良いと記載されている場合、その置換基は、（１）置換されていないか、（２）その特定数以下の非水素置換基、または当該置換基上の置換可能な位置の最大数以下のいずれか少ない方によって置換されていることができる。従って、例えば、ある置換基が３個以下の置換基で置換されていても良いヘテロアリールと記載されている場合、３個未満の置換可能な位置を有するいずれのヘテロアリールも、そのヘテロアリールが置換可能な位置を有するだけの数以下のみの非水素置換基によって置換されていても良いことが考えられる。説明すると、テトラゾリル（それが単結合によって単一の非水素部分に結合している場合、１個のみの置換可能位置を有する）は、１個以下の非水素置換基で置換されていても良いものと考えられる。さらに説明すると、アミノ窒素が２個以下

の非水素置換基で置換されていても良いと記載されている場合、１級アミノ窒素は２個以下の非水素置換基で置換されていても良いが、２級アミノ窒素はわずか１個以下の非水素置換基で置換されていても良い。

【０４７９】

「置換可能な位置」という用語は、置換基部分が所期の使用に関して薬物動態的および薬力学的に安定な化合物を与える位置を意味する。

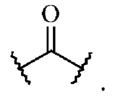
【０４８０】

接頭辞「ハロ」は、その接頭辞が結合している置換基が１以上の独立に選択されるハロゲンで置換されていることを示している。例えば、ハロアルキルは、１個のハロゲンを１個の水素に代えて有し、または複数のハロゲンを同数の水素に代えて有するアルキル置換基を意味する。ハロアルキルの例には、クロロメチル、１－ブロモエチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、および１，１，１－トリフルオロエチルなどがある。さらに説明すると、「ハロアルコキシ」は、１個のハロゲンが１個の水素に代えてあり、または複数のハロゲンが同数の水素に代えてあるアルコキシ置換基を意味する。ハロアルコキシ置換基の例には、クロロメトキシ、１－ブロモエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ（「パーフルオロメチルオキシ」とも称される）、および１，１，１，－トリフルオロエトキシなどがある。ある置換基が複数のハロゲンによって置換されている場合、そのハロゲンは同一であっても異なっていても良い（別段の断りがない限り）ことは認識しておくべきである。

【０４８１】

「カルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｃ（Ｏ）－を意味する。

【化２８４】



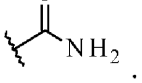
【０４８２】

この用語は、水和カルボニル置換基、すなわち、－Ｃ（ＯＨ）$_2$－を包含するものでもある。

【０４８３】

「アミノカルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$を意味する。

【化２８５】



【０４８４】

「オキシ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、エーテル置換基を意味し、－Ｏ－と描くことができる。

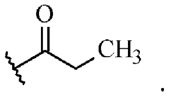
【０４８５】

「アルコキシ」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、アルキルエーテル置換基、すなわち－Ｏ－アルキルを意味する。そのような置換基の例には、メトキシ（－Ｏ－ＣＨ$_3$）、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソ－プロポキシ、ｎ－ブトキシ、イソ－ブトキシ、ｓｅｃ－ブトキシ、およびｔｅｒｔ－ブトキシなどがある。

【０４８６】

「アルキルカルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－Ｃ（Ｏ）－アルキルを意味する。例えば、「エチルカルボニル」は下記のように描くことができる。

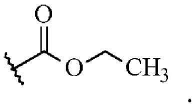
【化２８６】



【０４８７】

「アルコキシカルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－アルキルを意味する。例えば、「エトキシカルボニル」は下記のように描くことができる。

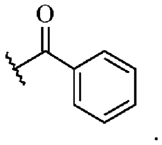
【化２８７】



【０４８８】

「炭素環カルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－Ｃ（Ｏ）－炭素環を意味する。例えば、「フェニルカルボニル」は下記のように描くことができる。

【化２８８】



【０４８９】

同様に、「複素環カルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、－Ｃ（Ｏ）－複素環を意味する。

【０４９０】

「スルファニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、チアエーテル置換基、すなわち二価硫黄原子がエーテル酸素原子に代えて存在するエーテル置換基を意味する。そのような置換基は、－Ｓ－と描くことができる。これ、例えば「アルキル－スルファニル－アルキル」はアルキル－Ｓ－アルキルを意味する。

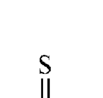
【０４９１】

「チオール」または「メルカプト」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、スルフヒドリル置換基を意味し、－ＳＨと描くことができる。

