CSA716275 Organizacion y digitalizacion CSA Ltda
A

08-116130

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD DE PCT

PATENTE DE INVENCIÓN
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No. 08-116130

54. TITULO: COMPUESTO DE PIPERAZINA, PROCESO Y USO DEL MISMO COMO INHIBIDOR DE POLIMERASA DEL VIRUS DE LA HEPATITIS C

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL: C07D 241/04

71. SOLICITANTE: JAPAN TOBACCO INC.

DOMICILIO: 2-1, Toranomon 4-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422, JAPON

74. APODERADO: Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.

22. BOGOTA, D.C., 30 OCT. 2008

Se compone de tres Partes

Industria y
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 08-116130- -00000-0000
Fecha: 2008-10-30 11:11:42 Dep: 2020 NUEVAS CREACIONES
Tra: 11 PATENTES Y II Eve: 378 FASE NACIONAL I
Act: 411 PRESENTACION Folios: 1629

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRÁMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION (X) MODELO DE UTILIDAD ( )	(X)	( )
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente	(X)	( )
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	(X)	( )
- Descripción de la invención	(X)	( )
- Dibujos de ser estos pertinentes	( )	( )
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	(X)	( )

COMPLETA (X) INCOMPLETA ( )

DISEÑO INDUSTRIAL ( )

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	( )	( )
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	( )	( )
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño	( )	( )
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	( )	( )

COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( )

EZQUEMA DE TRAZADO ( )

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	( )	( )
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	( )	( )
- Representación gráfica del Esquema de Trazado	( )	( )
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	( )	( )

COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( )

Firma responsable: Sandra Rodriguez

Fecha: OCT-30-08

PETITORIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 08-116130- -00000-0000
Fecha 2008-10-30 11:11:42 Dep 2020 NULCRLACIONI
Tra 11 PATENTLIYII Lve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 1629

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

18 Nov. 2008

SOLICITUD DE:PATENTE EN COLOMBIA

(1)

[X] Patente de Invención. [ ] Patente de Modelo de Utilidad.

[X] Capítulo I [ ] Capítulo II

(2) SOLICITANTE (71)	Nombre: JAPAN TOBACCO INC Dirección: 2-1, Toranomon 2-chome Minato-ku, Tokyo 105-8422 JAPON Domicilio: Tokyo, JAPON Lugar de Constitución: JAPON Teléfono: Fax: E-mail:	IDENTIFICACIÓN C.C. [ ] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual Número
(3) REPRESENTANTE O APODERADO (74)	Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A. Dirección: CALLE 94A No. 7A-09 Teléfono: 610 7420 Fax: 610 0706 E-mail: info@castellanosyco.com	IDENTIFICACIÓN C.C. [X] NIT [ ] C.E. [ ] Otro [ ] Cual Número 39'779.654 TPA 70.819
(4) INVENTOR (ES) (72)	VER ANEXO # 1	

(5) PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/JP2007/058901 Fecha 18/04/2007

Publicación Internacional No. WO2007/119889 A1 Fecha 25/10/2007

(6) Título (54) COMPUESTO DE PIPERAZINA NOVEDOSO Y USO DEL MISMO COMO INHIBIDOR DE POLIMERASA DEL VIRUS DE LA HEPATITIS C

(7) Clasificación Internacional (51) C07D 24/104, A61K 31/495, A61P 31/14

(8) Prioridad SI [X] NO [ ]

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
JP	18/04/2006	2006-115008
US	01/05/2006	60/796,565

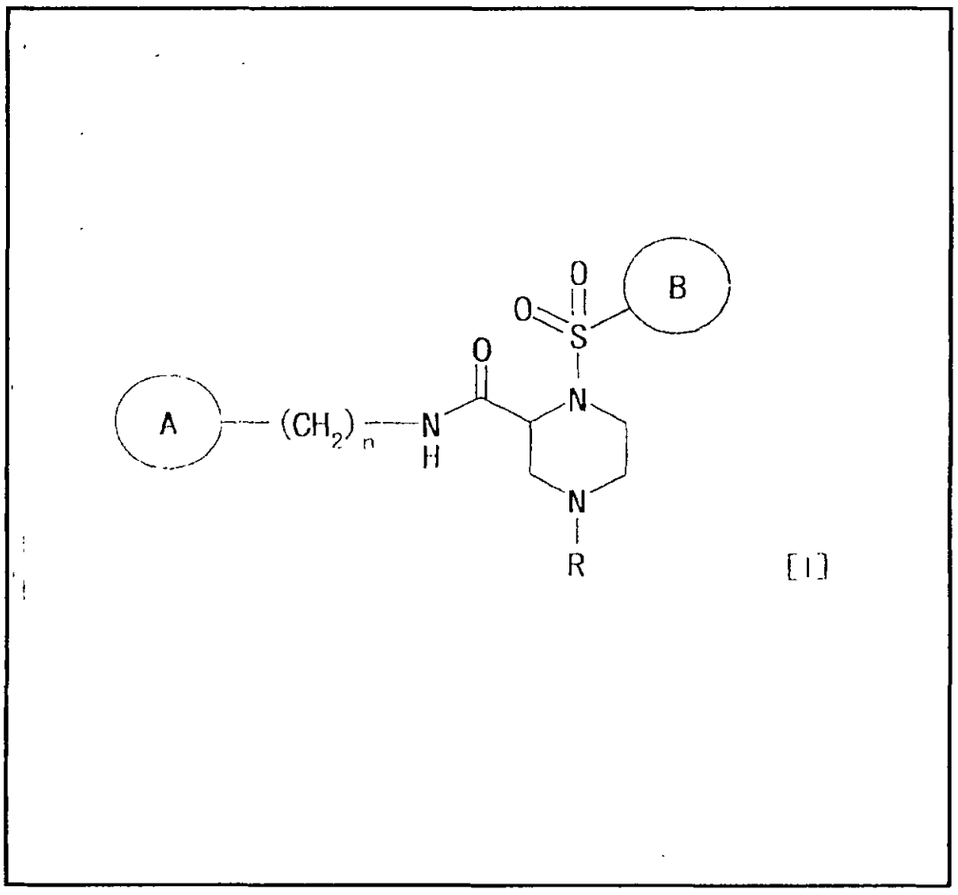
(9) Comprobante de pago No. 08-84,951 Fecha Octubre 27 de 2008

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

Anexos

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- [X] Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
- [ ] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- [ ] Declaraciones.
- [X] Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- [X] Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- [ ] Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- [ ] Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- [ ] De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- [ ] De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indigenas.
- [ ] De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- [X] Arte final 12x12
- [ ] De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- [ ] De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- [X] Otros **Tarjeta Propietario y Extracto para la Publicación**

1) **FIGURA CARACTERISTICA:**



[I]

2) **Solicito la concesión de la patente,**

NOMBRE: **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

FIRMA:

C.C. No. 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

30 OCT. 2008

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página. - MCA/gcb/P1651

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1
INVENTORES

1. **HIROYUKI ABE**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

2. **MASAHIRO TANAKA**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

3. **KAZUYUKI SUGIMOTO**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

4. **AKIRA SUMA**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

5. **MASAHIRO YOKOTA**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

6. **MAKOTO SHIOZAKI**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

7. **KIYOSEI IIO**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

8. **KAZUHITO UEYAMA**
   c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
   1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
   Osaka 5691125, JAPON

9. **DAI MOTODA**
c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
Osaka 5691125, JAPON

10. **TORU NOGUCHI**
c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi
Osaka 5691125, JAPON

11. **TSUYOSHI ADACHI**
c/o Pharmaceutical Frontier Research Laboratories Central
Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
13-2, Fukuura 1-chome, Kanazawa-ku, Yokohama-shi,
Kanagawa 2360004, JAPON

12. **JUNICHIRO TSURUHA**
c/o Pharmaceutical Frontier Research Laboratories Central
Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
13-2, Fukuura 1-chome, Kanazawa-ku, Yokohama-shi,
Kanagawa 2360004, JAPON

13. **SATOKI DOI**
c/o Pharmaceutical Frontier Research Laboratories Central
Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc.
13-2, Fukuura 1-chome, Kanazawa-ku, Yokohama-shi,
Kanagawa 2360004, JAPON

P1657
6

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 08-116130- -00000-0000
Fecha 2008-10-30 11:11:42 Dep 2020 NUEVA LACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 1629

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 84,951
FECHA : OCTUBRE 27 DE 2008

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	14669314	27/10/2008	54,526,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
		TOTAL : $	501,000.00

SON: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

CASTELLANOS & CO LTDA.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E S. D.

Ref.: **PODER** conferido por la sociedad **JAPAN TOBACCO INC.**

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO,** mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pié de mi firma, atentamente manifiesto a Uds. que sustituyo en la Dra. **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO,** el poder que me confirió la sociedad **JAPAN TOBACCO INC.,** con domicilio en **2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422, JAPÓN** debidamente legalizado por Apostilla, bajo los Nos. **02041 y 02042** el día **14 de Junio de 2004**, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional en Colombia, para: **"COMPUESTO DE PIPERAZINA NOVEDOSO Y USO DEL MISMO COMO INHIBIDOR DE POLIMERASA DEL VIRUS DE LA HEPATITIS C".-**

Del Señor Jefe,

Ximena Castellanos Abondano
C.C. No. **39.773.330** de Usaquén
T.P.A. No. **58.236** del C.S.J.
Calle 94A No. 7A-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480

Acepto

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. **39.779.654** de Usaquén
T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.
Calle 94A No. 7A-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480

Bogotá, D.C.
XCA/MCA/P1651

C:\USER\DEPARTAMENTO DE PATENTES\PATENTES\16\P1651\MEMORIAL DE SUSTITUCION doc

AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL
(Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2782 de 1989, art. 1 mod. 36)
Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
de esta ciudad compareció personalmente:
Ximena Castellanos Abondano
identificado con C.C. 39778330
expedida en Usaquen y tarjeta profesional de abogado(a) No. 52236 del Consejo
Superior de la Judicatura declarante dijo que el contenido de este escrito es
cierto y que la firma que aparece escrito es
suya.

Firma del declarante

En Bogotá D.C. a 28 OCT. 2008
AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

REPUBLICA DE COLOMBIA
Círculo de Santafé
de Bogotá, D.C.
NOTARIA 41
Carrera 12 Nº 93-26
AGUSTIN MORALES RIVEIRA
OFC.

AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL
(Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2782 de 1989, art. 1 mod. 36)
Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
de esta ciudad compareció personalmente:
Margarita Castellanos
identificado con C.C. 39779654
expedida en Usaquen y tarjeta profesional de abogado(a) No. 70819 del Consejo
Superior de la Judicatura declarante dijo que el contenido de este escrito es
cierto y que la firma que aparece escrito es
suya.

Firma del declarante

En Bogotá D.C. a 28 OCT. 2008
AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

REPUBLICA DE COLOMBIA
Círculo de Santafé
de Bogotá, D.C.
NOTARIA 41
Carrera 12 Nº 93-26
AGUSTIN MORALES RIVEIRA
OFC.

4926-FNPCT, 4929-FNPCT

PODER

El (los) suscrito (s) JAPAN TOBACCO INC.

domiciliado (s) en 2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422 - JAPON

nombra(n) por el presente a **XIMENA CASTELLANOS A.** y/o **MARGARITA CASTELLANOS A.** abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá - Colombia para

para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:

a) Obtención de patentes de invención , modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen; depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Para la obtención de Registros Sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba determinados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 7 de Junio de 2004

En Tokyo, JAPON

Por Teruo DAITO

(Notary should execute on other side)
(Consular legalization necessary)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned Japan Tobacco Inc.

of 2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422 Japan

hereby grant(s) Power of Attorney to **XIMENA CASTELLANOS A.** and/or **MARGARITA CASTELLANOS A.** attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09 Bogotá - COLOMBIA to

and to obtain the protection of my (our) industrial property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities or persons , specially those, administrative contentious and judicial, in all matters concerning the following :

a) Obtention of patents, models and designs; registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of commercial names and ensigns; its renewal , extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rigths; b) For de obtention of Sanitary Registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rigths; actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of Court .

Given and signed this June 7, 2004

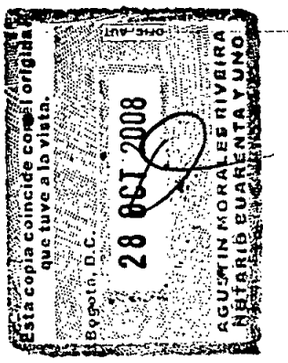
in Tokyo - JAPAN

By Japan Tobacco Inc.

Teruo DAITO, Patent Attorney
General Manager,
Patent Information Dept.

(Notary should execute on other side)
(Consular legalization necessary)

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
ABOGADOS COLOMBIA
Carrera 9 No. 93-09 - P.O. Box 6349 - Bogotá, Colombia.
Tels.: (571) 610 7420 /60 / 80 - Fax. (571) 610 0706 - e-mail acastell@impsat.net.co



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: **JAPAN**

   This public document

2. has been signed by — Katsuyuki YAMAGUCHI

3. acting in the capacity of — Notary Public of the Osaka Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of — Katsuyuki YAMAGUCHI, Notary Public

Certified

5. at **Osaka**

6. JUN. 14. 2004

7. by **the Ministry of Foreign Affairs**

8. No. 02041

9. Seal/stamp:

10. Signature:

Tsutomu HIGUCHI
For the Minister for Foreign Affairs

Esta copia coincide con el original que tuve a la vista.
Bogotá, D.C. 28 OCT 2008
AGUSTIN MORALES RIVEIRA
NOTARIO CUARENTA Y UNO

10

認証登簿平成１６年第100号

嘱託人大東輝雄は、本公証人の面前で、別紙編綴の書面に署名した。

よって、これを認証する。

平成１６年３月３１日、本職の役場において。

大阪府高槻市芥川町１丁目１５番１８号(ミドリ芥川ビル内)

大阪法務局所属

公証人　山口勝之

Registerd No.100(2004)

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Teruo DAITO signed the attached document in my very presence on this 31st day of March 2004.

Katsuyuki Yamaguchi

Katsuyuki Yamaguchi
Notary, attached to
Osaka Legal affairs Bureau
15-18,1-chome,Akutagawa-cho,
Takatsuki-shi,Osaka,Japan.

OSAKA LEGAL AFFAIRS BUREAU
NOTARY
15-18,(Midori Akutagawa Bldg.)1-chome
Akutagawa-cho,Takatsuki-shi,Osaka,Japan

28 OCT 2008

大阪法務局所属　公証人役場

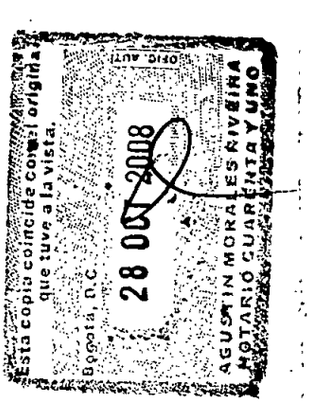
証明書

東京都港区虎ノ門二丁目２番１号を本店所在地とする日本国法人日本たばこ産業株式会社の代表取締役社長である私 本田勝彦 は、該法人を代表して知的財産権に係わる書類を署名作成する権限を有するものであることをここに宣言し、これをもって、２００４年３月３１日当時、該法人の医薬総合研究所特許情報室長職にあった大東輝雄　氏が、代理人に指名され、該法人名義にて外国に提出する特許、実用新案登録の出願等手続に要する願書、委任状、譲渡書、授権書、申請書、請求書、その他を含む関係書類について該法人を代表して署名、押印、作成する権限を有していたものであることを証明する。

２００４年６月７日

日本たばこ産業株式会社

代表取締役社長　本田　勝彦



CERTIFICATE

I, KATSUHIKO HONDA, President and Chief Executive Officer of JAPAN TOBACCO INC., a Japanese corporation located at 2-1, TORANOMON 2-CHOME, MINATO-KU, TOKYO 105-8422, JAPAN, hereby declare that I am authorized to sign and execute documents relating to intellectual property rights on behalf of the said corporation, and hereby certify that, as of March 31, 2004, Mr. TERUO DAITO was Director of Patent Information Dept. of Central Pharmaceutical Research Institute of the said corporation, was my proxy, and was authorized to sign and execute documents relating to intellectual property rights on behalf of the said corporation. Said documents include, but are not limited to, applications, powers of attorney, assignments, authorizations of agents, petitions and the like in connection with patent and utility model filed in foreign countries with the name of the said corporation.

Dated this 7 day of June, 2004,
JAPAN TOBACCO INC.

KATSUHIKO HONDA
President and Chief Executive Officer

Esta copia coincide con el original que tuve a la vista.
28 OCT 2008

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: **JAPAN**

   This public document

2. has been signed by — Katsuyuki YAMAGUCHI

3. acting in the capacity of — Notary Public of the Osaka Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of — Katsuyuki YAMAGUCHI, Notary Public

Certified

5. at **Osaka**

6. JUN. 14. 2004

7. by **the Ministry of Foreign Affairs**

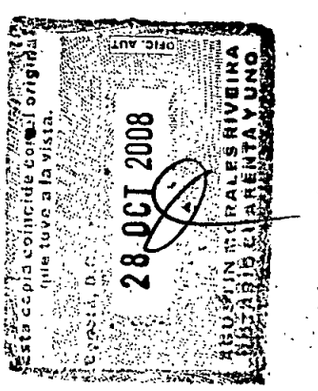
8. No. 02042

9. Seal/stamp: MINISTRY OF FOREIGN AFFAIRS · JAPAN

10. Signature:

Tsutomu HIGUCHI

For the Minister for Foreign Affairs



登簿番号平成１６年第１６８号

日本国法律に従い設立され、日本国東京都港区虎ノ門二丁目２番１号に所在する日本たばこ産業株式会社において、２００４年３月３１日当時、医薬総合研究所特許情報室長職にあった大東輝雄氏が、該法人名義で知的財産関係書類について該法人を代表して署名押印、作成する権限を有していたこと及び同氏が２００４年３月３１日、本職の面前で別紙書類に署名したことを証明する。

よって、ここにこれを認証する。

平成１６年６月８日、本職の役場において。

大阪府高槻市芥川町１丁目１５番１８号（ミドリ芥川ビル）

大阪法務局所属（高槻公証役場）

公証人　山口勝之

28 OCT 2008

大阪法務局所属　公証人役場

Registration Book No.168 (2004)

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that :

1) Teruo Daito was Director of Patent Information Dept. of Central Pharmaceutical Reseearch Institute of JAPAN TOBACCO INC. ,a Japanese corporation of being legally constituted and in existance in accordance with the laws of Japan ,located at 2-1, Toranomon2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422 Japan ,as of March 31,2004 and was authorized to sign and execute documents relating to intellectual property rights on behalf of the said corporation.

2) said Teruo Daito signed the attaced document in my presence on 31st day of March,2004.

IN TESTIMONY WHEREOF,I have hereto subscribed my name and affixed my seal of office.

On the 8th day of June,2004
at the Office of Notary Katsuyuki Yamaguchi

Katsuyuki Yamaguchi

Katsuyuki Yamaguchi
Notary,attached to
Osaka Legal affairs Bureau,
15-18,1-chome,Akutagawacho,
Takatsuki-shi, Osaka,Japan

OSAKA LEGAL AFFAIRS BUREAU
NOTARY
15-18,(Midori Akutagawa Bldg.)1-chome
Akutagawa-cho,Takatsuki-shi,Osaka,Japan

28 OCT 2008

16

総第 1558 号

証　　明

大阪法務局所属公証人　山口勝之

平成 16 年 3 月 31 日付

平成16年 登簿 第 100 号

この認証の付与は，在職中の公証人がその権限に基づいてしたものであり，かつ，その押印は，真実のものであることを証明する。

平成16年6月14日
平成　　年　　月　　日

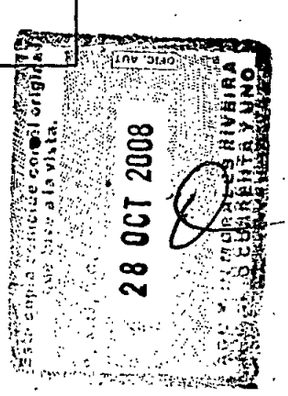
大阪法務局長　梅津和宏

CERTIFICATE

This is to certify that the annexed Notarial Certificate has been executed by Notary,duly authorized and practising in Osaka, Japan, and that the Official seal appearing on the same is genuine.

Date 04. 6. 14

Director of the Osake Legal Affairs Bureau



17

総第 1559 号

証　　明

大阪法務局所属公証人　山口勝之

平成 16年 6 月 8 日付

平成16年 登簿 第 168 号

この認証の付与は，在職中の公証人がその権限に基づいてしたものであり，かつ，その押印は，真実のものであることを証明する。

平成16年6月14日
平成　　年　　月　　日

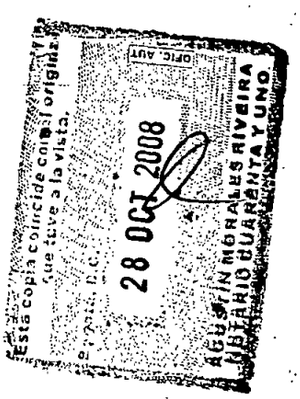
大阪法務局長　梅津和宏

CERTIFICATE

This is to certify that the annexed Notarial Certificate has been executed by Notary,duly authorized and practising in Osaka, Japan, and that the Official seal appearing on the same is genuine.

Date 04. 6.14

Director of the Osake Legal Affairs Bureau



----------TRADUCCION OFICIAL No. 04-0616----------

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.----------

(Anexo a un documento de poder otorgado por Japan Tobacco Inc.)

Registro No. 100 (2004)

CERTIFICADO NOTARIAL

La presente es para certificar que Teruo DAITO firmó el documento adjunto en mi propia presencia hoy día 31 de marzo de 2004.

(fdo) ilegible

Katsuyuki Yamaguchi

Notario adjunto a la Oficina de Asuntos Legales de Osaka – 15-18, 1-chome, Akutagawa-cho, Takatsuki-shi, Osaka, Japón

(Sello) Oficina de Asuntos Legales de Osaka

NOTARIO – 15-18 (Midori Akutagawa Bldg) 1-chome

Akutagawa-cho, Takatsuki-shi, Osaka, Japón

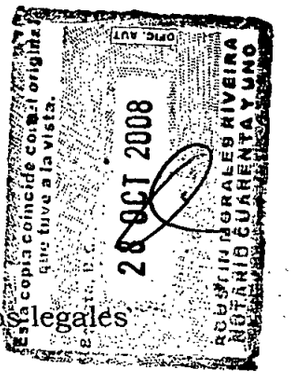
APOSTILLA

(Convención e La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: JAPON

Este documento público

2. ha sido firmado por Katsuyuki YAMAGUCHI
3. actuando en su carácter de Director de la Oficina de Asuntos legales de Osaka



DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

4. lleva el sello de Katsuyuki YAMAGUCHI, Notario Público

Certificado

5. en Osaka 6. el 14 de Junio 2004

7. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

8. No. 02041

9. Sello: 10: Firma

(fdo) ilegible

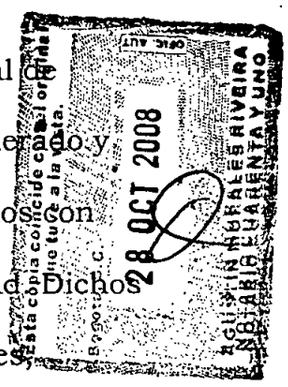
Tsutomu HIGUCHI

Por el Ministro de Relaciones Exteriores.

(Sello del Ministerio de Relaciones Exteriores de Japón)

CERTIFICADO

Yo, KATSUHIKO HONDA, Presidente y Funcionario jefe Ejecutivo de JAPAN TOBACCO INC., una sociedad japonesa situada en 2-1, TORANOMON 2-CHOME, MINATO-KU, TOKYO 105-8422, JAPON, declaro por medio del presente que estoy autorizado para firmar y otorgar documentos relacionados con derechos de propiedad intelectual en nombre de dicha sociedad, y por medio del presente certifico que, a Marzo 31 de 2004, el señor TERUO DAITO era el Director del Departamento de Información de Patentes del Instituto Central de Investigaciones Farmacéuticas de dicha sociedad, era mi apoderado y estaba autorizad para firmar y otorgar documentos relacionados con derechos de propiedad intelectual en nombre de dicha sociedad. Dichos documentos incluyen, pero no se limitan a, solicitudes, poderes, cesiones, autorizaciones de agentes, peticiones y similar en relación con



DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA OFICIAL
MINISTERIO DE JUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

patentes y modelos de utilidad presentados en países extranjeros con el nombre de dicha sociedad.

Dado hoy día 7 de Junio de 2004

JAPAN TOBACCO INC.

KATSUHIKO HONDA

Presidente y Funcionario Jefe Ejecutivo

Libro de Registro No. 168 (2004)

CERTIFICADO NOTARIAL

La presente es para certificar que:

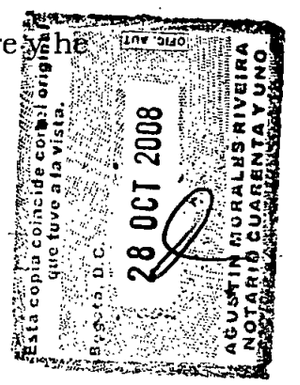
1) Teruo Daito era el Director del departamento de Información de Patentes del Instituto Central de Investigaciones Farmacéuticas de JAPAN TOBACCO INC., una sociedad japonesa que están legalmente constituida y existe de acuerdo con las leyes del Japón, situada en 2-1, Toranomon 2-chome, Minato-ku, Tokio 105-8422 Japón, a Marzo 31 de 2004, y estaba autorizado para firmar y otorgar documentos relacionados con derechos de propiedad intelectual en nombre de dicha sociedad.
2) Dicho Tereuo Daito firmó el documento adjunto en mi propia presencia el día 31 de Marzo de 2004.

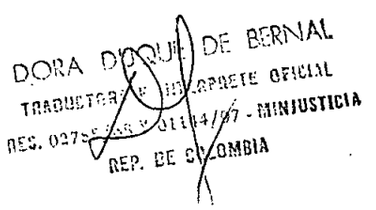
EN TESTIMONIO DE LO CUAL, he suscrito aquí mi nombre y he fijado mi sello de oficio.

El día 8 de Junio de 2004

En la Oficina del Notario Katsuyuki Yamaguchi

(fdo) ilegible





Katsuyuki Yamaguchi

Notario adjunto a la Oficina de Asuntos Legales

De Osaka, 15-18, 1-chome, Akutagawacho

Takatsuki-shi, Osaka, Japón

(Sello) Oficina de Asuntos Legales de Osaka

NOTARIO – 15-18 (Midori Akutagawa Bldg) 1-chome

Akutagawa-cho, Takatsuki-shi, Osaka, Japón

CERTIFICADO 1558

La presente es para certificar que la firma que aparece anteriormente ha sido impuesta por Notario, debidamente autorizado y en ejercicio en Osaka, Japón y que el sello oficial que aparece en el mismo es auténtico.

Fecha: 04.6.14

Director de la Oficina de Asuntos Legales de Osaka

CERTIFICADO 1559

La presente es para certificar que la firma que aparece anteriormente ha sido impuesta por Notario, debidamente autorizado y en ejercicio en Osaka, Japón y que el sello oficial que aparece en el mismo es auténtico.

Fecha: 04.6.14

Director de la Oficina de Asuntos Legales de Osaka

APOSTILLA

(Convención e La Haya del 5 de Octubre de 1961)

5. País: JAPON

Este documento público

6. ha sido firmado por Katsuyuki YAMAGUCHI

28 OCT 2008

AGUSTIN MORALES RIVEIRA
NOTARIO CUARENTA Y UNO

DORA [illegible] DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02[illegible]/56 Y 0[illegible]/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

7. actuando en su carácter de Director de la Oficina de Asuntos legales de Osaka
8. lleva el sello de Katsuyuki YAMAGUCHI, Notario Público

Certificado

5. en Osaka 6. el 14 de Junio 2004

7. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

8. No. 02042

9. Sello: 10: Firma

(fdo) ilegible

Tsutomu HIGUCHI

Por el Ministro de Relaciones Exteriores.

(Sello del Ministerio de Relaciones Exteriores de Japón)

Es traducción fiel y completa, a la cual me remito,

Bogotá, Junio 22, 2004.

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

Esta copia coincide con el original que tuve a la vista.
Bogotá, D.C. 28 OCT 2008
ARMANDO MORALES RIVEIRA
SECRETARIO CUARENTA Y UNO

NO SE ANEXA CONSULTA

2004 JUN 24

JEFE DE LEGALIZACIONES SANTAFE D.C.

23

JUNES A.D.C.

Esta copia coincide con el original que tuve a la vista.
Bogotá, D.C.
28 OCT 2008
AGUSTIN MORALES RIVEIRA
NOTARIO CUARENTA Y UNO

EXTERIORES

041035

CUYA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS

2004 JUN 24 A 11:23

JEFE DE LEGALIZACIONES SANTAFE DE BOGOTA D.C.

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2007 年10 月25 日 (25.10.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/119889 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 241/04 (2006.01)	*A61K 31/5365* (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)	*A61K 31/5377* (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)	*A61K 31/549* (2006.01)
A61K 31/497 (2006.01)	*A61P 31/14* (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01)	*A61P 43/00* (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01)	*C07D 401/04* (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01)	*C07D 401/06* (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)	*C07D 401/12* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)	*C07D 401/14* (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)	*C07D 403/04* (2006.01)

[続葉有]

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/058901

(22) 国際出願日: 2007 年4 月18 日 (18.04.2007)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2006-115008 2006 年4 月18 日 (18.04.2006) JP
60/796,565 2006 年5 月1 日 (01.05.2006) US

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒1058422 東京都港区虎ノ門二丁目２番１号 Tokyo (JP).

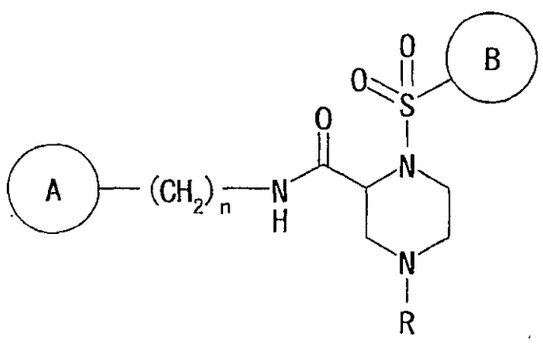
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 阿部博行 (ABE, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 田中正浩 (TANAKA, Masahiro) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 杉本和幸 (SUGIMOTO, Kazuyuki) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 須磨陽 (SUMA, Akira) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 横田正宏 (YOKOTA, Masahiro) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 塩崎真 (SHIOZAKI, Makoto) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 飯尾清誠 (IIO, Kiyosei) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 上山和人 (UEYAMA, Kazuhito) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 元田大 (MOTODA, Dai) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 野口徹 (NOGUCHI, Toru) [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 安達剛 (ADACHI, Tsuyoshi) [JP/JP]; 〒2360004 神奈川県横浜市金沢区福浦１丁目１３－２日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所 医薬探索研究所内 Kanagawa (JP). 鶴羽淳一郎 (TSURUHA, Junichiro) [JP/JP]; 〒2360004 神奈川県横浜市金沢区福浦１丁目１３－２日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所 医薬探索研究所内 Kanagawa (JP). 土井郷樹 (DOI, Satoki) [JP/JP]; 〒2360004 神奈川県横浜市金沢区福浦１丁目１３－２日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所 医薬探索研究所内 Kanagawa (JP).

/続葉有/

(54) Title: NOVEL PIPERAZINE COMPOUND. AND USE THEREOF AS HCV POLYMERASE INHIBITOR

(54) 発明の名称: 新規ピペラジン化合物、及びそのＨＣＶポリメラーゼ阻害剤としての利用



[I]

(57) Abstract: Disclosed is a compound represented by the general formula [I] shown below, a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate of the compound or the salt. Also disclosed are an anti-HCV agent and an HCV polymerase inhibitor each comprising the compound. The compound has an HCV polymerase inhibitory activity and therefore has an anti-HCV activity. Therefore, the compound is useful as a therapeutic or prophylactic agent for hepatitis C, wherein each symbol is as defined in the description.

(57) 要約: 本発明は、下記一般式［Ｉ］: （式中、各記号は明細書に記載の通りである。）で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、並びに該化合物を含有してなる抗ＨＣＶ剤及びＨＣＶポリメラーゼ阻害剤に関する。本発明の化合物は、ＨＣＶポリメラーゼ阻害作用により抗ＨＣＶ作用を示し、Ｃ型肝炎の治療剤又は予防剤として有用である。

WO 2007/119889 A1

(74) 代理人: 高島一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目１番１号明治安田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(51) 国際特許分類 [続葉有]:

C07D 403/06 (2006.01)	*C07D 417/12* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)	*C07D 417/14* (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)	*C07D 471/04* (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)	*C07D 475/00* (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)	*C07D 487/04* (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)	*C07D 491/052* (2006.01)
C07D 413/06 (2006.01)	*C07D 498/04* (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)	*C07D 513/04* (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)	*C07D 519/00* (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)	

添付公開書類:

— 国際調査報告書

— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部分、請求に基づき国際事務局から入手可能

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

明細書

新規ピペラジン化合物、及びそのＨＣＶポリメラーゼ阻害剤としての利用

技術分野

本発明は、Ｃ型肝炎治療剤として有用な新規ピペラジン化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物に関する。また本発明は、抗Ｃ型肝炎ウイルス（ＨＣＶ）作用、特にＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ阻害活性により抗ＨＣＶ作用を示すＣ型肝炎の予防若しくは治療に有効なピペラジン化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物を含む抗ＨＣＶ剤に関する。

背景技術

１９８９年、輸血後の非Ａ非Ｂ型肝炎の主要な原因ウイルスが発見されＣ型肝炎ウイルス（ＨＣＶ）と名づけられた。現在では、Ａ型、Ｂ型、Ｃ型の他、数種の肝炎ウイルスが発見されており、ＨＣＶにより引き起こされる肝炎がＣ型肝炎と呼ばれている。

ＨＣＶ感染患者は全世界人口の数%にも及ぶと推定されており、その感染は長期慢性化する特徴を有する。

ＨＣＶは、エンベロープを有するＲＮＡウイルスであり、ゲノムは一本鎖プラス鎖ＲＮＡで、フラビウイルス科の Hepacivirus 属に分類される。例えば同じ肝炎ウイルスであっても、ＤＮＡウイルスであるＢ型肝炎ウイルス（ＨＢＶ）は、免疫能の未熟な新生児、乳幼児期以外では、たとえ感染しても免疫機構により排除され急性感染で終わる。それと比較し、ＨＣＶは、未だ明らかではない原因により宿主の免疫機構を回避するため、免疫機構の発達した大人に感染した場合でも持続感染に移行することが多い。

ＨＣＶの持続感染に伴い慢性肝炎が引き起こされると、その後、高率に肝硬変、肝癌へと進行し、手術で癌を摘出しても、非癌部で引き続き起こる炎症のため肝癌が再発する患者も多いことが知られている。また、ＨＣＶ感染が慢性蕁麻疹、偏平苔癬、クリオグロブリン血症性紫斑等の皮膚疾患に関与するとの報告も見られる。

よって、Ｃ型肝炎の有効な治療方法の確立が望まれており、その中でも、抗炎症剤により炎症を抑える対症療法とは別に、炎症が引き起こされない程度にＨＣＶを減らす或いはＨＣＶを根絶させる薬剤の開発が強く望まれている。

現在、ＨＣＶ排除の唯一有効な治療法としてインターフェロン治療が知られている。しかし、インターフェロンによりウイルスを排除できる人は、全患者の１／３程度であり、残りの人には全く効かない、若しくは一時的な効果しか見られないことが知られている。近年、ポリエチレングリコール化したインターフェロンも実用化され、効果の増強、副作用の低下が見られる。しかし、依然著効率は低く、従って、インターフェロンに代わり用いられる若しくはそれと併用される抗ＨＣＶ薬への期待は大きい。

また近年、リバビリン（Ｒｉｂａｖｉｒｉｎ：１－β－Ｄ－リボフラノシル－１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－カルボキサミド）がインターフェロンとの併用によるＣ型肝炎治療剤として市販されている。しかし、インターフェロンの有効性を高めはするものの、依然有効率は低く、更なる新規なＣ型肝炎治療剤が望まれている。

また、インターフェロンアゴニスト、インターロイキン－１２アゴニスト等、患者自身の免疫力を増強させウイルスを排除する手段も試みられているが、未だ有効とされる薬剤は見出されていない。

また近年、ＨＣＶ特異的なタンパク質をターゲットとしたＨＣＶ増殖阻害にも注目が集まっている。

ＨＣＶ自身の遺伝子にはセリンプロテアーゼ、ＲＮＡヘリカーゼ、ＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ等のタンパク質がコードされており、それらタンパク質はＨＣＶの増殖に必須の特異的タンパク質として機能する。

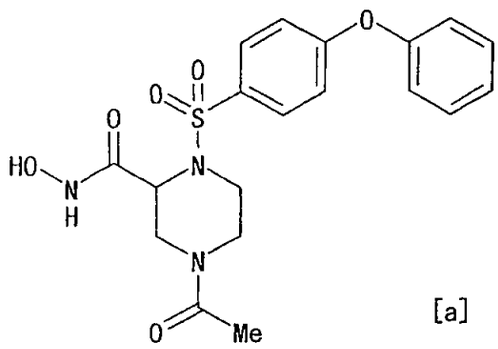
特異的タンパク質の一つであるＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ（以後単にＨＣＶポリメラーゼとも言う。）は、ウイルス増殖に必須の酵素である。プラス鎖ＲＮＡ遺伝子を持つＨＣＶの遺伝子複製は、まずプラス鎖ＲＮＡを鋳型にして、相補的なマイナス鎖ＲＮＡを合成し、さらにそのマイナス鎖ＲＮＡを鋳型にしてプラス鎖ＲＮＡを増幅するという手順によると考えられている。ＨＣＶのコードするタンパク質前駆体のＮＳ５Ｂと呼ばれる部位が、ＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ活性を示すことが示されており、ＨＣＶ遺伝子複製の中心的役割を果たすと考えられている。

よって、ＨＣＶポリメラーゼの阻害剤は、抗ＨＣＶ薬開発のターゲットとなり得、

その開発への期待は高い。しかし、その他の作用機序による抗ＨＣＶ薬の開発と同様、未だ有効なＨＣＶポリメラーゼ阻害剤の開発には至っておらず、未だＣ型肝炎を治療及び予防できる薬剤は不十分である。

次に、本発明に比較的類似する既知化合物について述べる。

ＷＯ２００４／７３５９９号（３３頁、表１）には、抗ＨＣＶ剤として下記化合物ａ等が開示されている（特許文献１参照）。

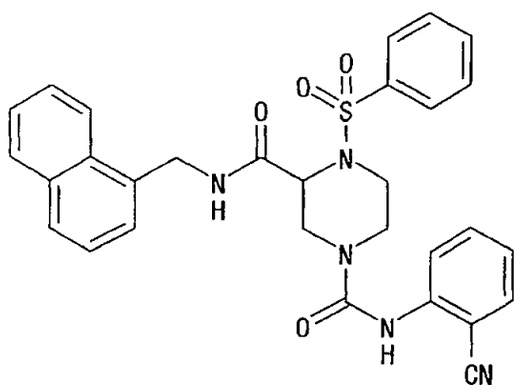


[a]

しかし、該明細書中に、本発明化合物は開示されておらず、また、それを示唆する記載も見られない。

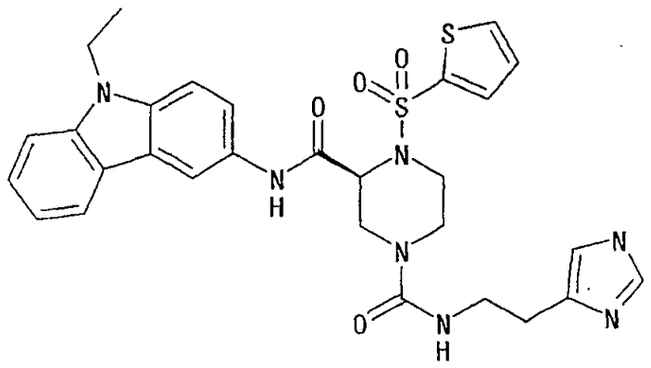
抗ＨＣＶ剤以外に、本発明と比較的類似する化合物を開示する文献として、以下が挙げられる。

ＷＯ２００４／７１３９０号（３３頁、８行）には、下記化合物ｂ等が月経困難症等の治療に用いられる化合物として開示されている（特許文献２参照）。



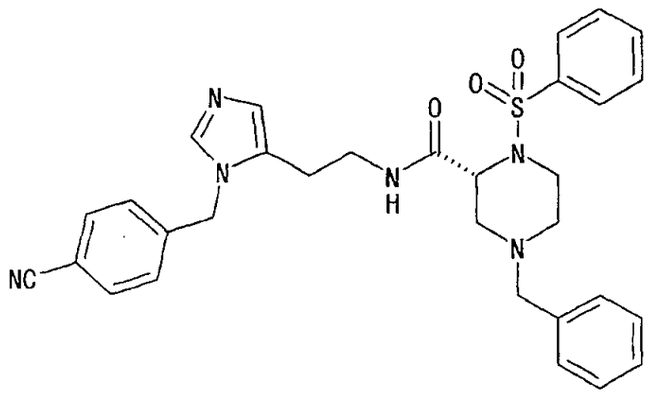
[b]

また、ＷＯ２００４／３１１８２号（２５頁、４行）には、下記化合物ｃ等が、不妊症の治療に用いられる化合物として開示されている（特許文献３参照）。



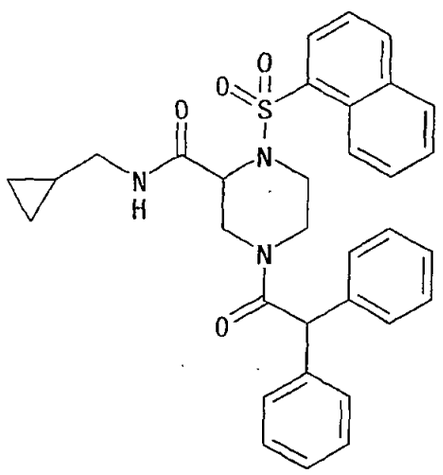
[c]

また、ＷＯ２０００／３９１１９号（４２頁、実施例２８Ｌ）には、下記化合物ｄ等が細胞の異常増殖を阻害する化合物として開示されている（特許文献４参照）。



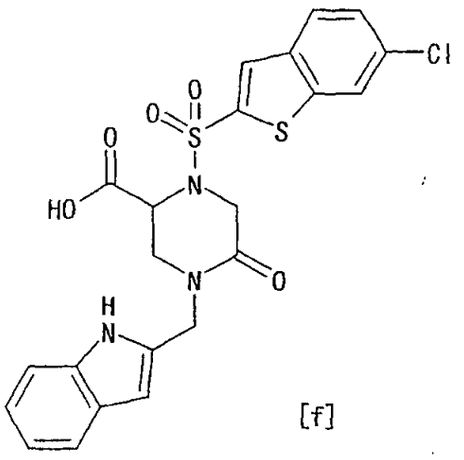
[d]

また、ＵＳ５，８８０，１２８号（カラム６７－６８、実施例２４）には、下記化合物ｅ等が細胞の異常増殖を阻害する化合物として開示されている（特許文献５参照）。



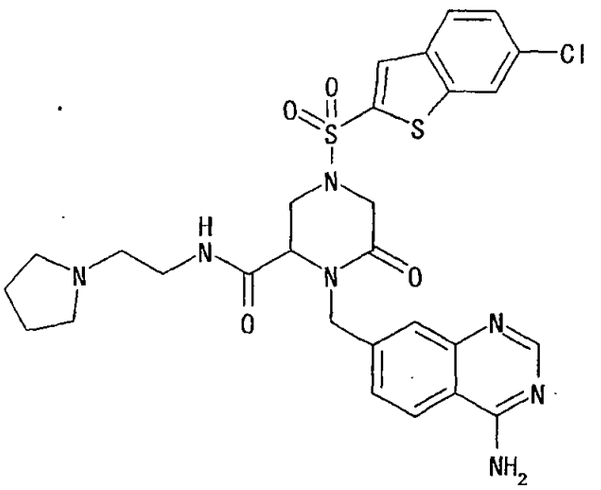
[e]

また、ＷＯ１９９９／３７３０４号には、下記化合物ｆ等がファクターＸａ阻害剤として開示され、ウイルス感染症への適応が例示されている（特許文献６参照）。



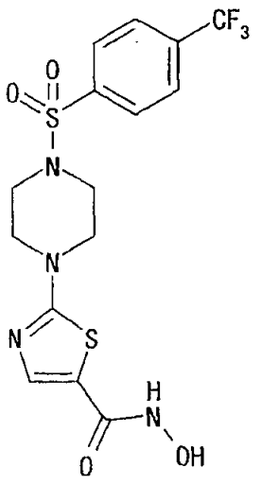
[f]

また、ＷＯ２００１／０７４３６号には、下記化合物ｇ等がファクターＸａ阻害剤として開示され、ウイルス感染症への適応が例示されている（特許文献７参照）。



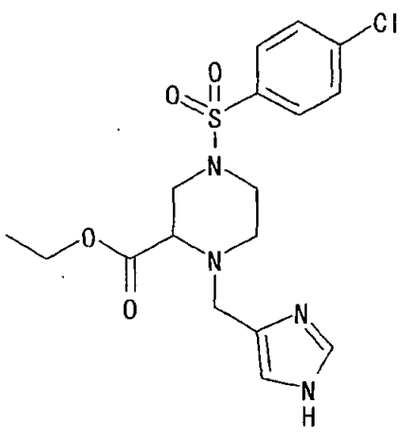
[g]

また、ＷＯ２００５／８６８９８号（９５頁、実施例９）及びＵＳ２００５／２３４０３３（３７頁、実施例９）には、増殖性疾患の治療剤として下記の化合物ｈ等が開示されている（特許文献８、及び、特許文献９参照）。



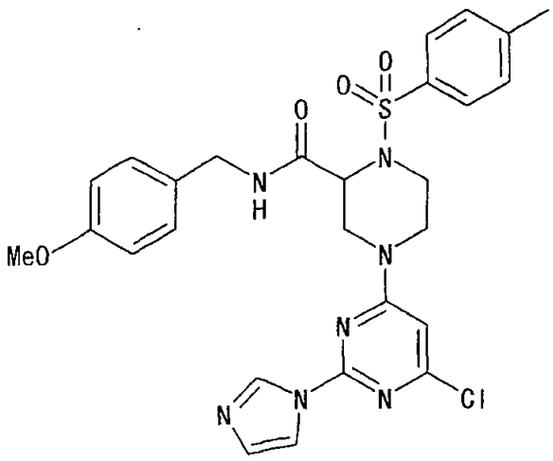
[h]

また、ＷＯ２０００／５３５９６号（４２頁、表２中）には、中枢神経系活性、及び、炎症性疾患、アレルギー性疾患に対する活性を有する化合物として下記の化合物ｉ等が開示されている（特許文献１０参照）。



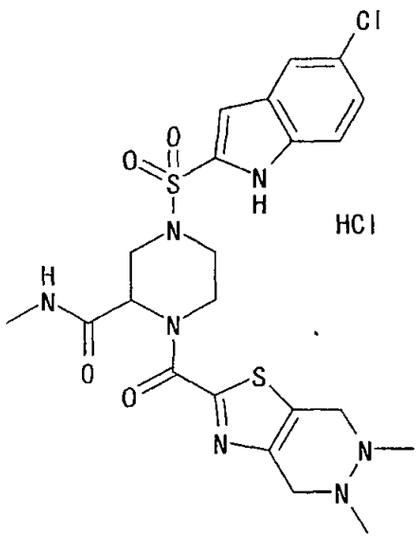
[i]

また、ＷＯ１９９８／３７０７９号（１３８頁、１９－２０行）には、多発性硬化症等の一酸化窒素産生の異常により引き起こされる疾患の治療剤として下記の化合物ｊ等が開示されている（特許文献１１参照）。



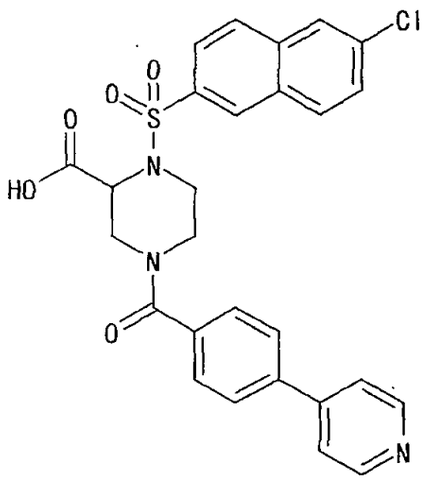
[j]

また、ＪＰ２００１－２９４５７２号（２９７頁、実施例３４９）には、抗血栓効果を有する化合物として下記の化合物ｋ等が開示されている(特許文献１２参照)。



[k]

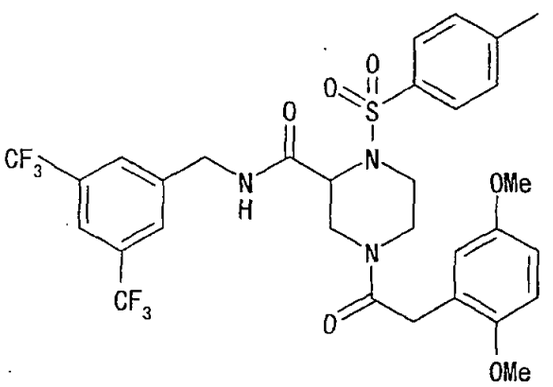
また、ＥＰ１１０４７５４号（実施例Ａ－３３）及びＥＰ１０３１５６３号（実施例３３）には、抗血栓効果を有する化合物として下記の化合物１等が開示されている（特許文献１３、及び、特許文献１４参照）。



[I]

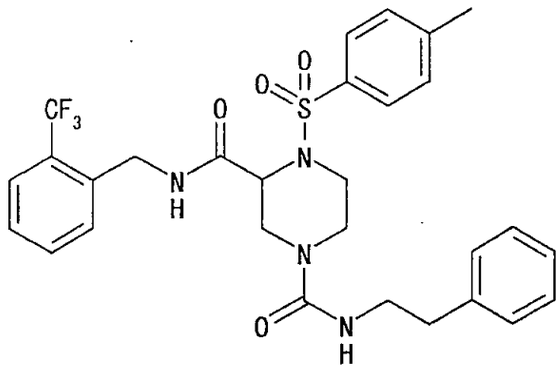
また、医薬用途以外で、本発明化合物と比較的類似な化合物としては、以下が挙げられる。

ＷＯ２００１／５４５０４号（図５５）には、駆虫薬として下記の化合物ｍ等が開示されている（特許文献１５参照）。



[m]

その他文献（Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　Ｌｅｔｔｅｒｓ，３９，１２９５－９８，１９９８；１２９７頁、表ＩＩ）には、下記化合物ｎ等が開示されており、その合成法が記載されている（非特許文献１参照）。



[n]

しかし、これらいずれの文献中にも、本発明化合物は開示されていないばかりか、該文献中の化合物の抗ＨＣＶ剤用途についても述べられておらず、それらを示唆する記載も見られない。

[特許文献１] ＷＯ２００４／７３５９９号（３３頁、表１）

[特許文献２] ＷＯ２００４／７１３９０号（３３頁、８行）

[特許文献３] ＷＯ２００４／３１１８２号（２５頁、４行）

[特許文献４] ＷＯ２０００／３９１１９号（４２頁、実施例２８Ｌ）

[特許文献５] ＵＳ５，８８０，１２８号（カラム６７－６８、実施例２４）

[特許文献６] ＷＯ１９９９／３７３０４号

[特許文献７] ＷＯ２００１／０７４３６号

[特許文献８] ＷＯ２００５／８６８９８号（９５頁、実施例９）

[特許文献９] ＵＳ２００５／２３４０３３（３７頁、実施例９）

[特許文献１０] ＷＯ２０００／５３５９６号（４２頁、表２中）

[特許文献１１] ＷＯ１９９８／３７０７９号（１３８頁、１９－２０行）

[特許文献１２] ＪＰ２００１－２９４５７２号（２９７頁、実施例３４９）

[特許文献１３] ＥＰ１１０４７５４号（実施例Ａ－３３）

[特許文献１４] ＥＰ１０３１５６３号（実施例３３）

[特許文献１５] ＷＯ２００１／５４５０４号（図５５）

[非特許文献１] Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔｅｒｓ，Ｖｏｌ．３９，１２９５－９８頁，１９９８（１２９７頁、表ＩＩ）

発明の開示

発明が解決しようとする課題

これまでの研究で得られた知見により、抗ＨＣＶ作用を有する薬剤は、Ｃ型肝炎の予防及び治療に有効であり、特にＨＣＶの有するＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ阻害作用を有する抗ＨＣＶ剤は有効なＣ型肝炎の予防及び治療剤、またＣ型肝炎に起因する疾患の予防及び治療剤に成り得ることが明らかとなった。

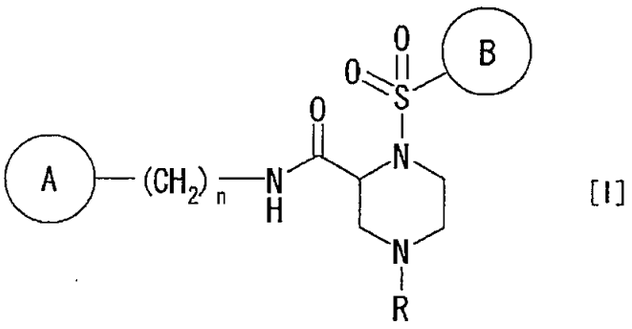
従って、本発明は、抗ＨＣＶ作用を有する薬剤、特にＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ阻害作用を有する薬剤を提供することを課題とする。

課題を解決するための手段

本発明者らは、抗ＨＣＶ作用、特にＲＮＡ依存性ＲＮＡポリメラーゼ阻害作用を有する化合物を見出すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明を完成するに至った。

より詳しくは、本発明は下記に示す通りである。

［１］　下記一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物を有効成分として含有してなる抗ＨＣＶ剤。



[I]

［式中、環Ａは、

下記グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいＣ$_{3-12}$炭素環基、又は、

下記グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有する。）であり、

ｎは、１乃至６の整数であり、

環Ｂは、

下記グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいＣ$_{3-12}$炭素環基、又は、

下記グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至6個のヘテロ原子を有する。）であり、

Rは、

水素原子、

$-COR^1$、

$-COOR^2$、

$-CONR^3R^4$、

$-SO_2R^5$、

$-CO-COOR^6$、

$-CO-CH=CH-COOR^{11}$、

$-CO-(CH_2)_a-NH-R^7$、

$-CO-(CH_2)_b-NHCOR^8$、

$-CO-(CH_2)_c-NHCOOR^9$

（ここで、R^1からR^9、及び、R^{11}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、又は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基であり、

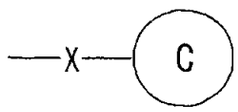
a、b及びcは、それぞれ同一又は異なって、1乃至4の整数である。）、

$-CO-CONH_2$、

$-C(=NH)NH_2$、

$-C(=S)NH_2$、

下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、又は、



（式中、Xは、

結合、

C_{1-4}アルキレン、

$-CO-(CH_2)_p-$、

$-CONR^{10}-(CH_2)_q-$、

$-CO-(CH_2)_r-O-(CH_2)_s-$、

$-CO-(CH_2)_t-NH-(CH_2)_u-$、

$-CO-(CH_2)_v-CONH-(CH_2)_w-$、又は、

$-CO-NH-SO_2-$であり、

環Cは、

下記グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、又は、

下記グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至6個のヘテロ原子を有する。）であり、

R^{10}は、水素原子、又は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基であり、

p、q、r、s、u、v及びwは、それぞれ同一又は異なって、0、又は1乃至4の整数であり、tは、1乃至4の整数である。）である。

グループA：

ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、

$-OR^{a1}$、

$-SR^{a2}$、

$-NR^{a3}R^{a4}$、

$-NHCOR^{a5}$、

$-NHSO_2R^{a14}$、

$-COOR^{a6}$、

$-CONR^{a7}R^{a8}$、

$-SO_2NR^{a9}R^{a10}$、

$-SO_2NHCOR^{a15}$、

$-COR^{a11}$、

$-SO_2R^{a12}$、

$-CONHSO_2R^{a13}$、

$-COCOOR^{a16}$、

$-COCONR^{a17}R^{a18}$、

$-CONR^{a19}(OR^{a20})$、

$-SF_5$

（ここで、R^{a1}からR^{a20}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、

下記グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有する。）、又は、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基である。）、

下記グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

下記グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}アルキニル基、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有する。）、

下記グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{6-1}

$_2$アリール－C_{1-4}アルキル基、

下記グループCから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基

（ここで、当該ヘテロ環部分は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有する。）、及び、

下記グループCから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基。

グループB：

ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、

C_{1-4}アルコキシ基、

アミノ基、

C_{1-4}アルキルアミノ基、

ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ基、

カルボキシル基、

C_{1-4}アルコキシ－カルボニル基、

カルバモイル基、

C_{1-4}アルキルアミノ－カルボニル基、

ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ－カルボニル基、

ヘテロ環－カルボニル基、及び、

トリ（C_{1-4}アルキル）アンモニウミル基

（ここで、当該ヘテロ環部分は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有する。）。

グループC：

ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、

カルボキシル基、

C_{1-4}アルキル基、

ハロゲノC_{1-4}アルキル基、

ヒドロキシC_{1-4}アルキル基、

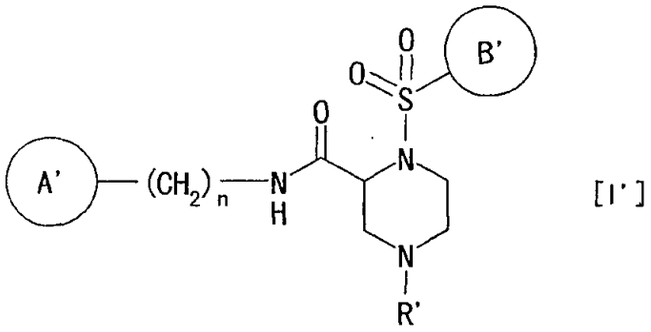
カルボキシC_{1-4}アルキル基、

C_{1-4}アルコキシC_{1-4}アルキル基、

C_{1-4}アルコキシ基、及び、

カルボキシC_{1-4}アルコキシ基。］

［２］　下記一般式［Ｉ’］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含有してなる、［１］記載の抗ＨＣＶ剤。



［Ｉ’］

［式中、環Ａ’は、

下記グループＡ’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、又は、

下記グループＡ’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）であり、

ｎは、１乃至６の整数であり、

環Ｂ’は、

下記グループＡ’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、又は、

下記グループＡ’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）であり、

Ｒ’は、

水素原子、

$-COR^{101}$、

$-COOR^{102}$、

$-CONR^{103}R^{104}$、

$-SO_2R^{105}$、

$-CO-COOR^{106}$、

$-CO-(CH_2)_a-NH-R^{107}$、

$-CO-(CH_2)_b-NHCOR^{108}$、

$-CO-(CH_2)_c-NHCOOR^{109}$

（ここで、R^{101}からR^{109}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、又は、下記グループB’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基であり、

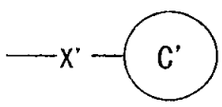
ａ、ｂ及びｃは、それぞれ同一又は異なって、１乃至４の整数である。）、

$-CO-CONH_2$、

$-C(=NH)NH_2$、

$-C(=S)NH_2$、

下記グループB’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、又は、



（式中、X’は、

結合、

アルキレン、

$-CO-(CH_2)_p-$、

$-CONR^{110}-(CH_2)_q-$、

$-CO-(CH_2)_r-O-(CH_2)_s-$、

$-CO-(CH_2)_t-NH-(CH_2)_u-$、又は、

$-CO-NH-SO_2-$であり、

環C’は、

下記グループA’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、又は、

下記グループA''から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する。）であり、

R^{110}は、水素原子、又は、下記グループB'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基であり、

p、q、r、s及びuは、それぞれ同一又は異なって、0、又は1乃至4の整数であり、tは、1乃至4の整数である。）である。

グループA''：

ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、

$-OR^{a101}$、

$-SR^{a102}$、

$-NR^{a103}R^{a104}$、

$-NHCOR^{a105}$、

$-COOR^{a106}$、

$-CONR^{a107}R^{a108}$、

$-SO_2NR^{a109}R^{a110}$、

$-COR^{a111}$、

$-SO_2R^{a112}$、

$-CONHSO_2R^{a113}$

（ここで、R^{a101}からR^{a113}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、

下記グループB'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

下記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

下記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄

原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）、又は、

下記グループＣ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基である。）、

下記グループＢ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

下記グループＣ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

下記グループＣ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）、及び、

下記グループＣ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基。

グループＢ’：

ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C_{1-4}アルコキシ基、アミノ基、C_{1-4}アルキルアミノ基、ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ基、カルボキシル基、C_{1-4}アルコキシ－カルボニル基、カルバモイル基、C_{1-4}アルキルアミノ－カルボニル基、ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ－カルボニル基、及び、ヘテロ環－カルボニル基

（ここで、当該ヘテロ環部分は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）。

グループＣ’：

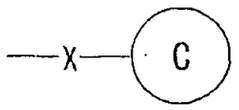
ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、C_{1-4}アルキル基、ハロゲノC_{1-4}アルキル基、及び、ヒドロキシC_{1-4}アルキル基。］

［３］　環Ａが、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基である、［１］記載の抗ＨＣＶ剤。

［４］　ｎが、１である、［１］記載の抗ＨＣＶ剤。

［５］　環Ｂが、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基である、［１］記載の抗ＨＣＶ剤。

［６］　Ｒが、



（式中、各記号は、［１］と同義である。）

である、［１］記載の抗ＨＣＶ剤。

［７］　Ｘが、結合である、［６］記載の抗ＨＣＶ剤。

［８］　Ｘが、－ＣＯ－（CH_2）$_p$－（式中、ｐは、［１］と同義である。）である、［６］記載の抗ＨＣＶ剤。

［９］　ｐが、１である、［８］記載の抗ＨＣＶ剤。

［１０］　Ｘが、－ＣＯＮＨ－（CH_2）$_q$－（式中、ｑは、［１］と同義である。）である、［６］記載の抗ＨＣＶ剤。

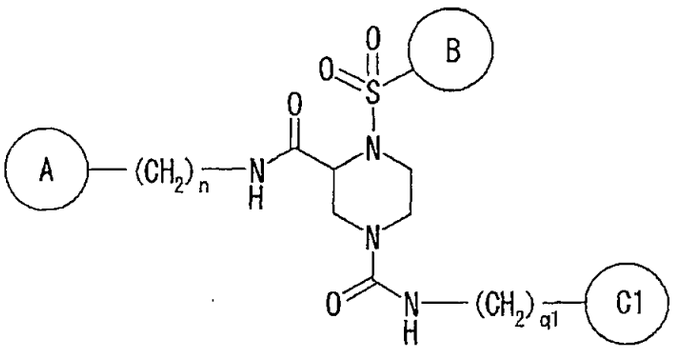
［１１］　ｑが、０である、［１０］記載の抗ＨＣＶ剤。

［１２］　ｑが、１である、［１０］記載の抗ＨＣＶ剤。

［１３］　環Ｃが、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基である、［６］記載の抗ＨＣＶ剤。

［１４］　［１］乃至［１３］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩を有効成分として含有してなるＨＣＶポリメラーゼ阻害剤。

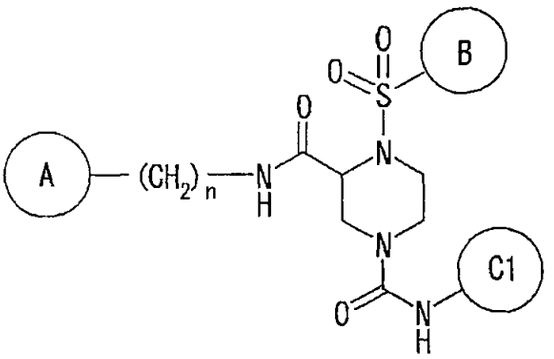
［１５］　下記一般式［Ｉ－Ａ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。



[I-A]

［式中、環Ｃ１は、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有し、グループＡは、［１］と同義である。）であり、ｑ１は、１乃至４の整数であり、その他の記号は［１］と同義である。］

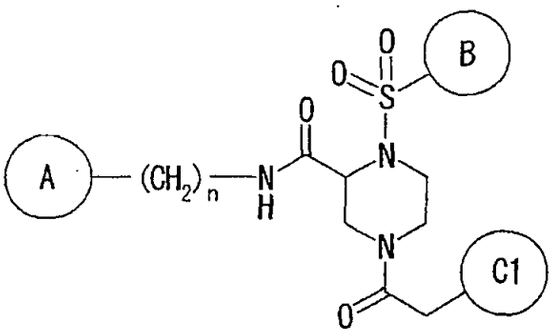
［１６］　下記一般式［Ｉ－Ｂ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。



[I-B]

［式中、環Ｃ１は、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有し、グループＡは、［１］と同義である。）であり、その他の記号は［１］と同義である。］

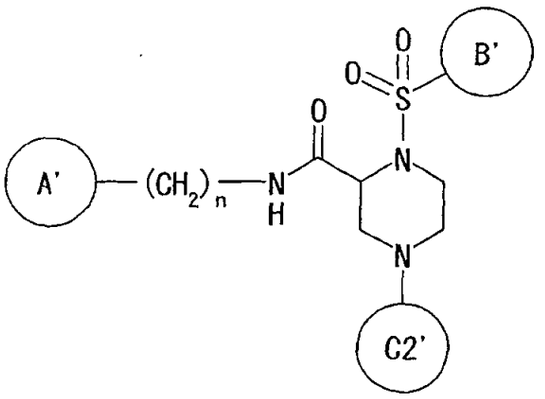
［１７］　下記一般式［Ｉ－Ｃ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。



[I-C]

［式中、環Ｃ１は、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至６個のヘテロ原子を有し、グループＡは、［１］と同義である。）であり、その他の記号は［１］と同義である。］

［１８．０］　下記一般式［Ｉ－Ｄ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩。



[I-D]

[式中、環Ｃ２’は、下記グループA’’’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる１乃至４個のヘテロ原子を有する。）であり、その他の記号は［２］と同義である。

グループA’’’：

ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、

$-OR^{a101}$、

$-SR^{a102}$、

$-NR^{a103}R^{a104}$、

$-NHCOR^{a105}$、

$-COOR^{a106}$、

$-CONR^{a107}R^{a108}$、

$-SO_2NR^{a109}R^{a110}$、

$-COR^{a111}$、

$-SO_2R^{a112}$、

$-CONHSO_2R^{a113}$

（ここで、R^{a101}からR^{a113}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、

上記グループB’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

上記グループC’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

上記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基

（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する。）、又は、

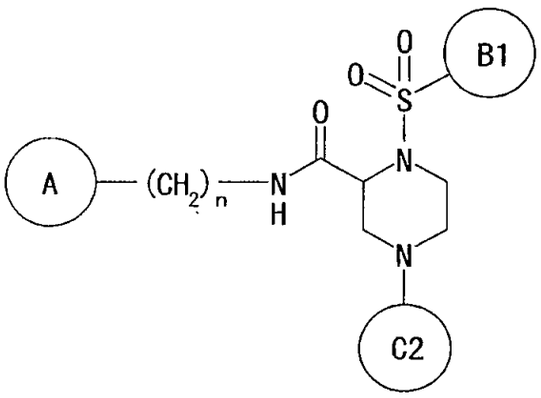
上記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基である。）、

上記グループB'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

上記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、及び、

上記グループC'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基。]

[18] 下記一般式[I－D1]で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。



[I-D1]

[式中、環B1は、グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいフェニル基（ここで、グループAは、[1]と同義である。）であり、環C2は、下記グループA'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至6個のヘテロ原子を有する。）であり、その他の記号は[1]と同義である。

グループA'：

ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、

$-OR^{a1}$、

$-SR^{a2}$、

$-NR^{a3}R^{a4}$、

$-NHCOR^{a5}$、

$-NHSO_2R^{a14}$、

$-COOR^{a6}$、

$-CONR^{a7}R^{a8}$、

$-SO_2NR^{a9}R^{a10}$、

$-SO_2NHCOR^{a15}$、

$-COR^{a11}$、

$-SO_2R^{a12}$、

$-CONHSO_2R^{a13}$、

$-COCOOR^{a16}$、

$-COCONR^{a17}R^{a18}$、

$-CONR^{a19}(OR^{a20})$、

$-SF_5$

（ここで、R^{a1}からR^{a20}は、それぞれ同一又は異なって、

水素原子、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基（ここで、当該ヘテロ環基は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至6個のヘテロ原子を有する。）、又は、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール-C_{1-4}アルキル基である。）、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}アルキニル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基

（ここで、当該ヘテロ環部分は、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至6個のヘテロ原子を有する。）、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基。

グループB及びグループCは、［1］と同義である。］

［19］ 環Aが、グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいフェニル基である、［15］乃至［18］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［20］ nが、1である、［15］乃至［18］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［21］ 環Bが、グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいフェニル基である、［15］乃至［17］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［22］ 環C1が、グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、ピペリジニル基、モルホリニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアジアゾリル基、オキサジアゾリル基、ピリジル基、及びピリミジニル基からなる群から選ばれる、［15］乃至［17］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［23］ 環C1が、グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換さ

れてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イソオキサゾリル基、チアジアゾリル基、オキサジアゾリル基、ピラゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ピリジル基、及びピリミジニル基からなる群から選ばれる、［１６］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［２４］　環Ｃ１が、グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、ピペリジニル基、モルホリニル基、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、イソオキサゾリル基、ピリジル基、及びピリミジニル基からなる群から選ばれる［１７］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［２５］　環Ｃ２が、グループＡ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、イミダゾリニル基、チアゾリニル基、オキサゾリニル基、チエニル基、ジオキソピロリジニル基、ジオキソピロリニル基、オキソピロリジニル基、オキソチアジアゾリニル基、テトラヒドロベンゾチアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、

キノリル基、

［１，５］ナフチリジニル基、

［１，６］ナフチリジニル基、

オキソピペリジニル基、

オキソジヒドロピリジニル基、

［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジニル基、

ベンゾイミダゾリル基、

イミダゾ［４，５－ｃ］ピリジニル基、

キノキサリニル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジニル基、

ピリド［３，４－ｂ］ピラジニル基、

プテリジニル基、

ピラジノ［2，3－b］ピラジニル基、

イミダゾ［4，5－b］ピラジニル基、

2，2－ジオキソ－1，2，3，4－テトラヒドロピラジノ［2，3－c］［1，2，6］チアジアジニル基、

2－オキソ－1，4－ジヒドロピラジノ［2，3－d］［1，3］オキサジニル基、

2－オキソ－2，3－ジヒドロイミダゾ［4，5－b］ピラジニル基、

［1，2，5］チアジアゾロ［3，4－b］ピラジニル基、

ベンゾチアゾリル基、

4，5，6，7－テトラヒドロベンゾチアゾリル基、

チアゾロ［5，4－b］ピリジニル基、

チアゾロ［5，4－c］ピリジニル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリミジニル基、

チアゾロ［5，4－d］ピリミジニル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリダジニル基、

チアゾロ［4，5－b］ピラジニル基、

チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジニル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－b］ピリジニル基、

ピラゾロ［3，4－d］チアゾリル基、

4，6－ジオキソ－5，6－ジヒドロピロロ［3，4－d］チアゾリル基、

4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジニル基、

4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジニル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジニル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジニル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジニル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジニル基、

4，7－ジオキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジニル基、

4－オキソ－3，4－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジニ

ル基、

5－オキソー［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジニル基、

7－オキソー［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジニル基、

4－オキソー［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジニル基、

［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾリル基、及び、インデノチアゾリル基からなる群から選ばれる、［18］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［26］　環C2が、グループA'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいチアゾール－2－イル基である［25］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［27］　環C2が、グループA'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、

ベンゾチアゾール－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロベンゾチアゾール－2－イル基、

チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－b］ピラジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

1H－ピラゾロ［3，4－d］チアゾール－5－イル基、

4，6－ジオキソ－5，6－ジヒドロ－4H－ピロロ［3，4－d］チアゾール－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

７－オキソ－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

７－オキソ－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４，７－ジオキソ－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－オキソ－３，４－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

５－オキソ－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

４－オキソ－４Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［２，３－ｃ］［１，２，４］トリアジン－７－イル基、

［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル基、及び、

インデノチアゾリル基からなる群から選ばれる、［２５］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［２８］　環Ｃ２が、グループＡ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいピラジン－２－イル基である、［２５］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［２９］　環Ｃ２が、グループＡ’から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基であって、当該ヘテロ環基は、

キノキサリン－２－イル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－３－イル基、

ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

プテリジン－６－イル基、

プテリジン－７－イル基、

ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、

１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、

２，２－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロピラジノ［２，３－ｃ］［１，２，６］チアジアジン－７－イル基、

２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル基、

２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、及び、

［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル基からなる群から選ばれる、［２５］に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［３０］　（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例３）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－３－イルアミド（実施例２１１）、

（Ｒ）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例２９５）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリミジン－４－イルアミド（実施例３００）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－２－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３０１）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－２－カルボン酸塩酸塩（実施例３１４）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－

1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－ピリジン－4－イルアミド（実施例３１８）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［1，3，4］チアジアゾール－2－イルアミド（実施例３３２）、

5－｛［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－［1，3，4］オキサジアゾール－2－カルボン酸　エチルエステル（実施例３３４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－ピリジン－4－イルアミド（実施例３４７）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［1，3，4］オキサジアゾール－2－イルアミド（実施例３４８）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）　1－ピリジン－4－イルアミド（実施例４３６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）　1－［1，3，4］チアジアゾール－2－イルアミド（実施例４３７）、

（2－｛［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－チアゾール－4－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例４７０）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－｛［4－（2－モルホリン－4－イル－2－オキソ－エチル）－チアゾール－2－イル］－アミド｝　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）（実施例４７５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－

1，3－ジカルボン酸　1－｛［4－（2－ヒドロキシ－エチル）－チアゾール－2－イル］－アミド｝　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）（実施例４７６）、

5－｛［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－［1，3，4］チアジアゾール－2－カルボン酸エチルエステル（実施例４７７）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－ヒドロキシメチル－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル）－アミド］（実施例４８２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（5－アセチル－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］（実施例４８３）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（1－ヒドロキシ－1－メチル－エチル）－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル］－アミド｝（実施例４８４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－メチル－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル）－アミド］（実施例４８８）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－トリフルオロメチル－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル）－アミド］（実施例４８９）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－メトキシ－ピリジン－4－イル）－アミド］（実施例４９

0）、

4－｛［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－2－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例４９１）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（（R）－3－ヒドロキシ－ピロリジン－1－カルボニル）－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル］－アミド｝（実施例４９５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（4－ヒドロキシ－ピペリジン－1－カルボニル）－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル］－アミド｝（実施例４９６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（モルホリン－4－カルボニル）－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル］－アミド｝（実施例４９７）、

4－｛［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－2－カルボン酸（実施例５０２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－カルバモイル－ピリジン－4－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］（実施例５０３）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－ジメチルカルバモイル－ピリジン－4－イル）－アミド］（実施例５０４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－

1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－ヒドロキシメチル－ピリジン－4－イル）－アミド］（実施例511）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－シクロプロピルカルバモイル－ピリジン－4－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例512）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［2－（モルホリン－4－カルボニル）－ピリジン－4－イル］－アミド｝（実施例513）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［2－（ピロリジン－1－カルボニル）－ピリジン－4－イル］－アミド｝（実施例514）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－クロロ－ピリジン－4－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例517）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－チアゾール－4－イルアミド（実施例525）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－メチル－イソオキサゾール－3－イル）－アミド］（実施例526）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチル－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－アミド］（実施例527）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチルーイソオキサゾールー5－イル）－アミド］（実施例528）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［1，2，4］トリアゾール－4－イルアミド（実施例539）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（5－メチルー［1，3，4］チアジアゾールー2－イル）－アミド］　3－（4－ペンタフルオロエチルーベンジルアミド）（実施例552）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチルーイソチアゾールー5－イル）－アミド］（実施例553）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－チアゾールー2－イルアミド（実施例554）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－トリフルオロメチルーピリジンー4－イル）－アミド］（実施例555）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（1H－［1，2，4］トリアゾールー3－イル）－アミド］（実施例565）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2H－テトラゾールー5－イル）－アミド］（実施例566）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－メチルーチアゾールー4－イル）－アミド］（実施例567）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（1－メチルー1H－ピラゾールー3－イル）－アミド］（実施例569）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－チアゾールー5－イルアミド（実施例607）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［4－（1－ヒドロキシー1－メチルーエチル）－チアゾールー2－イル］－アミド｝（実施例612）、及び、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（5－ブロモー［1，3，4］チアジアゾールー2－イル）－アミド］　3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド）（実施例936）

からなる群より選ばれる［16］記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［31］　（R）－4－（2－ピリジン－4－イルーアセチル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピルーベンジルアミド（実施例2）、

1－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－4－（2－ピペリジン－1－イルーアセチル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例102）、

1－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－4－（2－モルホリン－4－イルーアセチル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノーベンジルアミド（実

施例１０４）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－ピリジン－２－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１５３）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－ピリジン－３－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１５４）、

（Ｒ）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－ピペリジン－１－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１５８）、

（Ｒ）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－ピロリジン－１－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１５９）、

（Ｒ）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－モルホリン－４－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１６０）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－３－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１７５）、

（Ｒ）－４－（２－モルホリン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１８０）、

（Ｒ）－４－（２－１Ｈ－イミダゾール－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１９５）、

（Ｒ）－４－（２－イミダゾール－１－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２１９）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，３］トリアゾール－１－イル－アセチル）－１－（４

－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２２０）、

（Ｒ）－４－（２－ピラゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２２８）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，４］トリアゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２２９）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，４］トリアゾールー４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２３０）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，３］トリアゾールー２－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２４２）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２５７）、

（Ｒ）－４－（２－１Ｈ－テトラゾールー５－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６１）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー２－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２７８）、

（２－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－２Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例３０９）、

（２－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２

－オキソ－エチル｝－２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸（実施例３１０）、

（１－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例３１１）、

（１－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸（実施例３１２）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－アセチル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例３４６）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例４０９）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例４１０）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４１１）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例４１２）、

（２－｛２－オキソ－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－エチル｝－２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例４５５）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチル－テトラゾール－１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン

酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５６）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチルーテトラゾールー２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５７）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー２－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４６０）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４６１）、

（Ｒ）－４－（２－イミダゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４６２）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４６４）、

（２－｛２－オキソ－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－エチル｝－２Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸（実施例４６５）、

（２－｛２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－２Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例４６６）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチルーテトラゾールー１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４６７）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチルーテトラゾールー２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４６８）、

（R）－4－［2－（5－フェニル－テトラゾール－2－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例４７９）、

（R）－4－［2－（3－メチル－イソオキサゾール－5－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例４８０）、

（R）－4－［2－（1－メチル－1H－イミダゾール－4－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例4.98）、

（R）－4－（2－ピリジン－4－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５００）、

（R）－4－（2－ピリジン－4－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５０８）、

（R）－4－［2－（2－メチル－2H－テトラゾール－5－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５１８）、

（R）－4－［2－（1－メチル－1H－テトラゾール－5－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５１９）、

（5－｛2－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－2－オキソ－エチル｝－テトラゾール－2－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例５３２）、

（5－｛2－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジル

カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－テトラゾール－１－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例５３３）、

（Ｒ）－４－［２－（５－イソプロピル－テトラゾール－１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４１）、

（Ｒ）－４－［２－（５－イソプロピル－テトラゾール－２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４２）、

（Ｒ）－４－｛２－［５－（２－モルホリン－４－イル－２－オキソ－エチル）－テトラゾール－２－イル］－アセチル｝－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４３）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチル－テトラゾール－２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ペンタフルオロエチル－ベンジルアミド（実施例５５１）、

（Ｒ）－４－（２－ピリミジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９０）、

（Ｒ）－４－［２－（５－アミノ－テトラゾール－２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例１０９６）、及び、

（Ｒ）－４－［２－（５－アミノ－テトラゾール－１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例１０９７）からなる群より選ばれる［１７］記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或い

はその溶媒和物。

［３２］　２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル(実施例５)、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例６）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイルー４－メチルーチアゾールー２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例７）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニルー５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例８）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニルー５’－カルボン酸（実施例９）、

２－［（Ｒ）－３－［（６－イソプロピルーピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例１３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例１４）、

４－（４，５－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾールー２－イル）－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１０３）、

４－（４，５－ジヒドローチアゾールー２－イル）－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１１２）、

１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－４－（４－メチルーチアゾール

－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１５）、

４－（４，５－ジヒドロ－オキサゾール－２－イル）－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３３）、

４－ベンゾチアゾール－２－イル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３４）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（４－フェニル－チアゾール－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３５）、

（Ｒ）－４－（２，５－ジオキソ－ピロリジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１４７）、

（Ｒ）－４－（２，５－ジオキソ－４－フェニル－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１４８）、

４－（８Ｈ－インデノ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル）－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１５５）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（４，５，６，７－テトラヒドロ－ベンゾチアゾール－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１５６）、

２－［４－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメチル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例１７０）、

２－［４－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメチル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例１７１）、

（R）－4－（4，5－ジヒドロ－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１７９）、

（R）－4－（4－メチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１８４）、

（R）－4－ベンゾチアゾール－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１９１）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－カルボン酸（実施例２４４）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸　メチルエステル（実施例２５４）、

｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－イル｝－酢酸　メチルエステル（実施例２５５）、

｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－イル｝－酢酸（実施例２５９）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－カルボン酸　エチルエステル（実施例２９６）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸　メチルエステル（実施例２９７）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－カル

ボン酸（実施例２９８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例２９９）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例３０２）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸メチルエステル（実施例３０３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３１５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３１９）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３２０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３２２）、

４－ヒドロキシー２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリミジン－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例３２５）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３２６）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－ト

リフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３２７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３２８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３２９）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３３０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３３１）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３３３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３３５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーピリミジン－５－カルボン酸　ベンジルエステル（実施例３３６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーピリミジン－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例３３７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーピリミジン－５－カルボン酸（実施例３３８）、

4－メチル－2－［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３３９）、

（R）－4－（5－カルバモイル－4－メチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸 4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３４０）、

4－メチル－2－［（R）－3－（2－メチル－4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３４１）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリミジン－5－カルボン酸（実施例３４２）、

2－［（R）－3－（4－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３４３）、

2－［（R）－4－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３４４）、

（R）－4－（2－オキソ－ピロリジン－3－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸 4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３４５）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－イソニコチン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３４９）、

（R）－4－（1－メチル－1H－イミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸 4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５２）、

（R）－4－（1H－イミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸 4－イソプロピル－ベン

ジルアミド（実施例３５３）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－メチルカルバモイル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５４）、

（Ｒ）－４－（５－ジメチルカルバモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－シクロプロピル－２－メチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３５６）、

４－ヒドロキシ－２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリミジン－５－カルボン酸（実施例３５７）、

（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－酢酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３５８）、

３－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３５９）、

（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－酢酸（実施例３６０）、

３－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸（実施例３６１）、

（Ｒ）－４－（５－ニトロ－２Ｈ－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１

－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３６２）、

４－エチル－２－［（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３６３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３６４）、

４－メチル－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３６５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－エチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３６６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３６７）、

（Ｒ）－４－（５－アミノ－２Ｈ－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３６８）、

（Ｒ）－２－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸（実施例３６９）、

（Ｓ）－２－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸（実施例３７０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－ト

リフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－オキサゾール－５－カルボン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３７１）、

（R）－４－（５－ブロモ－２H－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３７２）、

（R）－４－（２H－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３７３）、

（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例３７４）、

６－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸（実施例３７６）、

（R）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－アミド　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）（実施例３７７）、

４－メチル－２－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３７８）、

２－［（R）－３－（４－ジメチルアミノーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸塩酸塩（実施例３７９）、

３－｛２－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－イル｝－プロピオン酸（実施例３８２）、

２－［（R）－３－（４－シクロプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３８３）、

（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例３８５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例３８６）、

2－［（R）－3－［（6－ジメチルアミノ－ピリジン－3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３８７）、

4－メチル－2－［（R）－3－［（6－プロピル－ピリジン－3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３８８）、

2－［（R）－3－［（6－アゼチジン－1－イル－ピリジン－3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３８９）、

4－メチル－2－［（R）－3－［（6－ピロリジン－1－イル－ピリジン－3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３９０）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メトキシメチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３９４）、

2－［（R）－3－（4－アゼチジン－1－イル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３９８）、

（R）－3－（4－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例３９９）、

2－［（R）－3－ベンジルカルバモイル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カ

ルボン酸（実施例４０１）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４０６）、

（Ｒ）－３－［（６－ジメチルアミノ－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４０７）、

（Ｒ）－３－［（６－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４０８）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１４）、

（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４１５）、

４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－ピロリジン－１－イル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１６）、

６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸（実施例４１７）、

４－メチル－２－［（Ｒ）－３－フェネチルカルバモイル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１８）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３’－クロロ－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチル

エステル（実施例４２０）、

（Ｒ）－６’－ブロモ－３’－クロロ－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４２１）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－３’，６’－ジメチル－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４２２）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４２３）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４２４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ジエチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４２５）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４２６）、

４－クロロ－５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４２７）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－３’－メチル－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４３１）、

（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－

トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４３２）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－５－メチルーチアゾール－４－カルボン酸（実施例４３４）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４３９）、

（Ｒ）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４０）、

（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－エトキシーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例４４２）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例４４４）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４４５）、

（Ｒ）－４－（５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４４６）、

（R）－４－（５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４４７）、

２－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４４８）、

（R）－６’－メチル－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４９）、

２－［（R）－３－（４－メトキシメチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４５１）、

（R）－４－（５－ヒドロキシメチル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４５２）、

２－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４５３）、

（R）－４－（６－ヒドロキシ－５－メチル－ピリダジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４５４）、

（R）－４－（５－アミノ－ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４５８）、

（R）－５’－アミノ－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４７１）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロ

ピルーベンジルアミド（実施例４７２）、

（R）－３－（４－メトキシメチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４７３）、

（R）－３－（２－クロロ－４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４７４）、

（R）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－５’－ヒドロキシメチルー３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４７８）、

（R）－３－（２－クロロ－４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４８５）、

４－メチル－６－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸　メチルエステル（実施例４８６）、

４－メチル－６－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸（実施例４８７）、

｛４－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピラゾール－１－イル｝－酢酸（実施例４９３）、

４－メチル－６－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸　アミド（実施例４９４）、

４－メチル－２－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（３－プロピル－４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４９９）、

（R）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリ

フルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例５０１）、

（Ｒ）－４－（５－ジメチルアミノメチル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５０５）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－メチルアミノメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５０６）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例５０７）、

２－［（Ｒ）－４－（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例５０９）、

（Ｒ）－４－（４－ヒドロキシメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５１０）、

（Ｒ）－６’－アセチルアミノ－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例５１５）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－４，５－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５１６）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例５２３）、

（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－エチ

ルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例５２４）

（Ｒ）－５’－アミノ－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５３０）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－ピロリジン－１－イルメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５３１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－４Ｈ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－５－カルボン酸　ベンジルエステル（実施例５３４）、

５－ヒドロキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３５）、

５－メトキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３６）、

５－ヒドロキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３７）、

（Ｒ）－５’－ジメチルアミノメチル－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５３８）、

（Ｒ）－５’－メタンスルホニルアミノ－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４４）、

（Ｒ）－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－

３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５４５）、

（Ｒ）－４－（６－ヒドロキシ－ピリダジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４６）、

６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸　アミド（実施例５４７）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４８）、

（Ｒ）－６’－アミノ－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４９）、

（Ｒ）－４－（２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５５６）、

（Ｒ）－４－（４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５５７）、

（Ｒ）－５’－ピロリジン－１－イルメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５５８）、

（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例５５９）、

（Ｒ）－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンス

ルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５６０）、

（Ｒ）－４－（５－ベンジル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５６１）、

（Ｒ）－４－（４，５－ビス－ヒドロキシメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５６２）、

（Ｒ）－４－（３－メチル－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５６３）、

（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例５６４）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７０）、

（Ｒ）－４－（６－クロロ－ピリミジン－４－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７１）、

（Ｒ）－４－ピリミジン－４－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７２）、

（Ｒ）－４－（４，６－ジオキソ－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－ピロロ［３，４－ｄ］チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７３）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７４）、

（R）－６’－アミノ－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７５）、

（R）－４－（３－メチル－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５７６）、

（R）－４－（５－シアノ－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７７）、

（R）－４－（４－オキソ－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７８）、

（R）－４－（２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７９）、

（R）－４－ピリミジン－４－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８０）、

（R）－４－（２－ヒドロキシ－ピリミジン－４－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５８１）、