【０４９２】

「チオカルボニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、硫黄が酸素に代えて存在するカルボニルを意味する。そのような置換基は、－Ｃ（Ｓ）－と描くことができ、下記のように描くこともできる。

【化２８９】



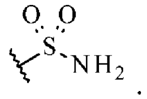
【０４９３】

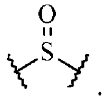
「スルホニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｓ（Ｏ）$_2$－を意味する。

【化２９０】

【０４９４】

従って、例えば「アルキル－スルホニル－アルキル」は、アルキル－Ｓ（Ｏ）$_2$－アルキルを意味する。

【０４９５】
「アミノスルホニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＮＨ$_2$を意味する。
【化２９１】


【０４９６】
「スルフィニル」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、下記のように描くこともできる－Ｓ（Ｏ）－を意味する。
【化２９２】


【０４９７】
従って、例えば、「アルキル－スルフィニル－アルキル」は、アルキル－Ｓ（Ｏ）－アルキルを意味する。
【０４９８】
「複素環」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には合計３から１４個の環原子を含む飽和（すなわち、「複素環アルキル」）、非芳香族部分飽和（すなわち、「複素環アルケニル」）、または複素環芳香族（すなわち、「ヘテロアリール」）環構造を意味する。少なくとも、環原子の一つがヘテロ原子（代表的には酸素、窒素または硫黄）であり、残りの環原子は通常は、独立に代表的には炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択される。
【０４９９】
複素環は、代表的には３から７個の環原子、より代表的には３から６個の環原子、さらにより代表的には５から６個の環原子を含む単一環であることができる。単一環複素環の例には、フラニル、チエニル（「チオフェニル」および「チオフラニル」とも称される）、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チオジアゾリル、オキサジアゾリル（１，２，３－オキサジアゾリル、１，２，４－オキサジアゾリル（「アゾキシミル」とも称される）、１，２，５－オキサジアゾリル（「フラザニル」とも称される）、および１，３，４－オキサジアゾリルなど）、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサチアゾリル、オキサトリアゾリル（１，２，３，４－オキサトリアゾリルおよび１，２，３，５－オキサトリアゾリルなど）、ピリジニル、ジアジニル（ピリダジニル（「１，２－ジアジニル」とも称される）、ピリミジニル（「１，３－ジアジニル」とも称される）、およびピラジニル（「１，４－ジアジニル」とも称される）など）、トリアジニル（ｓ－トリアジニル（「１，３，５－トリアジニル」とも称される）、ａｓ－トリアジニル（１，２，４－トリアジニルとも称される）、およびｖ－トリアジニル（「１，２，３－トリアジニル」とも称される）など）、オキサチアジニル（１，２，５－オキサチアジニルおよび１，２，６－オキサチアジニルなど）、オキセピニル、チエピニル、ジヒドロフラニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロチエニル（「ジヒドロチオフェニル」とも称される）、テトラヒドロチエニル（「テトラヒドロチオフェニル」とも称される）、イソピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、イソイミダゾリル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、ジチオリル、オキサチオリル、オキサチオラニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル、チアゾリル、イソチアゾリニル、チアゾリジニル、イソチアゾリジニル、ジオキサゾリル（１，２，３－ジオキサゾリル、１，２，４－ジオキサゾリル、１，３，２－ジオキサゾリル、および１，３，４－ジオキサゾリルなど）、ピラニル（１，２－ピラニルおよび１，４－ピラニルなど）、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、オキサジニル（１，２，３－オキサジニル、１，３，２－オキサジニル、１，

３，６－オキサジニル（「ペンタオキサゾリル」とも称される）、１，２，６－オキサジニル、および１，４－オキサジニルなど）、イソオキサジニル（ｏ－イソオキサジニルおよびｐ－イソオキサジニルなど）、オキサジアジニル（１，４，２－オキサジアジニルおよび１，３，５，２－オキサジアジニルなど）、モルホリニル、アゼピニルおよびジアゼピニルなどがある。