４－アミノ－２－［（R）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イ

ル］－チアゾール－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例５８２）、

（Ｒ）－４－（２－アミノ－ピリミジン－４－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８４）、

（Ｒ）－４－（４－アミノ－ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８５）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－アミド　３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］（実施例５８６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－４Ｈ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例５８７）、

（Ｒ）－４－（４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド(実施例５８８)、

（Ｒ）－４－（５－アセチル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル)－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド(実施例５８９）、

（Ｒ）－５’－シアノ－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９１）、

（Ｒ）－５’－モルホリン－４－イル－メチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９３）、

（R）－5’－（4－メチル－ピペラジン－1－イルメチル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９４）、

（R）－5’－ジメチルアミノメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９５）、

（R）－4－（3－アセチルアミノ－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９６）、

（R）－4－（4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９７）、

（R）－4－（5－メタンスルホニル－4，5，6，7－テトラヒドロ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６００）、

2－［（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－6，7－ジヒドロ－4H－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－5－カルボン酸　エチルアミド（実施例６０１）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６０２）、

2－［（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－ヒドロキシメチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例６０３）、

（R）－6’－アミノ－5’－ヒドロキシメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６０４）、

（R）－4－（6－アミノ－ピリミジン－4－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６０５）、

（R）－4－（3－メトキシ－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６０６）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６１５）、

（R）－4－（2－オキソ－1，4－ジヒドロ－2H－ピラジノ［2，3－d］［1，3］オキサジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６１６）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６１７）、

（R）－4－（4－オキソ－3，4－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６１８）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルアミド（実施例６１９）、

5－［（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリ

ジン－２－カルボン酸（実施例６２０）、

（R）－４－（３－メトキシ－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６２５）、

（R）－４－［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６２６）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例６２７）、

（R）－４－（２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例６２８）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－クロロ－ベンジルアミド（実施例６２９）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（６－ジメチルアミノ－ピリジン－３－イルメチル）－アミド（実施例６３０）、

５－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリジン－２－カルボン酸（実施例６３１）、

（R）－４－キノキサリン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６３２）、

（R）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６３３）、

（R）－6’－アミノ－5’－アミノメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６３８）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（ベンゾオキサゾール－2－イルメチル）－アミド（実施例６３９）、

（R）－4－（4－オキソ－3，4－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４０）、

（R）－4－（6－ヒドロキシ－［1，2，5］チアジアゾロ［3，4－b］ピラジン－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４７）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４８）、

（R）－4－（2，2－ジオキソ－1，2，3，4－テトラヒドロ－2λ^{6}－ピラジノ［2，3－c］［1，2，6］チアジアジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６５０）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－エトキシ－ベンジルアミド（実施例６５１）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－チオフェン－2－イル－ベンジルアミド（実施例６５２）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼン

スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ブロモ－ベンジルアミド（実施例６５３）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例６５６）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシメチル－ベンジルアミド（実施例６５７）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシ－ベンジルアミド（実施例６５８）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（［２，２’］ビチオフェニル－５－イルメチル）－アミド（実施例６５９）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例６６０）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メチルスルファニル－ベンジルアミド（実施例６６１）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－プロピル－１，２，３，６－テトラヒドロ－ピリジン－４－イルメチル）－アミド（実施例６６２）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ビフェニル－４－イルメチル）－アミド（実施例６６３）、

（Ｒ）－４－（４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミ

ド（実施例６６４）、

（R）－４－（１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６７６）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－オキソ－１－プロピル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－４－イルメチル）－アミド（実施例６８０）、

（R）－１－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８３）、

（R）－４－（６－ブロモ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８４）、

（R）－４－（７－ブロモ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８５）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８６）、

（R）－４－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例６８７）、

（R）－４－（６－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８８）、

（R）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６８９）、

（R）－４－ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオ

ロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９０）、

（Ｒ）－４－［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９１）、

（Ｒ）－４－（２－メチル－プテリジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９２）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－６－カルボン酸　エチルエステル（実施例６９３）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９４）、

（Ｒ）－１－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９５）、

（Ｒ）－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９６）、

（Ｒ）－１－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９７）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９８）、

（Ｒ）－４－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７００）、

（R）－４－（ビフェニル－４－スルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７０１）、

（R）－４－（４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７０４）、

（R）－４－プテリジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７０７）、

（R）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７０８）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－チオフェン－２－イル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７０９）、

３－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－６－カルボン酸　エチルエステル（実施例７１０）、

３－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－６－カルボン酸（実施例７１１）、

２－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－６－カルボン酸（実施例７１２）、

（R）－１－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７１３）、

（R）－１－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフ

ルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７１４）、

（R）－４－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７１５）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（６－プロピル－ピリジン－３－イルメチル）－アミド（実施例７２０）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－メチル－ピラジン－２－イルメチル）－アミド（実施例７２１）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－アミノ－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例７２２）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－ヒドロキシ－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例７２３）、

（R）－１－（２’－ヒドロキシ－ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７２４）、

（R）－１－（３’－ヒドロキシ－ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７２５）、

（R）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７２６）、

（R）－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７２７）、

５－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフ

ルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チオフェン－２－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例７２８）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－ピリジン－２－イル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例７３０）、

（４’－｛（Ｒ）－２－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－１－スルホニル｝－ビフェニル－２－イルオキシ）－酢酸（実施例７３１）、

（４’－｛（Ｒ）－２－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－１－スルホニル｝－ビフェニル－３－イルオキシ）－酢酸（実施例７３２）、

（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７３５）、

（Ｒ）－１－（４－ジメチルアミノ－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７３６）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７３９）、

（Ｒ）－４－［１，６］ナフチリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４０）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４１）、

（Ｒ）－４－（８－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４２）、

（R）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－ピロリジン－１－イル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４３）、

ｔｒａｎｓ－［４－（４－｛（Ｒ）－２－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－１－スルホニル｝－フェニル）－シクロヘキシル］－酢酸（実施例７４４）、

（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７４５）、

（Ｒ）－１－（４－モルホリン－４－イル－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７４６）、

（Ｒ）－１－（４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７４７）、

（Ｒ）－４－ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７４８）、

（Ｒ）－４－ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７４９）、

（Ｒ）－４－［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５０）、

（Ｒ）－１－［４－（２－オキソ－ピロリジン－１－イル）－ベンゼンスルホニル］－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７５１）、

（Ｒ）－１－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベ

ンジルアミド（実施例７５２）、

4’－｛（R）－2－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－1－スルホニル｝－ビフェニル－3－カルボン酸（実施例７５３）、

（R）－1－（4－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５４）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－ピロリジン－1－イル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５５）、

（R）－4－（3H－イミダゾ［4，5－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７５６）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５７）、

（R）－4－（1H－ベンゾイミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７５８）、

（R）－1－［4－（5－オキソ－2，5－ジヒドロ－［1，2，4］オキサジアゾール－3－イル）－ベンゼンスルホニル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７５９）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－3－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７６０）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７６１）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－6－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６２）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（2，2，2－トリフルオロ－エトキシ）－ベンジルアミド（実施例７６３）、

（メチル－｛4－［（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－2－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－フェニル｝－アミノ）－酢酸　エチルエステル（実施例７６４）、

（メチル－｛4－［（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－2－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－フェニル｝－アミノ）－酢酸（実施例７６５）、

（R）－4－（5－クロロ－キノキサリン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６６）、

（R）－4－（2－メチル－プテリジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６７）、

（R）－4－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６８）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６９）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－3－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７７０）、

（R）－4－［1，6］ナフチリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメト

キシーベンジルアミド（実施例７７１）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルスルファニルーベンジルアミド（実施例７７２）、

４－｛５－［（R）－２－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－プテリジン－７－イルーピペラジン－１－スルホニル］－２－トリフルオロメトキシーフェニル｝－酪酸（実施例７７３）、

６－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸（実施例７７４）、

（R）－４－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７７６）、

（R）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イルーピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例７７７）、

（R）－１－（３’－ヒドロキシービフェニルー４－スルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イルーピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例７７８）、

｛４’－［（R）－２－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イルーピペラジン－１－スルホニル］－ビフェニル－３－イルオキシ｝－酢酸（実施例７７９）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例７８０）、

３－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例７８１）、

（R）－４－キノキサリン－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼ

ンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７８２）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７８４）、

（Ｒ）－４－（４－オキソ－３，４－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７８５）、

（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７８６）、

（Ｒ）－４－（４－ピロリジン－１－イル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７８８）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９０）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９１）、

（Ｒ）－４－［１，５］ナフチリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９３）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９４）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼン

スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２，３，５，６－テトラフルオロ－４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７９５）、

（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－５’－ヒドロキシメチル－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９６）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２，４，６－トリクロロ－ベンジルアミド（実施例７９７）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（２－トリフルオロメチル－プテリジン－７－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９８）、

（Ｒ）－４－（８－ブロモ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９９）、

（Ｒ）－４－（５，７－ジクロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８００）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８０１）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８０２）、

（Ｒ）－４－（４，７－ジオキソ－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８０３）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（アダマンタン－１－イルメチル）

ーアミド（実施例８０４）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８０５）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸（実施例８０６）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸　アミド（実施例８０７）、

3－｛2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－イル｝－プロピオン酸（実施例８０８）、

（R）－6’－メチル－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例８０９）、

（R）－4－［8－（2－カルバモイルーエチル）－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８１０）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（3－フェニループロピル）－アミド（実施例８１１）、

（R）－1－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８１２）、

（R）－4－（8－ブロモーピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル）－1－（4

－エチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８１３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例８１４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８１５）、

３－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例８１６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例８１７）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ベンゾチアゾール－４－カルボン酸（実施例８１８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８１９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２０）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８２１）、

２－メチル－６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－

ニコチン酸（実施例８２２）、

５－フルオロ－２－メチル－６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸（実施例８２３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８２４）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２５）、

３－｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－プロピオン酸（実施例８２６）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－スルファモイル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２７）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－メチルスルファモイル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２８）、

（Ｒ）－４－（５－ジメチルスルファモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２９）、

（Ｒ）－４－（５－アセチルスルファモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８３２）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８３５）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモ

イル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８３６）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８３９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジメチル－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８４０）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ブチル－ベンジルアミド（実施例８４１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４２）、

２－［（Ｒ）－４－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４５）、

｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－オキソ－酢酸　エチルエステル（実施例８４６）、

４－クロロ－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－

（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例８４７）、

｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－オキソ－酢酸（実施例８４８）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－フェニル－シクロプロピルメチル）－アミド（実施例８４９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（２－メトキシ－１，１－ジメチル－エチル）－ベンジルアミド（実施例８５１）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－エチルアミド　３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド）（実施例８５２）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－ｔｅｒｔ－ブチルアミド　３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド）（実施例８５３）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジメチル－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８５４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ブチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８５５）、

ヒドロキシ－｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－酢酸　エチルエステル（実施例８５６）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－プロピル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例８５７）、

（R）－４－（４－メチル－５－メチルアミノオキサリル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８５９）、

２－［（R）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例８６２）、

２－［（R）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸（実施例８６３）、

（R）－１－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８６４）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　メチルアミド（実施例８６５）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例８６６）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－フェニル－アゼチジン－３－イルメチル）－アミド（実施例８６７）、

４－クロロ－２－［（R）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例８６８）、

（R）－４－（７－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１

－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８６９）、

（Ｒ）－４－（４－ヒドロキシメチル－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７０）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　イソプロピルアミド（実施例８７１）、

（Ｒ）－４－（８－シアノ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７２）、

（Ｒ）－１－（４－クロローベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７３）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸（実施例８７４）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　メチルアミド（実施例８７５）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　アミド（実施例８７６）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジ

ン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８７７）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８７８）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８７９）、

７－クロロ－２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例８８０）、

（Ｒ）－１－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８１）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１－メトキシメチル－シクロプロピル）－ベンジルアミド（実施例８８２）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルアミド（実施例８８３）、

（Ｒ）－１－（４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８４）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［５，４－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８５）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８６）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８７）、

（R）－4－（5，7－ジヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８８）、

4－クロロ－2－［（R）－3－［4－（1，1－ジメチル－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例８９０）、

2－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　エチルエステル（実施例８９１）、

2－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸（実施例８９２）、

（R）－4－（4－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８９３）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８９４）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８９５）、

（R）－4－（7－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1

－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８９６）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８９７）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンジルアミド（実施例８９８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３－フェニルーシクロプチルメチル）－アミド（実施例８９９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９００）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ナフタレン－２－イルメチル）－アミド（実施例９０１）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９０２）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９０３）、

（Ｒ）－４－（６－メチル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホ

ニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０４）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０５）、

（Ｒ）－４－（７－クロロ－４－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９０６)、

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９０７)、

（Ｒ）－４－（５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（４－メチル－２－プロピルーチアゾール－５－イルメチル）－アミド（実施例９０９）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１０）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９１１）、

（Ｒ）－４－（５－ブロモーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１２）、

（R）－4－（5－クロローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例９１３）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イルー1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例９１４）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　アミド（実施例９１５）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　メチルアミド（実施例９１６）、

（R）－4－（4－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１７）、

（R）－4－（5－クロローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１８）、

（R）－1－（4－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イルーピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１９）、

（R）－4－（7－メチル－5－オキソ－5H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２０）、

（R）－4－（5－メチルーチアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２１）、

（R）－4－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾ

ールー６－イルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２２）、

（Ｒ）－４－（６－オキソ－ピペリジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２３）、

（Ｒ）－４－（６－オキソ－１，６－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド　塩酸塩（実施例９２４）、

（Ｒ）－４－（５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２５）、

（Ｒ）－４－（５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９２６）、

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２７）、

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９２８）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９２９）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例９３０）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３１）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３２）、

（R）－4－（3－メチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３３）、

（R）－4－（7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９３４）、

（R）－4－（5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９３５）、

（R）－4－（4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３７）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（ジフルオロ－メトキシ－メチル）－ベンジルアミド（実施例９３８）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－メトキシメチル－ベンジルアミド(実施例９３９)、

（R）－4－（4－ヒドロキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－

イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４０）、

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４１）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４２）、

（Ｒ）－４－（５－アミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４３）、

（Ｒ）－４－（７－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４４）、

（Ｒ）－４－（５－ジメチルアミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４５）、

（Ｒ）－４－［５－（２－ヒドロキシ－エチルアミノ）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４６）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例９４８）、

（Ｒ）－４－（５－エチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４９）、

（Ｒ）－４－（５－エチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１

－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５０）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－（３－トリフルオロメチルー［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾールー６－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５１）、

（Ｒ）－４－（５－メチルアミノーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５２）、

（Ｒ）－４－［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５３）、

（Ｒ）－４－［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５４）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５５）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イルーピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５６）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５７）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボ

ン酸　4－（エチルーメチルーアミノ）ーベンジルアミド（実施例９５８）、

（R）－4－（5－クロローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオローエトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９５９）、

（R）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオローエトキシ）－ベンゼンスルホニル］－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６０）、

（R）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－4－（5－トリフルオロメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９６１)、

（R）－4－（7－アミノ－5－クロローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９６２)、

（R）－4－（5－クロロ－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６３）、

（R）－4－（5－シアノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６４）、

（R）－4－（5－クローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－メトキシーベンジルアミド（実施例９６５）、

（R）－4－（5－クローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－フルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６６）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－フルオ

ロメトキシーベンジルアミド（実施例９６７）、

（R）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６８）、

（R）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６９）、

（R）－４－（５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７０）、

（R）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例９７１）、

（R）－４－（５－フルオロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７２）、

（R）－４－（５－イソプロピルアミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９７３)、

（R）－４－（５－ブロモ－７－ジエチルアミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７４）、

（R）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７５）、

（R）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例９７６）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例977）、

（R）－4－（5－アセチル－4－メチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例978）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　アミド（実施例979）、

（R）－4－（1，3－ジメチル－1H－ピラゾロ［3，4－d］チアゾール－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例980)、

（R）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－4－（5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例981）、

（R）－4－（7－アミノ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例982)、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例983）、

（R）－4－（5－イソプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例984）、

（R）－4－（4－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例985）、

（R）－4－（3－メチル－4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，

3－ｃ］［1，2，4］トリアジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８６）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８７）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（インドリジン－2－イルメチル）－アミド（実施例９８９）、

7－オキソ－2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－5－カルボン酸　メチルアミド（実施例９９０）、

（R）－4－（5－イソプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９１）、

（R）－4－（5－シクロプロピルメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例９９２)、

（R）－4－（5－クロロ－2－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９３）、

（R）－4－［5－（3－ヒドロキシ－3－メチル－ブター1－イニル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９４）、

（R）－4－（5－エチニル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カル

ボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９９５）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ペンタフルオロスルファニルーベンジルアミド（実施例９９６）、

（Ｒ）－４－（５－クロローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオローベンジルアミド(実施例９９７)、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオローベンジルアミド（実施例９９８）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９９９）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例１０００)、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１００１）、

（Ｒ）－４－［４－（２－ヒドロキシーエチルアミノ）－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１００２）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－５－トリフルオロメチル－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１００３）、

（Ｒ）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン

－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００４）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００５）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００６）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例１００７）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例１００８)、

（Ｒ）－４－（４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００９）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１０）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１１）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピルメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例１０１２)、

２－［（Ｒ）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チ

アゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　アミド（実施例１０１３）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１４）、

（R）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－4－（5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１５）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１６）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１７）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１８）、

（R）－4－（5－メチル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１９）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２０）、

（R）－4－（7－アミノ－5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実

施例１０２１）、

（Ｒ）－４－（７－メトキシ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２２）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２３）、

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例１０２４)、

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２５）、

（Ｒ）－４－（６－クロロ－５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２６）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２７）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２８）、

５－メチル－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－カルボン酸　アミド（実施

例１０２９）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３０）、

（Ｒ）－４－（４－オキソ－３－トリフルオロメチル－４Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［２，３－ｃ］［１，２，４］トリアジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３１）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３２）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸（実施例１０３３）、

（Ｒ）－４－（４－アミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３４）、

（Ｒ）－４－（４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３５）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３６）、

（Ｒ）－４－（５－エチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニ

ル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３７）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－７－トリフルオロメチル－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３８）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３９）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０４０）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例１０４１）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０４２）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０４３）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０４４）、

（R）－4－（5－シクロプロピルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシー2－フルオローベンジルアミド（実施例１０４５）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　メチルアミド（実施例１０４６）、

（R）－4－［5－（1－ヒドロキシー1－メチルーエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４７）、

（R）－4－（5－アセチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４８）、

（R）－4－（7－オキソ－5－トリフルオロメチルー7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４９）、

（R）－4－（5－メトキシーチアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５０）、

（R）－4－（5－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオローエトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５１）、

（R）－4－（5－ヒドロキシメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５２）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５３）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　メトキシーメチルーアミド（実施例１０５４）、

（R）－4－（7－アミノ－5－メトキシメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５５）、

（R）－4－（5－ピロリジン－1－イルメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５６）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５７）、

（R）－1－（4－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５８）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５９）、

（R）－4－［5－（1－ヒドロキシーエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミ

ジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６０）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０６１）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６２）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸　エチルエステル（実施例１０６４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸（実施例１０６５）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－５－トリフルオロメチル－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６６）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－５－トリフルオロメチル－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６７）、

（R）－4－（7－オキソ－5－トリフルオロメチル－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６８）、

（R）－4－（5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６９）、

（R）－4－［5－（2－メトキシ－エチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７０）、

（R）－4－［5－（2－メトキシ－エチル）－4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７１）、

（R）－4－（5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７２）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－3－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０７３）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－3－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０７４）、

（R）－4－［5－（1－ヒドロキシ－1－メチル－エチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミ

ド（実施例１０７５）、

（R）－４－［５－（１－メトキシメチル－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７６）、

（R）－４－［５－（１－ヒドロキシメチル－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７７）、

（R）－４－［５－（２－ヒドロキシ－エチル）－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７８）、

（R）－４－［５－（１－メトキシ－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７９）、

（R）－４－［５－（１－ヒドロキシ－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０８０）、

２－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－６－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例１０８１）、

２－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－６－カルボン酸（実施例１０８２）、

２－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，

４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸　エチルエステル（実施例１０８３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸（実施例１０８４）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオローベンジルアミド（実施例１０８５）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０８６）、

（Ｒ）－４－（５－ジフルオロメトキシーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例１０８７)、

（Ｒ）－４－（５－イソプロピル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０８８）、

（Ｒ）－４－（５－イソプロピル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０８９）、

（Ｒ）－４－（７－アミノ－５－シクロプロピルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０９０）、

（Ｒ）－４－［７－アミノ－５－（１－ヒドロキシ－１－メチルーエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシー

ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９１）、

ヒドロキシ－｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－酢酸（実施例１０９２）、

４－クロロ－２－［（Ｒ）－３－［４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例１０９３）、

｛５－メチル－３－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピラゾール－１－イル｝－酢酸（実施例１０９４）、

［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－イルメチル］－トリエチル－アンモニウムトリフルオロ－メタンスルホン酸塩（実施例１０９５）、

（Ｒ）－４－［５－（２－ヒドロキシ－エチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９８）、

（Ｒ）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９９）、

（Ｒ）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１００）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０１）、

（R）－4－（5－シクロプロピルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3－フルオロ－4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１１０２）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－7－カルボン酸（実施例１１０４）、

（R）－4－（5－ヒドロキシメチル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１１０５）、

｛4－オキソ－2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－4H－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－5－イル｝－酢酸（実施例１１０６）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１１０７）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１１０８）、

2－［（R）－3－（4－ジフルオロメトキシ－3－フルオローベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－7－カルボン酸（実施例１１０９）、

（R）－4－（5－シクロプロピルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（2－フルオロ－4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施

例１１１０）、

（Ｒ）－３－（４－ジフルオロメトキシ－３－フルオローベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例１１１１）、

３－｛４－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－５－イル｝プロピオン酸（実施例１１１２）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオローベンジルアミド（実施例１１１３）、及び、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオローベンジルアミド（実施例１１１４）

からなる群より選ばれる［１８］記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物。

［３３］　［１５］乃至［３２］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含有する医薬組成物。

［３４］　［１５］乃至［３２］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含有する抗ウイルス剤。

［３５］　［１５］乃至［３２］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物を有効成分として含有するＣ型肝炎治療剤。

［３６］　（ａ）［１４］に記載のＨＣＶポリメラーゼ阻害剤と、（ｂ）他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも１つの薬剤とを組み合わせてなるＣ型肝炎治療剤。

［３７］　（ａ）［１４］に記載のＨＣＶポリメラーゼ阻害剤と、（ｂ）インター

フェロンとを組み合わせてなるＣ型肝炎治療剤。

［３８］　（ａ）［１５］乃至［３２］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び（ｂ）他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも１つの薬剤を含有する医薬組成物。

［３９］　（ａ）［１５］乃至［３２］のいずれかに記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び（ｂ）インターフェロンを含有する医薬組成物。

［４０］　抗ＨＣＶ剤を製造するための［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物の使用。

［４１］　ＨＣＶポリメラーゼ阻害剤を製造するための［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物の使用。

［４２］　Ｃ型肝炎治療剤を製造するための、（ａ）［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び（ｂ）他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも１つの薬剤の使用。

［４３］　Ｃ型肝炎治療剤を製造するための、（ａ）［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び（ｂ）インターフェロンの使用。

［４４］　有効量の［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物を哺乳動物に投与することを含む、哺乳動物におけるＣ型肝炎の治療方法。

［４５］　有効量の、他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも１つの薬剤を該哺乳動物に投与することをさらに含む、［４４］記載の方法。

［４６］　有効量のインターフェロンを該哺乳動物に投与することをさらに含む、［４４］記載の方法。

［４７］　有効量の［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物を哺乳動物に投与することを含む、哺乳動物におけるＨＣＶポリメラーゼの阻害方法。

［４８］　有効量の、他の抗ウイルス剤、抗炎症剤及び免疫増強剤からなる群より選ばれる少なくとも１つの薬剤を該哺乳動物に投与することをさらに含む、［４７］記載の方法。

［４９］　有効量のインターフェロンを該哺乳動物に投与することをさらに含む、［４７］記載の方法。

［５０］　［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含有するＣ型肝炎治療用医薬組成物。

［５１］　［１］記載の一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含有するＨＣＶポリメラーゼ阻害用医薬組成物。

本明細書において使用する各置換基及び各部位の定義は、次の通りである。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である。

環Ａ、環Ｂ上の置換基（グループＡ）として好ましくは、フッ素原子であり、「グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基」のグループＢとして好ましくは、フッ素原子である。

「C_{3-12}炭素環基」とは、炭素数３乃至１２の飽和若しくは不飽和の環状炭化水素基であり、具体的には、C_{6-12}アリール基、C_{3-10}シクロアルキル基、C_{3-10}シクロアルケニル基、或いはそれらを構成する環の２つ以上が縮合した縮合炭素環基等を意味する。

「C_{6-12}アリール基」とは、炭素数６乃至１２のアリール基であり、例えば、フェニル基、ナフチル基（例、ナフタレン－２－イル等）、アズレニル基、ペンタレニル基等が挙げられる。

「C_{3-10}シクロアルキル基」とは、炭素数３乃至１０個のシクロアルキル基であり、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基等、及び、アダマンチル基（例、アダマンタン－１－イル等）、ノルボルニル基（例、ノルボルナン－２－イル）等の架橋式炭素環が挙げられる。好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、及び、シクロオクチル基

であり、より好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、及び、シクロヘキシル基であり、更に好ましくは、シクロプロピル基、及び、シクロブチル基、最も好ましくは、シクロプロピル基である。

「C_{3-10}シクロアルケニル基」とは、炭素数３乃至１０個のシクロアルケニル基であり、少なくとも１個、好ましくは１又は２個の二重結合を含む。例えば、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘキサジエニル基（２，４－シクロヘキサジエン－１－イル基、２，５－シクロヘキサジエン－１－イル基等）、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基等が挙げられる。

これら「C_{6-12}アリール基」、「C_{3-10}シクロアルキル基」、「C_{3-10}シクロアルケニル基」を構成する環の２つ以上が縮合した縮合炭素環基としては、例えば、インデニル基、インダニル基（例、インダン－５－イル等）、フルオレニル基、ジヒドロナフチル基、テトラヒドロナフチル基（例、１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－２－イル、５，６，７，８－テトラヒドロナフタレン－２－イル等）、ペルヒドロナフチル基、テトラヒドロベンゾシクロヘプテニル基（例、６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゾシクロヘプテニル等）等が挙げられる。

「ヘテロ環基」とは、環を構成する原子として、炭素原子の他に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる１乃至６個（好ましくは１乃至４個）のヘテロ原子を有し、環を構成する原子の数が３乃至１４であり、飽和環及び不飽和環、単環及び縮合環を含む。

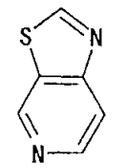
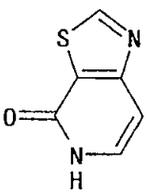
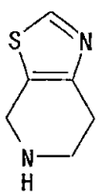
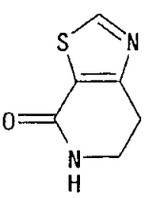
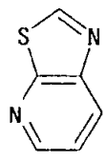
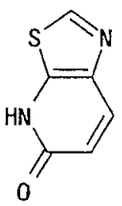
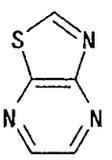
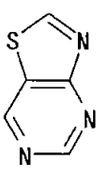
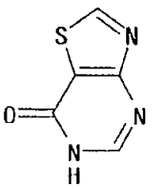
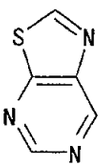
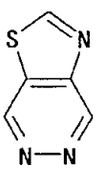
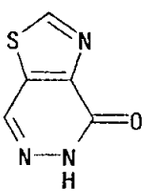
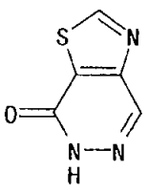
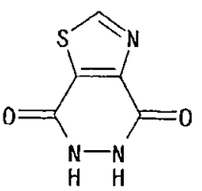
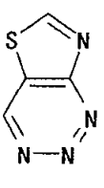
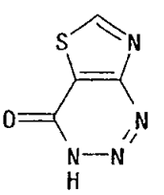
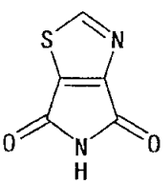
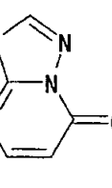
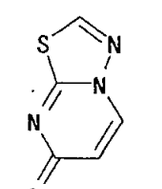
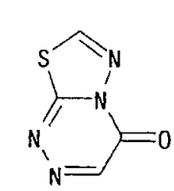
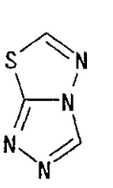
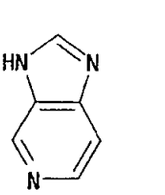
「単環であるヘテロ環基」として具体的には、ピリジル基（例、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル、ピリジン－４－イル）、ピラジニル基（例、ピラジン－２－イル等）、ピリミジニル基（例、ピリミジン－２－イル、ピリミジン－４－イル、ピリミジン－５－イル等）、ピリダジニル基（例、ピリダジン－３－イル等）、トリアジニル基、ピロリル基、ピラゾリル基（例、ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－３－イル、２Ｈ－ピラゾール－３－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル等）、イミダゾリル基（例、イミダゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－２－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル等）、トリアゾリル基（例、１，２，４－トリアゾール－３－イル、１，２，４－トリアゾール－１－イル、１，２，４－ト

リアゾール－４－イル、１，２，３－トリアゾール－１－イル、１，２，３－トリアゾール－２－イル、１，３，４－トリアゾール－１－イル等）、テトラゾリル基（例、テトラゾール－１－イル、テトラゾール－２－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル等）、チエニル基（例、チオフェン－２－イル、チオフェン－３－イル等）、フリル基（例、フラン－３－イル等）、オキサゾリル基（例、オキサゾール－２－イル等）、イソオキサゾリル基（例、イソオキサゾール－５－イル、イソオキサゾール－３－イル等）、チアゾリル基（例、チアゾール－２－イル、チアゾール－４－イル、チアゾール－５－イル等）、イソチアゾリル基（例、イソチアゾール－５－イル、イソチアゾール－３－イル等）、チアジアゾリル基（例、１，３，４－チアジアゾール－２－イル、１，２，３－チアジアゾール－４－イル、１，２，４－チアジアゾール－３－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル等）、オキサジアゾリル基（例、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル等）、２－オキソ－１，２－ジヒドロピリジル基（例、２－オキソ－１，２－ジヒドロピリジン－４－イル、２－オキソ－１，２－ジヒドロピリジン－３－イル、６－オキソ－１，６－ジヒドロピリジン－３－イル等）、１，２，３，６－テトラヒドロピリジル基（例、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル等）、ピロリニル基（例、２－ピロリン－１－イル基、３－ピロリン－３－イル等）、オキソピロリニル基（例、２－オキソ－３－ピロリン－１－イル、２－オキソ－３－ピロリン－３－イル等）、ジオキソピロリニル基（例、２，５－ジオキソ－３－ピロリン－３－イル等）、イミダゾリニル基（例、２－イミダゾリン－２－イル等）、チアゾリニル基（例、２－チアゾリン－２－イル等）、オキソチアゾリニル基（例、４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾール－２－イル等）、オキサゾリニル基（例、２－オキサゾリン－２－イル等）、アゼチジニル基（例、アゼチジン－１－イル、アゼチジン－３－イル等）、ピロリジニル基（例、ピロリジン－１－イル等）、オキソピロリジニル基（例、２－オキソピロリジン－１－イル、２－オキソピロリジン－３－イル等）、ジオキソピロリジニル基（例、２，５－ジオキソピロリジン－３－イル等）、オキソチアジアゾリニル基（例、５－オキソ－４，５－ジヒドロ－１，３，４－チアジアゾール－２－イル等）、オキソオキサジアゾリニル基（例、５－オキソ－２，５－ジヒドロ－１，２，４－オキサジアゾー

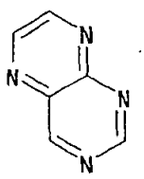
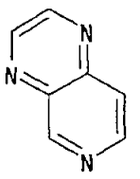
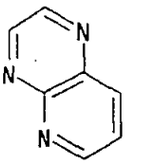
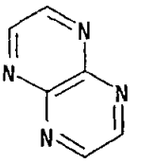
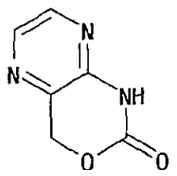
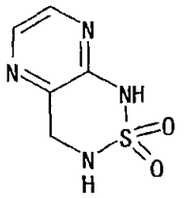
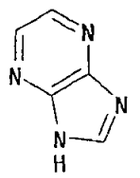
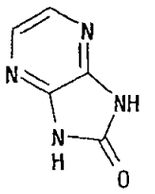
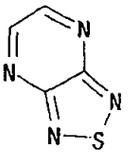
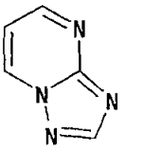
ルー３－イル等）、イミダゾリジニル基、ピペリジニル基（例、ピペリジン－１－イル、ピペリジン－４－イル等）、オキソピペリジニル基（例、６－オキソピペリジン－３－イル基）、ピペラジニル基（例、ピペラジン－１－イル等）、モルホリニル基（例、モルホリン－４－イル等）、チオモルホリニル基、テトラヒドロピラニル基等が挙げられる。

また、「縮合環であるヘテロ環基」として具体的には、キノリル基、イソキノリル基、キナゾリニル基、キノキサリル基（例、キノキサリン－２－イル、キノキサリン－６－イル等）、フタラジニル基、シンノリニル基、ナフチリジニル基（例、１，５－ナフチリジン－２－イル、１，６－ナフチリジン－２－イル等）、インドリル基（例、１Ｈ－インドール－３－イル等）、ベンズイミダゾリル基（例、１Ｈ－ベンズイミダゾール－２－イル等）、インドリニル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基（例、ベンゾチオフェン－２－イル等）、ベンズオキサゾリル基（例、ベンズオキサゾール－２－イル等）、ベンゾジオキシニル基、ベンゾチアゾリル基（例、ベンゾチアゾール－２－イル等）、テトラヒドロキノリル基（例、１，２，３，４－テトラヒドロキノリン－７－イル等）、ジヒドロベンゾフラニル基（例、２，３－ジヒドロベンゾフラン－５－イル等）、ジヒドロベンゾチエニル基、ジヒドロベンゾジオキシニル基（例、２，３－ジヒドロベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル等）、インデノチアゾリル基（例、８Ｈ－インデノ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル等）、テトラヒドロベンゾチアゾリル基（例、４，５，６，７－テトラヒドロベンゾチアゾール－２－イル等）、インドリジニル基（例、インドリジン－２－イル等）等が挙げられる。

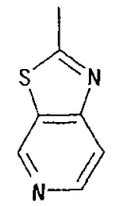
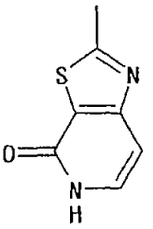
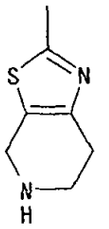
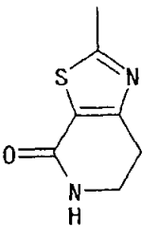
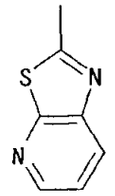
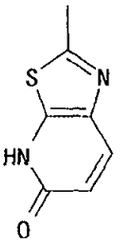
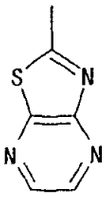
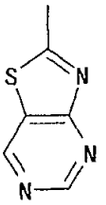
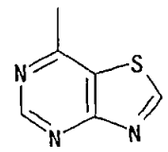
また、「縮合環であるヘテロ環基」には、以下の式で表される縮合ヘテロ環の炭素原子又は窒素原子を介して結合する基も含まれる。

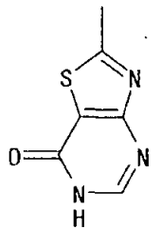
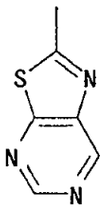
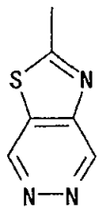
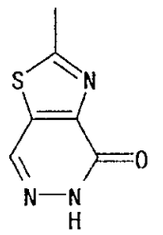
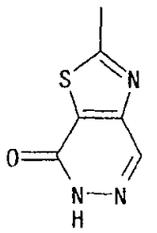
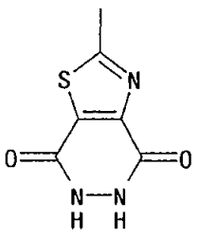
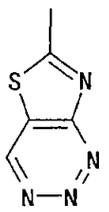
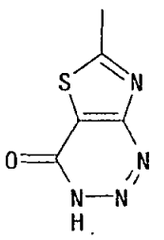
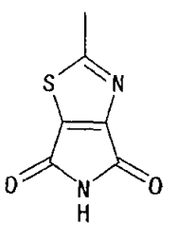
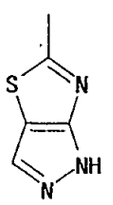
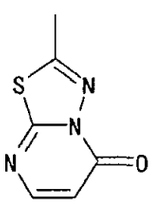
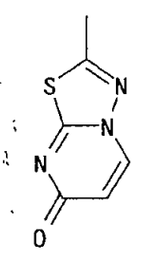
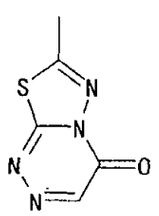
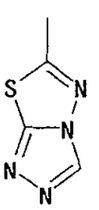
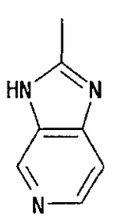
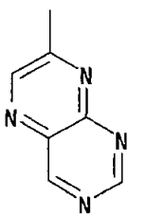
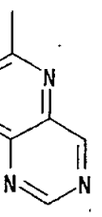
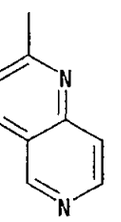
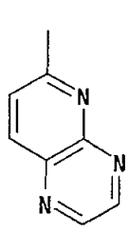
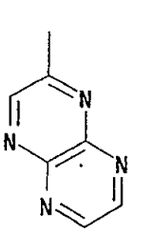
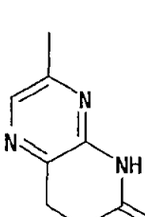
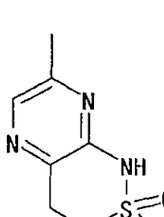


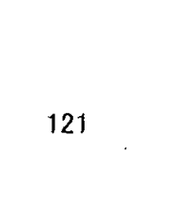











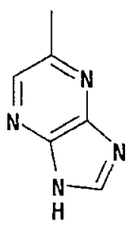
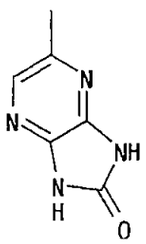
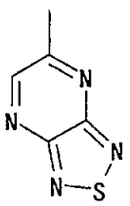
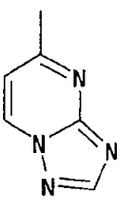
例えば、

5



等が挙げられる。

「縮合環であるヘテロ環基」として好ましくは、二縮合環であり、中でも単環であるヘテロ環と単環であるヘテロ環どうしの縮合環が好ましい。

「C_{1-10}アルキル基」とは、炭素数１乃至１０の直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ｓｅｃ－ブチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ｔｅｒｔ－ペンチル基、１－エチルプロピル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、１－プロピルブチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基等が挙げられる。好ましくは炭素数１乃至６のアルキル基であり、より好ましくは炭素数１乃至４のアルキル基である。

「C_{1-4}アルキル基」とは、炭素数１乃至４の直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ｓｅｃ－ブチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基が挙げられる。

「C_{2-10}アルキニル基」とは、炭素数２乃至１０の直鎖又は分岐鎖アルキニル基であり、例えば、エチニル基、１－プロピニル基、２－プロピニル基、１－ブチニル基、２－ブチニル基、３－ブチニル基、１－ペンチニル基、１－ヘキシニル基、１－ヘプチニル基、１－オクチニル基、３－メチルブター１－イン－１－イル基等が挙げられる。好ましくは炭素数２乃至６のアルキニル基であり、より好ましくは炭素数２乃至４のアルキニル基である。

「C_{1-4}アルキレン」とは、炭素数１乃至４の直鎖又は分岐鎖アルキレンであり、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、$-CH(CH_3)-$、$-C(CH_3)_2-$、$-CH(CH_3)-CH_2-$、$-CH_2-CH(CH_3)-$、$-C(CH_3)_2-CH_2-$、$-CH_2-C(CH_3)_2-$、$-CH(CH_3)-(CH_2)_2-$、$-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$、$-(CH_2)_2-CH(CH_3)-$等

が挙げられる。

「ハロゲノC_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{1-4}アルキル基」が上記定義の「ハロゲン原子」で置換されたものであり、例えば、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ブロモメチル基、クロロメチル基、1，2－ジクロロエチル基、2，2－ジクロロエチル基、2，2，2－トリフルオロエチル基等が挙げられる。

「ヒドロキシC_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{1-4}アルキル基」がヒドロキシ基で置換されたものであり、例えば、ヒドロキシメチル基、1－ヒドロキシエチル基、2－ヒドロキシエチル基、3－ヒドロキシプロピル基、4－ヒドロキシブチル基等が挙げられる。

「カルボキシC_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{1-4}アルキル基」がカルボキシ基で置換されたものであり、例えば、カルボキシメチル基、1－カルボキシエチル基、2－カルボキシエチル基、3－カルボキシプロピル基、4－カルボキシブチル基等が挙げられる。

「C_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であり、アリール部位が上記定義の「C_{6-12}アリール基」であるアリール－アルキル基であり、例えば、ベンジル基、1－フェニルエチル基、2－フェニルエチル基、3－フェニルプロピル基、2－フェニルプロピル基、4－フェニルブチル基等が挙げられる。

「ヘテロ環－C_{1-4}アルキル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であり、ヘテロ環部分が上記定義の「ヘテロ環基」であるヘテロ環－アルキル基であり、例えば、ピロリジニルメチル基（例、ピロリジン－1－イルメチル等）、ピペリジニルメチル基（例、ピペリジン－1－イルメチル、ピペリジン－4－イルメチル等）、ピペラジニルメチル基（例、ピペラジン－1－イルメチル等）、モルホリニルメチル基（例、モルホリン－4－イルメチル等）、チオモルホリニルメチル基等が挙げられる。

「C_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であり、シクロアルキル部位が上記定義の「C_{3-10}シクロアルキル基」であるシクロアルキル－アルキル基であり、例えば、シクロプロピ

ルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、２－シクロプロピルエチル基等が挙げられる。

「C_{1-4}アルコキシ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であるアルキル－オキシ基であり、例えば、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、ｔｅｒｔ－ブトキシ基等が挙げられる。

「C_{1-4}アルキルアミノ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であるアルキル－アミノ基であり、例えば、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、ｓｅｃ－ブチルアミノ基、ｔｅｒｔ－ブチルアミノ基等である。

「ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であるジアルキル－アミノ基であり、例えば、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジイソブチルアミノ基、ジ－ｓｅｃ－ブチルアミノ基、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルアミノ基、Ｎ－ブチル－Ｎ－メチルアミノ基等が挙げられる。

「C_{1-4}アルコキシ－カルボニル基」とは、そのアルコキシ部位が上記定義の「C_{1-4}アルコキシ基」であるアルコキシ－カルボニル基であり、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブチルオキシカルボニル基、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基等が挙げられる。

「C_{1-4}アルキルアミノ－カルボニル基」とは、そのアルキルアミノ部位が上記定義の「C_{1-4}アルキルアミノ基」であるアルキルアミノ－カルボニル基であり、例えば、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、プロピルアミノカルボニル基、イソプロピルアミノカルボニル基、ブチルアミノカルボニル基、イソブチルアミノカルボニル基、ｓｅｃ－ブチルアミノカルボニル基、ｔｅｒｔ－ブチルアミノカルボニル基等が挙げられる。

「ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ－カルボニル基」とは、そのジアルキルアミノ部位が上記定義の「ジ（C_{1-4}アルキル）アミノ基」であるジアルキルアミノ－カル

ボニル基であり、例えば、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ジプロピルアミノカルボニル基、ジイソプロピルアミノカルボニル基、ジブチルアミノカルボニル基、ジイソブチルアミノカルボニル基、ジーｓｅｃーブチルアミノカルボニル基、ジーｔｅｒｔーブチルアミノカルボニル基、Ｎーエチルー
5 Ｎーメチルアミノカルボニル基、Ｎーメチルー Ｎープロピルアミノカルボニル基、Ｎーブチルー Ｎーメチルアミノカルボニル基等が挙げられる。