【０５００】

複素環はあるいは、一緒に縮合した２または３環であることができ、例えば、インドリジニル、ピラノピロリル、プリニル、イミダゾピラジニル、イミダゾロピリダジル、ピリドピリジニル（ピリド［３，４－ｂ］－ピリジニル、ピリド［３，２－ｂ］－ピリジニル、ピリド［４，３－ｂ］－ピリジニル、およびナフチリジニルなど）、プテリジニル、ピリダジノテトラジニル、ピラジノテトラジニル、ピリミジノテトラジニル、ピリンジニル（ｐｙｒｉｎｄｉｎｙｌ）、ピラゾロピリミジニル、ピラゾロピラジニル、ピラゾロピリダジル、または４Ｈ－キノリジニルなどがある。一部の実施形態において、好ましい多環複素環は、インドリジニル、ピラノピロリル、プリニル、ピリドピリジニル、ピリンジニル（ｐｙｒｉｎｄｉｎｙｌ）、および４Ｈ－キノリジニルである。

【０５０１】

縮合環複素環の他の例には、ベンゾ－縮合複素環などがあり、例えば、ベンゾフラニル（「クマロニル」とも称される）、イソベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル（「インドオキサジニル」とも称される）、アントラニリル、ベンゾチエニル（「ベンゾチオフェニル」、「チオナフテニル」および「ベンゾチオフラニル」とも称される）、イソベンゾチエニル（「イソベンゾチオフェニル」、「イソチオナフテニル」および「イソベンゾチオフラニル」とも称される）、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、インドリル、イソインダゾリル（「ベンゾピラゾリル」とも称される）、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾアジニル（キノリニル（「１－ベンゾアジニル」とも称される）およびイソキノリニル（「２－ベンゾアジニル」とも称される）など）、フタラジニル、キノキザリニル、ベンゾジアジニル（シンノリニル（「１，２－ベンゾジアジニル」とも称される）およびキナゾリニル（「１，３－ベンゾジアジニル」とも称される）など）、ベンゾイミダゾチアゾリル、カルバゾリル、アクリジニル、イソインドリル、インドレニニル（「シュードインドリル」とも称される）、ベンゾジオキソリル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、クロメニル、イソクロメニル、チオクロメニル、イソチオクロメニル、ベンゾジオキサニル、テトラヒドロイソキノリニル、ベンゾオキサジニル（１，３，２－ベンゾオキサジニル、１，４，２－ベンゾオキサジニル、２，３，１－ベンゾオキサジニル、および３，１，４－ベンゾオキサジニルなど）、ベンゾイソオキサジニル（１，２－ベンゾイソオキサジニルおよび１，４－ベンゾイソオキサジニルなど）、ベンゾオキサジアジニル、およびキサンテニルである。一部の実施形態において、好ましいベンゾ－縮合複素環は、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、アントラリル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、インドリル、イソインダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾアジニル、フタラジニル、キノキザリニル、ベンゾジアジニル、カルバゾリル、アクリジニル、イソインドリル、インドレニニル、ベンゾジオキソリル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、ベンゾジオキサニル、テトラヒドロイソキノリニル、ベンゾオキサジニル、ベンゾイソオキサジニルおよびキサンテニルである。

【０５０２】

「２－縮合環」複素環（単独でまたは別の用語と組み合わせて）という用語は、二つの縮合環を含む飽和、非芳香族部分飽和、またはヘテロアリールを意味する。そのような複素環には、例えば、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、アントラニリル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インドリジニル、ピラノピロリ

ル、ベンゾオキサジアゾリル、インドリル、イソインダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、プリニル、イミダゾピラジニル、イミダゾロピリダジル、キノリニル、イソキノリニル、ピリドピリジニル、フタラジニル、キノキザリニル、ベンゾジアジニル、プテリジニル、ピリダジノテトラジニル、ピラジノテトラジニル、ピリミジノテトラジニル、ピリンジニル（ｐｙｒｉｎｄｉｎｙｌ）、イソインドリル、インドレニニル、ピラゾロピリミジニル、ピラゾロピラジニル、ピラゾロピリダジル、ベンゾジオキソリル、クロマニル、イソクロマニル、チオクロマニル、イソチオクロマニル、クロメニル、イソクロメニル、チオクロメニル、イソチオクロメニル、ベンゾジオキサニル、テトラヒドロイソキノリニル、４Ｈ－キノリジニル、ベンゾオキサジニル、およびベンゾイソオキサジニルなどがある。一部の実施形態において、好ましい２－縮合環複素環には、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、アントラニリル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インドリジニル、ピラノピロリル、ベンゾオキサジアゾリル、インドリル、イソインダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、プリニル、キノリニル、イソキノリニル、ピリドピリジニル、フタラジニル、キノキザリニル、ベンゾジアジニル、プテリジニル、ピリンジニル（ｐｙｒｉｎｄｉｎｙｌ）、イソインドリル、インドレニニル、ベンゾジオキソリル、ベンゾジオキサニル、テトラヒドロイソキノリニル、４Ｈ－キノリジニル、ベンゾオキサジニル、およびベンゾイソオキサジニルなどがある。