「ヘテロ環ーカルボニル基」とは、そのヘテロ環部位が上記定義の「ヘテロ環基」を構成する環であるヘテロ環ーカルボニル基であり、例えば、ピロリジニルカルボニル基（例、ピロリジンー１ーイルカルボニル等）、ピペリジニルカルボニル基（例、
10 ピペリジンー１ーイルカルボニル等）、モルホリニルカルボニル基（例、モルホリンー４ーカルボニル等）が挙げられる。

「トリ（C_{1-4}アルキル）アンモニウミル基」とは、そのアルキル部位が上記定義の「C_{1-4}アルキル基」であるトリアルキルーアンモニウミル基（トリアルキルーアンモニオ基）であり、例えば、トリメチルアンモニウミル基、トリエチルアン
15 モニウミル基、トリプロピルアンモニウミル基、トリブチルアンモニウミル基等が挙げられる。

「C_{1-4}アルコキシC_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{1-4}アルキル基」が上記定義の「C_{1-4}アルコキシ基」で置換されたものであり、例えば、メトキシメチル基、１ーメトキシシエチル基、２ーメトキシエチル基、３ーメトキシプロピル
20 基、４ーメトキシブチル基、エトキシメチル基、２ーエトキシエチル基等が挙げられる。

「カルボキシC_{1-4}アルコキシ基」とは、上記定義の「C_{1-4}アルコキシ基」がカルボキシ基で置換されたものであり、例えば、カルボキシメトキシ基、１ーカルボキシエトキシ基、２ーカルボキシエトキシ基、３ーカルボキシプロポキシ基、４ー
25 カルボキシブトキシ基等が挙げられる。

「グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基」とは、上記定義の「C_{3-12}炭素環基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{3-12}炭素環基を含む。該置換基は、グループＡから選ばれる。

具体的には、フェニル基、４－メチルフェニル基、４－エチルフェニル基、４－プロピルフェニル基、４－イソプロピルフェニル基、４－ブチルフェニル基、４－イソブチルフェニル基、４－ｔｅｒｔ－ブチルフェニル基、４－ｔｅｒｔ－ペンチルフェニル基、４－ネオペンチルフェニル基、４－（１－エチルプロピル）フェニル基、４－（１－プロピルブチル）フェニル基、２－トリフルオロメチルフェニル基、３－トリフルオロメチルフェニル基、４－トリフルオロメチルフェニル基、４－（１，１－ジフルオロエチル）フェニル基、４－（１，１－ジフルオロプロピル）フェニル基、４－ペンタフルオロエチルフェニル基、４－（１－シアノ－１－メチルエチル）フェニル基、４－（ヒドロキシメチル）フェニル基、４－（２－ヒドロキシエチル）フェニル基、４－（３－ヒドロキシプロピル）フェニル基、４－（２－ヒドロキシ－１，１－ジメチルエチル）フェニル基、４－（メトキシメチル）フェニル基、４－（２－メトキシ－１，１－ジメチルエチル）フェニル基、４－［ジフルオロ（メトキシ）メチル］フェニル基、４－（２－メトキシカルボニルエチル）フェニル基、４－（１－メトキシカルボニル－１－メチルエチル）フェニル基、４－（１－カルボキシ－１－メチルエチル）フェニル基、４－（１－ジメチルカルバモイル－１－メチルエチル）フェニル基、２－フルオロフェニル基、３－フルオロフェニル基、４－フルオロフェニル基、２－クロロフェニル基、３－クロロフェニル基、４－クロロフェニル基、３－ブロモフェニル基、４－ブロモフェニル基、４－ヨードフェニル基、４－ニトロフェニル基、４－シアノフェニル基、２－ヒドロキシフェニル基、３－ヒドロキシフェニル基、４－ヒドロキシフェニル基、２－メトキシフェニル基、３－メトキシフェニル基、４－メトキシフェニル基、４－エトキシフェニル基、４－プロポキシフェニル基、４－イソプロポキシフェニル基、４－フルオロメトキシフェニル基、４－ジフルオロメトキシフェニル基、３－トリフルオロメトキシフェニル基、４－トリフルオロメトキシフェニル基、４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェニル基、４－（１，１，２，２－テトラフルオロエトキシ）フェニル基、３－カルボキシメトキシフェニル基、４－カルボキシメトキシフェニル基、４－メトキシカルボニルメトキシフェニル基、４－（２－メトキシカルボニルエトキシ）フェニル基、４－フェノキシフェニル基、３－エトキシカルボニルメトキシフェニル基、４－エトキシカルボニルメトキシフェニル基、２－

ベンジルオキシフェニル基、４－メチルスルファニルフェニル基、４－トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、４－（４－クロロフェノキシ）フェニル基、４－（ピリジン－３－イルオキシ）フェニル基、４－アミノフェニル基、２－ジメチルアミノフェニル基、３－ジメチルアミノフェニル基、４－ジメチルアミノフェニル基、４－ジエチルアミノフェニル基、４－（Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ）フェニル基、４－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルアミノ）フェニル基、４－［Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ］フェニル基、４－（Ｎ－カルボキシメチル－Ｎ－メチルアミノ）フェニル基、４－（Ｎ－エトキシカルボニルメチル－Ｎ－メチルアミノ）フェニル基、４－アセチルアミノフェニル基、４－（２，２－ジメチルプロピオニルアミノ）フェニル基、２－カルボキシフェニル基、３－カルボキシフェニル基、４－カルボキシフェニル基、２－メトキシカルボニルフェニル基、４－メトキシカルボニルフェニル基、２－ベンジルオキシカルボニルフェニル基、４－スルファモイルフェニル基、４－アセチルフェニル基、４－ペンタフルオロスルファニルフェニル基、４－シクロプロピルフェニル基、４－シクロヘキシルフェニル基、４－（１－ヒドロキシメチルシクロプロピル）フェニル基、４－（１－メトキシメチルシクロプロピル）フェニル基、４－（４－カルボキシメチルシクロヘキシル）フェニル基、４－シクロペンチルフェニル基、ビフェニル－２－イル基、ビフェニル－３－イル基、ビフェニル－４－イル基、２’－クロロビフェニル－４－イル基、３’－クロロビフェニル－４－イル基、４’－クロロビフェニル－４－イル基、２’－ヒドロキシビフェニル－４－イル基、３’－ヒドロキシビフェニル－４－イル基、２’－カルボキシメトキシビフェニル－４－イル基、３’－カルボキシメトキシビフェニル－４－イル基、３’－カルボキシビフェニル－４－イル基、４－（アゼチジン－１－イル）フェニル基、４－シクロプロピルメチルフェニル基、４－（ピロリジン－１－イル）フェニル基、４－（２－オキソピロリジン－１－イル）フェニル基、４－（ピペリジン－１－イル）フェニル基、４－（モルホリン－４－イル）フェニル基、４－（４－メチルピペラジン－１－イル）フェニル基、４－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）フェニル基、４－（フラン－３－イル）フェニル基、４－（１，２，３－チアジアゾール－４－イル）フェニル基、４－（チオフェン－２－イル）フェニル基、４－（５－オキソ－２，５－ジヒドロ

－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）フェニル基、４－エチル－２－メチルフェニル基、２－メチル－４－プロピルフェニル基、４－イソプロピル－２－メチルフェニル基、４－シクロプロピル－２－メチルフェニル基、３，４－ジクロロフェニル基、２，４－ジクロロフェニル基、３，５－ジクロロフェニル基、４－ブロモ－２－クロロフェニル基、２－クロロ－４－プロピルフェニル基、２－フルオロ－４－イソプロピルフェニル基、２，４－ジメトキシフェニル基、３，４－ジメトキシフェニル基、４－ブロモ－２－フルオロフェニル基、４－ブロモ－３－フルオロフェニル基、３－エチル－４－メトキシフェニル基、３－イソプロピル－４－メトキシフェニル基、３－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェニル基、３－クロロ－４－メトキシフェニル基、２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－ヨード－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－プロピル－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－（２－カルボキシエチル）－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－（３－カルボキシプロピル）－４－トリフルオロメトキシフェニル基、３－カルボキシ－４－メトキシフェニル基、３－カルボキシ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、４－メトキシ－３－メトキシカルボニルフェニル基、４－メトキシ－３－メトキシカルボニルメチルフェニル基、４－メトキシ－３－（２－メトキシカルボニルエチル）フェニル基、３－カルボキシメチル－４－メトキシフェニル基、３－（２－カルボキシエチル）－４－メトキシフェニル基、３－シアノ－４－メトキシフェニル基、３－シクロペンチル－４－メトキシフェニル基、４－メトキシ－３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）フェニル基、３－ヒドロキシ－４－プロピルフェニル基、３－アミノ－４－プロピルフェニル基、３－ヒドロキシ－４－メトキシフェニル基、４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロフェニル基、４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロフェニル基、４－カルボキシ－３－フルオロフェニル基、２－（４－シアノフェノキシ）－３，５－ジメチルフェニル基、２，４，６－トリクロロフェニル基、２，３，５，６－テトラフルオロ－４－トリフルオロメチルフェニル基、シクロヘキシル基、１－ヒドロキシシクロヘキシル基、４－カルボキシシクロヘキシル基、２－フェニルシクロプロピル基、３－フェニルシクロブチル基、アダマンタン－１－イル基、インダン－５－イル基、５，６，７，８－テトラヒド

ロナフタレン－２－イル基、６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゾシクロヘプテン－２－イル基、７－カルボキシメチル－６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゾシクロヘプテン－２－イル基、ナフタレン－２－イル基等が挙げられる。

「グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基はグループＡから選ばれる。

具体的には、ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基、６－プロピルピリジン－３－イル基、６－イソプロピルピリジン－３－イル基、６－トリフルオロメチルピリジン－３－イル基、６－ジメチルアミノピリジン－３－イル基、６－（アゼチジン－１－イル）ピリジン－３－イル基、６－（ピロリジン－１－イル）ピリジン－３－イル基、６－（モルホリン－４－イル）ピリジン－３－イル基、５－ブロモ－６－クロロピリジン－３－イル基、６－メトキシ－５－メチルピリジン－２－イル基、２－オキソ－１－プロピル－１，２－ジヒドロピリジン－４－イル基、２－オキソ－６－プロピル－１，２－ジヒドロピリジン－３－イル基、１－プロピル－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル基、５－メチルピラジン－２－イル基、１Ｈ－インドール－３－イル基、１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル基、１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、５－フェニルチオフェン－２－イル基、５－（ピリジン－２－イル）チオフェン－２－イル基、２，２’－ビチオフェニル－５－イル基、４－メチル－２－プロピルチアゾール－５－イル基、２－（チオフェン－２－イル）チアゾール－４－イル基、１－フェニルアゼチジン－３－イル基、ピペリジン－１－イル基、ピペリジン－４－イル基、１－プロピルピペリジン－４－イル基、１－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピペリジン－４－イル基、１－アセチルピペリジン－４－イル基、モルホリン－４－イル基、ベンゾオキサゾール－２－イル基、インドリジン－２－イル基、５－エチルチオフェン－２－イル基、５－プロピルチオフェン－２－イル基、５－イソプロピルチオフェン－２－イル基、５－トリフルオロメチルチオフェン－２－イル基、５－クロロチオフェン－２－イル基、５－ブロモチオフェン－２－イル基、５－カルボキシメチルチオフェン－２－イル基、５－（２－カルボキシエチル）チオフェン－

２－イル基、５－ベンゼンスルホニルチオフェン－２－イル基、５－（４－クロロフェニル）チオフェン－２－イル基、５－（５－トリフルオロメチルイソオキサゾール－３－イル）チオフェン－２－イル基、５－（４－クロロピラゾール－１－イル）チオフェン－２－イル基、２，３－ジヒドロベンゾフラン－５－イル基、ベンゾチオフェン－２－イル基、２，２，３，３－テトラフルオロ－２，３－ジヒドロ－ベンゾ［１，４］ジオキシン－６－イル基、１－メチル－１，２，３，４－テトラヒドロキノリン－７－イル基、２－プロピルチアゾール－５－イル基、４－メチルチアゾール－２－イル基、４－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、４－カルボキシメチルチアゾール－２－イル基、４－メトキシカルボニルメチルチアゾール－２－イル基、４－（２－カルボキシエチル）チアゾール－２－イル基、４－カルボキシチアゾール－２－イル基、５－カルボキシチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、４－エトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、４－フェニルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシ－４－メチルチアゾール－２－イル基、４－カルボキシ－５－メチルチアゾール－２－イル基、４－エチル－５－カルボキシチアゾール－２－イル基、５－カルボキシ－４－トリフルオロメチルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－エトキシカルボニル－４－トリフルオロメチルチアゾール－２－イル基、５－メチルアミノメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－ジメチルアミノメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－メチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－ジメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（２－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（２－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（（Ｒ）－１－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５

－（（Ｓ）－１－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシ－４－メトキシメチルチアゾール－２－イル基、５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（２－カルボキシエチル）－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（カルボキシ）（ヒドロキシ）メチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－（エトキシカルボニル）（ヒドロキシ）メチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－シアノ－４－メチルチアゾール－２－イル基、４－メチル－５－スルファモイルチアゾール－２－イル基、４－メチル－５－メチルスルファモイルチアゾール－２－イル基、５－ジメチルスルファモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－アセチルスルファモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－アセチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－エトキシカルボニルカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、５－メチルカルバモイルカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、４－メチル－５－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）チアゾール－２－イル基、４－メチル－５－（ピロリジン－１－イルメチル）チアゾール－２－イル基、４，５－ビス（ヒドロキシメチル）チアゾール－２－イル基、４－カルボキシ－５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシ－４－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、４－カルボキシ－５－メトキシメチルチアゾール－２－イル基、５－カルボキシ－４－クロロチアゾール－２－イル基、４－アミノ－５－エトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、ピラジン－２－イル基、５－シアノピラジン－２－イル基、５－ヒドロキシメチルピラジン－２－イル基、５－ジメチルアミノメチルピラジン－２－イル基、５－（トリエチルアンモニウミルメチル）ピラジン－２－イル基、５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、５－アミノピラジン－２－イル基、５－メタンスルホニルアミノピラジン－２－イル基、５－カルボキシピラジン－２－イル基、５－カルバモイルピラジン－２－イル基、５－エチルカルバモイルピラジン－２－イル基、５－ｔｅｒｔ－ブチルカルバモイルピラジン－２－イル基、５－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ピラジン－２－イル基、５－（ピロリジン－１－イルメチル）ピラジン－２－イル基、５－（モルホリン－４－イルメチル）ピラジン－２－イル基、５－（４－メチルピペラジン－１－イルメ

チル）ピラジン－２－イル基、５－メトキシカルボニル－３－メチルピラジン－２－イル基、５－カルボキシ－６－メチルピラジン－２－イル基、６－アミノ－５－ヒドロキシメチルピラジン－２－イル基、６－アミノ－５－アミノメチルピラジン－２－イル基、６－アミノ－５－カルボキシピラジン－２－イル基、６－アミノ－５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、６－アセチルアミノ－５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、３，６－ジメチル－５－カルボキシピラジン－２－イル基、６－ブロモ－３－クロロ－５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、６－アミノ－３－クロロ－５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、５－アミノピリジン－２－イル基、５－カルボキシピリジン－２－イル基、４－カルボキシピリジン－２－イル基、５－メトキシカルボニルピリジン－２－イル基、５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピリジン－２－イル基、５－カルボキシ－６－メチルピリジン－２－イル基、５－カルボキシ－３－フルオロ－６－メチルピリジン－２－イル基、６－カルボキシピリジン－３－イル基、６－オキソ－１，６－ジヒドロピリジン－３－イル基、５－カルボキシピリミジン－２－イル基、５－エトキシカルボニル－４－ヒドロキシピリミジン－２－イル基、５－カルボキシ－４－ヒドロキシピリミジン－２－イル基、５－メトキシカルボニル－４－メチルピリミジン－２－イル基、５－カルボキシ－４－メチルピリミジン－２－イル基、５－ベンジルオキシカルボニル－４－メチルピリミジン－２－イル基、４－アミノピリミジン－２－イル基、６－クロロピリミジン－４－イル基、２－ヒドロキシピリミジン－４－イル基、２－アミノピリミジン－４－イル基、６－アミノピリミジン－４－イル基、６－ヒドロキシピリダジン－３－イル基、６－カルボキシピリダジン－３－イル基、６－カルバモイルピリダジン－３－イル基、５－メチル－６－ヒドロキシピリダジン－３－イル基、６－カルボキシ－５－メチルピリダジン－３－イル基、６－メトキシカルボニル－５－メチルピリダジン－３－イル基、６－カルバモイル－５－メチルピリダジン－３－イル基、１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、５－カルボキシ－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、１－カルボキシメチル－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、５－カルボキシ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、５－カルボキシ－２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イル基、４－クロロ－５－カル

ボキシー１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、４－メチル－５－カルボキシオキサゾール－２－イル基、１，２，４－トリアゾール－３－イル基、１，２，４－トリアゾール－４－イル基、５－ブロモ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、５－ニトロ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、５－アミノ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、３－アミノ－１，２，４－トリアゾール－１－イル基、５－アミノ－３－メチル－１，２，４－トリアゾール－１－イル基、ベンゾチアゾール－２－イル基、４－カルボキシベンゾチアゾール－２－イル基、８Ｈ－インデノ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル基、２－イミダゾリン－２－イル基、２－チアゾリン－２－イル基、４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾール－２－イル基、２－オキサゾリン－２－イル基、２，５－ジオキソピロリジン－３－イル基、４－フェニル－２，５－ジオキソ－３－ピロリン－３－イル基、２－オキソピロリジン－３－イル基、３－カルボキシアゼチジン－１－イル基、４－カルボキシピペリジン－１－イル基、６－オキソピペリジン－３－イル基、５－オキソ－４，５－ジヒドロ－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、４，５，６，７－テトラヒドロベンゾチアゾール－２－イル基、５－メチルイソオキサゾール－３－イル基、１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、１，２，３－トリアゾール－１－イル基、１，２，４－トリアゾール－１－イル基、１，３，４－トリアゾール－１－イル基、１，２，３－トリアゾール－２－イル基、ピラゾール－１－イル基、テトラゾール－１－イル基、１Ｈ－テトラゾール－５－イル基、２Ｈ－テトラゾール－５－イル基、テトラゾール－２－イル基、５－メチルテトラゾール－１－イル基、５－メチルテトラゾール－２－イル基、１－メチルテトラゾール－５－イル基、２－メチルテトラゾール－５－イル基、５－イソプロピルテトラゾール－１－イル基、５－イソプロピルテトラゾール－２－イル基、５－カルボキシメチルテトラゾール－１－イル基、５－カルボキシメチルテトラゾール－２－イル基、５－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－１－イル基、５－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－２－イル基、１－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－５－イル基、２－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－５－イル基、５－［２－（モルホリン－４－イル）－２－オキソエチル］テトラゾール

－２－イル基、５－アミノテトラゾール－１－イル基、５－アミノテトラゾール－２－イル基、５－フェニルテトラゾール－２－イル基、３－メチルイソオキサゾール－５－イル基、４－メチルピペラジン－１－イル基、２－トリフルオロメチルピリジン－４－イル基、２－ヒドロキシメチルピリジン－４－イル基、２－カルボキシピリジン－４－イル基、２－カルバモイルピリジン－４－イル基、２－ジメチルカルバモイルピリジン－４－イル基、２－（シクロプロピルカルバモイル）ピリジン－４－イル基、２－（モルホリン－４－カルボニル）ピリジン－４－イル基、２－（ピロリジン－１－カルボニル）ピリジン－４－イル基、２－クロロピリジン－４－イル基、２－メトキシピリジン－４－イル基、２－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピリジン－４－イル基、ピリミジン－４－イル基、チアゾール－２－イル基、チアゾール－４－イル基、チアゾール－５－イル基、２－メチルチアゾール－４－イル基、４－（１－ヒドロキシ－１－メチルエチル）チアゾール－２－イル基、４－エトキシカルボニルメチルチアゾール－２－イル基、４－［２－（モルホリン－４－イル）－２－オキソエチル］チアゾール－２－イル基、３－メチルイソチアゾール－５－イル基、１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－メチル－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－ブロモ－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－エトキシカルボニル－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－トリフルオロメチル－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチル－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－（１－ヒドロキシ－１－メチルエチル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－（（Ｒ）－３－ヒドロキシピロリジン－１－カルボニル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－（４－ヒドロキシピペリジン－１－カルボニル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－（モルホリン－４－カルボニル）－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、５－アセチル－１，３，４－チアジアゾール－２－イル基、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル基、３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、３－メトキシ－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、３－アセチルアミノ－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、５－エトキシカルボニル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル基、５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルチオフェン－２－イル基、

１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル基、

キノキサリン－２－イル基、

キノキサリン－６－イル基、

５－クロロキノキサリン－２－イル基、

６－クロロキノキサリン－２－イル基、

８－クロロキノキサリン－２－イル基、

６－ブロモキノキサリン－２－イル基、

７－ブロモキノキサリン－２－イル基、

５－カルボキシキノキサリン－２－イル基、

６－カルボキシキノキサリン－２－イル基、

７－カルボキシキノキサリン－２－イル基、

８－カルボキシキノキサリン－２－イル基、

６－エトキシカルボニルキノキサリン－２－イル基、

７－エトキシカルボニルキノキサリン－２－イル基、

１，５－ナフチリジン－２－イル基、

１，６－ナフチリジン－２－イル基、

チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

６－カルボキシ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

７－カルボキシ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

７－エトキシカルボニル－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

６－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－メチル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－ベンジル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，

４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－ベンジルオキシカルボニル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－エチルカルバモイル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－アセチル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

５－メタンスルホニル－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

４－オキソ－４，５，６，７－テトラヒドロチアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル基、

５－メトキシ－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル基、

５－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル基、

チアゾロ［４，５－ｂ］ピラジン－２－イル基、

チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－エチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－イソプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－ヒドロキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－（１－ヒドロキシエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－（２－ヒドロキシエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－（１－ヒドロキシ－１－メチルエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－メトキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－（２－メトキシエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－エチニル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

5－（3－ヒドロキシ－3－メチル－ブター1－イニル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－フルオロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ブロモ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－シアノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ジフルオロメトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－アミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－イソプロピルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ジメチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（2－ヒドロキシエチルアミノ）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－カルボキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－エトキシカルボニル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－カルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ジメチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（N－メトキシ－N－メチルカルバモイル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－アセチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（1－ヒドロキシメチルシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（1－メトキシメチルシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（1－ヒドロキシシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（1－メトキシシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－（ピロリジン－1－イルメチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－シクロプロピルメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5，7－ジクロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－ブロモ－7－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5，7－ジヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－メトキシ－5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－（1－ヒドロキシ－1－メチルエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－メトキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－カルバモイル－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－クロロ－2－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－7－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－

２－イル基、

７－オキソ－５－トリフルオロメチル－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－クロロ－７－オキソ－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

チアゾロ［５，４－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

５－メチル－チアゾロ［５，４－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－ヒドロキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

７－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

７－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－カルボキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－エトキシカルボニル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－カルバモイル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－メチルカルバモイル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－ジメチルカルバモイル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

７－クロロ－４－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

７－クロロ－４－エトキシカルボニル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

５－メチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

５－エチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

５－（２－ヒドロキシエチル）－４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、

5－（2－メトキシエチル）－4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

6－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－ヒドロキシメチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－カルボキシ－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－エトキシカルボニル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－カルバモイル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－メチルカルバモイル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4，7－ジオキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

4－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

4－アミノ－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

4－（2－ヒドロキシエチルアミノ）－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

4－オキソ－3，4－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

4，6－ジオキソ－5，6－ジヒドロ－4H－ピロロ［3，4－d］チアゾール－2－イル基、

1，3－ジメチル－1H－ピラゾロ［3，4－d］チアゾール－5－イル基、

7－メチル－5－オキソ－5H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

5－オキソ－7－トリフルオロメチル－5H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

5－メチル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

5－イソプロピル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

7－オキソ－5－トリフルオロメチル－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

5－エトキシカルボニル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

5－メチルカルバモイル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

6－クロロ－5－メチル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

3－メチル－4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基、

4－オキソ－3－トリフルオロメチル－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基、

［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3－メチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3－トリフルオロメチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3H－イミダゾ［4，5－c］ピリジン－2－イル基、

プテリジン－７－イル基、

プテリジン－６－イル基、

２－メチルプテリジン－７－イル基、

２－トリフルオロメチルプテリジン－７－イル基、

ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－（２－カルボキシエチル）－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－（２－カルバモイルエチル）－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－ブロモ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－シアノ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－カルボキシ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－カルバモイル－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－メチルカルバモイル－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－イソプロピルカルバモイル－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

８－ジメチルカルバモイル－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－３－イル基、

ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－６－イル基、

ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、

２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル基、

２，２－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－２λ^{6}－ピラジノ［２，３－ｃ］［１，２，６］チアジアジン－７－イル基、

１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、

２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、

６－ヒドロキシ－［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル基、

［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル基

等が挙げられる。

「グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基」とは、上記定義の「C_{1-10}アルキル基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{1-10}アルキル基を含む。該置換基は、グループＢから選ばれる。

具体的には、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、１－エチルプロピル基、１－プロピルブチル基、ｔｅｒｔ－ペンチル基、ネオペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、１，１－ジフルオロエチル基、１，１－ジフルオロプロピル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、１，１，２，２－テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、シアノメチル基、１－シアノ－１－メチルエチル基、ヒドロキシメチル基、１－ヒドロキシエチル基、２－ヒドロキシエチル基、３－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－１－メチルエチル基、２－ヒドロキシ－１，１－ジメチルエチル基、メトキシメチル基、２－メトキシ－１，１－ジメチルエチル基、ジフルオロ（メトキシ）メチル基、アミノメチル基、２－アミノエチル基、メチルアミノメチル基、ジメチルアミノメチル基、ジプロピルアミノメチル基、２－ジプロピルアミノエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、（Ｒ）－１－カルボキシエチル基、（Ｓ）－１－カルボキシエチル基、３－カルボキシプロピル基、４－カルボキシブチル基、５－カルボキシペンチル基、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルメチル基、２－メトキシカルボニルエチル基、２－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルエチル基、３－メトキシカルボニルプロピル基、４－メトキシカルボニルブチル基、５－エトキシカルボニルペンチル基、１－メトキシカルボニル－１－メチルエチル基、１－カルボキシ－１－メチルエチル基、カルバモイルメチル基、２－カルバモイルエチル基、１－ジメチルカルバモイル－１－メチルエチル基、２－アセチルアミノエチル基、２－（モルホリン－４－イル）－２－オキソエチル基、トリエチルアンモニウミルメチル基、（カルボキシ）（ヒドロキシ）メチル基、（エトキシカルボニル）（ヒドロキシ）メチル基等が挙げられる。

「グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基」として、更に好ましくは、無置換のアルキル基、及び、ハロゲン原

子によって置換されたC_{1-10}アルキル基である。

「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}アルキニル基」とは、上記定義の「C_{2-10}アルキニル基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{2-10}アルキニル基を含む。該置換基は、グループBから選ばれる。

具体的には、エチニル基、1－プロピニル基、2－プロピニル基、1－ブチニル基、2－ブチニル基、3－ブチニル基、1－ペンチニル基、1－ヘキシニル基、1－ヘプチニル基、1－オクチニル基、3－メチルブター1－イン－1－イル基、3－ヒドロキシ－3－メチルブター1－イン－1－イル基等が挙げられる。

「グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基」とは、上記定義の「C_{3-12}炭素環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{3-12}炭素環基を含む。該置換基は、グループCから選ばれる。

具体的には、フェニル基、4－クロロフェニル基、4－シアノフェニル基、2－ヒドロキシフェニル基、3－ヒドロキシフェニル基、2－カルボキシメトキシフェニル基、3－カルボキシメトキシフェニル基、3－カルボキシフェニル基、シクロプロピル基、1－ヒドロキシメチルシクロプロピル基、1－メトキシメチルシクロプロピル基、1－ヒドロキシシクロプロピル基、1－メトキシシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が挙げられる。

「グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基」とは、上記定義の「ヘテロ環基」が1乃至5個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環基を含む。該置換基は、グループCから選ばれる。

具体的には、アゼチジン－1－イル基、ピロリジン－1－イル基、2－オキソピロリジン－1－イル基、ピペリジン－1－イル基、モルホリン－4－イル基、4－メチルピペラジン－1－イル基、1－メチル－1H－ピラゾール－4－イル基、フラン－3－イル基、1，2，3－チアジアゾール－4－イル基、チオフェン－2－イル基、1H－テトラゾール－5－イル基、2H－テトラゾール－5－イル基、ピリジン－2－イル基、ピリジン－3－イル基、5－トリフルオロメチルイソオキサゾール－3－イル基、4－クロロピラゾール－1－イル基、3－ヒドロキシピロリ

ジン－１－イル基、４－ヒドロキシピペリジン－１－イル基、５－オキソ－２，５－ジヒドロ－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル基等が挙げられる。

「グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基を含む。該置換基は、グループＣから選ばれる。具体的には、ベンジル基等が挙げられる。

「グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「ヘテロ環－C_{1-4}アルキル基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のヘテロ環－C_{1-4}アルキル基を含む。該置換基は、グループＣから選ばれる。具体的には、ピロリジン－１－イルメチル基、４－メチルピペラジン－１－イルメチル基、モルホリン－４－イルメチル基等が挙げられる。

「グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基」とは、上記定義の「C_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基」が１乃至５個の置換基で置換されてもよいものであり、無置換のC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基を含む。該置換基は、グループＣから選ばれる。具体的には、シクロプロピルメチル基等が挙げられる。

環Ａ、環Ｂ及びＲについての好適な基は以下の通りである。

環Ａとして、好ましくは、

フェニル基、

４－メチルフェニル基、

４－エチルフェニル基、

４－プロピルフェニル基、

４－イソプロピルフェニル基、

４－ブチルフェニル基、

４－ｔｅｒｔ－ブチルフェニル基、

４－ｔｅｒｔ－ペンチルフェニル基、

４－（１－エチルプロピル）フェニル基、

4－（1－プロピルブチル）フェニル基、

2－トリフルオロメチルフェニル基、

3－トリフルオロメチルフェニル基、

4－トリフルオロメチルフェニル基、

4－（1，1－ジフルオロエチル）フェニル基、

4－（1，1－ジフルオロプロピル）フェニル基、

4－ペンタフルオロエチルフェニル基、

4－（1－シアノ－1－メチルエチル）フェニル基、

4－（ヒドロキシメチル）フェニル基、

4－（2－ヒドロキシエチル）フェニル基、

4－（3－ヒドロキシプロピル）フェニル基、

4－（2－ヒドロキシ－1，1－ジメチルエチル）フェニル基、

4－（メトキシメチル）フェニル基、

4－（2－メトキシ－1，1－ジメチルエチル）フェニル基、

4－［ジフルオロ（メトキシ）メチル］フェニル基、

4－（1－メトキシカルボニル－1－メチルエチル）フェニル基、

4－（1－カルボキシ－1－メチルエチル）フェニル基、

4－（1－ジメチルカルバモイル－1－メチルエチル）フェニル基、

2－フルオロフェニル基、

3－フルオロフェニル基、

2－クロロフェニル基、

3－クロロフェニル基、

4－クロロフェニル基、

4－ブロモフェニル基、

4－ニトロフェニル基、

2－ヒドロキシフェニル基、

3－ヒドロキシフェニル基、

4－ヒドロキシフェニル基、

2－メトキシフェニル基、

3－メトキシフェニル基、

4－メトキシフェニル基、

4－エトキシフェニル基、

4－イソプロポキシフェニル基、

4－フルオロメトキシフェニル基、

4－ジフルオロメトキシフェニル基

3－トリフルオロメトキシフェニル基、

4－トリフルオロメトキシフェニル基、

4－（2，2，2－トリフルオロエトキシ）フェニル基、

4－（1，1，2，2－テトラフルオロエトキシ）フェニル基、

4－フェノキシフェニル基、

4－メチルスルファニルフェニル基、

4－トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、

4－アミノフェニル基、

2－ジメチルアミノフェニル基、

3－ジメチルアミノフェニル基、

4－ジメチルアミノフェニル基、

4－ジエチルアミノフェニル基、

4－（N－エチル－N－メチルアミノ）フェニル基、

4－（N－メチル－N－プロピルアミノ）フェニル基、

4－［N－（2－ヒドロキシエチル）－N－メチルアミノ］フェニル基、

4－（2，2－ジメチルプロピオニルアミノ）フェニル基、

4－カルボキシフェニル基、

4－メトキシカルボニルフェニル基、

4－スルファモイルフェニル基、

4－ペンタフルオロスルファニルフェニル基、

4－シクロプロピルフェニル基、

4－（1－ヒドロキシメチルシクロプロピル）フェニル基、

4－（1－メトキシメチルシクロプロピル）フェニル基、

4－シクロペンチルフェニル基、

ビフェニル－２－イル基、

ビフェニル－４－イル基、

２’－クロロビフェニル－４－イル基、

３’－クロロビフェニル－４－イル基、

４’－クロロビフェニル－４－イル基、

４－（アゼチジン－１－イル）フェニル基、

４－（ピロリジン－１－イル）フェニル基、

４－（ピペリジン－１－イル）フェニル基、

４－（モルホリン－４－イル）フェニル基、

４－（４－メチルピペラジン－１－イル）フェニル基、

４－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル）フェニル基、

４－（フラン－３－イル）フェニル基、

４－（１，２，３－チアジアゾール－４－イル）フェニル基、

４－（チオフェン－２－イル）フェニル基、

４－エチル－２－メチルフェニル基、

２－メチル－４－プロピルフェニル基、

４－イソプロピル－２－メチルフェニル基、

４－シクロプロピル－２－メチルフェニル基、

３，４－ジクロロフェニル基、

２，４－ジクロロフェニル基、

４－ブロモ－２－クロロフェニル基、

２－クロロ－４－プロピルフェニル基、

２－フルオロ－４－イソプロピルフェニル基、

２，４－ジメトキシフェニル基、

３，４－ジメトキシフェニル基、

３－ヒドロキシ－４－プロピルフェニル基、

３－アミノ－４－プロピルフェニル基、

３－ヒドロキシ－４－メトキシフェニル基、

４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロフェニル基、

４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロフェニル基、

３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

２，４，６－トリクロロフェニル基、

２，３，５，６－テトラフルオロ－４－トリフルオロメチルフェニル基、

シクロヘキシル基、

１－ヒドロキシシクロヘキシル基、

４－カルボキシシクロヘキシル基、

２－フェニルシクロプロピル基、

３－フェニルシクロブチル基、

アダマンタン－１－イル基、

ナフタレン－２－イル基、

ピリジン－２－イル基、

ピリジン－３－イル基、

ピリジン－４－イル基、

６－プロピルピリジン－３－イル基、

６－イソプロピルピリジン－３－イル基、

６－トリフルオロメチルピリジン－３－イル基、

６－ジメチルアミノピリジン－３－イル基、

６－（アゼチジン－１－イル）ピリジン－３－イル基、

６－（ピロリジン－１－イル）ピリジン－３－イル基、

６－メトキシ－５－メチルピリジン－２－イル基、

２－オキソ－１－プロピル－１，２－ジヒドロピリジン－４－イル基、

２－オキソ－６－プロピル－１，２－ジヒドロピリジン－３－イル基、

１－プロピル－１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－４－イル基、

５－メチルピラジン－２－イル基、

１Ｈ－インドール－３－イル基、

１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール－４－イル基、

１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、

５－プロピルチオフェン－２－イル基、

５－フェニルチオフェン－２－イル基、

５－（ピリジン－２－イル）チオフェン－２－イル基、

２，２’－ビチオフェニル－５－イル基、

４－メチル－２－プロピルチアゾール－５－イル基、

２－（チオフェン－２－イル）チアゾール－４－イル基、

１－フェニルアゼチジン－３－イル基、

ピペリジン－１－イル基、

ピペリジン－４－イル基、

１－プロピルピペリジン－４－イル基、

１－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピペリジン－４－イル基、

１－アセチルピペリジン－４－イル基、

モルホリン－４－イル基、

ベンゾオキサゾール－２－イル基、

インドリジン－２－イル

等である。

環Ａのもう１つの好ましい態様としては、上記グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいフェニル基であり、さらに好ましくは上記グループＡから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されたフェニル基である。

この場合、フェニル基上の置換基として好ましくは、上記定義の「ハロゲン原子」、－ＯＲ^{a1}（ここで、Ｒ^{a1}は上記定義の通り。）、上記定義の「グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいＣ$_{1-10}$アルキル基」である。

フェニル基上の置換基の置換位置として好ましくは、４位モノ置換、２，４ジ置換、３，４－ジ置換であり、ここで、２位、３位、４位の置換基は、それぞれ同一又は異なっていても良い。更に好ましくは、４位モノ置換、又は、３，４ジ置換である。

ｎとして好ましくは、１である。

環Ｂとして好ましくは、

フェニル基、

４－メチルフェニル基、

４－エチルフェニル基、

４－プロピルフェニル基、

４－イソプロピルフェニル基、

４－ブチルフェニル基、

４－イソブチルフェニル基、

４－ｔｅｒｔ－ブチルフェニル基、

４－ｔｅｒｔ－ペンチルフェニル基、

４－ネオペンチルフェニル基、

４－（１－エチルプロピル）フェニル基、

３－トリフルオロメチルフェニル基、

４－トリフルオロメチルフェニル基、

４－ヒドロキシメチルフェニル基、

４－メトキシメチルフェニル基、

４－（２－メトキシカルボニルエチル）フェニル基、

４－フルオロフェニル基、

２－クロロフェニル基、

３－クロロフェニル基、

４－クロロフェニル基、

３－ブロモフェニル基、

４－ブロモフェニル基、

４－ヨードフェニル基、

４－ニトロフェニル基、

４－シアノフェニル基、

４－ヒドロキシフェニル基、

３－メトキシフェニル基、

４－メトキシフェニル基、

４－エトキシフェニル基、

４－プロポキシフェニル基、

4－イソプロポキシフェニル基、

4－ジフルオロメトキシフェニル基、

4－トリフルオロメトキシフェニル基、

4－（2，2，2－トリフルオロエトキシ）フェニル基、

4－（1，1，2，2－テトラフルオロエトキシ）フェニル基、

4－カルボキシメトキシフェニル基、

4－メトキシカルボニルメトキシフェニル基、

4－（2－メトキシカルボニルエトキシ）フェニル基、

4－（4－クロロフェノキシ）フェニル基、

4－（ピリジン－3－イルオキシ）フェニル基、

4－アミノフェニル基、

4－ジメチルアミノフェニル基、

4－（N－カルボキシメチル－N－メチルアミノ）フェニル基、

4－（N－エトキシカルボニルメチル－N－メチルアミノ）フェニル基、

4－アセチルアミノフェニル基、

3－カルボキシフェニル基、

4－カルボキシフェニル基、

4－メトキシカルボニルフェニル基、

4－アセチルフェニル基、

4－シクロプロピルフェニル基、

4－シクロヘキシルフェニル基、

4－（4－カルボキシメチルシクロヘキシル）フェニル基、

ビフェニル－3－イル基、

ビフェニル－4－イル基、

4’－クロロビフェニル－4－イル基、

2’－ヒドロキシビフェニル－4－イル基、

3’－ヒドロキシビフェニル－4－イル基、

2’－カルボキシメトキシビフェニル－4－イル基、

3’－カルボキシメトキシビフェニル－4－イル基、

3’－カルボキシビフェニル－４－イル基、

４－シクロプロピルメチルフェニル基、

４－（ピロリジン－１－イル）フェニル基、

４－（２－オキソピロリジン－１－イル）フェニル基、

４－（モルホリン－４－イル）フェニル基、

４－（チオフェン－２－イル）フェニル基、

４－（５－オキソ－２，５－ジヒドロ－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）フェニル基、

３，４－ジクロロフェニル基、

２，４－ジクロロフェニル基、

３，５－ジクロロフェニル基、

４－ブロモ－２－フルオロフェニル基、

４－ブロモ－３－フルオロフェニル基、

３，４－ジメトキシフェニル基、

３－エチル－４－メトキシフェニル基、

３－イソプロピル－４－メトキシフェニル基、

３－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシフェニル基、

３－クロロ－４－メトキシフェニル基、

２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－ヨード－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－プロピル－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－（２－カルボキシエチル）－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－（３－カルボキシプロピル）－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

３－カルボキシ－４－メトキシフェニル基、

３－カルボキシ－４－トリフルオロメトキシフェニル基、

４－メトキシ－３－メトキシカルボニルフェニル基、

４－メトキシ－３－メトキシカルボニルメチルフェニル基、

４－メトキシ－３－（２－メトキシカルボニルエチル）フェニル基、

3－カルボキシメチル－4－メトキシフェニル基、

3－（2－カルボキシエチル）－4－メトキシフェニル基、

3－シアノ－4－メトキシフェニル基、

3－シクロペンチル－4－メトキシフェニル基、

4－メトキシ－3－（2H－テトラゾール－5－イル）フェニル基、

4－カルボキシ－3－フルオロフェニル基、

2－（4－シアノフェノキシ）－3，5－ジメチルフェニル基、

シクロヘキシル基、

インダン－5－イル基、

5，6，7，8－テトラヒドロナフタレン－2－イル基、

6，7，8，9－テトラヒドロ－5H－ベンゾシクロヘプテン－2－イル基、

7－カルボキシメチル－6，7，8，9－テトラヒドロ－5H－ベンゾシクロヘプテン－2－イル基、

ナフタレン－2－イル基、

5－エチルチオフェン－2－イル基、

5－プロピルチオフェン－2－イル基、

5－イソプロピルチオフェン－2－イル基、

5－トリフルオロメチルチオフェン－2－イル基、

5－クロロチオフェン－2－イル基、

5－ブロモチオフェン－2－イル基、

5－カルボキシメチルチオフェン－2－イル基、

5－（2－カルボキシエチル）チオフェン－2－イル基、

5－ベンゼンスルホニルチオフェン－2－イル基、

5－（4－クロロフェニル）チオフェン－2－イル基、

5－（5－トリフルオロメチルイソオキサゾール－3－イル）チオフェン－2－イル基、

5－（4－クロロピラゾール－1－イル）チオフェン－2－イル基、

6－（モルホリン－4－イル）ピリジン－3－イル基、

5－ブロモ－6－クロロピリジン－3－イル基、

2，3－ジヒドロベンゾフラン－5－イル基、

ベンゾチオフェン－2－イル基、

2，2，3，3－テトラフルオロ－2，3－ジヒドローベンゾ［1，4］ジオキシン－6－イル基、

1－メチル－1，2，3，4－テトラヒドロキノリン－7－イル基、

2－プロピルチアゾール－5－イル基

等である。

環Bのもう1つの好ましい態様としては、上記グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいフェニル基であり、さらに好ましくは上記グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されたフェニル基である。

この場合、フェニル基上の置換基として好ましくは、上記定義の「ハロゲン原子」、－OR^{a1}（ここで、R^{a1}は上記定義の通り。）、上記定義の「グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基」、及び、「グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基」（特に好ましくは、上記定義の「C_{3-10}シクロアルキル基」である。）である。

フェニル基上の置換基の置換位置として好ましくは、4位モノ置換、2，4ジ置換、3，4－ジ置換であり、ここで、2位、3位、4位の置換基は、それぞれ同一又は異なっていても良い。更に好ましくは、4位モノ置換である。