【０５０３】

「ヘテロアリール」（単独で、または別の用語と組み合わせて）という用語は、代表的には５から１４個の環原子を含む芳香族複素環を意味する。ヘテロアリールは、単一環または複数（代表的には２または３）縮合環であることができる。そのような部分には、例えば、５員環、例えばフラニル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、チオジアゾリル、オキサジアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサチアゾリル、およびオキサトリアゾリル；６員環、例えばピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、トリアジニル、およびオキサチアジニル；７員環、例えばオキセピニルおよびチエピニル；６／５員縮合環系、例えばベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、アントラニリル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、インドリジニル、ピラノピロリル、ベンゾオキサジアゾリル、インドリル、イソインダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、プリニル、イミダゾピラジニル、およびイミダゾロピリダジル；および６／６員縮合環系、例えばキノリニル、イソキノリニル、ピリドピリジニル、フタラジニル、キノキザリニル、ベンゾジアジニル、プテリジニル、ピリダジノテトラジニル、ピラジノテトラジニル、ピリミジノテトラジニル、ベンゾイミダゾチアゾリル、カルバゾリルおよびアクリジニルなどがある。一部の実施形態において、好ましい５員環には、フラニル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、ピラゾリル、およびイミダゾリルなどがあり；好ましい６員環には、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、およびトリアジニルなどがあり；好ましい６／５員縮合環系にはベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、アントラニリル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、およびプリニルなどがあり；好ましい６／６員縮合環系にはキノリニル、イソキノリニル、およびベンゾジアジニルなどがある。

【０５０４】

炭素環または複素環は、例えば、独立にハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、オキソ、アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルコキシ、アリールアルコキシアルキル、アリールアルコキシカルボニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアルコキシアルキル、およびシクロアルキルアルコキシカルボニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていることができる。より代表的には、炭素環または複素環は、例えば、独立にハロゲン、－ＯＨ、－Ｃ（Ｏ）－ＯＨ、オキソ、$Ｃ_1$－Ｃ

${}_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルカルボニル、アリール、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシカルボニル、シクロアルキル、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、およびシクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシカルボニルからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。前記アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルコキシ、アリールアルコキシアルキル、またはアリールアルコキシカルボニル置換基はさらに、例えば、１以上のハロゲンで置換されていても良い。そのような適宜の置換基の前記アリールおよびシクロアルキルは代表的には、３から６個の環原子、より代表的には５から６個の環原子を含む単一環である。

【０５０５】

アリールまたはヘテロアリールは、例えば、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＨ、－Ｃ（Ｏ）－ＯＨ、アミノ、アミノアルキル、アルキル、アルキルスルファニル、カルボキシアルキルスルファニル、アルキルカルボニルオキシ、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルコキシ、アルコキシアルキルスルファニル、アルコキシカルボニルアルキルスルファニル、カルボキシアルコキシ、アルコキシカルボニルアルコキシ、炭素環、炭素環アルキル、炭素環オキシ、炭素環スルファニル、炭素環アルキルスルファニル、炭素環アミノ、炭素環アルキルアミノ、炭素環カルボニルアミノ、炭素環アルキル、炭素環カルボニルオキシ、炭素環オキシアルコキシ炭素環、炭素環スルファニルアルキルスルファニル炭素環、炭素環スルファニルアルコキシ炭素環、炭素環オキシアルキルスルファニル炭素環、複素環、複素環アルキル、複素環オキシ、複素環スルファニル、複素環アルキルスルファニル、複素環アミノ、複素環アルキルアミノ、複素環カルボニルアミノ、複素環カルボニルオキシ、複素環オキシアルコキシ複素環、複素環スルファニルアルキルスルファニル複素環、複素環スルファニルアルコキシ複素環、および複素環オキシアルキルスルファニル複素環からなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。より代表的には、アリールまたはヘテロアリールは、例えば、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＨ、－Ｃ（Ｏ）－ＯＨ、アミノ、アミノ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、カルボキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルカルボニルオキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシカルボニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシカルボニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、カルボキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシカルボニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシ、アリール、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、アリールオキシ、アリールスルファニル、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、アリールアミノ、アリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルアミノ、アリールカルボニルアミノ、アリールカルボニルオキシ、アリールオキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシアリール、アリールスルファニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニルアリール、アリールスルファニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルコキシアリール、アリールオキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニルアリール、シクロアルキル、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルキルスルファニル、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、シクロアルキルアミノ、シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールスルファニル、ヘテロアリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルスルファニル、ヘテロアリールアミノ、ヘテロアリール－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ、およびヘテロアリールカルボニルオキシからなる群から選択される１以上の置換基で置換されていても良い。ここで、いずれかのそのような置換基における炭素に結合した１以上の水素が、例えば、

ハロゲンで置き換わっていても良い。さらに、そのような適宜の置換基のシクロアルキル、アリール、およびヘテロアリール部分は代表的には、３から６個の環原子、より代表的には５または６個の環原子を含む単一環である。

【０５０６】

複数成分置換基に付けた接頭辞は、最初の成分のみに当てはまる。説明のため、「アルキルシクロアルキル」という用語は、二つの成分：アルキルおよびシクロアルキルを含む。従って、C_1－C_6－アルキルシクロアルキル上のC_1－C_6－接頭辞は、当該アルキルシクロアルキルのアルキル成分が１から６個の炭素原子を含み、当該C_1－C_6－接頭辞がシクロアルキル成分を説明しないことを意味している。

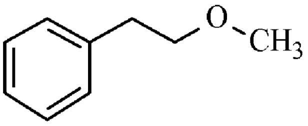
【０５０７】

置換基が「独立に選択される」と記載されている場合、各置換基は他のものから独立に選択される。従って、各置換基は、他の選択される化合物と同一または異なっていることができる。

【０５０８】

言葉を用いて置換基を説明する場合、当該置換基の最も右に記載の成分が、自由原子価を有する成分である。説明のため、メトキシエチルで置換されたベンゼンは、下記の構造を有する。

【化２９３】

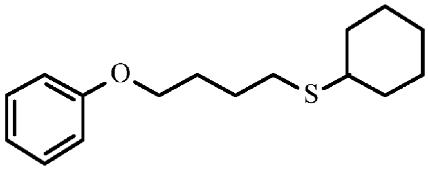


.

【０５０９】

分かる通り、エチルがベンゼンに結合しており、メトキシが、ベンゼンから最も遠い成分である置換基の成分である。さらなる説明として、シクロヘキサニルスルファニルブトキシで置換されたベンゼンは、下記の構造を有する。

【化２９４】

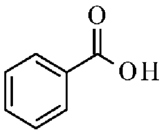


.

【０５１０】

化学式を用いて一価置換基を説明する場合、その式の左側の点線は、自由原子価を有する置換基の部分を示す。説明のため、－Ｃ（Ｏ）－ＯＨで置換されたベンゼンは下記構造を有する。

【化２９５】

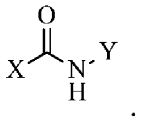


.

【０５１１】

化学式を用いて、描かれている化学構造の二つの他の成分（右側と左側の成分）の間の二価（または「連結」）成分を説明する場合、連結成分の最も左の点線は、描かれた構造における左側の成分に結合している連結成分の部分を示す。他方、最も右の点線は、描かれた構造における右側の成分の結合している連結成分の一部を示す。説明のため描かれた化学構造がＸ－Ｌ－Ｙであり、Ｌが－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｈ）－として記載されている場合、

その化学式は下記のようになると考えられる。
【化２９６】



【０５１２】
点線は、孤立している場合の三重結合成分を特徴付けるのには用いられない。従って、例えば、３価窒素は「Ｎ」と識別され、水素に結合している３価炭素は本特許においては「ＣＨ」と識別される。
【０５１３】
「含む」、「包含する」および「含んでいる」という言葉は、排他的ではなく包括的に解釈すべきものである。この解釈は、これらの言葉が米国特許法下に提供される解釈と同じであるとするものである。
【０５１４】
「医薬として許容される」という用語は、修飾されている名詞が医薬製品で使用されるのに適していることを意味するように形容詞的に使用される。それを用いて、例えば塩もしくは賦形剤を説明する場合、それは、その塩もしくは賦形剤が組成物の他の成分と適合性であり、有害効果が塩の利益に勝る程度に所期の被投与動物に対して有害ではないものであると特徴付けるものである。
【０５１５】
好ましい実施形態の上記の詳細な説明は、当業界の他者が本発明、それの原理およびそれの実際の適用について精通することで、その当業界の他者が、ある特定の使用の要件に最も良く適し得るように、本発明をそれの多くの形態で適応および適用可能となるようにすることのみを目的としたものである。従って本発明は、上記実施形態に限定されるものではなく、多様に改変することが可能である。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2015/065870