Rとして好ましくは、

水素原子、

ホルミル基、

アセチル基、

プロピオニル基、

イソブチリル基、

2，2－ジメチルプロピオニル基、

2－シアノアセチル基、

2－ヒドロキシアセチル基、

2－ヒドロキシ－2－メチルプロピオニル基、

３－ヒドロキシプロピオニル基、

２－メトキシアセチル基、

２－アミノアセチル基、

３－アミノプロピオニル基、

２－ジメチルアミノアセチル基、

２－ジプロピルアミノアセチル基、

３－ジプロピルアミノプロピオニル基、

２－カルボキシアセチル基、

３－カルボキシプロピオニル基

４－カルボキシブチリル基、

５－カルボキシペンタノイル基、

６－カルボキシヘキサノイル基、

３－メトキシカルボニルプロピオニル基、

４－メトキシカルボニルブチリル基、

５－メトキシカルボニルペンタノイル基、

６－エトキシカルボニルヘキサノイル基、

メトキシカルボニル基、

ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基、

カルバモイル基、

エチルカルバモイル基、

ジメチルカルバモイル基、

カルボキシメチルカルバモイル基、

（３－カルボキシプロピル）カルバモイル基、

メタンスルホニル基、

カルボキシカルボニル基、

２－エトキシ－２－オキソアセチル基、

（Ｚ）－３－カルボキシプロパ－２－エノイル基、

（Ｅ）－３－カルボキシプロパ－２－エノイル基、

２－カルボキシメチルアミノアセチル基、

２－（２－カルボキシエチルアミノ）アセチル基、

アセチルアミノアセチル基、

３－アセチルアミノプロピオニル基、

２－（３－カルボキシプロピオニルアミノ）アセチル基、

２－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルアミノ）アセチル基、

３－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルアミノ）プロピオニル基、

２－（３－メトキシカルボニルプロピオニルアミノ）アセチル基、

２－アミノ－２－オキソアセチル基、

カルバムイミドイル基、

チオカルバモイル基、

メチル基、

カルボキシメチル基、

メトキシカルボニルメチル基、

カルバモイルメチル基、

４－カルボキシフェニル基、

４－メチルチアゾール－２－イル基、

４－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、

５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、

４－カルボキシメチルチアゾール－２－イル基、

４－メトキシカルボニルメチルチアゾール－２－イル基、

４－（２－カルボキシエチル）チアゾール－２－イル基、

４－カルボキシチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシチアゾール－２－イル基、

５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、

４－エトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、

４－フェニルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシ－４－メチルチアゾール－２－イル基、

４－カルボキシ－５－メチルチアゾール－２－イル基、

４－エチル－５－カルボキシチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシ－４－トリフルオロメチルチアゾール－２－イル基、

５－ヒドロキシメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－メトキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－エトキシカルボニル－４－トリフルオロメチルチアゾール－２－イル基、

５－メチルアミノメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－ジメチルアミノメチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－メチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－ジメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルメチルカルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（２－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（２－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（（Ｒ）－１－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（（Ｓ）－１－カルボキシエチル）カルバモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシ－４－メトキシメチルチアゾール－２－イル基、

５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（２－カルボキシエチル）－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（カルボキシ）（ヒドロキシ）メチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－（エトキシカルボニル）（ヒドロキシ）メチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－シアノ－４－メチルチアゾール－２－イル基、

４－メチル－５－スルファモイルチアゾール－２－イル基、

４－メチル－５－メチルスルファモイルチアゾール－２－イル基、

５－ジメチルスルファモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－アセチルスルファモイル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－アセチル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－エトキシカルボニルカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

５－メチルカルバモイルカルボニル－４－メチルチアゾール－２－イル基、

４－メチル－５－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）チアゾール－２－イル基、

４－メチル－５－（ピロリジン－１－イルメチル）チアゾール－２－イル基、

４，５－ビス（ヒドロキシメチル）チアゾール－２－イル基、

４－カルボキシ－５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシ－４－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、

４－カルボキシ－５－メトキシメチルチアゾール－２－イル基、

５－カルボキシ－４－クロロチアゾール－２－イル基、

４－アミノ－５－エトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、

ピラジン－２－イル基、

５－シアノピラジン－２－イル基、

５－ヒドロキシメチルピラジン－２－イル基、

５－ジメチルアミノメチルピラジン－２－イル基、

５－（トリエチルアンモニウミルメチル）ピラジン－２－イル基、

５－メトキシカルボニルピラジン－２－イル基、

５－アミノピラジン－２－イル基、

５－メタンスルホニルアミノピラジン－２－イル基、

５－カルボキシピラジン－２－イル基、

５－カルバモイルピラジン－２－イル基、

５－エチルカルバモイルピラジン－２－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブチルカルバモイルピラジン－２－イル基、

５－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ピラジン－２－イル基、

５－（ピロリジン－１－イルメチル）ピラジン－２－イル基、

５－（モルホリン－４－イルメチル）ピラジン－２－イル基、

5－（4－メチルピペラジン－1－イルメチル）ピラジン－2－イル基、

5－メトキシカルボニル－3－メチルピラジン－2－イル基、

5－カルボキシ－6－メチルピラジン－2－イル基、

6－アミノ－5－ヒドロキシメチルピラジン－2－イル基、

6－アミノ－5－アミノメチルピラジン－2－イル基、

6－アミノ－5－カルボキシピラジン－2－イル基、

6－アミノ－5－メトキシカルボニルピラジン－2－イル基、

6－アセチルアミノ－5－メトキシカルボニルピラジン－2－イル基、

3，6－ジメチル－5－カルボキシピラジン－2－イル基、

6－ブロモ－3－クロロ－5－メトキシカルボニルピラジン－2－イル基、

6－アミノ－3－クロロ－5－メトキシカルボニルピラジン－2－イル基、

5－アミノピリジン－2－イル基、

5－カルボキシピリジン－2－イル基、

4－カルボキシピリジン－2－イル基、

5－メトキシカルボニルピリジン－2－イル基、

5－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピリジン－2－イル基、

5－カルボキシ－6－メチルピリジン－2－イル基、

5－カルボキシ－3－フルオロ－6－メチルピリジン－2－イル基、

6－カルボキシピリジン－3－イル基、

6－オキソ－1，6－ジヒドロピリジン－3－イル基、

5－カルボキシピリミジン－2－イル基、

5－エトキシカルボニル－4－ヒドロキシピリミジン－2－イル基、

5－カルボキシ－4－ヒドロキシピリミジン－2－イル基、

5－メトキシカルボニル－4－メチルピリミジン－2－イル基、

5－カルボキシ－4－メチルピリミジン－2－イル基、

5－ベンジルオキシカルボニル－4－メチルピリミジン－2－イル基、

4－アミノピリミジン－2－イル基、

ピリミジン－4－イル基、

6－クロロピリミジン－4－イル基、

２－ヒドロキシピリミジン－４－イル基、

２－アミノピリミジン－４－イル基、

６－アミノピリミジン－４－イル基、

６－ヒドロキシピリダジン－３－イル基、

６－カルボキシピリダジン－３－イル基、

６－カルバモイルピリダジン－３－イル基、

５－メチル－６－ヒドロキシピリダジン－３－イル基、

６－カルボキシ－５－メチルピリダジン－３－イル基、

６－メトキシカルボニル－５－メチルピリダジン－３－イル基、

６－カルバモイル－５－メチルピリダジン－３－イル基、

５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

５－カルボキシ－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

１－カルボキシメチル－５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

５－カルボキシ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

５－カルボキシ－２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

４－クロロ－５－カルボキシ－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、

１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、

１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、

４－メチル－５－カルボキシオキサゾール－２－イル基、

１，２，４－トリアゾール－３－イル基、

５－ブロモ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、

５－ニトロ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、

５－アミノ－１，２，４－トリアゾール－３－イル基、

３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、

３－メトキシ－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、

３－アセチルアミノ－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、

５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルチオフェン－２－イル基、

ベンゾチアゾール－２－イル基、

４－カルボキシベンゾチアゾール－２－イル基、

8Ｈ－インデノ［1，2－d］チアゾール－2－イル基、

2－イミダゾリン－2－イル基、

2－チアゾリン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾール－2－イル基、

2－オキサゾリン－2－イル基、

2，5－ジオキソピロリジン－3－イル基、

4－フェニル－2，5－ジオキソ－3－ピロリン－3－イル基、

2－オキソピロリジン－3－イル基、

6－オキソピペリジン－3－イル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロ－1，3，4－チアジアゾール－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロベンゾチアゾール－2－イル基、

1Ｈ－ベンゾイミダゾール－2－イル基、

キノキサリン－2－イル基、

キノキサリン－6－イル基、

5－クロロキノキサリン－2－イル基、

6－クロロキノキサリン－2－イル基、

8－クロロキノキサリン－2－イル基、

6－ブロモキノキサリン－2－イル基、

7－ブロモキノキサリン－2－イル基、

5－カルボキシキノキサリン－2－イル基、

6－カルボキシキノキサリン－2－イル基、

7－カルボキシキノキサリン－2－イル基、

8－カルボキシキノキサリン－2－イル基、

6－エトキシカルボニルキノキサリン－2－イル基、

7－エトキシカルボニルキノキサリン－2－イル基、

1，5－ナフチリジン－2－イル基、

1，6－ナフチリジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

6－カルボキシ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

7－カルボキシ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

7－エトキシカルボニル－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

6－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－メチル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－ベンジル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－ベンジルオキシカルボニル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－エチルカルバモイル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－アセチル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

5－メタンスルホニル－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

5－メトキシ－チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－b］ピラジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－エチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－イソプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ヒドロキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－ヒドロキシエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（2－ヒドロキシエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－ヒドロキシ－1－メチルエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－メトキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（2－メトキシエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－エチニル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（3－ヒドロキシ－3－メチル－ブター1－イニル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－フルオロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ブロモ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－シアノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ジフルオロメトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－アミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－メチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－イソプロピルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ジメチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（2－ヒドロキシエチルアミノ）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－カルボキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－エトキシカルボニル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－カルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ジメチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（N－メトキシ－N－メチルカルバモイル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－アセチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－ヒドロキシメチルシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－メトキシメチルシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－ヒドロキシシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（1－メトキシシクロプロピル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－（ピロリジン－1－イルメチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－シクロプロピルメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5，7－ジクロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5－ブロモ－7－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
5，7－ジヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
7－メトキシ－5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
7－アミノ－5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
7－アミノ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、
7－アミノ－5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－（1－ヒドロキシ－1－メチルエチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－メトキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－アミノ－5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－カルバモイル－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－クロロ－2－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－7－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

7－オキソ－5－トリフルオロメチル－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

5－クロロ－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル基、

5－メチル－チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－ヒドロキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

7－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

7－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－カルボキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－エトキシカルボニル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－カルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－メチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－ジメチルカルバモイル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
7－クロロ－4－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
7－クロロ－4－エトキシカルボニル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
5－メチル－4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
5－エチル－4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
5－（2－ヒドロキシエチル）－4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
5－（2－メトキシエチル）－4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
6－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－ヒドロキシメチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－カルボキシ－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－エトキシカルボニル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－カルバモイル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4－メチルカルバモイル－7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、
4，7－ジオキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダ

ジン－２－イル基、

チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

４－アミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

４－（２－ヒドロキシエチルアミノ）－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

４－オキソ－３，４－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル基、

４，６－ジオキソ－５，６－ジヒドロ－４Ｈ－ピロロ［３，４－ｄ］チアゾール－２－イル基、

１，３－ジメチル－１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｄ］チアゾール－５－イル基、

７－メチル－５－オキソ－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

５－オキソ－７－トリフルオロメチル－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

５－イソプロピル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

７－オキソ－５－トリフルオロメチル－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

５－エトキシカルボニル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

５－メチルカルバモイル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

６－クロロ－５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基、

3－メチル－4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基、

4－オキソ－3－トリフルオロメチル－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基、

［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3－メチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3－トリフルオロメチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基、

3H－イミダゾ［4，5－c］ピリジン－2－イル基、

プテリジン－7－イル基、

プテリジン－6－イル基、

2－メチルプテリジン－7－イル基、

2－トリフルオロメチルプテリジン－7－イル基、

ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－（2－カルボキシエチル）－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－（2－カルバモイルエチル）－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－ブロモ－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－シアノ－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－カルボキシ－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－カルバモイル－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－メチルカルバモイル－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－イソプロピルカルバモイル－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

8－ジメチルカルバモイル－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル基、

ピリド［2，3－b］ピラジン－2－イル基、

ピリド［2，3－b］ピラジン－3－イル基、

ピリド［2，3－b］ピラジン－6－イル基、

ピラジノ［2，3－b］ピラジン－2－イル基、

２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル基、

２，２－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－２λ^{6}－ピラジノ［２，３－ｃ］［１，２，６］チアジアジン－７－イル基、

１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、

２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、

６－ヒドロキシ－［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル基、

［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリミジン－５－イル基、

２－（ピリジン－４－イル）エチル基、

ベンゾイル基、

シクロプロピルカルボニル基、

ピリジン－４－カルボニル基

チアゾール－４－カルボニル基、

５－メチルイソオキサゾール－３－カルボニル基、

３－アミノ－１，２，４－トリアゾール－１－カルボニル基、

５－アミノ－３－メチル－１，２，４－トリアゾール－１－カルボニル基、

３－カルボキシアゼチジン－１－イルカルボニル基、

４－カルボキシピペリジン－１－イルカルボニル基、

フェニルアセチル基、

２－（２－メトキシフェニル）アセチル基、

２－（３－メトキシフェニル）アセチル基、

２－（４－メトキシフェニル）アセチル基、

２－（ピリジン－２－イル）アセチル基、

２－（ピリジン－３－イル）アセチル基、

２－（ピリジン－４－イル）アセチル基、

２－（ピリミジン－４－イル）アセチル基、

２－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）アセチル基、

2－（1Ｈ－イミダゾール－４－イル）アセチル基、

2－（1－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル）アセチル基、

2－（1，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル基、

2－（1，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル基、

2－（1，３，４－トリアゾール－１－イル）アセチル基、

2－（1，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル基、

2－（ピラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（テトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（1Ｈ－テトラゾール－５－イル）アセチル基、

2－（テトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（５－メチルテトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（５－メチルテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（1－メチルテトラゾール－５－イル）アセチル基、

2－（２－メチルテトラゾール－５－イル）アセチル基、

2－（５－イソプロピルテトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（５－イソプロピルテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（５－カルボキシメチルテトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（５－カルボキシメチルテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（５－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（５－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（1－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－５－イル）アセチル基、

2－（２－エトキシカルボニルメチルテトラゾール－５－イル）アセチル基、

2－［５－［２－（モルホリン－４－イル）－２－オキソエチル］テトラゾール－２－イル］アセチル基、

2－（５－アミノテトラゾール－１－イル）アセチル基、

2－（５－アミノテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（５－フェニルテトラゾール－２－イル）アセチル基、

2－（３－メチルイソオキサゾール－５－イル）アセチル基、

2－（４－メチルピペラジン－１－イル）アセチル基、

２－（ピロリジン－１－イル）アセチル基、

２－（ピペリジン－１－イル）アセチル基、

２－（モルホリン－４－イル）アセチル基、

３－（モルホリン－４－イル）プロピオニル基、

２－シクロヘキシルアセチル基、

フェニルカルバモイル基、

２－クロロフェニルカルバモイル基、

３－クロロフェニルカルバモイル基、

４－クロロフェニルカルバモイル基、

２－ヒドロキシフェニルカルバモイル基、

２－メトキシフェニルカルバモイル基、

３－メトキシフェニルカルバモイル基、

４－メトキシフェニルカルバモイル基、

２－ベンジルオキシフェニルカルバモイル基、

２－カルボキシフェニルカルバモイル基、

３－カルボキシフェニルカルバモイル基、

４－カルボキシフェニルカルバモイル基、

（４－ジメチルアミノフェニル）カルバモイル基、

（３－エトキシカルボニルメトキシフェニル）カルバモイル基、

（４－エトキシカルボニルメトキシフェニル）カルバモイル基、

（３－カルボキシメトキシフェニル）カルバモイル基、

（４－カルボキシメトキシフェニル）カルバモイル基、

（２－メトキシカルボニルフェニル）カルバモイル基、

（３－メトキシカルボニルフェニル）カルバモイル基、

（４－メトキシカルボニルフェニル）カルバモイル基、

（２－ベンジルオキシカルボニルフェニル）カルバモイル基、

（ピリジン－３－イル）カルバモイル基、

（ピリジン－４－イル）カルバモイル基、

（２－トリフルオロメチルピリジン－４－イル）カルバモイル基、

（２－ヒドロキシメチルピリジン－４－イル）カルバモイル基、
（２－カルボキシピリジン－４－イル）カルバモイル基、
（２－カルバモイルピリジン－４－イル）カルバモイル基、
（２－ジメチルカルバモイルピリジン－４－イル）カルバモイル基、
［２－（シクロプロピルカルバモイル）ピリジン－４－イル］カルバモイル基、
［２－（モルホリン－４－カルボニル）ピリジン－４－イル］カルバモイル基、
［２－（ピロリジン－１－カルボニル）ピリジン－４－イル］カルバモイル基、
（２－クロロピリジン－４－イル）カルバモイル基、
（２－メトキシピリジン－４－イル）カルバモイル基、
（２－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニルピリジン－４－イル）カルバモイル基、
Ｎ－メチル－Ｎ－（ピリジン－４－イル）カルバモイル基、
［４－（２－ヒドロキシエチル）チアゾール－２－イル］カルバモイル基、
（ピリミジン－４－イル）カルバモイル基、
（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）カルバモイル基、
（１，２，４－トリアゾール－３－イル）カルバモイル基、
（１，２，４－トリアゾール－４－イル）カルバモイル基、
（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）カルバモイル基、
（チアゾール－２－イル）カルバモイル基、
（チアゾール－４－イル）カルバモイル基、
（チアゾール－５－イル）カルバモイル基、
（２－メチルチアゾール－４－イル）カルバモイル基、
［４－（１－ヒドロキシ－１－メチルエチル）チアゾール－２－イル］カルバモイル基、
（４－エトキシカルボニルメチルチアゾール－２－イル）カルバモイル基、
［４－［２－（モルホリン－４－イル）－２－オキソエチル］チアゾール－２－イル］カルバモイル基、
（３－メチルイソチアゾール－５－イル）カルバモイル基、
（３－メチルイソオキサゾール－５－イル）カルバモイル基、
（５－メチルイソオキサゾール－３－イル）カルバモイル基、

（1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－メチル－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－ブロモ－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－エトキシカルボニル－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－トリフルオロメチル－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－ヒドロキシメチル－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

［5－（1－ヒドロキシ－1－メチルエチル）－1，3，4－チアジアゾール－2－イル］カルバモイル基、

［5－（（R）－3－ヒドロキシピロリジン－1－カルボニル）－1，3，4－チアジアゾール－2－イル］カルバモイル基、

［5－（4－ヒドロキシピペリジン－1－カルボニル）－1，3，4－チアジアゾール－2－イル］カルバモイル基、

［5－（モルホリン－4－カルボニル）－1，3，4－チアジアゾール－2－イル］カルバモイル基、

（5－アセチル－1，3，4－チアジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（3－メチル－1，2，4－チアジアゾール－5－イル）カルバモイル基、

（1，3，4－オキサジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

（5－エトキシカルボニル－1，3，4－オキサジアゾール－2－イル）カルバモイル基、

ベンジルカルバモイル基、

フェノキシアセチル基、

ベンジルアミノアセチル基、

2－（ピリジン－3－イルアミノ）アセチル基、

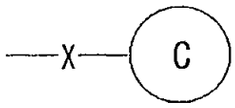
2－（1－メチル－1H－ピラゾール－3－イルアミノ）アセチル基、

2－（5－ブロモ－1，3，4－チアジアゾール－2－イルカルバモイル）アセチル基、

ベンゼンスルホニルアミノカルボニル基

等である。

Rのもう1つの好ましい態様としては、水素原子以外の基であり、特に好ましくは、



である。

（式中、各記号は上記定義の通り。）

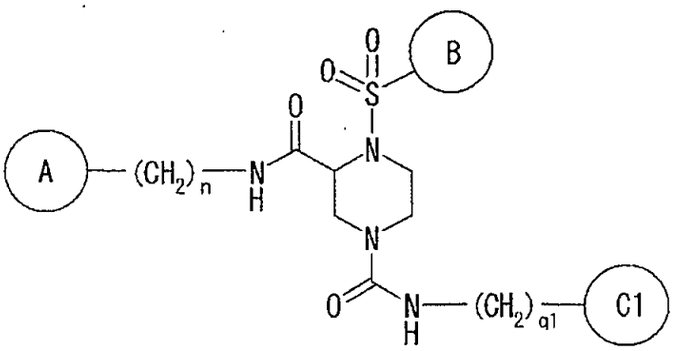
ここで、Xとして好ましくは、

結合、－CO－（CH_2）$_p$－、及び、－CONR^{10}－（CH_2）$_q$－、であり、

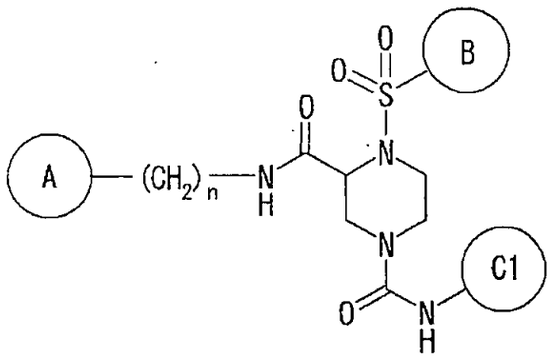
更に好ましくは、結合である。

環Cとして好ましくは、上記定義の「グループAから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基」であり、更に好ましくは、上記定義の「グループA'から選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基」である。

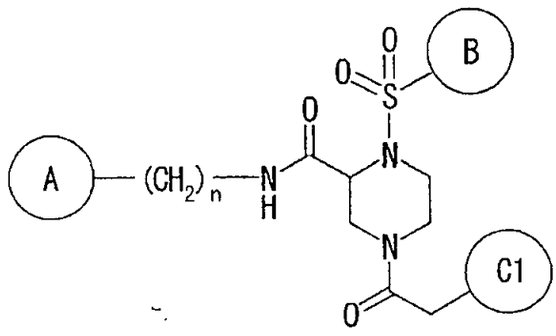
一般式［1］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物として好ましくは、



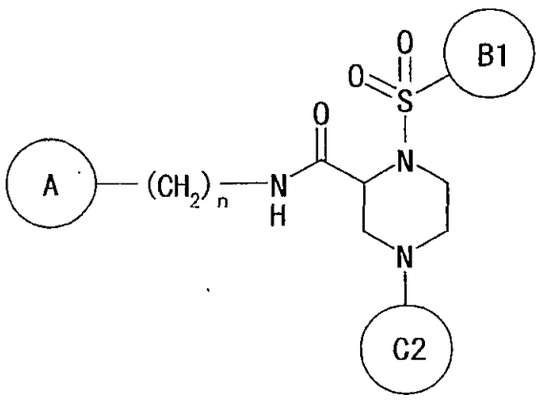
[I-A]



[I-B]



[I-C]



[I-D1]

（式中、各記号は前記定義の通りである。）

で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物であって、特に好ましくは一般式［Ｉ－Ｄ１］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物である。

環Ｃ２として好ましくは、上記「グループＡ’」から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換された上記定義の「単環であるヘテロ環基」であり、「単環であるヘテロ環基」部位として特に好ましくは、チアゾリル基（特に、チアゾール－２－イル）、又は、ピラジニル基（特に、ピラジン－２－イル）である。

ここで、「単環であるヘテロ環基」上の置換基（グループA'）として好ましくは、シアノ基、－COOR^{a6}、－CONR^{a7}R^{a8}、及び、－SO$_2$NR^{a9}R^{a10}であり、更に好ましくは、－COOR^{a6}、及び、－CONR^{a7}R^{a8}である。

環Ｃ２のもう１つの好ましい態様として、上記「グループA'」から選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよい上記定義の「縮合環であるヘテロ環基」が挙げられる。「縮合環であるヘテロ環基」部位として特に好ましくは、二縮合環であるヘテロ環基であり、中でも単環であるヘテロ環と単環であるヘテロ環どうしの縮合環が好ましい。

「縮合環であるヘテロ環基」部位として好ましくは、具体的には、ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－３－イル基、ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、プテリジン－６－イル基、プテリジン－７－イル基、ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、２，２－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロピラジノ［２，３－ｃ］［１，２，６］チアジアジン－７－イル基、２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル基、２－オキソ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、及び、［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル基であり、更に好ましくは、ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－３－イル基、ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、プテリジン－６－イル基、プテリジン－７－イル基、ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル基、１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル基、及び、［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジニル基であり、特に好ましくは、ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル基、及び、プテリジン－７－イル基である。

「縮合環であるヘテロ環基」部位のもう１つの好ましい態様として、

ベンゾチアゾール－２－イル基、

４，５，６，７－テトラヒドロベンゾチアゾール－２－イル基、

チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル基、

チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル基、

チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基、

チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－b］ピラジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

1H－ピラゾロ［3，4－d］チアゾール－5－イル基、

4，6－ジオキソ－5，6－ジヒドロ－4H－ピロロ［3，4－d］チアゾール－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4，7－ジオキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－オキソ－3，4－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

5－オキソ－5H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基、及び、

［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル基が挙げられる。

更に好ましくは、

チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－b］ピラジン－2－イル基、

チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

5－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル基、

4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、

4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

7－オキソ－6，7－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4，7－ジオキソ－4，5，6，7－テトラヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、

4－オキソ－3，4－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル基、

5－オキソ－5H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、

7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基、及び、

4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル基であり、

更により好ましくは、チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル基、チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル基、4－オキソ－4，5－ジヒドロチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル基、及び、7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル基であり、更に好ましくは、チアゾロ［4，5－d］ピリミ

ジン－２－イル基、４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル基、及び、７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル基である。

R^{A1}及びR^{A2}の好ましい態様は、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、$-OR^{a1}$、$-SR^{a2}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-NHCOR^{a5}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、$-SO_2R^{a12}$、

グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A1}の更に好ましい態様は、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-NHCOR^{a5}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、

グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A3}、R^{A4}及びR^{A5}の好ましい態様は、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、$-OR^{a1}$、$-SR^{a2}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-NHCOR^{a5}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、$-SO_2R^{a12}$

グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A3}の更に好ましい態様は、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-COOR^{a6}$、$-COR^{a11}$、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A4}の更に好ましい態様は、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、$-OR^{a1}$、$-SR^{a2}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-NHCOR^{a5}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、$-SO_2R^{a12}$、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A5}の更に好ましい態様は、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-NHCOR^{a5}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A6}及びR^{A7}の好ましい態様は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、$-CONR^{a19}(OR^{a20})$、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}アルキニル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A6}の更に好ましい態様は、水素原子、ハロゲン原子、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、及び、$-CONR^{a7}R^{a8}$である。

R^{A7}の更に好ましい態様は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、$-COR^{a11}$、$-CONR^{a19}(OR^{a20})$、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}ア

ルキニル基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基、及び、

グループCから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基である。

R^{A14}の好ましい態様は、$-OR^{a1}$、$-NR^{a3}R^{a4}$、及び、$-CONR^{a7}R^{a8}$である。

R^{A8}及びR^{A9}の好ましい態様は、水素原子、及び、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基である。

R^{A10}及びR^{A11}の好ましい態様は、水素原子、ハロゲン原子、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、及び、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基である。

R^{A10}の更に好ましい態様は、水素原子、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、及び、

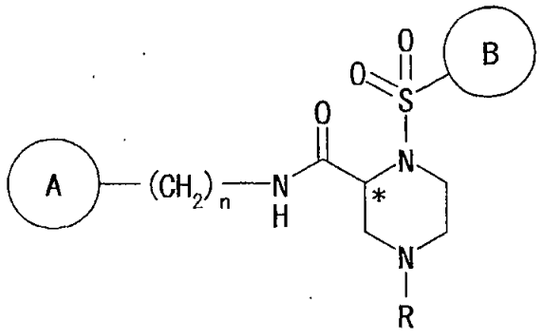
グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基である。

R^{A11}の更に好ましい態様は、水素原子、及び、ハロゲン原子である。

R^{A12}及びR^{A13}の好ましい態様は、水素原子、$-COOR^{a6}$、$-CONR^{a7}R^{a8}$、及び、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基である。

一般式［I］で表される化合物の下記＊部位の炭素原子が、不斉炭素原子である場合、化合物として好ましくは、R体である。



[I]

一般式［Ｉ］で表される化合物の例としては、以下の化合物が挙げられる。

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド塩酸塩（実施例１）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例３）、

（Ｒ）－４－チオカルバモイル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例６）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例７）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，

2’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例８）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（３－ヨード－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１０）、

４－｛５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－トリフルオロメトキシ－フェニル｝－酪酸（実施例１１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－メチル－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例１２）、

２－［（Ｒ）－３－［（６－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例１３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例１４）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド塩酸塩（実施例１５）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－メチル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１６）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－メタンスルホニル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１７）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１８）、

（Ｓ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１９）、

４－アセチル－１－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カル

ボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２０）、
４－アセチル－１－（２－クロロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２１）、
４－アセチル－１－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２２）、
４－アセチル－１－（５－ブロモ－チオフェン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２３）、
４－アセチル－１－ベンゼンスルホニル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２４）、
４－アセチル－１－［４－（４－クロロ－フェノキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２５）、
４－アセチル－１－（４’－クロロ－ビフェニル－４－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２６）、
４－アセチル－１－［２－（４－シアノ－フェノキシ）－３，５－ジメチル－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２７）、
４－アセチル－１－［５－（４－クロロ－フェニル）－チオフェン－２－スルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２８）、
４－アセチル－１－（３－クロロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例２９）、
４－アセチル－１－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例３０）、
４－アセチル－１－（４－アセチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例３１）、
４－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメチル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　メチルエステル（実施例３２）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－クロロ－ベンジルアミド（実施例３３）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－クロロ－ベンジルアミド（実施例３４）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－クロロ－ベンジルアミド（実施例３５）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ビフェニル－４－イルメチル）－アミド（実施例３６）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例３７）、

4－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－スルファモイル－ベンジルアミド（実施例３８）、

4－アセチル－１－（４－アセチルアミノ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例３９）、

4－アセチル－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４０）、

4－アセチル－１－（３，４－ジクロロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４１）、

4－アセチル－１－（ビフェニル－３－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４２）、

4－アセチル－１－［５－（５－トリフルオロメチル－イソオキサゾール－３－イル）－チオフェン－２－スルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４３）、

4－アセチル－１－（４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４４）、

4－アセチル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４５）、

4－アセチル－１－（４－シアノ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例４６）、

4－アセチル－1－（5－ベンゼンスルホニル－チオフェン－2－スルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例47）、

4－アセチル－1－（2，3－ジヒドロ－ベンゾフラン－5－スルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例48)、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　ベンジルアミド（実施例49）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　2－メトキシ－ベンジルアミド（実施例50）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3－メトキシ－ベンジルアミド（実施例51）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－メトキシ－ベンジルアミド（実施例52）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例53）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ブロモ－ベンジルアミド（実施例54）、

4－（2－ヒドロキシ－アセチル）－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例55）、

4－（2－ヒドロキシ－2－メチル－プロピオニル）－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例56）、

1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－4－（2－メトキシ－アセチル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例57）、

4－（3－ヒドロキシ－プロピオニル）－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例58）、

４－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ジメチルアミド　３－（４－トリフルオロメチルーベンジルアミド）（実施例５９）、

４－アセチルー１－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例６０）、

４－アセチルー１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例６１）、

４－アセチルー１－［５－（４－クロローピラゾールー１－イル）－チオフェン－２－スルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例６２）、

４－ホルミルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例６３）、

４－アセチルー１－（トルエン－４－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例６４）、

４－アセチルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド(実施例６５)、

４－アセチルー１－［４－（ピリジン－３－イルオキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド塩酸塩（実施例６６）、

４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－フルオローベンジルアミド（実施例６７）、

４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルアミド（実施例６８）、

４－アセチルー１－（５－ブロモ－６－クローピリジン－３－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド塩酸塩（実施例６９）、

４－アセチルー１－（６－モルホリン－４－イルーピリジン－３－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド塩酸塩（実施例７０）、

４－アセチル－１－（３－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７１）、

４－アセチル－１－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７２）、

４－アセチル－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７３）、

４－アセチル－１－（ベンゾ［ｂ］チオフェン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７４）、

４－アセチル－１－（５－イソプロピル－チオフェン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例７５)、

４－（｛［４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－安息香酸　メチルエステル（実施例７６）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ニトロ－ベンジルアミド（実施例７７）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－ベンジルアミド（実施例７８）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（１Ｈ－インドール－３－イル）－エチル］－アミド（実施例７９）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－モルホリン－４－イル－ベンジルアミド（実施例８０）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－ベンジルアミド（実施例８１）、

３－（４－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例８２）、

４－アセチル－１－（４－イソプロポキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－

２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例８３）、
１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド塩酸塩（実施例８４）、
４－アセチル－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例８５）、
｛２－［３－（４－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－カルバミン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例８６）、
｛３－［３－（４－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－３－オキソ－プロピル｝－カルバミン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例８７）、
４－（２－アミノ－アセチル）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド塩酸塩（実施例８８）、
４－（３－アミノ－プロピオニル）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド塩酸塩（実施例８９）、
４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－アミノ－ベンジルアミド（実施例９０）、
４－アセチル－１－（４－ブチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例９１）、
４－アセチル－１－（４－ジメチルアミノ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例９２）、
４－アセチル－１－（４－アミノ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド塩酸塩（実施例９３）、
［３－（４－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－酢酸　メチルエステル（実施例９４）、
４－（２－ジメチルアミノ－アセチル）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例９

5）、

［3－（4－ジメチルアミノーベンジルカルバモイル）－4－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－酢酸（実施例９６）、

4－アセチルー1－［4－（1，1－ジメチループロピル）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例９７）、

4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（2，2－ジメチループロピオニルアミノ）－ベンジルアミド（実施例９８）、

4－（｛［4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－安息香酸（実施例９９）、

4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3，4－ジクロローベンジルアミド（実施例１００）、

4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　2，4－ジクロローベンジルアミド（実施例１０１）、

1－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－4－（2－ピペリジン－1－イルーアセチル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１０２）、

4－（4，5－ジヒドロ－1H－イミダゾール－2－イル）－1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１０３）、

1－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－4－（2－モルホリン－4－イルーアセチル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１０４）、

4－（2－ベンジルアミノーアセチル）－1－（4－ヨードーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１０５）、

4－［4－アセチルー2－（4－トリフルオロメチルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－安息香酸　メチルエステル（実施例１０６）、

4－［4－アセチル－2－（4－トリフルオロメチル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－安息香酸（実施例１０７）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1－メチル－1Ｈ－ピラゾール－4－イル）－ベンジルアミド（実施例１０８）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ピペリジン－1－イル－ベンジルアミド（実施例１０９）、

4－（2－ジプロピルアミノ－アセチル）－1－（4－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１１０）、

1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－4－チオカルバモイル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例１１１)、

4－（4，5－ジヒドロ－チアゾール－2－イル）－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１２）、

1－（4－ヨード－ベンゼンスルホニル）－4－（3－モルホリン－4－イル－プロピオニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１１３）、

4－（3－ジプロピルアミノ－プロピオニル）－1－（4－ヨード－ベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジメチルアミノ－ベンジルアミド(実施例１１４）、

1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－4－（4－メチル－チアゾール－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１５）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（4’－クロロ－ビフェニル－4－イルメチル）－アミド（実施例１１６）、

4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１１７）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　フェネチル－アミド（実施例１１８）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１９）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１２０）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１２１）、

４－（２－シクロヘキシル－アセチル）－１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１２２）、

４－ベンゾイル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１２３）、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－フェニルアセチル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例１２４)、

１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（２－フェノキシ－アセチル)－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド(実施例１２５）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－フェノキシ－ベンジルアミド（実施例１２６）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロポキシ－ベンジルアミド（実施例１２７）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１２８）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１２９）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－プロピオニル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１３０）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－フェニルアセチル－ピペラジン－

２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１３１）、
４－アセチル－１－（４－ヒドロキシメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３２）、
４－（４，５－ジヒドロ－オキサゾール－２－イル）－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３３）、
４－ベンゾチアゾール－２－イル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３４）、
１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（４－フェニル－チアゾール－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３５）、
４－アセチル－１－（３，４－ジメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１３６）、
（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１３７）、
（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（４－クロロ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例１３８）、
４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロペンチル－ベンジルアミド（実施例１３９）、
４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１－プロピル－ブチル）－ベンジルアミド（実施例１４０）、
４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３’－クロロ－ビフェニル－４－イルメチル）－アミド（実施例１４１）、
４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２’－クロロ－ビフェニル－４－イルメチル）－アミド（実施例１４２）、

４－アセチル－１－（４－メトキシメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１４３）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－エチル－ベンジルアミド（実施例１４４）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３－フェニル－プロピル）－アミド（実施例１４５）、

（Ｒ）－４－カルバモイルメチル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１４６）、

（Ｒ）－４－（２，５－ジオキソ－ピロリジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１４７）、

（Ｒ）－４－（２，５－ジオキソ－４－フェニル－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例１４８）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（２－クロロ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例１４９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（３－クロロ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例１５０）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（６－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメチル）－アミド（実施例１５１）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ピリジン－２－イルメチル）－アミド（実施例１５２）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－（２－ピリジン－２－イル－アセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例１５３）、

１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４－（２－ピリジン－３－イルーアセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１５４）、

４－（８Ｈ－インデノ［１，２－ｄ］チアゾール－２－イル）－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１５５）、

１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－４－（４，５，６，７－テトラヒドローベンゾチアゾール－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１５６）、

（Ｒ）－４－（２－アミノーアセチル）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド塩酸塩（実施例１５７）、

（Ｒ）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４－（２－ピペリジン－１－イルーアセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１５８）、

（Ｒ）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４－（２－ピロリジン－１－イルーアセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１５９）、

（Ｒ）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４－（２－モルホリン－４－イルーアセチル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド（実施例１６０）、

４－アセチルー１－（２，４－ジクロローベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１６１）、

４－アセチルー１－［４－（１－エチループロピル）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１６２）、

４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１－エチループロピル）－ベンジルアミド（実施例１６３）、

４－アセチルー１－（ナフタレン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン

酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１６４）、

４－アセチルー１－（３－ブロモーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１６５）、

３－｛４－［４－アセチルー２－（４－トリフルオロメチルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－フェニル｝－プロピオン酸　メチルエステル（実施例１６６）、

４－アセチルー１－（４－シクロヘキシルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１６７）、

３－［４－アセチルー２－（４－トリフルオロメチルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－安息香酸（実施例１６８）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（２－ヒドロキシー１，１－ジメチルーエチル）－ベンジルアミド（実施例１６９）、

２－［４－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメチルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例１７０）、

２－［４－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメチルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例１７１）、

（Ｒ）－４－フェニルアセチルー１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１７２）、

４－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－オキソ－酪酸　メチルエステル（実施例１７３）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－５－オキソ－ペンタン酸　メチルエステル（実施例１７４）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－３－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメ

チルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１７５）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド(実施例１７６)、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－エチルアミド　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）（実施例１７７）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）　１－フェニルアミド（実施例１７８）、

（Ｒ）－４－（４，５－ジヒドローチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１７９）、

（Ｒ）－４－（２－モルホリン－４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１８０）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－［（２－ヒドロキシ－エチル）－メチルーアミノ］－ベンジルアミド（実施例１８１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ブロモ－２－クローベンジルアミド(実施例１８２)、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－クロロ－４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１８３）、

（Ｒ）－４－（４－メチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１８４）、

（Ｒ）－４－（２－アセチルアミノーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベン

ジルアミド（実施例１８５）、

｛３－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－３－オキソープロピル｝－カルバミン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例１８６）、

４－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－オキソ－酪酸（実施例１８７）、

（Ｒ）－４－（３－アセチルアミノープロピオニル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１８８）、

（Ｒ）－４－（３－アミノープロピオニル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド塩酸塩（実施例１８９）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－５－オキソ－ペンタン酸（実施例１９０）、

（Ｒ）－４－ベンゾチアゾールー２－イルー１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１９１）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－エトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１９２）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－プロポキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１９３）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－イソブチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１９４）、

（Ｒ）－４－（２－１Ｈ－イミダゾールー４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例１９５）、

４－アセチルー１－シクロヘキサンスルホニルーピペラジン－２－カルボン酸　４

－トリフルオロメチルーベンジルアミド（実施例１９６）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２，４－ジメトキシーベンジルアミド（実施例１９７）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３，４－ジメトキシーベンジルアミド（実施例１９８）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－酪酸（実施例１９９）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－［（４－ジメチルアミノーフェニル）－アミド］　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）（実施例２００）、

（Ｒ）－４－（ピリジン－４－カルボニル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０１）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（メチループロピルーアミノ）－ベンジルアミド（実施例２０２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（５，６，７，８－テトラヒドローナフタレン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（インダン－５－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０４）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０５）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０６）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２０７）、

（R）－４－アセチル－１－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド(実施例２０８)、

（R）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド二塩酸塩（実施例２０９）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メチル－ベンジルアミド（実施例２１０）、

（R）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－３－イルアミド（実施例２１１）、

６－［（R）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６－オキソ－ヘキサン酸　メチルエステル（実施例２１２）、

６－［（R）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６－オキソ－ヘキサン酸（実施例２１３）、

（R）－４－アセチル－１－（４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２１４）、

（R）－４－アセチル－１－（３－イソプロピル－４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２１５）、

（R）－４－アセチル－１－（３－クロロ－４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２１６）、

｛５－［（R）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－メトキシ－フェニル｝－酢酸　メチルエステル（実施例２１７）、

３－｛５－［（R）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－メトキシ－フェニル｝－プロピオン酸　メチルエステル（実施例２１８）、

（R）－4－（2－イミダゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２１９）、

（R）－4－（2－［1，2，3］トリアゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２２０）、

｛5－［（R）－4－アセチル－2－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－2－メトキシ－フェニル｝－酢酸（実施例２２１）、

3－｛5－［（R）－4－アセチル－2－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－2－メトキシ－フェニル｝－プロピオン酸（実施例２２２）、

2－［4－（｛［（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－フェニル］－2－メチル－プロピオン酸　メチルエステル（実施例２２３）、

（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（2－ヒドロキシ－エチル）－ベンジルアミド（実施例２２４）、

（R）－4－（2－アミノ－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド塩酸塩（実施例２２５）、

（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ヒドロキシメチル－ベンジルアミド(実施例２２６)、

（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－メチルスルファニル－ベンジルアミド(実施例２２７)、

（R）－4－（2－ピラゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２２８）、

（R）－4－（2－［1，2，4］トリアゾール－1－イル－アセチル）－1－（4

－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２２９）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，４］トリアゾール－４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２３０）、

２－［４－（｛［（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－フェニル］－２－メチループロピオン酸（実施例２３１）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－エチルーベンジルアミド（実施例２３２）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１－ジメチルカルバモイルー１－メチルーエチル）－ベンジルアミド（実施例２３３）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１－ヒドロキシメチルーシクロプロピル）－ベンジルアミド（実施例２３４）、

５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－メトキシー安息香酸　メチルエステル（実施例２３５）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（３－エチル－４－メトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２３６）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－［４－（２，２－ジメチループロピル）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２３７）、

｛４－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－フェノキシ｝－酢酸　メチルエステル（実施例２３８）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（３－シアノ－４－メトキシーベンゼンスルホニル）

－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２３９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（３－ｔｅｒｔ－ブチル－４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２４０）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（３－シクロペンチル－４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２４１）、

（Ｒ）－４－（２－［１，２，３］トリアゾール－２－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２４２）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ベンジルアミド　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）（実施例２４３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例２４４）、

（４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸　エチルエステル（実施例２４５）、

（４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸（実施例２４６）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－エチル－ベンジルアミド（実施例２４７）、

５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－メトキシ－安息香酸（実施例２４８）、

｛４－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－フェノキシ｝－酢酸（実施例２４９）、

3－｛4－［（R）－4－アセチル－2－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－スルホニル］－フェノキシ｝－プロピオン酸　メチルエステル（実施例２５０）、

（R）－4－アセチル－1－（4－ヒドロキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２５１）、

N－｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－2－オキソ－エチル｝－スクシンアミド酸　メチルエステル（実施例２５２）、

（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド(実施例２５３)、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸　メチルエステル（実施例２５４）、

｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－イル｝－酢酸　メチルエステル（実施例２５５）、

（3－｛［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸　エチルエステル（実施例２５６）、

（R）－4－（2－テトラゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２５７）、

（R）－4－（2－シアノ－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２５８）、

｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－4－イル｝－酢酸（実施例２５９）、

（3－｛［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4

－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸（実施例２６０）、

（Ｒ）－４－（２－１Ｈ－テトラゾール－５－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６１）、

（Ｒ）－４－（２－アミノーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノーベンジルアミド二塩酸塩（実施例２６２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（３－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゾシクロヘプテン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６４）、

（Ｒ）－４－ベンゼンスルホニルアミノカルボニル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６５）、

（Ｒ）－４－［２－（４－メトキシーフェニル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６６）、

（Ｒ）－４－［２－（２－メトキシーフェニル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６７）、

（Ｒ）－４－［２－（３－メトキシーフェニル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例２６８）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－［（２－クロローフェニル）－アミド］　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）（実施例２６９）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，