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A61K31/451 A61K31/496 A61P33/10
ADD.

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)
A61K

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 practicable, search terms used)

EPO-Internal, BIOSIS, CHEM ABS Data, EMBASE, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2010/115688 A1 (INTERVET INT BV [NL]; CHASSAING CHRISTOPHE PIERRE ALAIN [DE]; MEYER TH) 14 October 2010 (2010-10-14) claims; examples -----	1-17
Y	WO 2014/081697 A2 (MERIAL LTD [US]) 30 May 2014 (2014-05-30) page 86; claims -----	1-17
Y	WO 2010/146083 A1 (INTERVET INT BV [NL]; CHASSAING CHRISTOPHE PIERRE ALAIN [DE]; MEYER TH) 23 December 2010 (2010-12-23) page 28; claims -----	1-17

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
2 September 2015	16/09/2015

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, Fax: (+31-70) 340-3016	Steendijk, Martin

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2015/065870

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2010115688 A1	14-10-2010	AR 076258 A1	01-06-2011
		AU 2010233952 A1	15-09-2011
		CA 2755669 A1	14-10-2010
		EP 2408742 A1	25-01-2012
		ES 2525252 T3	19-12-2014
		NZ 594765 A	29-11-2013
		TW 201041868 A	01-12-2010
		US 2011319393 A1	29-12-2011
		UY 32502 A	29-10-2010
		WO 2010115688 A1	14-10-2010
WO 2014081697 A2	30-05-2014	AU 2013348175 A1	11-06-2015
		CA 2891926 A1	30-05-2014
		CN 104884453 A	02-09-2015
		EP 2922845 A2	30-09-2015
		KR 20150085077 A	22-07-2015
		US 2014142114 A1	22-05-2014
		WO 2014081697 A2	30-05-2014
WO 2010146083 A1	23-12-2010	AR 077124 A1	03-08-2011
		AU 2010261791 A1	15-12-2011
		CA 2765130 A1	23-12-2010
		CN 102459186 A	16-05-2012
		EP 2443091 A1	25-04-2012
		NZ 596607 A	25-10-2013
		TW 201111358 A	01-04-2011
		US 2012094981 A1	19-04-2012
		UY 32713 A	31-01-2011
		WO 2010146083 A1	23-12-2010

フロントページの続き

(81)指定国　AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

(74)代理人　100137213
弁理士　安藤　健司
(74)代理人　100143823
弁理士　市川　英彦
(74)代理人　100151448
弁理士　青木　孝博
(74)代理人　100183519
弁理士　櫻田　芳恵
(74)代理人　100196483
弁理士　川嵜　洋祐
(74)代理人　100203035
弁理士　五味渕　琢也
(74)代理人　100185959
弁理士　今藤　敏和
(74)代理人　100160749
弁理士　飯野　陽一
(74)代理人　100160255
弁理士　市川　祐輔
(74)代理人　100202267
弁理士　森山　正浩
(74)代理人　100146318
弁理士　岩瀬　吉和
(74)代理人　100127812
弁理士　城山　康文
(72)発明者　シャセン，クリストフ・ピエール・アラン
ドイツ国、５５２７０・シュヴァベンハイム、ツーア・プロープスタイ・１
(72)発明者　ルッツ，ユルゲン
ドイツ国、５５２７０・シュヴァベンハイム、ツーア・プロープスタイ
(72)発明者　ヘクロス，アンニャ・レジーナ
ドイツ国、５５２７０・シュヴァベンハイム、ツーア・プロープスタイ・１

Ｆターム(参考)　4C076 BB01　CC31　EE07A EE23A EE50A FF04
4C086 AA01　BC21　BC50　BC85　GA07　GA08　GA10　GA12　MA01　MA02
MA04　MA05　MA52　NA14　ZB39　ZC61