3－ジカルボン酸　1－［（3－クロロ－フェニル）－アミド］　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）（実施例２７０）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（4－クロロ－フェニル）－アミド］　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）（実施例２７１）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［（2－メトキシ－フェニル）－アミド］（実施例２７２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［（3－メトキシ－フェニル）－アミド］（実施例２７３）、

N－｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－2－オキソ－エチル｝－スクシンアミド酸（実施例２７４）、

3－｛［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸　メチルエステル（実施例２７５）、

4－｛［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸　メチルエステル（実施例２７６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［（4－メトキシ－フェニル）－アミド］（実施例２７７）、

（R）－4－（2－テトラゾール－2－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２７８）、

（R）－4－（2－メトキシ－アセチル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２７９）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例２８０）、

（３－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸　エチルエステル（実施例２８１）、

（３－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－フェノキシ）－酢酸（実施例２８２）、

３－｛５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－チオフェン－２－イル｝－プロピオン酸（実施例２８３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－［４－（２，２，２－トリフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２８４）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸（実施例２８５）、

３－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸（実施例２８６）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（５－プロピル－チオフェン－２－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド(実施例２８７)、

（Ｒ）－４－アセチル－１－［４－メトキシ－３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２８８）、

｛５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－チオフェン－２－イル｝－酢酸(実施例２８９)、

［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－オキソ－酢酸　エ

チルエステル（実施例２９０）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－２－メチル－ベンジルアミド（実施例２９１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－フルオロ－４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例２９２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－エチル）－ベンジルアミド（実施例２９３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例２９４）、

（Ｒ）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例２９５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例２９６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例２９７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例２９８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例２９９）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリミジン

－４－イルアミド（実施例３００）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－２－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３０１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例３０２）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸メチルエステル（実施例３０３）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イルーエチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３０４）、

５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－トリフルオロメトキシ－安息香酸（実施例３０５）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（２，２，３，３－テトラフルオロ－２，３－ジヒドローベンゾ［１，４］ジオキシン－６－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３０６）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（１－メチル－１，２，３，４－テトラヒドローキノリン－７－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３０７）、

（Ｒ）－４－アミノオキサリル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３０８）、

（２－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例３０９）、

（２－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－２Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸（実施例３１０）、

（１－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－１Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例３１１）、

（１－｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチル｝－１Ｈ－テトラゾールー５－イル）－酢酸（実施例３１２）、

（Ｒ）－４－カルバムイミドイルー１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド塩酸塩（実施例３１３）、

４－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－２－カルボン酸塩酸塩（実施例３１４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３１５）、

７－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－ヘプタン酸　エチルエステル（実施例３１６）、

７－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－ヘプタン酸（実施例３１７）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例３１８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プ

ロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３１９）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３２０）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－エチル－２－メチルーベンジルアミド(実施例３２１)、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３２２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－２－メチルーベンジルアミド（実施例３２３）、

３－｛５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－トリフルオロメトキシーフェニル｝－プロピオン酸（実施例３２４）、

４－ヒドロキシ－２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリミジン－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例３２５）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３２６）、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３２７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾールー５－カルボン酸（実施例３２８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プ

ロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３２９）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例３３０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３３１）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）　１－［１，３，４］チアジアゾール－２－イルアミド（実施例３３２）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３３３）、

５－｛［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－［１，３，４］オキサジアゾール－２－カルボン酸　エチルエステル（実施例３３４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３３５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーピリミジン－５－カルボン酸　ベンジルエステル（実施例３３６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーピリミジン－５－カルボン酸　メチルエステル（実施例３３７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル

－ピリミジン－５－カルボン酸（実施例３３８）、

４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３３９）、

（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３４０）、

４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３４１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリミジン－５－カルボン酸（実施例３４２）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ジメチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３４３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３４４）、

（Ｒ）－４－（２－オキソ－ピロリジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３４５）、

１－（４－ヨード－ベンゼンスルホニル）－４－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－アセチル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例３４６）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例３４７）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，

3－ジカルボン酸　3－（4－イソプロピル－ベンジルアミド）　1－［1，3，4］オキサジアゾール－2－イルアミド（実施例３４８）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－イソニコチン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３４９）、

4－（4－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－アミド　3－（4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド）（実施例３５０）、

4－アセチル－1－（3，5－ジクロロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例３５１）、

（R）－4－（1－メチル－1H－イミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５２）、

（R）－4－（1H－イミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５３）、

（R）－4－（4－メチル－5－メチルカルバモイル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５４）、

（R）－4－（5－ジメチルカルバモイル－4－メチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例３５５）、

2－［（R）－3－（4－シクロプロピル－2－メチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－メチル－チアゾール－5－カルボン酸（実施例３５６）、

4－ヒドロキシ－2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリミジン－5－カルボン酸（実施例３５７）、

（｛2－［（R）－3－（4－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4

ートリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝ーアミノ）ー酢酸　ｔｅｒｔーブチルエステル（実施例３５８）、

３－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝ーアミノ）ープロピオン酸　ｔｅｒｔーブチルエステル（実施例３５９）、

（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝ーアミノ）ー酢酸（実施例３６０）、

３－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝ーアミノ）ープロピオン酸（実施例３６１）、

（Ｒ）－４－（５－ニトロー２Ｈー［１，２，４］トリアゾールー３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー２ーカルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３６２）、

４－エチルー２－［（Ｒ）－３－（２－メチルー４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］ーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３６３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルー２－メチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３６４）、

４－メチルー２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジンー１ーイル］ーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３６５）、

２－［（Ｒ）－３－（４－エチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー１ーイル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３６６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例３６７）、

（Ｒ）－４－（５－アミノ－２Ｈ－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３６８）、

（Ｒ）－２－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸（実施例３６９）、

（Ｓ）－２－（｛２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾールー５－カルボニル｝－アミノ）－プロピオン酸（実施例３７０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーオキサゾールー５－カルボン酸トリフルオロ酢酸塩（実施例３７１）、

（Ｒ）－４－（５－ブロモ－２Ｈ－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３７２）、

（Ｒ）－４－（２Ｈ－［１，２，４］トリアゾール－３－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例３７３）、

（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例３７４）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（２－プロピルーチアゾールー５－スルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド(実施例３７５)、

６－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－ト

リフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸（実施例３７６）、

（R）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－アミド　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）（実施例３７７）、

４－メチル－２－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例３７８）、

２－［（R）－３－（４－ジメチルアミノーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸塩酸塩（実施例３７９）、

２－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（５－プロピルーチオフェン－２－スルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３８０）、

２－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（６，７，８，９－テトラヒドロ－５H－ベンゾシクロヘプテン－２－スルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３８１）、

３－｛２－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－イル｝－プロピオン酸（実施例３８２）、

２－［（R）－３－（４－シクロプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３８３）、

｛２－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソーエチルアミノ｝－酢酸塩酸塩（実施例３８４）、

（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例３８５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロー2H－［1，2’］ビピラジニルー5’－カルボン酸（実施例３８６）、

2－［（R）－3－［（6－ジメチルアミノーピリジンー3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－4－メチルーチアゾールー5－カルボン酸（実施例３８７）、

4－メチルー2－［（R）－3－［（6－プロピルーピリジンー3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾールー5－カルボン酸（実施例３８８）、

2－［（R）－3－［（6－アゼチジンー1－イルーピリジンー3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－4－メチルーチアゾールー5－カルボン酸（実施例３８９）、

4－メチルー2－［（R）－3－［（6－ピロリジンー1－イルーピリジンー3－イルメチル）－カルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾールー5－カルボン酸（実施例３９０）、

3－｛2－［（R）－3－（4－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－2－オキソーエチルアミノ｝－プロピオン酸塩酸塩（実施例３９１）、

（R）－4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボン酸［2－（4－メトキシーフェニル）－エチル］－アミド（実施例３９２）、

4－（2－｛［（R）－4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボニル］－アミノ｝－エチル）－安息香酸（実施例３９３）、

2－［（R）－3－（4－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－4－メトキシメチルーチアゾールー5－カルボン酸（実施例３９４）、

（R）－4－アセチルー1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボン酸（2－ピリジンー4－イルーエチル）－アミド（実施例3

９５）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－ピリジン－２－イルーエチル）－アミド（実施例３９６）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－ピリジン－３－イルーエチル）－アミド（実施例３９７）、

２－［（Ｒ）－３－（４－アゼチジン－１－イルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例３９８）、

（Ｒ）－３－（４－ジメチルアミノーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例３９９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－シクロプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド（実施例４００）、

２－［（Ｒ）－３－ベンジルカルバモイル－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例４０１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－ピペリジン－１－イルーエチル）－アミド（実施例４０２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－モルホリン－４－イルーエチル）－アミド（実施例４０３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３－モルホリン－４－イループロピル）－アミド（実施例４０４）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３－ピロリジン－１－イループロピル）－アミド（実施

例４０５）、

（R）－４－（５－カルバモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４０６）、

（R）－３－［（６－ジメチルアミノ－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４０７）、

（R）－３－［（６－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４０８）、

（R）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例４０９）、

（R）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジメチルアミノ－ベンジルアミド（実施例４１０）、

（R）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４１１）、

（R）－４－（２－ピリジン－４－イル－アセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例４１２）、

４－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－安息香酸（実施例４１３）、

２－［（R）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１４）、

（R）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４１５）、

４－メチル－２－［（R）－３－（４－ピロリジン－１－イル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１６）、

６－［（R）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸（実施例４１７）、

４－メチル－２－［（R）－３－フェネチルカルバモイル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４１８）、

（R）－４－アセチル－１－（４－ブロモ－２－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４１９）、

（R）－６’－アミノ－３’－クロロ－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４２０）、

（R）－６’－ブロモ－３’－クロロ－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４２１）、

（R）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－３’，６’－ジメチル－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４２２）、

（R）－６’－アミノ－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施

例４２３）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４２４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ジエチルアミノ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４２５）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４２６）、

４－クロロ－５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４２７）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－シクロプロピルメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４２８）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（２－フルオロ－４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４２９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４３０）、

（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－３’－メチル－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例４３１）、

（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４３２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラ

ジン－２－カルボン酸　［２－（１Ｈ－イミダゾール－４－イル）－エチル］－アミド塩酸塩（実施例４３３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－５－メチル－チアゾール－４－カルボン酸（実施例４３４）、

（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゼンシクロヘプテン－２－スルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４３５）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－プロピル－ベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド（実施例４３６）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－プロピル－ベンジルアミド）　１－［１，３，４］チアジアゾール－２－イルアミド（実施例４３７）、

（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（５－プロピル－チオフェン－２－スルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４３８）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４３９）、

（Ｒ）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４０）、

（Ｒ）－３－（２－メチル－４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４１）、

２－［（Ｒ）－３－（４－エトキシ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－

チアゾール－５－カルボン酸（実施例４４２）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例４４４）、

５－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－カルボン酸（実施例４４５）、

（Ｒ）－４－（５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４４６）、

（Ｒ）－４－（５－メタンスルホニルアミノカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４４７）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４４８）、

（Ｒ）－６’－メチル－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例４４９）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例４５０）、

２－［（Ｒ）－３－（４－メトキシメチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例４５１）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシメチル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボ

ン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５２）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－トリフルオロメチルーチアゾールー５－カルボン酸（実施例４５３）、

（Ｒ）－４－（６－ヒドロキシー５－メチルーピリダジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５４）、

（２－｛２－オキソ－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－エチル｝－２Ｈ－テトラゾール－５－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例４５５）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチルーテトラゾールー１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５６）、

（Ｒ）－４－［２－（５－メチルーテトラゾールー２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５７）、

（Ｒ）－４－（５－アミノーピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４５８）、

（Ｒ）－４－アセチルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４５９）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー２－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４６０）、

（Ｒ）－４－（２－テトラゾールー１－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例４６１）、

（R）－4－（2－イミダゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例462）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－（メチル－ピリジン－4－イル－アミド）　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）（実施例463）、

（R）－4－（2－テトラゾール－1－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例464）、

（2－｛2－オキソ－2－［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－エチル｝－2H－テトラゾール－5－イル）－酢酸（実施例465）、

（2－｛2－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－2－オキソ－エチル｝－2H－テトラゾール－5－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例466）、

（R）－4－［2－（5－メチル－テトラゾール－1－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例467）、

（R）－4－［2－（5－メチル－テトラゾール－2－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例468）、

（R）－4－アセチル－1－（4－ブロモ－3－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例469）、

（2－｛［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－チアゾール－4－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例470）、

（R）－5’－アミノ－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－

3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例４７１）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例４７２）、

（R）－3－（4－メトキシメチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例４７３）、

（R）－3－（2－クロロ－4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例４７４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－｛［4－（2－モルホリン－4－イル－2－オキソ－エチル）－チアゾール－2－イル］－アミド｝　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）（実施例４７５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－｛［4－（2－ヒドロキシ－エチル）－チアゾール－2－イル］－アミド｝　3－（4－プロピル－ベンジルアミド）（実施例４７６）、

5－｛［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－［1，3，4］チアジアゾール－2－カルボン酸エチルエステル（実施例４７７）、

（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－5’－ヒドロキシメチル－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例４７８）、

（R）－4－［2－（5－フェニル－テトラゾール－2－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例４７９）、

（R）－4－［2－（3－メチル－イソオキサゾール－5－イル）－アセチル］－

1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４８０）、

（R）－4－アセチル－1－（4－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－フラン－3－イルーベンジルアミド（実施例４８１）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－ヒドロキシメチルー［1，3，4］チアジアゾールー2－イル）－アミド］（実施例４８２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（5－アセチルー［1，3，4］チアジアゾールー2－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例４８３）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（1－ヒドロキシ－1－メチルーエチル）－［1，3，4］チアジアゾールー2－イル］－アミド｝（実施例４８４）、

（R）－3－（2－クロロ－4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニルー5’－カルボン酸（実施例４８５）、

4－メチル－6－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリダジン－3－カルボン酸　メチルエステル（実施例４８６）、

4－メチル－6－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリダジン－3－カルボン酸（実施例４８７）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－メチルー［1，3，4］チアジアゾールー2－イル）－アミド］（実施例４８８）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－［（５－トリフルオロメチルー［１，３，４］チアジアゾールー２－イル）－アミド］（実施例４８９）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－［（２－メトキシーピリジン－４－イル）－アミド］（実施例４９０）、

４－｛［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－２－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例４９１）、

（R）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－［１，２，３］チアジアゾール－４－イルーベンジルアミド（実施例４９２）、

｛４－［（R）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピラゾール－１－イル｝－酢酸（実施例４９３）、

４－メチル－６－［（R）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸　アミド（実施例４９４）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－｛［５－（（R）－３－ヒドロキシーピロリジン－１－カルボニル）－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル］－アミド｝（実施例４９５）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－｛［５－（４－ヒドロキシーピペリジン－１－カルボニル）－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル］－アミド｝（実施例４９６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－｛［5－（モルホリン－4－カルボニル）－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル］－アミド｝（実施例４９７）、

（R）－4－［2－（1－メチル－1H－イミダゾール－4－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例４９８）、

4－メチル－2－［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（3－プロピル－4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例４９９）、

（R）－4－（2－ピリジン－4－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５００）、

（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例５０１）、

4－｛［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－ピリジン－2－カルボン酸（実施例５０２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－カルバモイル－ピリジン－4－イル）－アミド］　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例５０３）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－ジメチルカルバモイル－ピリジン－4－イル）－アミド］（実施例５０４）、

（R）－4－（5－ジメチルアミノメチル－4－メチル－チアゾール－2－イル）

－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５０５）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－メチルアミノメチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５０６）、

（Ｒ）－６’－アミノ－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例５０７）、

（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５０８）、

２－［（Ｒ）－４－（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸（実施例５０９）、

（Ｒ）－４－（４－ヒドロキシメチルーチアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５１０）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－［（２－ヒドロキシメチルーピリジン－４－イル）－アミド］（実施例５１１）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－［（２－シクロプロピルカルバモイルーピリジン－４－イル）－アミド］　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例５１２）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－｛［２－（モルホリン－４－カルボニル）－ピリジン－４－イル］

ーアミド｝（実施例５１３）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－｛［２－（ピロリジン－１－カルボニル）－ピリジン－４－イル］－アミド｝（実施例５１４）、

（R）－６’－アセチルアミノ－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２H－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル（実施例５１５）、

（R）－４－（５－オキソ－４，５－ジヒドロ－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５１６）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－［（２－クロロ－ピリジン－４－イル）－アミド］　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］（実施例５１７）、

（R）－４－［２－（２－メチル－２H－テトラゾール－５－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５１８）、

（R）－４－［２－（１－メチル－１H－テトラゾール－５－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５１９）、

（R）－４－（チアゾール－４－カルボニル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５２０）、

（R）－４－（５－メチル－イソオキサゾール－３－カルボニル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５２１）、

（R）－4－（5－エチル－チオフェン－2－スルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例５２２）、

（R）－4－（5－メチル－1H－ピラゾール－3－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－イソプロピル－ベンジルアミド（実施例５２３）、

（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例５２４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－チアゾール－4－イルアミド（実施例５２５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（5－メチル－イソオキサゾール－3－イル）－アミド］（実施例５２６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチル－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－アミド］（実施例５２７）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチル－イソオキサゾール－5－イル）－アミド］（実施例５２８）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５２９）、

（R）－5’－アミノ－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボ

ン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５３０）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－ピロリジン－１－イルメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５３１）、

（５－｛２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－テトラゾール－２－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例５３２）、

（５－｛２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－２－オキソ－エチル｝－テトラゾール－１－イル）－酢酸　エチルエステル（実施例５３３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－４Ｈ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－５－カルボン酸　ベンジルエステル（実施例５３４）、

５－ヒドロキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－プロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３５）、

５－メトキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３６）、

５－ヒドロキシメチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－４－カルボン酸（実施例５３７）、

（Ｒ）－５’－ジメチルアミノメチル－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５３８）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－

１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　１－［１，２，４］トリアゾール－４－イルアミド（実施例５３９）、

（Ｒ）－４－（３－アミノ－［１，２，４］トリアゾール－１－カルボニル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４０）、

（Ｒ）－４－［２－（５－イソプロピル－テトラゾール－１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４１）、

（Ｒ）－４－［２－（５－イソプロピル－テトラゾール－２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４２）、

（Ｒ）－４－｛２－［５－（２－モルホリン－４－イル－２－オキソ－エチル）－テトラゾール－２－イル］－アセチル｝－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５４３）、

（Ｒ）－５’－メタンスルホニルアミノ－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４４）、

（Ｒ）－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５４５）、

（Ｒ）－４－（６－ヒドロキシ－ピリダジン－３－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例５４６）、

６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリダジン－３－カルボン酸　アミド（実施例５４７）、

（R）－4－（5－メチル－4，5，6，7－テトラヒドロ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例548）、

（R）－6’－アミノ－5’－ヒドロキシメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド(実施例549)、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ペンタフルオロエチル－ベンジルアミド（実施例550）、

（R）－4－［2－（5－メチル－テトラゾール－2－イル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ペンタフルオロエチル－ベンジルアミド（実施例551）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（5－メチル－［1，3，4］チアジアゾール－2－イル）－アミド］　3－（4－ペンタフルオロエチル－ベンジルアミド）（実施例552）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（3－メチル－イソチアゾール－5－イル）－アミド］（実施例553）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－チアゾール－2－イルアミド（実施例554）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－トリフルオロメチル－ピリジン－4－イル）－アミド］（実施例555）、

（R）－4－（2－オキソ－1，4－ジヒドロ－2H－ピラジノ［2，3－d］［1，

3］オキサジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５５６）、

（Ｒ）－４－（４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５５７）、

（Ｒ）－５’－ピロリジン－１－イルメチル－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルアミド（実施例５５８）、

（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例５５９）、

（Ｒ）－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例５６０）、

（Ｒ）－４－（５－ベンジル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５６１）、

（Ｒ）－４－（４，５－ビス－ヒドロキシメチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５６２）、

（Ｒ）－４－（３－メチル－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピルーベンジルアミド（実施例５６３）、

（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２

H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例５６４）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（1H－［1，2，4］トリアゾール－3－イル）－アミド］（実施例５６５）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2H－テトラゾール－5－イル）－アミド］（実施例５６６）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（2－メチル－チアゾール－4－イル）－アミド］（実施例５６７）、

（R）－4－（5－アミノ－3－メチル－［1，2，4］トリアゾール－1－カルボニル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５６８）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］　1－［（1－メチル－1H－ピラゾール－3－イル）－アミド］（実施例５６９）、

（R）－4－（5－ヒドロキシメチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７０）、

（R）－4－（6－クロロ－ピリミジン－4－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７１）、

（R）－4－ピリミジン－4－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７２）、

（R）－4－（4，6－ジオキソ－5，6－ジヒドロ－4H－ピロロ［3，4－d］チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７３）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例５７４）、

（R）－6’－アミノ－5’－ヒドロキシメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７５）、

（R）－4－（3－メチル－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５７６）、

（R）－4－（5－シアノ－4－メチル－チアゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７７）、

（R）－4－（4－オキソ－4，5，6，7－テトラヒドロ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７８）、

（R）－4－（2－オキソ－1，4－ジヒドロ－2H－ピラジノ［2，3－d］［1，3］オキサジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５７９）、

（R）－4－ピリミジン－4－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８０）、

（R）－4－（2－ヒドロキシ－ピリミジン－4－イル）－1－（4－トリフルオ

ロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５８１）、

４－アミノ－２－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例５８２）、

（Ｒ）－４－［４－メチル－５－（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－チアゾール－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５８３）、

（Ｒ）－４－（２－アミノ－ピリミジン－４－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８４）、

（Ｒ）－４－（４－アミノ－ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５８５）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－アミド　３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド］（実施例５８６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－４Ｈ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例５８７）、

（Ｒ）－４－（４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５８８）、

（Ｒ）－４－（５－アセチル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５８９）、

（R）－4－（2－ピリミジン－4－イル－アセチル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９０）、

（R）－5’－シアノ－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９１）、

（R）－5’－（1H－テトラゾール－5－イル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９２）、

（R）－5’－モルホリン－4－イルメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９３）、

（R）－5’－（4－メチル－ピペラジン－1－イルメチル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９４）、

（R）－5’－ジメチルアミノメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９５）、

（R）－4－（3－アセチルアミノ－［1，2，4］チアジアゾール－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例５９６）、

（R）－4－（4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例５９７）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－ピリジン－２－イル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例５９８）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－チオフェン－２－イル－チアゾール－４－イルメチル）－アミド（実施例５９９）、

（R）－４－（５－メタンスルホニル－４，５，６，７－テトラヒドロ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６００）、

２－［（R）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－４Ｈ－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－５－カルボン酸　エチルアミド（実施例６０１）、

（R）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド(実施例６０２)、

２－［（R）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－ヒドロキシメチル－チアゾール－５－カルボン酸（実施例６０３）、

（R）－６’－アミノ－５’－ヒドロキシメチル－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６０４）、

（R）－４－（６－アミノ－ピリミジン－４－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６０５）、

（R）－４－（３－メトキシ－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン

酸’４－ｔｅｒｔ－ブチルーベンジルアミド（実施例６０６）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－チアゾール－５－イルアミド（実施例６０７）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシーベンジルアミド（実施例６０８）、

（Ｒ）－４－イソブチリル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６０９）、

（Ｒ）－４－シクロプロパンカルボニル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６１０）、

（Ｒ）－４－（２，２－ジメチル－プロピオニル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６１１）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド］　１－｛［４－（１－ヒドロキシ－１－メチル－エチル）－チアゾール－２－イル］－アミド｝（実施例６１２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ヒドロキシーベンジルアミド（実施例６１３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－フェニル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例６１４）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６１５）、

（Ｒ）－４－（２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラジノ［２，３－ｄ］［１，３］オキサジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホ

ニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６１６）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６１７）、

（Ｒ）－４－（４－オキソ－３，４－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６１８）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルアミド（実施例６１９）、

５－［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリジン－２－カルボン酸（実施例６２０）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－ヒドロキシ－シクロヘキシルメチル）－アミド（実施例６２１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（［２，２’］ビチオフェニル－５－イルメチル）－アミド（実施例６２２）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－チオフェン－２－イル－ベンジルアミド（実施例６２３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－ヒドロキシ－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例６２４）、

（Ｒ）－４－（３－メトキシ－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン

酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６２５）、
（R）－4－［1，2，4］トリアゾロ［1，5－a］ピリミジン－5－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６２６）、
（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例６２７）、
（R）－4－（2－オキソ－2，3－ジヒドロ－1H－イミダゾ［4，5－b］ピラジン－5－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例６２８）、
（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－クロロ－ベンジルアミド（実施例６２９）、
（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ--ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（6－ジメチルアミノ－ピリジン－3－イルメチル）－アミド（実施例６３０）、
5－［（R）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリジン－2－カルボン酸（実施例６３１）、
（R）－4－キノキサリン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６３２）、
（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６３３）、
（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（2－オキソ－1－プロピル－1，2－ジヒドロ－ピリジン－4－イルメチル）－アミド（実施例６３４）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3－アミノ－4－プロピル－ベンジルアミド（実施例６３５）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3－メトキシ－ベンジルアミド(実施例６３６)、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　3－ヒドロキシ－ベンジルアミド(実施例６３７)、

（R）－6’－アミノ－5’－アミノメチル－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６３８）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（ベンゾオキサゾール－2－イルメチル）－アミド（実施例６３９）、

（R）－4－（4－オキソ－3，4－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４０）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（シアノ－ジメチル－メチル）－ベンジルアミド（実施例６４１）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（ビフェニル－2－イルメチル）－アミド（実施例６４２）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　シクロヘキシルメチル－アミド(実施例６４３)、

4－（｛［（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－ピペリジン－1－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例６４４）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－ヒドロキシ－４－メトキシ－ベンジルアミド（実施例６４５）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－オキソ－６－プロピル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イルメチル）－アミド（実施例６４６）、

（R）－４－（６－ヒドロキシ－［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４７）、

（R）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６４８）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（６－メトキシ－５－メチル－ピリジン－２－イルメチル）－アミド（実施例６４９）、

（R）－４－（２，２－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－２λ^{6}－ピラジノ［２，３－ｃ］［１，２，６］チアジアジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６５０）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－エトキシ－ベンジルアミド（実施例６５１）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－チオフェン－２－イル－ベンジルアミド（実施例６５２）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ブロモ－ベンジルアミド（実施例６５３）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ピペリジン－４－イルメチル）－アミド　塩酸塩（実施例６５４）、

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ブロモ－ベンジルアミド（実施例６５５）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピル－ベンジルアミド（実施例６５６）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシメチル－ベンジルアミド（実施例６５７）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシ－ベンジルアミド（実施例６５８）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（［２，２’］ビチオフェニル－５－イルメチル）－アミド（実施例６５９）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例６６０）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メチルスルファニル－ベンジルアミド（実施例６６１）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－プロピル－１，２，３，６－テトラヒドロ－ピリジン－４－イルメチル）－アミド（実施例６６２）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ビフェニル－４－イルメチル）－アミド（実施例６６３）、

（R）－4－（4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６６４）、

（Z）－4－［（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－オキソ－ブター2－エン酸（実施例６６５）、

（Z）－4－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－オキソ－ブター2－エン酸（実施例６６６）、

（E）－4－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－オキソ－ブター2－エン酸（実施例６６７）、

（E）－4－［（R）－3－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－4－オキソ－ブター2－エン酸（実施例６６８）、

ｔｒａｎｓ－4－（｛［（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボニル］－アミノ｝－メチル）－シクロヘキサンカルボン酸（実施例６６９）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（1－アセチル－ピペリジン－4－イルメチル）－アミド（実施例６７０）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　［2－（2－メトキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６７１）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　［2－（3－メトキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６７２）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）

－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（４－メトキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６７３）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（３－ヒドロキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６７４）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（４－ヒドロキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６７５）、

（Ｒ）－４－（１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｂ］ピラジン－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６７６）、

｛［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボニル］－アミノ｝－酢酸（実施例６７７）、

３－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－３－オキソ－プロピオン酸（実施例６７８）、

［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－オキソ－酢酸（実施例６７９）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－オキソ－１－プロピル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－４－イルメチル）－アミド（実施例６８０）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－プロピル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド（実施例６８１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　［２－（２－ヒドロキシ－フェニル）－エチル］－アミド（実施例６８２）、

（R）－１－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８３）、

（R）－４－（６－ブロモ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８４）、

（R）－４－（７－ブロモ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８５）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８６）、

（R）－４－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例６８７）、

（R）－４－（６－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６８８）、

（R）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルアミド（実施例６８９）、

（R）－４－ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９０）、

（R）－４－［１，２，５］チアジアゾロ［３，４－ｂ］ピラジン－５－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例６９１）、

（R）－４－（２－メチル－プテリジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジ

フルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９２）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－６－カルボン酸　エチルエステル（実施例６９３）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９４）、

（Ｒ）－１－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９５）、

（Ｒ）－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９６）、

（Ｒ）－１－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９７）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例６９８）、

（Ｒ）－４－（５－ブロモ－チオフェン－２－スルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例６９９）、

（Ｒ）－４－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７００）、

（Ｒ）－４－（ビフェニル－４－スルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例７０１）、

（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）

ーピペラジンー２ーカルボン酸　４－（３－ヒドロキシープロピル）ーベンジルアミド（実施例７０２）、

（R）－４ーアセチルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー２ーカルボン酸　（１－プロピルー１Ｈーピラゾールー４ーイルメチル）ーアミド（実施例７０３）、

（R）－４－（４－オキソ－４，５－ジヒドローチアゾールー２ーイル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー２ーカルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルアミド（実施例７０４）、

１－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー１ーカルボニル］ーアゼチジンー３ーカルボン酸（実施例７０５）、

１－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー１ーカルボニル］ーピペリジンー４ーカルボン酸（実施例７０６）、

（R）－４ープテリジンー６ーイルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー２ーカルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルアミド（実施例７０７）、

（R）－１－（４－ヨードーベンゼンスルホニル）－４ープテリジンー７ーイルーピペラジンー２ーカルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルアミド（実施例７０８）、

（R）－４ープテリジンー７ーイルー１－（４－チオフェンー２ーイルーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー２ーカルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルアミド（実施例７０９）、

３－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー１ーイル］ーキノキサリンー６ーカルボン酸　エチルエステル（実施例７１０）、

３－［（R）－３－［４－（１，１－ジフルオロープロピル）ーベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）ーピペラジンー１ーイル］ーキノキサリンー６ーカルボン酸（実施例７１１）、

2－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－キノキサリン－6－カルボン酸（実施例７１２）、

（R）－1－（4－クロロ－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７１３）、

（R）－1－（4－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７１４）、

（R）－4－チアゾロ［5，4－c］ピリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７１５）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　［3－（3－ヒドロキシ－フェニル）－プロピル］－アミド（実施例７１６）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　［3－（4－ヒドロキシ－フェニル）－プロピル］－アミド（実施例７１７）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（6－プロピル－ピリジン－3－イルメチル）－アミド（実施例７１８）、

（R）－4－アセチル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（5－メチル－ピラジン－2－イルメチル）－アミド（実施例７１９）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（6－プロピル－ピリジン－3－イルメチル）－アミド（実施例７２０）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（5－メチル－ピラジン－2－イル

メチル）－アミド（実施例７２１）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－アミノ－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例７２２）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－ヒドロキシ－４－プロピル－ベンジルアミド（実施例７２３）、

（Ｒ）－１－（２’－ヒドロキシ－ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７２４）、

（Ｒ）－１－（３’－ヒドロキシ－ビフェニル－４－スルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７２５）、

（Ｒ）－１－（４－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７２６）、

（Ｒ）－１－（ビフェニル－４－スルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７２７）、

５－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チオフェン－２－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル（実施例７２８）、

（２－｛（Ｒ）－２－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－１－スルホニル｝－６，７，８，９－テトラヒドロ－５Ｈ－ベンゾシクロヘプテン－７－イル）－酢酸（実施例７２９）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－ピリジン－２－イル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例７３０）、

（4’－｛（R）－2－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－1－スルホニル｝－ビフェニル－2－イルオキシ）－酢酸（実施例７３１）、

（4’－｛（R）－2－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－1－スルホニル｝－ビフェニル－3－イルオキシ）－酢酸（実施例７３２）、

（R）－4－［2－（ピリジン－3－イルアミノ）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３３）、

（R）－4－［2－（1－メチル－1H－ピラゾール－3－イルアミノ）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３４）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３５）、

（R）－1－（4－ジメチルアミノ－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３６）、

（R）－1－（5－ブロモ－チオフェン－2－スルホニル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３７）、

（R）－1－（ベンゾ［b］チオフェン－2－スルホニル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３８）、

（R）－4－チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例７３９）、

（R）－4－［1，6］ナフチリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキ

シーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４０）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４１）、

（Ｒ）－４－（８－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４２）、

（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－ピロリジン－１－イル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４３）、

ｔｒａｎｓ－［４－（４－｛（Ｒ）－２－［４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－１－スルホニル｝－フェニル）－シクロヘキシル］－酢酸（実施例７４４）、

（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７４５）、

（Ｒ）－１－（４－モルホリン－４－イル－ベンゼンスルホニル）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４６）、

（Ｒ）－１－（４－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－プテリジン－７－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４７）、

（Ｒ）－４－ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７４８）、

（Ｒ）－４－ピラジノ［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７４９）、

（R）－4－［1，2，4］トリアゾロ［1，5－a］ピリミジン－5－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５０）、

（R）－1－［4－（2－オキソ－ピロリジン－1－イル）－ベンゼンスルホニル］－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７５１）、

（R）－1－（4－クロロ－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５２）、

4’－｛（R）－2－［4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－1－スルホニル｝－ビフェニル－3－カルボン酸（実施例７５３）、

（R）－1－（4－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５４）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－ピロリジン－1－イル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５５）、

（R）－4－（3H－イミダゾ［4，5－c］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７５６）、

（R）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７５７）、

（R）－4－（1H－ベンゾイミダゾール－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７５８）、

（R）－1－［4－（5－オキソ－2，5－ジヒドロ－［1，2，4］オキサジアゾール－3－イル）－ベンゼンスルホニル］－4－プテリジン－7－イル－ピペラ

ジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７５９）、

（Ｒ）－４－ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－３－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７６０）、

（Ｒ）－４－ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例７６１）、

（Ｒ）－４－ピリド［２，３－ｂ］ピラジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６２）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（２，２，２－トリフルオロ－エトキシ）－ベンジルアミド（実施例７６３）、

（メチル－｛４－［（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－２－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－フェニル｝－アミノ）－酢酸　エチルエステル（実施例７６４）、

（メチル－｛４－［（Ｒ）－４－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル－２－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－フェニル｝－アミノ）－酢酸（実施例７６５）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－キノキサリン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６６）、

（Ｒ）－４－（２－メチル－プテリジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６７）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６８）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７６９）、

（R）－4－ピリド［2，3－b］ピラジン－3－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７７０）、

（R）－4－［1，6］ナフチリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７７１）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメチルスルファニル－ベンジルアミド（実施例７７２）、

4－｛5－［（R）－2－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－1－スルホニル］－2－トリフルオロメトキシ－フェニル｝－酪酸（実施例７７３）、

6－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ニコチン酸（実施例７７４）、

（R）－1－（5－ブロモ－チオフェン－2－スルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７７５）、

（R）－4－チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７７６）、

（R）－1－（4－ヨード－ベンゼンスルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベンジルアミド（実施例７７７）、

（R）－1－（3’－ヒドロキシ－ビフェニル－4－スルホニル）－4－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピル－ベン

ジルアミド（実施例７７８）、

{4’－[(R)－2－(4－プロピルーベンジルカルバモイル)－4－ピリド[3，4－b]ピラジン－2－イルーピペラジン－1－スルホニル]－ビフェニル－3－イルオキシ}－酢酸（実施例７７９）、

2－[(R)－4－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－3－(4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル)－ピペラジン－1－イル]－キノキサリン－5－カルボン酸（実施例７８０）、

3－[(R)－4－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－3－(4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル)－ピペラジン－1－イル]－キノキサリン－5－カルボン酸（実施例７８１）、

(R)－4－キノキサリン－6－イル－1－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７８２）、

(R)－1－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７８３）、

(R)－4－(7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ[4，5－d]ピリミジン－2－イル)－1－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７８４）、

(R)－4－(4－オキソ－3，4－ジヒドローチアゾロ[4，5－d][1，2，3]トリアジン－6－イル)－1－(4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７８５）、

(R)－4－(4－エチルーベンゼンスルホニル)－3－(4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル)－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－[1，2’]ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例７８６）、

(R)－4－(5－ブロモーチオフェン－2－スルホニル)－3－(4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル)－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－[1，2’]ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例７８７）、

（R）－4－（4－ピロリジン－1－イル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例７８８）、

（R）－1－（5－ブロモ－チオフェン－2－スルホニル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７８９）、

（R）－1－（4－ニトロ－ベンゼンスルホニル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９０）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９１）、

（R）－1－（5－クロロ－チオフェン－2－スルホニル）－4－プテリジン－7－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９２）、

（R）－4－［1，5］ナフチリジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９３）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－b］ピラジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９４）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　2，3，5，6－テトラフルオロ－4－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例７９５）、

（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－5’－ヒドロキシメチル－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－3－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例７９６）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　2，4，6－トリクロロ－ベンジル

アミド（実施例７９７）、

（R）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－（２－トリフルオロメチループテリジン－７－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７９８）、

（R）－４－（８－ブロモ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例７９９）、

（R）－４－（５，７－ジクロローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８００）、

（R）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８０１）、

（R）－４－（５－クローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８０２）、

（R）－４－（４，７－ジオキソ－４，５，６，７－テトラヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８０３）、

（R）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（アダマンタン－１－イルメチル）－アミド（実施例８０４）、

（R）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８０５）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピ

リド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸（実施例８０６）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸　アミド（実施例８０７）、

3－｛2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－イル｝－プロピオン酸（実施例８０８）、

（R）－6’－メチル－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－3，4，5，6－テトラヒドロ－2H－［1，2’］ビピラジニル－5’－カルボン酸（実施例８０９）、

（R）－4－［8－（2－カルバモイルーエチル）－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８１０）、

（R）－4－プテリジン－7－イル－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（3－フェニル－プロピル）－アミド（実施例８１１）、

（R）－1－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８１２）、

（R）－4－（8－ブロモ－ピリド［3，4－b］ピラジン－2－イル）－1－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８１３）、

2－［（R）－4－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－キノキサリン－5－カルボン酸（実施例８１４）、

2－［（R）－4－（4－エチルーベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジ

ン－８－カルボン酸（実施例８１５）、

３－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例８１６）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－キノキサリン－５－カルボン酸（実施例８１７）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ベンゾチアゾール－４－カルボン酸（実施例８１８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８１９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８２０）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８２１）、

２－メチル－６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸（実施例８２２）、

５－フルオロ－２－メチル－６－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ニコチン酸（実施例８２３）、

２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８２４）、

（R）－1－（4－ニトローベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８２５）、

3－｛4－メチルー2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾールー5－イル｝－プロピオン酸（実施例８２６）、

（R）－4－（4－メチルー5－スルファモイルーチアゾールー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８２７）、

（R）－4－（4－メチルー5－メチルスルファモイルーチアゾールー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８２８）、

（R）－4－（5－ジメチルスルファモイルー4－メチルーチアゾールー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８２９）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－フェニルアミド　3－（4－プロピルーベンジルアミド）（実施例８３０）、

2－｛［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸　メチルエステル（実施例８３１）、

（R）－4－（5－アセチルスルファモイルー4－メチルーチアゾールー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例８３２）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－ベンジルオキシーフェニル）－アミド］　3－（4－プロピルーベンジルアミド）（実施例８３３）、

（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，3－ジカルボン酸　1－［（2－ヒドロキシーフェニル）－アミド］　3－（4

ープロピルーベンジルアミド）（実施例８３４）、

（R）－1－（4－ニトローベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８３５）、

2－［（R）－3－［4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸（実施例８３６）、

2－｛［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸　ベンジルエステル（実施例８３７）、

2－｛［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－カルボニル］－アミノ｝－安息香酸（実施例８３８）、

（R）－4－（4－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８３９）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジメチループロピル）－ベンジルアミド（実施例８４０）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ブチル－ベンジルアミド（実施例８４１）、

2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジン－8－カルボン酸（実施例８４２）、

2－［（R）－4－（4－ニトローベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－ピリド［3，4－b］ピラジ

ン－８－カルボン酸（実施例８４３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－クロロ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８４５）、

｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－'（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－オキソ－酢酸　エチルエステル（実施例８４６）、

４－クロロ－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例８４７）、

｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－オキソ－酢酸（実施例８４８）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（２－フェニル－シクロプロピルメチル）－アミド（実施例８４９）、

（Ｒ）－１－（５－クロロ－チオフェン－２－スルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例８５０)、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（２－メトキシ－１，１－ジメチル－エチル）－ベンジルアミド（実施例８５１）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２'］ビピラジニル－３，５'－ジカルボン酸　５'－エチルアミド　３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド）（実施例８

５２）、

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－３，５’－ジカルボン酸　５’－ｔｅｒｔ－ブチルアミド　３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド）（実施例８５３）、

２－［（Ｒ）－３－［４－（１，１－ジメチル－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８５４）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８５５）、

ヒドロキシ－｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－酢酸　エチルエステル（実施例８５６）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（５－プロピル－チオフェン－２－イルメチル）－アミド（実施例８５７）、

２－｛（Ｒ）－４－（５－クロロ－チオフェン－２－スルホニル）－３－［４－（１，１－ジメチル－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－ピペラジン－１－イル｝－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８５８）、

（Ｒ）－４－（４－メチル－５－メチルアミノオキサリル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例８５９）、

２－［（Ｒ）－４－（５－クロロ－チオフェン－２－スルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８６０）、

２－［（Ｒ）－４－（５－クロロ－チオフェン－２－スルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸（実施例８６１）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　エチルエステル（実施例８６２）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸（実施例８６３）、

（Ｒ）－１－（４－フルオローベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８６４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　メチルアミド（実施例８６５）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例８６６）、

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イルー１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（１－フェニルーアゼチジン－３－イルメチル）－アミド（実施例８６７）、

４－クロロ－２－［（Ｒ）－４－（４－エチルーベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例８６８）、

（Ｒ）－４－（７－クロローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８６９）、

（Ｒ）－４－（４－ヒドロキシメチルー７－オキソ－６，７－ジヒドローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７０）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－８－カルボン酸　イソプロピルアミド（実施例８７１）、

（Ｒ）－４－（８－シアノ－ピリド［３，４－ｂ］ピラジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７２）、

（Ｒ）－１－（４－クローベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７３）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸（実施例８７４）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　メチルアミド（実施例８７５）、

７－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　アミド（実施例８７６）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７７）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８７８）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８７９）、

7－クロロ－2－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　エチルエステル（実施例８８０）、

（R）－1－（4－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８１）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1－メトキシメチル－シクロプロピル）－ベンジルアミド（実施例８８２）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルアミド（実施例８８３）、

（R）－1－（4－メトキシ－ベンゼンスルホニル）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８４）、

（R）－4－チアゾロ［5，4－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８５）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８６）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８７）、

（R）－4－（5，7－ジヒドロキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８８８）、

4－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－2－フルオロ－安息香酸（実施例８８９）、

4－クロロ－2－［（R）－3－［4－（1，1－ジメチル－プロピル）－ベンジルカルバモイル］－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾール－5－カルボン酸（実施例８９０）、

2－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　エチルエステル（実施例８９１）、

2－［（R）－4－（4－エチル－ベンゼンスルホニル）－3－（4－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸（実施例８９２）、

（R）－4－（4－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８９３）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８９４）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例８９５）、

（R）－4－（7－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例８９６）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル－1－（4－トリフル

オロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例８９７）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンジルアミド（実施例８９８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（３－フェニル－シクロブチルメチル）－アミド（実施例８９９）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９００）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　（ナフタレン－２－イルメチル）－アミド（実施例９０１）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９０２）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９０３）、

（Ｒ）－４－（６－メチル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０４）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－

1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０５）、

（R）－4－（7－クロロ－4－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９０６)、

（R）－4－（7－クロロ－5－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９０７)、

（R）－4－（5－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９０８）、

（R）－4－（7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（4－メチル－2－プロピルーチアゾール－5－イルメチル）－アミド（実施例９０９）、

（R）－4－（5－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１０）、

（R）－4－（5－メチル－7－オキソ－6，7－ジヒドローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロープロピル）－ベンジルアミド（実施例９１１）、

（R）－4－（5－ブロモーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９１２）、

（R）－4－（5－クロローチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－プロピルーベンジルアミド（実施例９１３）、

（R）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド（実施例９１４）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　アミド（実施例９１５）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－カルボン酸　メチルアミド（実施例９１６）、

（R）－４－（４－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９１７）、

（R）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９１８）、

（R）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９１９）、

（R）－４－（７－メチル－５－オキソ－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２０）、

（R）－４－（５－メチル－チアゾロ［５，４－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２１）、

（R）－４－［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２２）、

（R）－4－（6－オキソ－ピペリジン－3－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２３）、

（R）－4－（6－オキソ－1，6－ジヒドロ－ピリジン－3－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド　塩酸塩（実施例９２４）、

（R）－4－（5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２５）、

（R）－4－（5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９２６）、

（R）－4－（7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２７）、

（R）－4－（7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－（1，1－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９２８）、

（R）－4－（5－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９２９）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－4－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例９３０）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３１）、

（R）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３２）、

（R）－４－（３－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［３，４－ｂ］［１，３，４］チアジアゾール－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３３）、

（R）－４－（７－クロロ－５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９３４）、

（R）－４－（５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例９３５）、

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－［（５－ブロモ－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル）－アミド］　３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド）（実施例９３６）、

（R）－４－（４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９３７）、

（R）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（ジフルオロ－メトキシ－メチル）－ベンジルアミド（実施例９３８）、

（R）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシメチル－ベンジルアミド（実施例９３９）、

（R）－4－（4－ヒドロキシメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４０）、

（R）－4－（7－クロロ－5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４１）、

（R）－4－（5－メチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４２）、

（R）－4－（5－アミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４３）、

（R）－4－（7－メトキシ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４４）、

（R）－4－（5－ジメチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４５）、

（R）－4－［5－（2－ヒドロキシ－エチルアミノ）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４６）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（5－トリフルオロメチル－チオフェン－2－スルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９４７）、

7－オキソ－2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－5－カルボン酸　メチルエステル（実施例９４８）、

（R）－4－（5－エチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例949）、

（R）－4－（5－エチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例950）、

（R）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－4－（3－トリフルオロメチル－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例951）、

（R）－4－（5－メチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例952）、

（R）－4－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例953）、

（R）－4－［1，2，4］トリアゾロ［3，4－b］［1，3，4］チアジアゾール－6－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例954）、

（R）－4－（5－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例955）、

（R）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例956）、

（R）－4－（5－メチル－4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホ

ニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９５７）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルアミド（実施例９５８）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９５９）、

（Ｒ）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９６０）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例９６１)、

（Ｒ）－４－（７－アミノ－５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例９６２)、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９６３）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９６４）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－メトキシ－ベンジルアミド（実施例９６５）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１

－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－フルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６６）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－フルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６７）、

（Ｒ）－４－（５－クロローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６８）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９６９）、

（Ｒ）－４－（５－メチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７０）、

（Ｒ）－４－（５－クロローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピルーベンジルアミド（実施例９７１）、

（Ｒ）－４－（５－フルオローチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７２）、

（Ｒ）－４－（５－イソプロピルアミノーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９７３)、

（Ｒ）－４－（５－ブロモ－７－ジエチルアミノーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７４）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２

－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７５）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－シクロプロピルーベンジルアミド（実施例９７６）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７７）、

（Ｒ）－４－（５－アセチル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９７８）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　アミド（実施例９７９）、

（Ｒ）－４－（１，３－ジメチル－１Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｄ］チアゾール－５－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９８０)、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９８１）、

（Ｒ）－４－（７－アミノ－５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例９８２)、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９８３）、

（Ｒ）－４－（５－イソプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例９８４）、

（R）－4－（4－クロロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８５）、

（R）－4－（3－メチル－4－オキソ－4H－［1，3，4］チアジアゾロ［2，3－c］［1，2，4］トリアジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８６）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］［1，2，3］トリアジン－6－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８７）、

（R）－4－［2－（5－ブロモ－［1，3，4］チアジアゾール－2－イルカルバモイル）－アセチル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９８８）、

（R）－4－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　（インドリジン－2－イルメチル）－アミド（実施例９８９）、

7－オキソ－2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－5－カルボン酸　メチルアミド（実施例９９０）、

（R）－4－（5－イソプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９１）、

（R）－4－（5－シクロプロピルメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例９９２)、

（R）－4－（5－クロロ－2－ジエチルアミノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－7－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピ

ペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９３）、

（Ｒ）－４－［５－（３－ヒドロキシ－３－メチル－ブター１－イニル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９４）、

（Ｒ）－４－（５－エチニル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９５）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ペンタフルオロスルファニル－ベンジルアミド（実施例９９６）、

（Ｒ）－４－（５－クロロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド(実施例９９７)、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施例９９８）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例９９９）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド(実施例１０００)、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００１）、

（Ｒ）－４－［４－（２－ヒドロキシ－エチルアミノ）－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベン

ゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００２）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－５－トリフルオロメチル－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００３）、

（Ｒ）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００４）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００５）、

（Ｒ）－４－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００６）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　エチルエステル（実施例１００７）、

（Ｒ）－４－（５－ヒドロキシメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００８）、

（Ｒ）－４－（４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１００９）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１０）、

（R）－4－（5－シアノ－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１１）、

（R）－4－（5－シクロプロピルメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１２）、

2－［（R）－3－（4－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　アミド（実施例１０１３）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１４）、

（R）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－4－（5－トリフルオロメチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１５）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１６）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１７）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０１８）、

（R）－4－（5－メチル－7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジル

アミド（実施例１０１９）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２０）、

（Ｒ）－４－（７－アミノ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２１）、

（Ｒ）－４－（７－メトキシ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２２）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２３）、

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２４）、

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２５）、

（Ｒ）－４－（６－クロロ－５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２６）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルア

ミド（実施例１０２７）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０２８）、

５－メチル－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－カルボン酸　アミド（実施例１０２９）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３０）、

（Ｒ）－４－（４－オキソ－３－トリフルオロメチル－４Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［２，３－ｃ］［１，２，４］トリアジン－７－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３１）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３２）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸（実施例１０３３）、

（Ｒ）－４－（４－アミノ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３４）、

（Ｒ）－４－（４－メトキシ－チアゾロ［４，５－ｄ］［１，２，３］トリアジン

－６－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３５）、

（Ｒ）－４－（５－シアノ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３６）、

（Ｒ）－４－（５－エチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３７）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－７－トリフルオロメチル－５Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３８）、

（Ｒ）－４－（５－メチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－［４－（１，１，２，２－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０３９）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０４０）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　ジメチルアミド（実施例１０４１）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオロ－ベンジルアミド（実施

例１０４２）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４３）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオローベンジルアミド（実施例１０４４）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－２－フルオローベンジルアミド（実施例１０４５）、

２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－５－カルボン酸　メチルアミド（実施例１０４６）、

（Ｒ）－４－［５－（１－ヒドロキシ－１－メチルーエチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４７）、

（Ｒ）－４－（５－アセチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－５－トリフルオロメチル－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０４９）、

（Ｒ）－４－（５－メトキシーチアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボ

ン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５０）、

（R）－4－（5－メチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－［4－（1，1，2，2－テトラフルオロ－エトキシ）－ベンゼンスルホニル］－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５１）、

（R）－4－（5－ヒドロキシメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５２）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５３）、

2－［（R）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－3－（4－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－1－イル］－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－5－カルボン酸　メトキシ－メチルーアミド（実施例１０５４）、

（R）－4－（7－アミノ－5－メトキシメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５５）、

（R）－4－（5－ピロリジン－1－イルメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５６）、

（R）－4－（7－オキソ－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０５７）、

（R）－1－（4－ジフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－4－（7－オキ

ソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０５８）、

（Ｒ）－４－（７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０５９）、

（Ｒ）－４－［５－（１－ヒドロキシ－エチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６０）、

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０６１）、

（Ｒ）－４－（５－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［５，４－ｂ］ピリジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６２）、

（Ｒ）－１－（４－ジフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６３）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸　エチルエステル（実施例１０６４）、

２－［（Ｒ）－４－（４－エチル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸（実施例１０６５）、

（R）－4－（7－オキソ－5－トリフルオロメチル－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６６）、

（R）－4－（7－オキソ－5－トリフルオロメチル－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６７）、

（R）－4－（7－オキソ－5－トリフルオロメチル－7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６８）、

（R）－4－（5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０６９）、

（R）－4－［5－（2－メトキシ－エチル）－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７０）、

（R）－4－［5－（2－メトキシ－エチル）－4－オキソ－4，5－ジヒドロ－チアゾロ［4，5－d］ピリダジン－2－イル］－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７１）、

（R）－4－（5－シクロブチル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７２）、

（R）－4－（5－シクロプロピル－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシ－3－フルオロ－ベンジルアミド（実施例

１０７３）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１０７４）、

（Ｒ）－４－［５－（１－ヒドロキシ－１－メチル－エチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７５）、

（Ｒ）－４－［５－（１－メトキシメチル－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７６）、

（Ｒ）－４－［５－（１－ヒドロキシメチル－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７７）、

（Ｒ）－４－［５－（２－ヒドロキシ－エチル）－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７８）、

（Ｒ）－４－［５－（１－メトキシ－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０７９）、

（Ｒ）－４－［５－（１－ヒドロキシ－シクロプロピル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０８０）、

2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジンー6－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル(実施例１０８１)、

2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジンー6－カルボン酸（実施例１０８２）、

2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジンー7－カルボン酸　エチルエステル（実施例１０８３）、

2－［（R）－3－（4－プロピルーベンジルカルバモイル）－4－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー1－イル］－チアゾロ［5，4－c］ピリジンー7－カルボン酸（実施例１０８４）、

（R）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－4－（5－トリフルオロメチルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジンー2－イル）－ピペラジンー2－カルボン酸　4－ジフルオロメトキシー3－フルオローベンジルアミド（実施例１０８５）、

（R）－4－（5－オキソー4，5－ジヒドロ－チアゾロ［5，4－b］ピリジン－2－イル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０８６）、

（R）－4－（5－ジフルオロメトキシーチアゾロ［4，5－d］ピリミジンー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド(実施例１０８７)、

（R）－4－（5－イソプロピルー7－オキソー7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジンー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2－カルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド（実施例１０８８）、

（R）－4－（5－イソプロピルー7－オキソー7H－［1，3，4］チアジアゾロ［3，2－a］ピリミジンー2－イル）－1－（4－トリフルオロメトキシーベ

ンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０８９）、

（Ｒ）－４－（７－アミノ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９０）、

（Ｒ）－４－［７－アミノ－５－（１－ヒドロキシ－１－メチル－エチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９１）、

ヒドロキシ－｛４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－イル｝－酢酸（実施例１０９２）、

４－クロロ－２－［（Ｒ）－３－［４－（エチル－メチル－アミノ）－ベンジルカルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸（実施例１０９３）、

｛５－メチル－３－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－ピラゾール－１－イル｝－酢酸（実施例１０９４）、

［（Ｒ）－３－（４－ｔｅｒｔ－ブチル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－イルメチル］－トリエチル－アンモニウムトリフルオロ－メタンスルホン酸塩（実施例１０９５）、

（Ｒ）－４－［２－（５－アミノ－テトラゾール－２－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例１０９６）、

（Ｒ）－４－［２－（５－アミノ－テトラゾール－１－イル）－アセチル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－（１，１－ジフルオロ－プロピル）－ベンジルアミド（実施例１０９７）、

（R）－４－［５－（２－ヒドロキシ－エチル）－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル］－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９８）、

（R）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１０９９）、

（R）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１００）、

（R）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０１）、

（R）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０２）

（R）－４－アセチル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０３）、

２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸（実施例１１０４）、

（R）－４－（５－ヒドロキシメチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０５）、

｛４－オキソ－２－［（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホ

ニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－５－イル｝－酢酸（実施例１１０６）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０７）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１０８）、

２－［（Ｒ）－３－（４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾロ［５，４－ｃ］ピリジン－７－カルボン酸（実施例１１０９）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（実施例１１１０）、

（Ｒ）－３－（４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸（実施例１１１１）、

３－｛４－オキソ－２－［（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－５－イル｝プロピオン酸（実施例１１１２）、

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオ

ロ－ベンジルアミド（実施例１１１３）、

（R）－４－（５－シクロプロピル－７－オキソ－６，７－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド（実施例１１１４）、

４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１１５）、

（R）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１１６）、及び、

（S）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメチル－ベンジルアミド（実施例１１１７）。

一般式［Ｉ］で表される化合物（以下、本発明化合物ともいう）の製薬上許容される塩とは、本発明化合物と無毒の塩を形成するものであればいかなる塩でもよく、例えば、無機酸との塩、有機酸との塩、無機塩基との塩、有機塩基との塩、アミノ酸との塩等が挙げられる。

無機酸との塩として、例えば、塩酸、硝酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸等との塩が挙げられる。

有機酸との塩として、例えば、シュウ酸、マレイン酸、クエン酸、フマル酸、乳酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、グルコン酸、アスコルビン酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸等との塩が挙げられる。

無機塩基との塩として、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アンモニウム塩等が挙げられる。

有機塩基との塩として、例えば、メチルアミン、ジエチルアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、エチレンジアミン、トリス（ヒドロキシメチル）メチルアミン、ジシクロヘキシルアミン、Ｎ，Ｎ’－ジベンジルエチレンジアミン、グアニジン、ピリジ

ン、ピコリン、コリン、シンコニン、メグルミン等との塩が挙げられる。

アミノ酸との塩として、例えば、リジン、アルギニン、アスパラギン酸、グルタミン酸等との塩が挙げられる。

自体公知の方法に従って、一般式［Ｉ］で表される化合物と、無機塩基、有機塩基、無機酸、有機酸、又はアミノ酸とを反応させることにより、各々の塩を得ることができる。

「溶媒和物」とは、一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩に、溶媒の分子が配位したものであり、水和物（含水物とも言う。）も包含される。溶媒和物は、製薬上許容される溶媒和物が好ましく、例えば、一般式［Ｉ］で表される化合物の１水和物、１／２水和物、２水和物、ナトリウム塩の１水和物、１メタノール和物、１エタノール和物、１アセトニトリル和物、２塩酸塩の２／３エタノール和物等が挙げられる。

自体公知の方法に従って、一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩の溶媒和物を得ることができる。

また、上記一般式［Ｉ］で示される化合物においては、種々の「異性体」が存在する。例えば、幾何異性体としてＥ体及びＺ体が存在し、また、不斉炭素原子が存在する場合は、これらに基づく立体異性体としての鏡像異性体及びジアステレオマーが存在する。また、軸不斉が存在する場合は、これらに基づく立体異性体が存在する。場合によっては互変異性体が存在し得る。従って、本発明の範囲にはこれらすべての異性体及びそれらの混合物が包含される。

また、一般式［Ｉ］で表される化合物は、同位元素（例えば、^{3}H、^{14}C、^{35}S等）で標識されていてもよい。

一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物としては、実質的に精製された、一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物が好ましい。さらに好ましくは、８０％以上の純度に精製された、一般式［Ｉ］で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、或いはその溶媒和物である。

本発明においては、一般式［Ｉ］で表される化合物のプロドラッグもまた、有用な薬剤となり得る。「プロドラッグ」とは、化学的又は代謝的に分解し得る基を有

し、生体に投与された後、例えば、加水分解、加溶媒分解、又は、生理的条件下で分解することによって、元の化合物に復元して本来の薬効を示す本発明化合物の誘導体であり、共有結合によらない複合体、及び、塩も含まれる。プロドラッグは、例えば、経口投与における吸収改善のため、或いは、標的部位へのターゲティングのために利用される。

修飾部位としては本発明化合物中の水酸基、カルボキシル基、アミノ基、チオール基などの反応性の高い官能基が挙げられる。

水酸基の修飾基として具体的には、アセチル基、プロピオニル基、イソブチリル基、ピバロイル基、パルミトイル基、ベンゾイル基、４－メチルベンゾイル基、ジメチルカルバモイル基、ジメチルアミノメチルカルボニル基、スルホ基、アラニル基、フマリル基等が挙げられる。また、ナトリウム塩化した３－カルボキシベンゾイル基、２－カルボキシエチルカルボニル基等が挙げられる。

カルボキシル基の修飾基として具体的には、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、ピバロイルオキシメチル基、カルボキシメチル基、ジメチルアミノメチル基、１－（アセチルオキシ）エチル基、１－（エトキシカルボニルオキシ）エチル基、１－（イソプロピルオキシカルボニルオキシ）エチル基、１－（シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ）エチル基、（５－メチル－２－オキソ－１，３－ジオキソール－４－イル）メチル基、ベンジル基、フェニル基、ｏ－トリル基、モルホリノエチル基、Ｎ，Ｎ－ジエチルカルバモイルメチル基、フタリジル基等が挙げられる。

アミノ基の修飾基として具体的には、ｔｅｒｔ－ブチル基、ドコサノイル基、ピバロイルメチルオキシ基、アラニル基、ヘキシルカルバモイル基、ペンチルカルバモイル基、３－メチルチオ－１－（アセチルアミノ）プロピルカルボニル基、１－スルホ－１－（３－エトキシ－４－ヒドロキシフェニル）メチル基、（５－メチル－２－オキソ－１，３－ジオキソール－４－イル）メチル基、（５－メチル－２－オキソ－１，３－ジオキソール－４－イル）メトキシカルボニル基、テトラヒドロフラニル基、ピロリジルメチル基等が挙げられる。

本発明化合物又はその塩、或いはその溶媒和物を含む医薬組成物としては、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、トローチ剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤等の経口剤、

或いは外用剤、坐剤、注射剤、点眼剤、経鼻剤、経肺剤等の非経口剤が挙げられる。

該医薬組成物は、医薬製剤の技術分野において自体公知の方法に従って、本発明化合物又はその塩、或いはその溶媒和物を、少なくとも１種以上の製薬上許容される担体等と、適宜、適量混合等することによって製造される。該医薬組成物中の本発明化合物又はその塩の含量は、剤形、本発明化合物又はその塩の投与量などにより異なるが、例えば、組成物全体の０．１乃至１００重量％である。

「製薬上許容される担体」としては、製剤素材として慣用の各種有機又は無機担体物質が挙げられ、例えば、固形製剤における賦形剤、崩壊剤、結合剤、流動化剤、滑沢剤等、或いは液状製剤における溶剤、溶解補助剤、懸濁化剤、等張化剤、緩衝剤、無痛化剤等が挙げられる。更に必要に応じて、保存剤、抗酸化剤、着色剤、甘味剤等の添加物が用いられる。

「賦形剤」としては、例えば、乳糖、白糖、Ｄ－マンニトール、Ｄ－ソルビトール、トウモロコシデンプン、デキストリン、微結晶セルロース、結晶セルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、アラビアゴム等が挙げられる。

「崩壊剤」としては、例えば、カルメロース、カルメロースカルシウム、カルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、クロスカルメロースナトリウム、クロスポビドン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、結晶セルロース等が挙げられる。

「結合剤」としては、例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポビドン、結晶セルロース、白糖、デキストリン、デンプン、ゼラチン、カルメロースナトリウム、アラビアゴム等が挙げられる。

「流動化剤」としては、例えば、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム等が挙げられる。

「滑沢剤」としては、例えば、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、タルク等が挙げられる。

「溶剤」としては、例えば、精製水、エタノール、プロピレングリコール、マクロゴール、ゴマ油、トウモロコシ油、オリーブ油等が挙げられる。

「溶解補助剤」としては、例えば、プロピレングリコール、Ｄ－マンニトール、

安息香酸ベンジル、エタノール、トリエタノールアミン、炭酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム等が挙げられる。

「懸濁化剤」としては、例えば、塩化ベンザルコニウム、カルメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、プロピレングリコール、ポビドン、メチルセルロース、モノステアリン酸グリセリン等が挙げられる。

「等張化剤」としては、例えば、ブドウ糖、Ｄ－ソルビトール、塩化ナトリウム、Ｄ－マンニトール等が挙げられる。

「緩衝剤」としては、例えば、リン酸水素ナトリウム、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム等が挙げられる。

「無痛化剤」としては、例えば、ベンジルアルコール等が挙げられる。

「保存剤」としては、例えば、パラオキシ安息香酸エチル、クロロブタノール、ベンジルアルコール、デヒドロ酢酸ナトリウム、ソルビン酸等が挙げられる。

「抗酸化剤」としては、例えば、亜硫酸ナトリウム、アスコルビン酸等が挙げられる。

「着色剤」としては、例えば、食用色素（例：食用赤色２号若しくは３号、食用黄色４号若しくは５号等）、β－カロテン等が挙げられる。

「甘味剤」としては、例えば、サッカリンナトリウム、グリチルリチン酸二カリウム、アスパルテーム等が挙げられる。

投与量は年齢、体重、症状、治療効果、投与方法等により異なるが、通常、成人ひとり当たり、１回に０．０１ｍｇ乃至３ｇ、好ましくは０．１ｍｇ乃至１ｇの範囲で、１日１回乃至数回が投与される。

「Ｃ型肝炎の予防」とは、例えば検査等によりＨＣＶが検出された人であってＣ型肝炎の症状が現われていない人に対し薬剤を投与すること、或いはＣ型肝炎の治療後、肝炎の症状が改善された人であってＨＣＶが根絶されておらず肝炎の再発が懸念される人に対し薬剤を投与することが挙げられる。

本発明のピペラジン化合物は、Ｃ型肝炎におけるウイルス血症の改善、及び／又は、その改善状態の維持、ウイルス感染症、特に、ＨＣＶ感染症の治療、及び／又は、その改善状態の維持に使用され得る。

ＨＣＶは遺伝子の変異が多いウイルスとして知られており、そのためインターフ

ェロンがそうである様に、遺伝子型によって効果に差異が生じ得る。従って、多くの遺伝子型に効果を示す化合物は、好ましい態様の一つである。ＨＣＶ１ａ型及び１ｂ型は、世界中に広く分布し、その割合が多いことから、特に、これら両方に高い効果を示す化合物が好ましい。

「治療」、「改善」或いは「効果」の指標としては、体内、特に血中のウイルス量の低減、また、ＨＣＶ　ＲＮＡ量の低減が挙げられる。

また、本発明のＣ型肝炎治療剤は、他の抗ウイルス剤、抗炎症剤、免疫増強剤との併用によって、相乗効果を期待する事ができる。

相乗効果の期待できる薬剤としては、例えば、インターフェロンーα、インターフェロンーβ、インターフェロンーγ、インターロイキンー２、インターロイキンー８、インターロイキンー１０、インターロイキンー１２、ＴＮＦα又はそれらの組換体、修飾体、アゴニスト、或いは、抗体、ワクチン、リボザイム、アンチセンスヌクレオチド等が挙げられる。

抗ＨＩＶ剤の併用療法（カクテル療法とも呼ばれる。）に見られるように、遺伝子の変異が多いウイルスに対し各種抗ウイルス剤を併用する事は、薬剤耐性ウイルスの出現・増加を抑えるためにも効果が期待できる。ＨＣＶ－ＩＲＥＳ阻害剤、ＨＣＶ－ＮＳ３プロテアーゼ阻害剤、ＨＣＶ－ＮＳ２ＮＳ３プロテアーゼ阻害剤、ＨＣＶ－ＮＳ５Ａ阻害剤、ＨＣＶポリメラーゼ阻害剤との２剤或いは３剤以上の併用が挙げられ、例えば、リバビリン（Ｒ）、インターフェロンーα（ＩＦＮ－α、Ｒｏｆｅｒｏｎ（Ｒ）、Ｉｎｔｒｏｎ　Ａ（Ｒ）、Ｓｕｍｉｆｅｒｏｎ（Ｒ）、ＭｕｌｔｉＦｅｒｏｎ（Ｒ）、Ｉｎｆｅｒｇｅｎ（Ｒ）、Ｏｍｎｉｆｅｒｏｎ（Ｒ）、Ｐｅｇａｓｙｓ（Ｒ）、ＰＥＧ－Ｉｎｔｒｏｎ　Ａ（Ｒ））、インターフェロンーβ（Ｆｒｏｎｅ（Ｒ）、Ｒｅｂｉｆ（Ｒ）、ＡｖｏｎｅＸ（Ｒ）、ＩＦＮβＭＯＣＨＩＤＡ（Ｒ））、インターフェロンーγ、インターフェロンーδ、インターフェロンーω、インターフェロンーτ、コンセンサスインターフェロン、アシアロインターフェロン、及び、これらのＲｅｇ化インターフェロン、１－β－Ｌ－リボフラノシル－１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－カルボキサミド、１６α－ブロモ－３β－ヒドロキシ－５α－アンドロスタン－１７－オン、１Ｈ－イミダゾール－４－エタナミド　ジヒドロクロライド、ＨＣＶリボザイムＨｅｐｔａｚｙｍｅ（Ｒ）、

ポリクローナル抗体Ｃｉｖａｃｉｒ（R）、ラクトフェリンＧＰＸ－４００、（１Ｓ，２Ｒ，８Ｒ，８ａＲ）－１，２，８－トリヒドロキシオクタヒドロインドリジニウム　クロリド、ＨＣＶワクチン(ＭＴＨ－６８／Ｂ、Ｉｎｎｉｖａｘ　Ｃ(R)、Ｅｎｇｅｒｉｘ　Ｂ（R））、アンチセンスオリゴヌクレオチドＩＳＩＳ－１４８０３、ＨＣＶ－ＲＮＡ転写酵素阻害剤ＶＰ－５０４０６、テトラクロロデカオキシド（高濃度Ｏｘｏｆｅｒｉｎ（R））、（Ｓ）－Ｎ－３－［３－（３－メトキシ－４－オキサゾール－５－イルフェニル）ウレイド］ベンジルカルバミン酸　テトラヒドロフラン－３－イルエステル、４－アミノ－２－エトキシメチル－α，α－ジメチル－１Ｈ－イミダゾ［４，５－ｃ］キノリン－１－エタノール、インターロイキン－２（Ｐｒｏｌｅｕｋｉｎ（R））、サイモシンα１、ＶＸ－４９７、ＶＸ－９５０、ＪＴＫ－００３、ＨＣＶ７９６、Ｒ－１６２６、ＮＭ２８３等との併用が挙げられる。（R）は商品名であることを示す。

ＨＣＶ－ＩＲＥＳ阻害剤として、特開平８－２６８８９０号、特開平１０－１０１５９１号、特開平７－６９８９９号、ＷＯ９９／６１６１３号、ＨＣＶプロテアーゼ阻害剤として、ＷＯ９８／２２４９６号、ＷＯ９９／７７３３号、ＷＯ９９／７７３４号、ＷＯ００／９５４３号、ＷＯ００／９５５８号、ＷＯ０１／５９９２９号、ＷＯ９８／１７６７９号、ＥＰ９３２６１７号、ＷＯ９９／５０２３０号、ＷＯ００／７４７６８号、ＷＯ９７／４３３１０号、ＵＳ５９９０２７６号、ＷＯ０１／５８９２９号、ＷＯ０１／７７１１３号、ＷＯ０２／８１９８号、ＷＯ０２／８１８７号、ＷＯ０２／８２４４号、ＷＯ０２／８２５６号、ＷＯ０１／７４０７号、ＷＯ０１／４０２６２号、ＷＯ０１／６４６７８号、ＷＯ９８／４６６３０号、特開平１１－２９２８４０号、特開平１０－２９８１５１号、特開平１１－１２７８６１号、特開２００１－１０３９９３号、ＷＯ９８／４６５９７号、ＷＯ９９／６４４４２号、ＷＯ００／３１１２９号、ＷＯ０１／３２９６１号、ＷＯ９３／１５７３０号、ＵＳ７８３２２３６号、ＷＯ００／２００４００号、ＷＯ０２／８２５１号、ＷＯ０１／１６３７９号、ＷＯ０２／７７６１号、ＨＣＶヘリカーゼ阻害剤として、ＷＯ９７／３６５５４号、ＵＳ５８３０９０５号、ＷＯ９７／３６８６６号、ＵＳ５６３３３８８号、ＷＯ０１／７０２７号、ＷＯ００／２４７２５号、ＨＣＶポリメラーゼ阻害剤として、ＷＯ００／１０５７３号、ＷＯ００／１３

７０８号、ＷＯ００／１８２３１号、ＷＯ００／６５２９号、ＷＯ０２／６２４６号、ＷＯ０１／３２１５３号、ＷＯ０１／６０３１５号、ＷＯ０１／７７０９１号、ＷＯ０２／４４２５号、ＷＯ０２／２０４９７号、ＷＯ００／４１４１号、インターフェロンアゴニスト或いは増強剤として、ＷＯ０１／５８８７７号、特開平１１－１８０９８１号、ＷＯ０１／１２２１４号等の公報に記載される化合物等との併用も挙げられる。

併用投与の場合、本発明化合物を、併用する薬剤（以下、併用薬という。）と同時に投与しても、時間間隔をおいて投与してもよい。本発明化合物と併用薬とを含有する医薬組成物として投与してもよく、又は本発明化合物を含有する医薬組成物と、併用薬を含有する医薬組成物を別々に投与してもよい。本発明化合物と併用薬の投与経路は同一であっても異なっていてもよい。

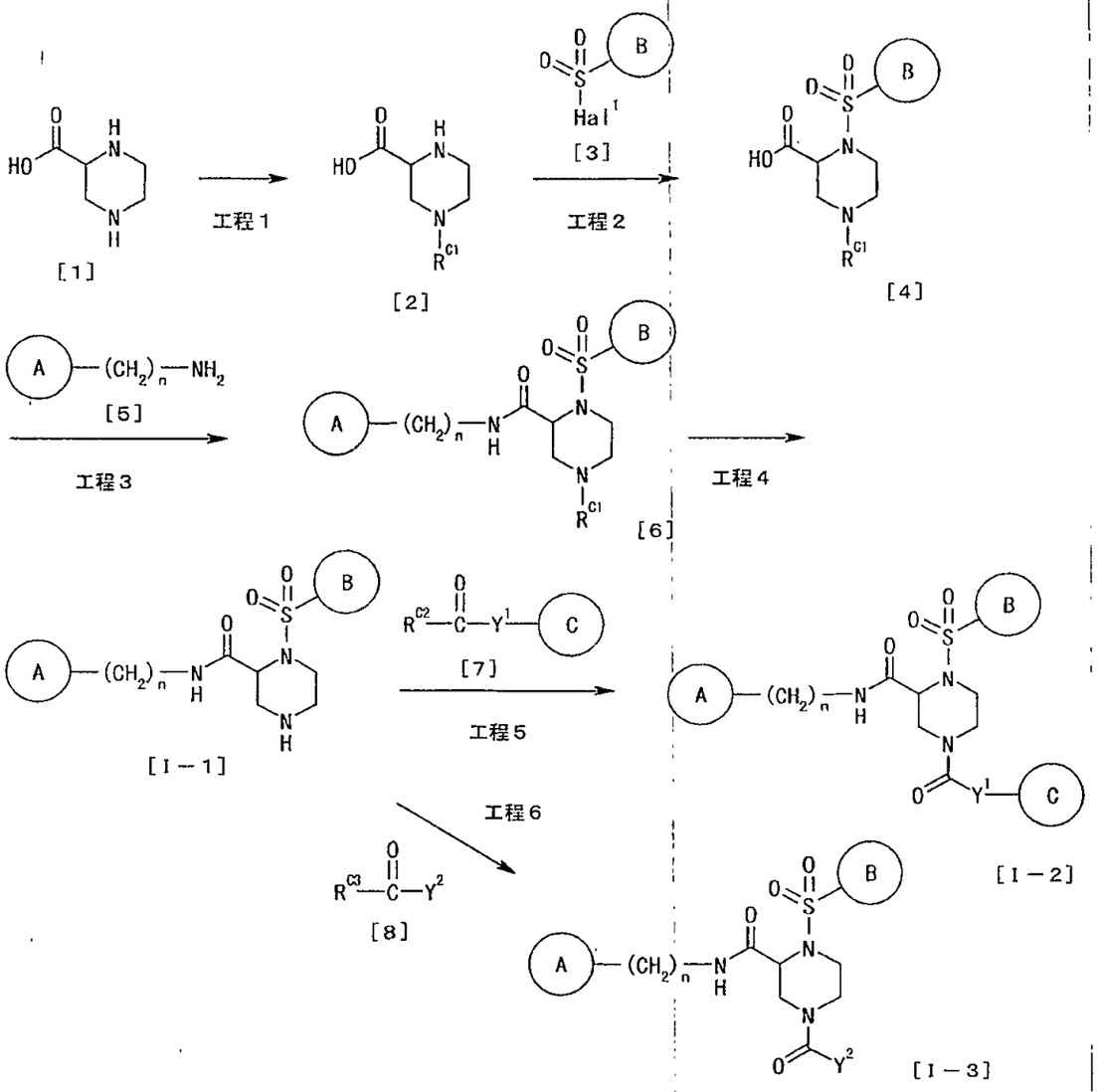
併用投与の場合、本発明化合物を、１回に０．０１ｍｇ乃至３ｇ、好ましくは０．１ｍｇ乃至１ｇの範囲の投与量で、１日１回乃至数回投与することができる。又は、より少ない投与量で投与してもよい。併用薬は、Ｃ型肝炎の予防又は治療に使用される場合の通常の投与量、例えば１回に０．０１ｍｇ乃至２ｇの範囲の投与量で投与することができる。又は、より少ない投与量で投与してもよい。

次に、本発明を実施するために用いる本発明化合物の製造方法の一例を説明する。しかしながら、本発明化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

本製法に記載はなくとも、必要に応じて官能基に保護基を導入し後工程で脱保護を行う、各製法及び工程の順序を入れ替えるなどの工夫により効率よく製造を行えばよい。

また、各工程において、反応後の処理は通常行われる方法で行えばよく、単離精製、結晶化、再結晶化、シリカゲルクロマトグラフィー、分取ＨＰＬＣ等の慣用される方法を適宜選択し、また組み合わせて行えばよい。

製法１－１



（式中、R^{C1}は、アミン保護基であり、Ｈａｌ^{1}は、ハロゲン原子であり、R^{C2}及びR^{C3}は、それぞれ同一又は異なって、水酸基又は脱離基であり、ここで、化合物［７］及び化合物［８］は、それぞれ、環Ｃ－Y^{1}－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Y^{1}－環Ｃ、Y^{2}－Ｃ（＝Ｏ）－Ｏ－Ｃ（＝Ｏ）－Y^{2}で表される酸無水物であってもよく、

Y^{1}は、＊－$(CH_2)_p$－、＊－NR^{10}－$(CH_2)_q$－、＊－$(CH_2)_r$－Ｏ－$(CH_2)_s$－、＊－$(CH_2)_t$－ＮＨ－$(CH_2)_u$－、－$(CH_2)_v$－ＣＯＮＨ－$(CH_2)_w$－、又は、＊－ＮＨ－SO_2－であり、

Y^{2}は、水素原子、

グループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

＊－OR^2、＊－$COOR^6$、－CH＝CH－$COOR^{11}$、＊－$(CH_2)_a$－NH－R^7、＊－$(CH_2)_b$－$NHCOR^8$、＊－$(CH_2)_c$－$NHCOOR^9$、又は、＊－$CONH_2$であり、

ここで＊は、カルボニル基に結合する側であり、その他各記号は前述の通りである。）

脱離基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、p－ニトロフェニルオキシ基、アジド基等が挙げられる。

アミン保護基としては、ベンゾイル基、tert－ブチル基、tert－ブチルカルボニル基、tert－ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、トリフルオロアセチル基、フルオレニルメトキシカルボニル基等が挙げられる。

工程1

常法により、化合物［1］に保護基を導入することにより、化合物［2］を得ることができる。

例えば、R^{C1}がtert－ブトキシカルボニル基である場合、冷却乃至室温下、テトラヒドロフラン（THF）、1，4－ジオキサン、及びそれらと水との混合溶媒等の溶媒中、水酸化ナトリウム等の塩基の存在下又は非存在下、tert－ブトキシカルボニルクロリド、2－tert－ブチルオキシカルボニル－オキシイミノ－2－フェニルアセトニトリル、或いはジ－tert－ブチルジカルボナートで処理をすればよい。

工程2

化合物［2］を、溶媒中、塩基の存在下、4－（ジメチルアミノ）ピリジン等の触媒の存在下又は非存在下、化合物［3］と反応させることにより、化合物［4］を得ることができる。

溶媒としては、水、1，4－ジオキサン、アセトニトリル、THF、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン、ピリジン、N，N－ジメチルホルムアミド（DMF）等の単独又は混合溶媒が挙げられ、好ましくは、1，4－ジオキサンと水との混合溶媒、又はクロロホルムである。

塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、2，6－ルチジン、2，4，6－

コリジン、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等が挙げられ、好ましくは、トリエチルアミンである。

Hal^1として好ましくは、塩素原子である。

工程３

カルボン酸化合物［４］を、溶媒中、縮合剤の存在下、アミン化合物［５］とアミド縮合させることにより化合物［６］を得ることができる。

また、カルボン酸化合物［４］を塩化チオニル、塩化オキサリル等で誘導される酸ハライドとする（このとき触媒量のＤＭＦを加えてもよい。）、或いはクロロ炭酸エチル等により誘導される混合酸無水物とする等の方法により、カルボン酸化合物［４］の反応性誘導体とし、次いで、塩基の存在下、アミン化合物［５］と反応させることにより化合物［６］を得ることもできる。

溶媒としては、ＤＭＦ、アセトニトリル、ＴＨＦ、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、好ましくはＤＭＦである。

縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩、ジフェニルホスホリルアジド等が挙げられる。必要に応じて、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール等を加えてもよい。

塩基としては、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン、Ｎ－メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミンである。

工程４

常法により、化合物［６］のアミン保護基を除去することにより、化合物［１－１］を得ることができる。

例えば、R^{c1}がｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基の場合、室温下、酢酸エチル又はメタノール溶液中、塩化水素－酢酸エチル溶液で処理をする；室温下、テトラヒドロフラン中、塩酸で処理をする；或いは室温下、メタノール又はクロロホルム溶媒中、塩化水素－１，４－ジオキサン溶液で処理をする；クロロホルム溶液中、トリフルオロ酢酸で処理する等の方法を用い脱保護すればよい。

工程５

本工程において、R^{C2}は水酸基又は脱離基であり、脱離基として好ましくは、塩素原子である。

R^{C2}が水酸基の場合、製法１－１の工程３と同様にして、化合物［Ｉ－１］と化合物［７］を反応させることにより、化合物［Ｉ－２］を得ることができる。

R^{C2}が脱離基の場合、化合物［Ｉ－１］を、溶媒中、塩基の存在下、化合物［７］を反応させることにより、化合物［Ｉ－２］を得ることができる。

溶媒としては、ＤＭＦ、アセトニトリル、ＴＨＦ、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、好ましくはＤＭＦ、ＴＨＦ、クロロホルムである。

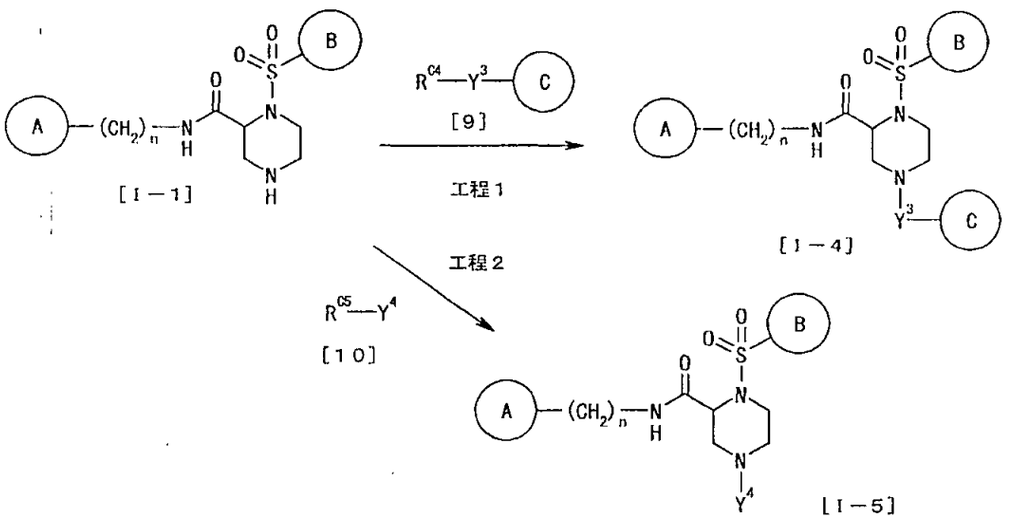
塩基としては、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、Ｎ－メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミンである。

工程６

本工程において、R^{C3}は水酸基又は脱離基であり、脱離基として好ましくは、塩素原子である。化合物［８］が、$Y^2-C(=O)-O-C(=O)-Y^2$で表される酸無水物である場合もまた、好ましい態様のひとつである。

前工程と同様にして、化合物［Ｉ－１］と化合物［８］を反応させることにより、化合物［Ｉ－３］を得ることができる。

製法１－２



（式中、R^{C4}及びR^{C5}は、それぞれ同一又は異なって、脱離基であり、

Y^3は、結合、又はC_{1-4}アルキレンであり、

Y^4は、$-SO_2R^5$、又はグループBから選ばれる1乃至5個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程1

本工程において、R^{C4}は脱離基であり、好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、メタンスルホニルオキシ基、p－トルエンスルホニルオキシ基、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基等であり、より好ましくは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチルチオ基、又はメチルスルホニル基である。

化合物［I－1］を、溶媒中、塩基の存在下、化合物［9］と反応させることにより、化合物［1－4］を得ることができる。

溶媒としては、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、DMF、アセトニトリル、THF、クロロホルム、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等が挙げられる。

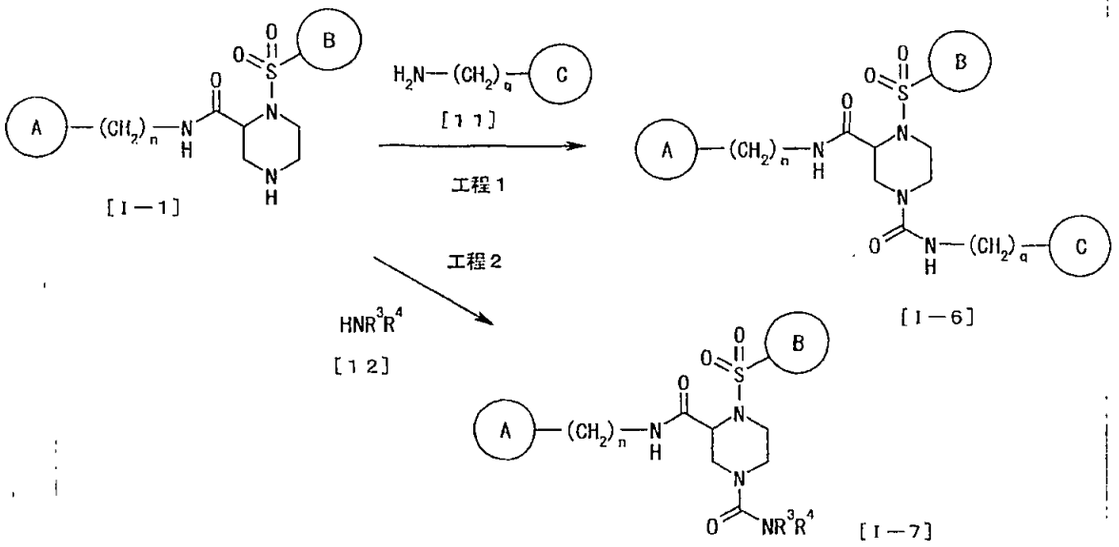
塩基としては、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4－（ジメチルアミノ）ピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられる。

工程2

本工程において、R^{C5}は脱離基であり、好ましくは、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である。

前工程と同様にして、化合物［I－1］を、化合物［10］と反応させることにより、化合物［I－5］を得ることができる。

製法1－3



（式中、各記号は前述の通りである。）

工程１

化合物［１１］を、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下、カルボニルジイミダゾール又はトリホスゲンと反応させ、次いで、塩基の存在下、化合物［Ｉ－１］と反応させることにより、化合物［Ｉ－６］を得ることができる。

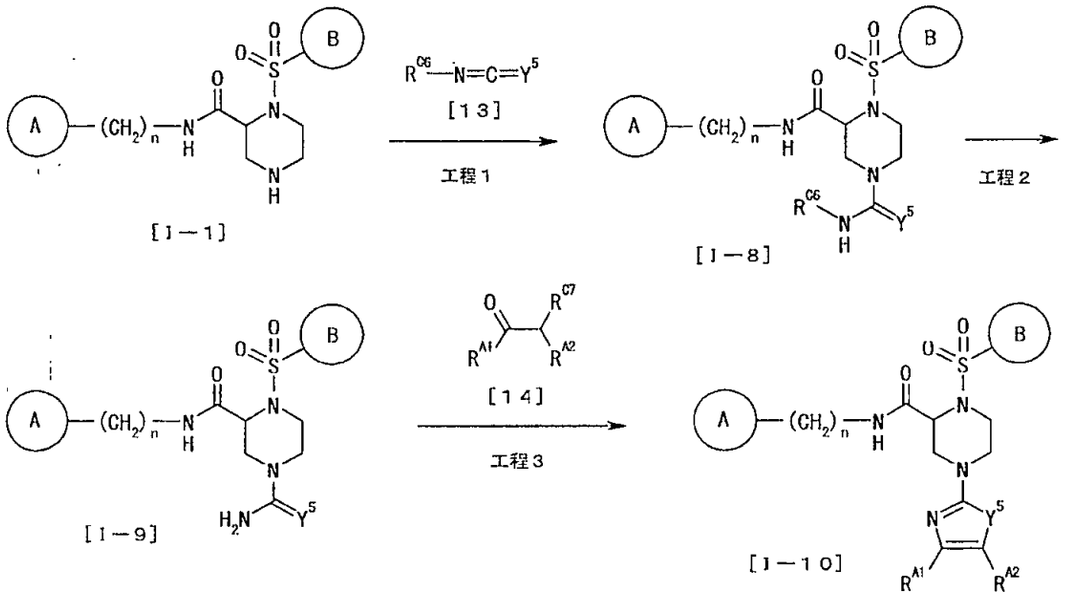
溶媒としては、クロロホルム、ＤＭＦ、アセトニトリル、ＴＨＦ、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、好ましくはクロロホルムである。

塩基としては、トリエチルアミン、炭酸カリウム、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられ、好ましくは、トリエチルアミンである。

工程２

前工程と同様にして、化合物［１２］を化合物［Ｉ－１］と反応させることにより、化合物［Ｉ－７］を得ることができる。

製法１－４



（式中、R^{C6}は、アミン保護基であり、R^{C7}は、ハロゲン原子であり、Y^5は、酸素原子又は硫黄原子であり、R^{A1}及びR^{A2}は、それぞれ同一又は異なって、グループAから選ばれる置換基であり、その他記号は前述の通りである。）

ここで、化合物［１４］として、R^{A1}とR^{A2}が一緒になって環を形成する化合物を用いることにより、４，５，６，７－テトラヒドロベンゾチアゾール、４，５，６，７－テトラヒドロベンゾオキサゾール、８Ｈ－インデノ［１，２－ｄ］チアゾール等の縮合環を形成することもできる。

工程１

化合物［Ｉ－１］を、溶媒中、塩基の存在下、化合物［１３］と反応させることにより、化合物［Ｉ－８］を得ることができる。

溶媒としては、クロロホルム、ＤＭＦ、アセトニトリル、ＴＨＦ、酢酸エチル、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、好ましくはクロロホルムである。

塩基としては、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられ、好ましくは、トリエチルアミンである。

工程２

常法により、化合物［Ｉ－８］を脱保護することにより、化合物［Ｉ－９］を得ることができる。

例えば、R^{C6}が、フルオレニルメトキシカルボニル基の時、化合物［Ｉ－８］を、塩基の存在下、反応させることにより化合物［Ｉ－９］を得ることができる。

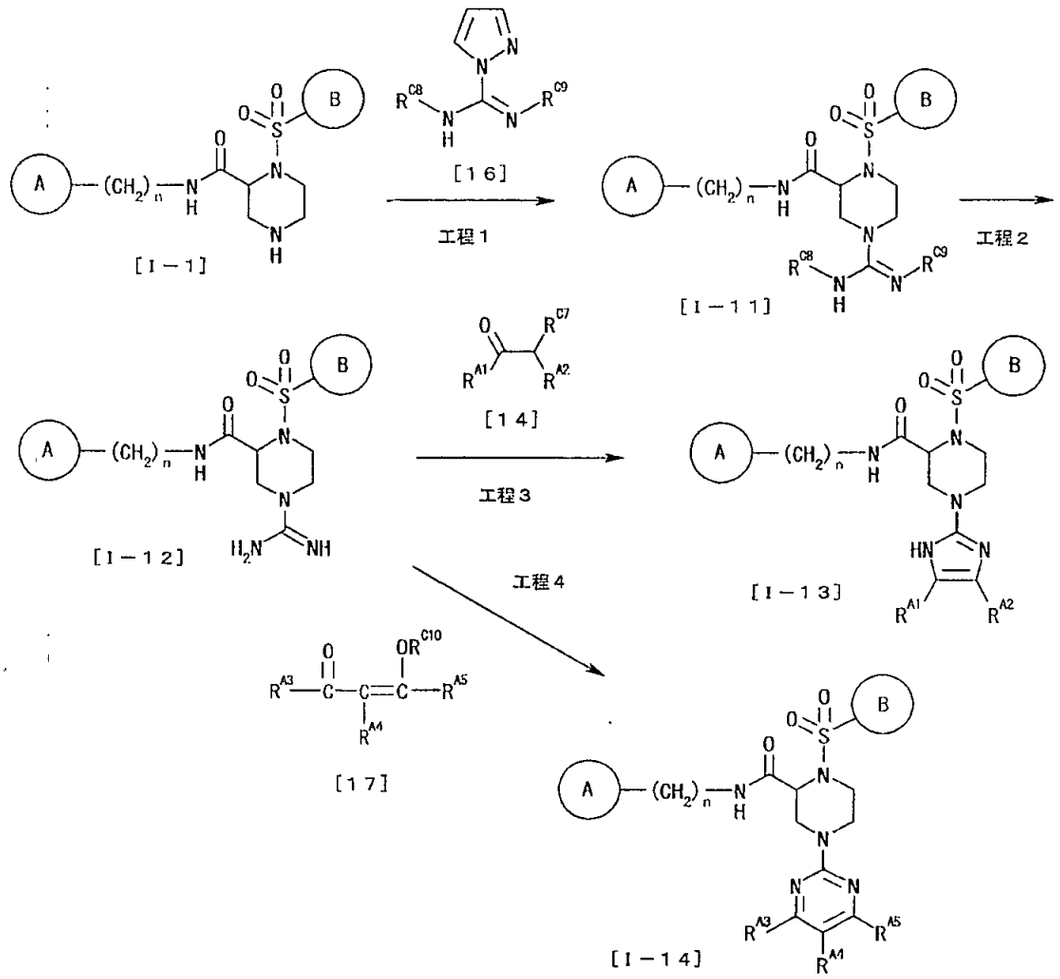
塩基としては、ピペリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン、モルホリン、ジシクロヘキシルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、テトラブチルアンモニウムフルオリド等が挙げられ、好ましくは、ピペリジンである。

工程３

化合物［Ｉ－９］を、溶媒中、加熱下、化合物［１４］と反応させることにより化合物［Ｉ－１０］を得ることができる。

溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ＤＭＦ、Ｎ－メチルピロリドン、ＴＨＦ、トルエン等が挙げられ、好ましくは、アセトニトリルである。

製法１－５



（式中、R^{C8}及びR^{C9}は、アミン保護基であり、R^{C10}は、メチル基、エチル基等のC_{1-4}アルキル基であり、R^{A3}、R^{A4}及びR^{A5}は、それぞれ同一又は異なって、グループAから選ばれる置換基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程1

化合物［I－1］を、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下、化合物［16］と反応させることにより、化合物［I－11］を得ることができる。

溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、DMF、THF、トルエン等が挙げられ、好ましくはアセトニトリル又はDMFである。

塩基としては、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4－（ジメチルアミノ）ピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等が挙げられ、好ましくは、ジイソ

プロピルエチルアミンである。

工程２

常法により、化合物［Ｉ－１１］のアミン保護基を除去することにより、化合物［Ｉ－１２］を得ることができる。

R^{C8}及びR^{C9}として好ましくは、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基である。

工程３

化合物［Ｉ－１２］を、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下、化合物［１４］と反応させることにより、化合物［Ｉ－１３］を得ることができる。

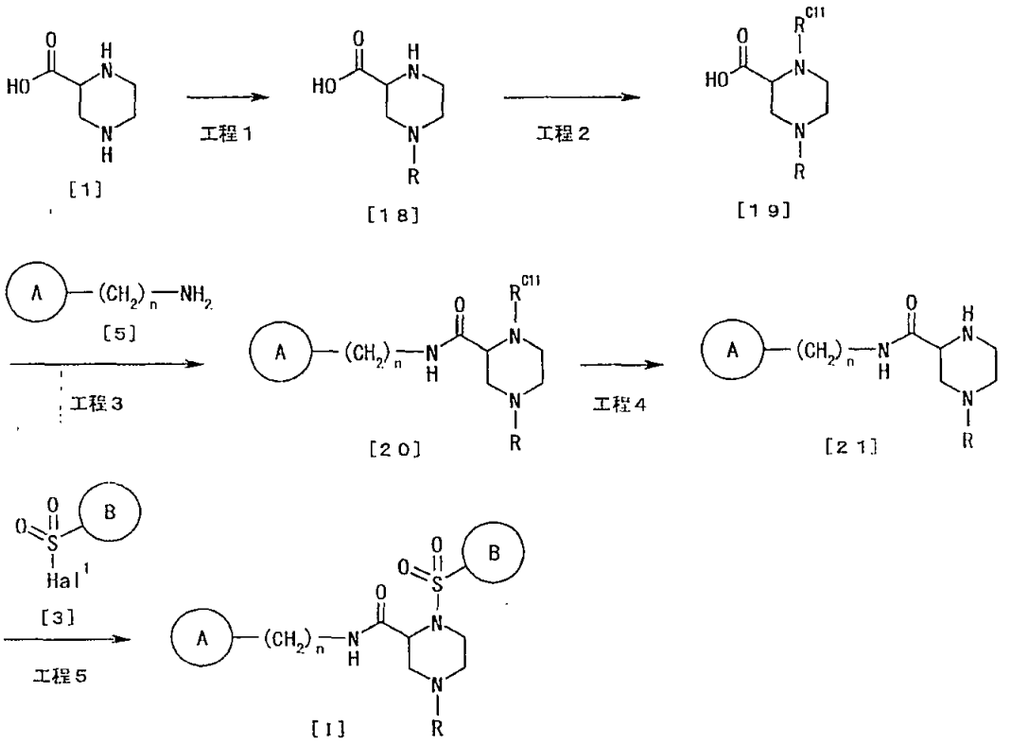
溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ＤＭＦ、ＴＨＦ、トルエン、１，４－ジオキサン等が挙げられ、好ましくはメタノール又はエタノールである。

塩基としては、ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、酢酸ナトリウム、アンモニア等が挙げられ、好ましくは、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシドである。

工程４

製法１－５の工程３と同様にして、化合物［Ｉ－１２］を、化合物［１７］と反応させることにより、化合物［Ｉ－１４］を得ることができる。

製法２



[1] [18] [19] [5] [20] [21] [3] [I]

（式中、R^{C11}は、アミン保護基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程１

製法１－１から１－５と同様にして、又は、常法により、化合物［１］から化合物［１８］を得ることができる。

工程２

常法により、化合物［１８］に保護基を導入することにより、化合物［１９］を得ることができる。

R^{C11}として好ましくは、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基である。

工程３

製法１－１の工程３と同様にして、化合物［１９］を、化合物［５］と反応させることにより、化合物［２０］を得ることができる。

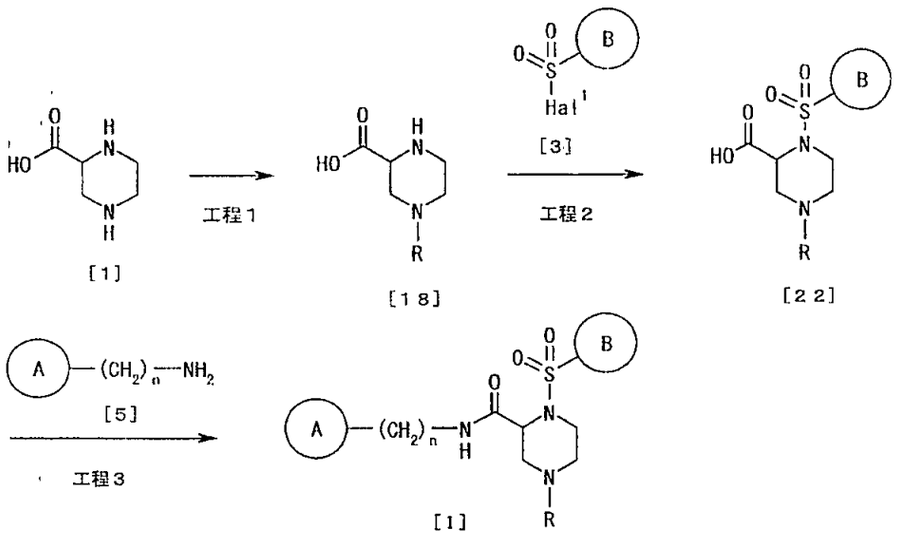
工程４

常法により、化合物［２０］のアミン保護基を除去することにより、化合物［２１］を得ることができる。

工程５

製法１－１の工程２と同様にして、化合物［２１］を、化合物［３］と反応させることにより、化合物［Ｉ］を得ることができる。

製法３



（式中、各記号は前述の通りである。）

工程１

製法１－１から１－５と同様にして、又は、常法により、化合物［１］から化合物［１８］を得ることができる。

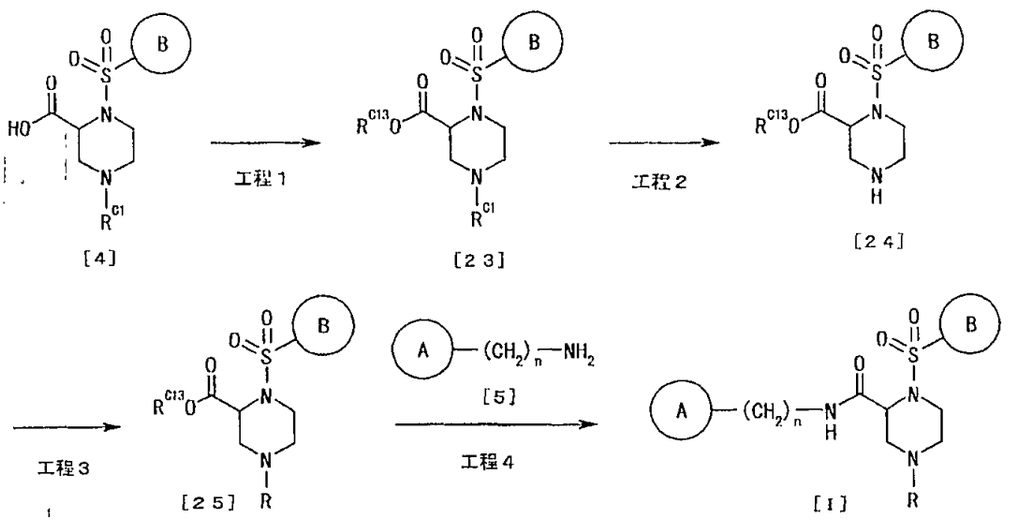
工程２

製法１－１の工程２と同様にして、化合物［１８］を、化合物［３］と反応させることにより、化合物［２２］を得ることができる。

工程３

製法１－１の工程３と同様にして、化合物［２２］を、化合物［５］と反応させることにより、化合物［Ｉ］を得ることができる。

製法４



[4] [23] [24] [25] [I]

（式中、R^{C13}は、カルボン酸保護基であり、その他記号は前述の通りである。）

カルボン酸保護基として、メチル基、エチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、ベンジル基、アリル基、テトラヒドロピラニル基等が挙げられる。

工程１

常法により、化合物［４］のカルボキシル基に保護基を導入することにより、化合物［２３］を得ることができる。

例えば、R^{C13}がベンジル基の場合、クロロホルム溶媒中、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等の触媒の存在下又は非存在下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩等の縮合剤の存在下、化合物［４］とベンジルアルコールを反応させることにより化合物［２３］を得ることができる。

工程２

常法により、化合物［２３］のアミン保護基を除去することにより、化合物［２４］を得ることができる。

R^{C1}として好ましくは、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基である。

工程３

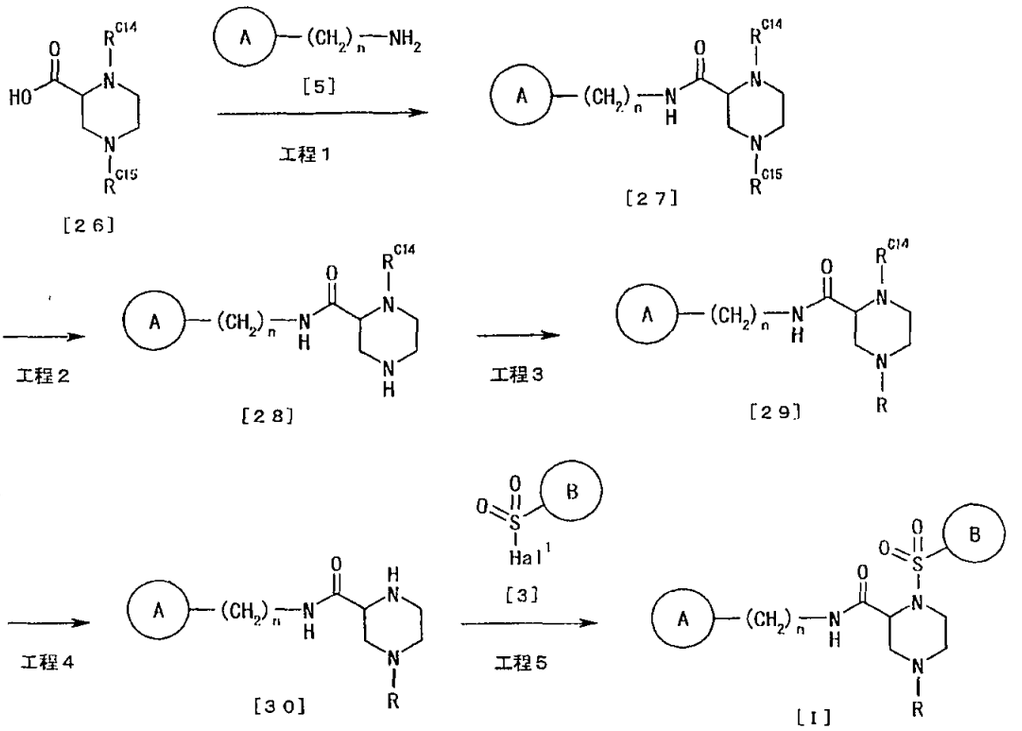
製法１－１から１－５と同様にして、又は、常法により、化合物［２４］から化合物［２５］を得ることができる。

工程４

R^{C13}を常法により除去した後、製法１－１の工程３と同様にして、化合物［２

5］を、化合物［５］と反応させることにより、化合物［Ｉ］を得ることができる。

製法５



（式中、R^{C14}及びR^{C15}は、それぞれ同一又は異なって、アミン保護基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程１

常法により得られる化合物［２６］を、製法１－１の工程３と同様にして、化合物［５］と反応させることにより、化合物［２７］を得ることができる。

工程２

常法により、化合物［２７］のアミン保護基を除去することにより、化合物［２８］を得ることができる。

ここで、R^{C14}とR^{C15}の組み合わせとしては、それぞれ、ベンジルオキシカルボニル基とｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基、トリフルオロアセチル基とベンジルオキシカルボニル基、トリフルオロアセチル基とｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基、９－フルオレニルメチルオキシカルボニル基とベンジルオキシカルボニル基、９－フルオレニルメチルオキシカルボニル基とｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基等の組み合わせが挙げられ、好ましくは、ベンジルオキシカルボニル基とｔｅｒｔ－ブト

キシカルボニル基の組み合わせである。

工程３

製法１－１から１－５と同様にして、又は、常法により、化合物［２８］から化合物［２９］を得ることができる。

工程４

常法により、化合物［２９］のアミン保護基を除去することにより、化合物［３０］を得ることができる。

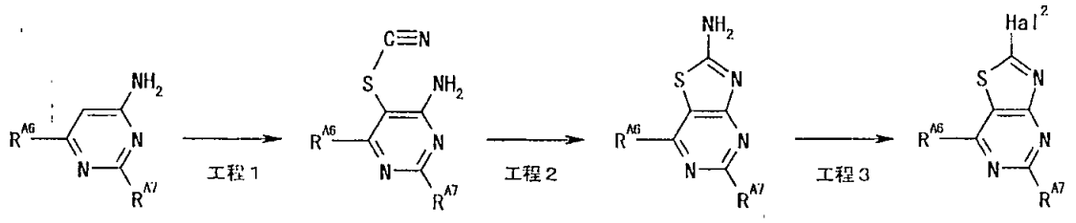
工程５

製法１－１の工程２と同様にして、化合物［３０］を、化合物［３］と反応させることにより、化合物［Ｉ］を得ることができる。

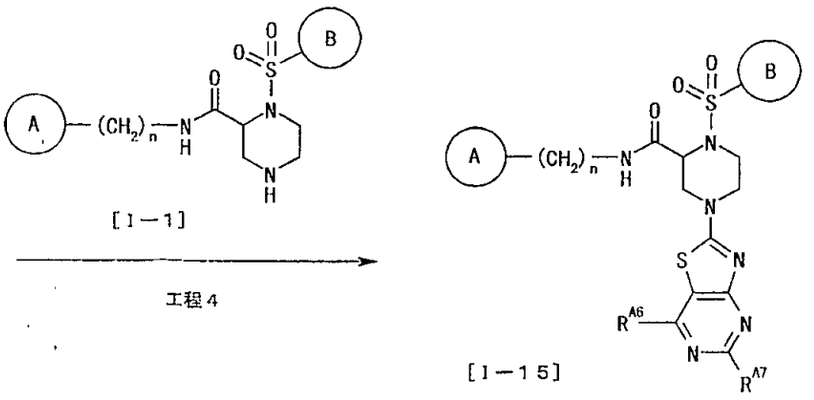
製法１－２－１

$R^{C4}-Y^3-$環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループ Ａから選ばれる置換基によって置換されてもよいチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。

本製法は、チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イルのピリミジン部位が、例えば他のアリール基であっても適用可能である。



［３０］ ［３１］ ［３２］ ［３３］



［Ｉ－１］ ［Ｉ－１５］

（式中、R^{A6}及びR^{A7}は、それぞれ同一又は異なって、水素原子又はグループAから選ばれる置換基であり、Hal^2は、臭素原子、塩素原子等のハロゲン原子であり、その他記号は前述の通りである。）

工程１

化合物［３０］を、溶媒中、塩基の存在下、チオシアン酸カリウム、チオシアン酸ナトリウム、チオシアン酸アンモニウム等のチオシアン酸塩、及び、ハロゲンと反応させることにより化合物［３１］を得ることができる。

溶媒としては、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、又は、ＤＭＦ、ＴＨＦ、トルエン等が挙げられ、好ましくはＤＭＦ又はメタノールである。

塩基としては、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等が挙げられ、好ましくはピリジンである。

ハロゲンとして好ましくは、臭素である。

工程２

化合物［３１］を、溶媒中、加熱することにより、化合物［３２］を得ることができる。

溶媒としては、含水又は非含水のＤＭＦ、ジメチルスルホキシド（ＤＭＳＯ）等が挙げられ、好ましくは非含水のＤＭＦである。

また、化合物［３１］を無水酢酸で加熱後、炭酸ナトリウム水溶液、又は、水酸化ナトリウム水溶液等のアルカリ溶液で処理することにより、化合物［３２］を得ることもできる。

工程３

化合物［３２］のアミノ基を、常法により脱離基に置換することにより、化合物［３３］を得ることができる。

例えば、Hal^2が塩素原子の場合、水酸化ナトリウム水溶液に懸濁させた化合物［３２］に亜硝酸ナトリウムを加え、次いで、塩酸を加える、或いは、化合物［３２］の塩酸溶液に亜硝酸ナトリウムを加える、或いは、化合物［３２］の酢酸溶液に塩酸を加え、次いで、亜硝酸ナトリウムを加えることにより、化合物［３３］を得ることができる。

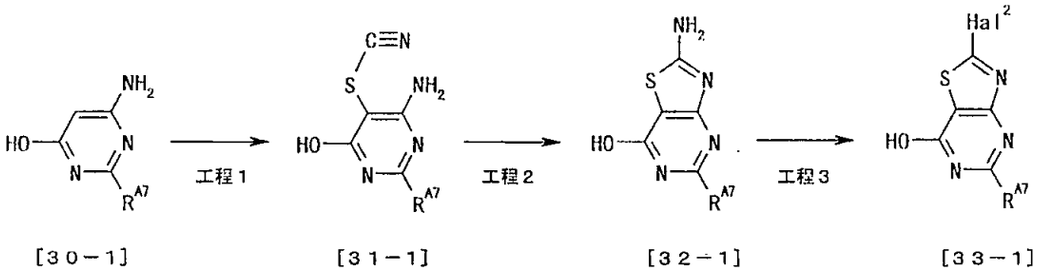
Hal^2として好ましくは、塩素原子である。

工程４

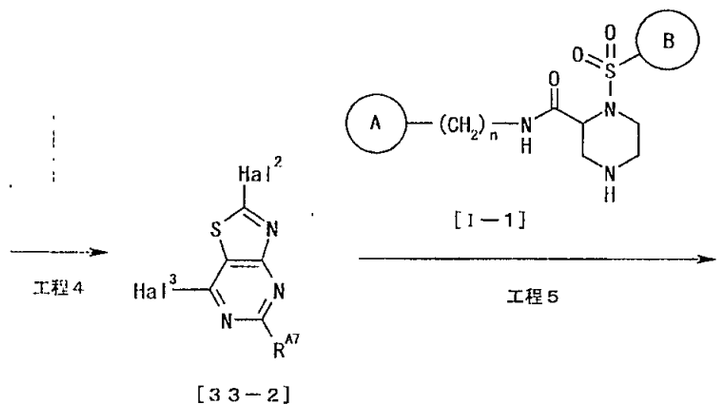
製法１－２の工程１と同様にして、化合物［３３］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［Ｉ－１５］を得ることができる。

製法１－２－１－１

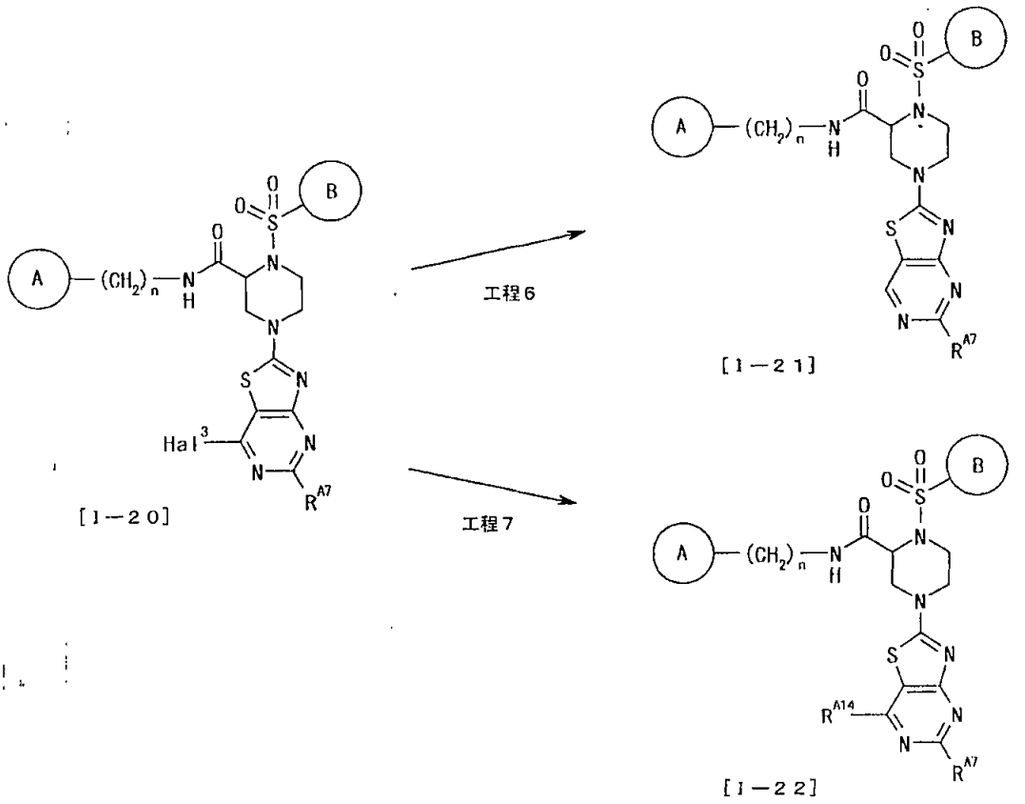
チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル基上の置換基を変換する製造例



［３０－１］ ［３１－１］ ［３２－１］ ［３３－１］



［３３－２］



[I－20]

[I－21]

[I－22]

（式中、Ｈａｌ^{3}は、ハロゲン原子であり、Ｒ^{A14}は、下記グループＡ１から選ばれる置換基であり、その他記号は前述の通りである。）

グループＡ１：

ニトロ基、シアノ基、

－ＯＲ^{a1}、

－ＳＲ^{a2}、

－ＮＲ^{a3}Ｒ^{a4}、

－ＮＨＣＯＲ^{a5}、

－ＮＨＳＯ$_2$Ｒ^{a14}、

－ＣＯＯＲ^{a6}、

－ＣＯＮＲ^{a7}Ｒ^{a8}、

－ＳＯ$_2$ＮＲ^{a9}Ｒ^{a10}、

－ＳＯ$_2$ＮＨＣＯＲ^{a15}、

－ＣＯＲ^{a11}、

－ＳＯ$_2$Ｒ^{a12}、

$-CONHSO_2R^{a13}$、

グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{1-10}アルキル基、

グループＢから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{2-10}アルキニル基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-12}炭素環基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{6-12}アリール－C_{1-4}アルキル基、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいヘテロ環－C_{1-4}アルキル基、及び、

グループＣから選ばれる１乃至５個の置換基によって置換されてもよいC_{3-10}シクロアルキル－C_{1-4}アルキル基。

工程１

製法１－２－１の工程１と同様にして、化合物［３０－１］から化合物［３１－１］を得ることができる。

工程２

製法１－２－１の工程２と同様にして、化合物［３１－１］をから、化合物［３２－１］を得ることができる。

工程３

製法１－２－１の工程３と同様にして、化合物［３２－１］のアミノ基を、常法によりハロゲン原子に置換することにより、化合物［３３－１］を得ることができる。

工程４

化合物［３３－１］の水酸基を、常法によりハロゲン原子に置換することにより、化合物［３３－２］を得ることができる。

例えば、化合物［３３－１］を、無溶媒或いは溶媒中、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化剤の存在下、加熱条件下で反応させることにより、化合物［３

３－２］を得ることができる。

反応を促進させるため、水、又は、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン，トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン等の塩基を加えてもよい。

溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム、１，４－ジオキサン、ＴＨＦ等が挙げられる。

工程５

製法１－２の工程１と同様にして、化合物［３３－２］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［Ｉ－２０］を得ることができる。

工程６

化合物［Ｉ－２０］のHal^3を、常法により還元することにより、化合物［Ｉ－２１］を得ることができる。

例えば、メタノール、エタノール等のアルコール溶媒中、ギ酸アンモニウムの存在下、パラジウム炭素、水酸化パラジウム等の触媒を用い、加熱条件下で反応させることにより化合物［Ｉ－２１］を得ることができる。

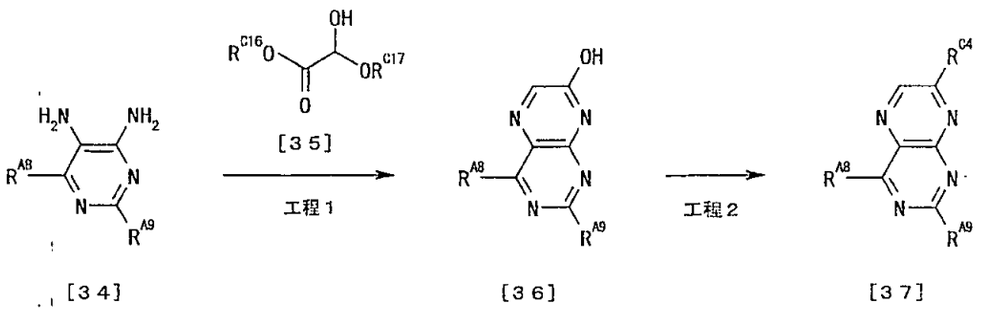
工程７

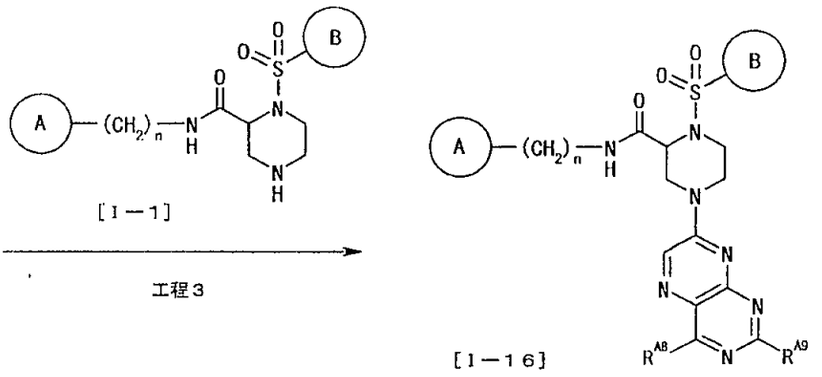
化合物［Ｉ－２０］のHal^3に、常法により置換基を導入・変換することにより、化合物［Ｉ－２２］を得ることができる。

製法１－２－２

R^{C4}－Y^3－環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループ Ａから選ばれる置換基によって置換されてもよいプテリジン－７－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。

本製法は、プテリジン－７－イルのピリミジン部位が、例えば他のアリール基であっても適用可能である。





（式中、R^{A8}及びR^{A9}は、それぞれ同一又は異なって、水素原子又はグループAから選ばれる置換基であり、R^{C16}及びR^{C17}は、それぞれ同一又は異なって、メチル基、エチル基等のC_{1-4}アルキル基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程1

化合物［34］を、溶媒中、塩基の存在下、加熱条件下で、化合物［35］と反応させることにより化合物［36］を得ることができる。

溶媒と塩基の組み合わせは、酢酸と水の混合溶媒、及び、酢酸ナトリウムの組み合わせが好ましい。

工程2

化合物［36］の水酸基を、常法により脱離基に置換することにより、化合物［37］を得ることができる。

例えば、R^{C4}が塩素原子の場合、溶媒中、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化剤の存在下、加熱することにより、化合物［37］を得ることができる。

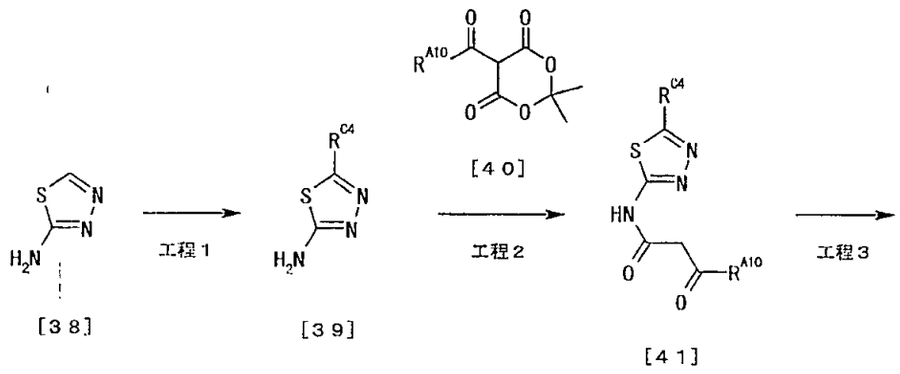
溶媒としては、ペンタクロロエタン、DMF、キシレン、ピリジン等が挙げられ、好ましくはペンタクロロエタンである。

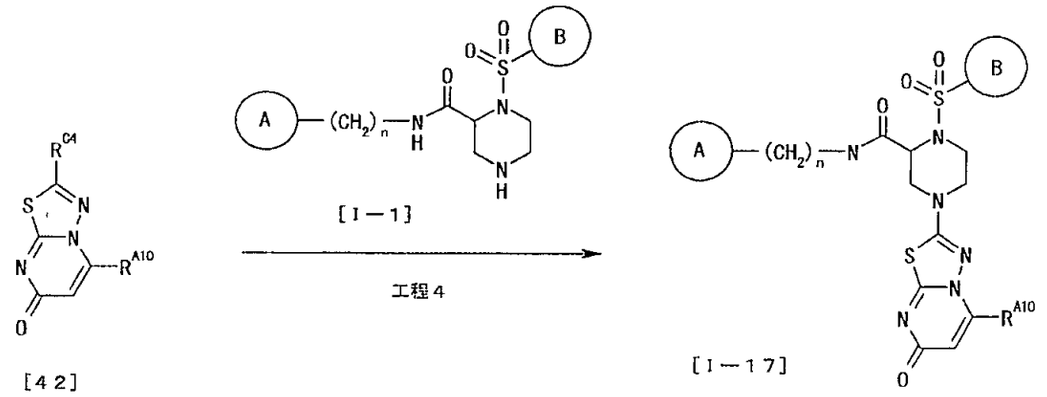
工程3

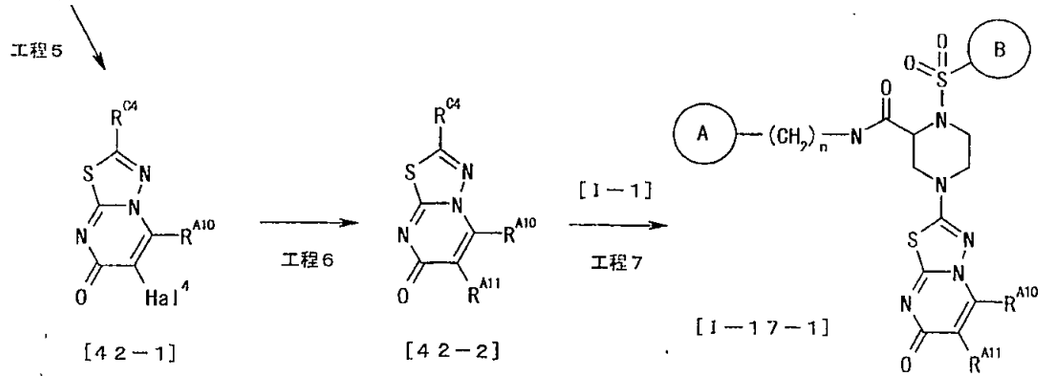
製法１－２の工程１と同様にして、化合物［３７］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［Ｉ－１６］を得ることができる。

製法１－２－３－１

R^{C4}－Y^3－環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループ
5 Ａから選ばれる置換基によって置換されてもよい７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。







（式中、R^{A10}及びR^{A11}は、それぞれ同一又は異なって、上記グループＡ１から選ばれる置換基であり、Ｈａｌ^{4}は、臭素原子、塩素原子等のハロゲン原子であり、その他記号は前述の通りである。）

工程１

化合物［３８］に、常法で脱離基を導入することにより、化合物［３９］を得ることができる。

例えば、R^{C4}がハロゲン原子の場合、化合物［３８］を、酢酸及び酢酸ナトリウムの存在下、ハロゲンと反応させることにより化合物［３９］を得ることができる。

工程２

化合物［３９］を、溶媒中、加熱条件下で化合物［４０］と反応させることにより化合物［４１］を得ることができる。

また、化合物［４０］に替えて、４－メチレンオキセタン－２－オンを用いることによっても、R^{A10}がメチル基である化合物［４１］を得ることができる。

溶媒としては、ＤＭＦ、ＴＨＦ、トルエン等が挙げられ、好ましくはトルエンである。

工程３

化合物［４１］を、濃硫酸、濃塩酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の酸の存在下、加熱条件下で反応させることにより化合物［４２］を得ることができる。

工程４

製法１－２の工程１と同様にして、化合物［４２］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［１－１７］を得ることができる。

工程５

化合物［４２］を、常法によりハロゲン化することにより、化合物［４２－１］を得ることができる。

工程６

化合物［４２－１］のＨａｌ^{4}に、常法により置換基を導入･変換することにより、化合物［４２－２］を得ることができる。

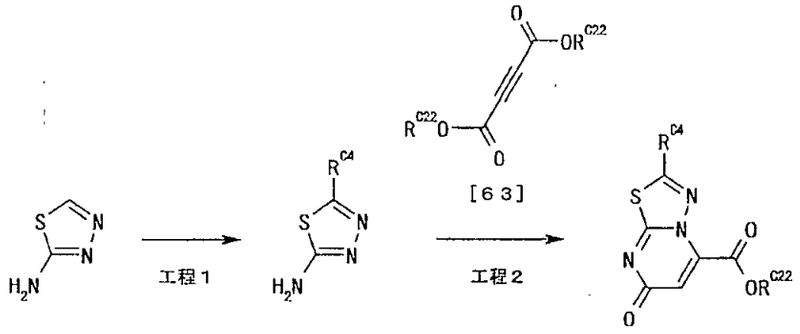
工程７

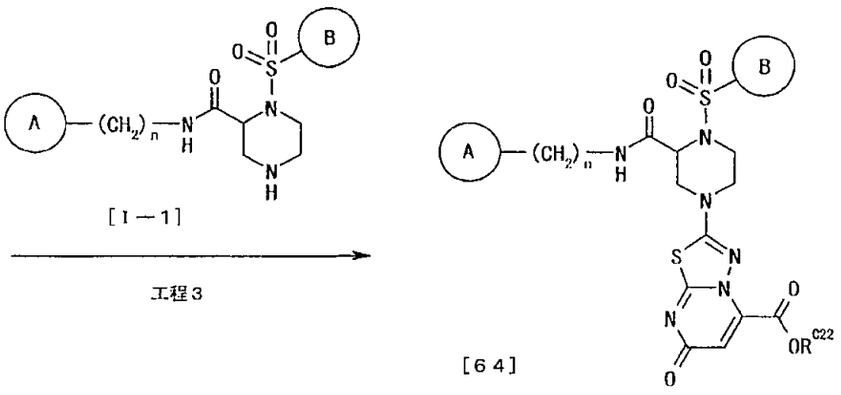
製法１－２の工程１と同様にして、化合物［４２－２］と化合物［Ｉ－１］を反

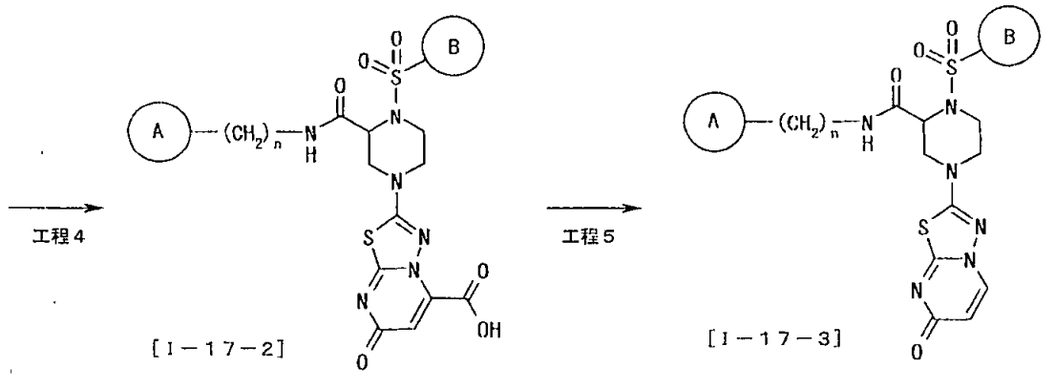
応させることにより化合物［Ｉ－１７－１］を得ることができる。

製法１－２－３－２

R^{C4}－Y^3－環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループ Ａから選ばれる置換基によって置換されてもよい７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］ チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。







（式中、R^{C22}は、カルボン酸保護基であり、その他記号は前述の通りである。）

工程１

製法１－２－３－１の工程１と同様にして、化合物［３８］に、常法で脱離基を導入することにより、化合物［３９］を得ることができる。

工程２

化合物［３９］を、メタノール、ｔｅｒｔ－ブチルアルコール等のアルコール系の溶媒中、加熱条件下で化合物［６３］と反応させることにより化合物［４２－１］を得ることができる。

工程３

製法１－２の工程１と同様にして、化合物［４２－１］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［６４］を得ることができる。

工程４

化合物［６４］のカルボン酸保護基を常法で脱保護することにより、化合物［Ｉ－１７－２］を得ることができる。

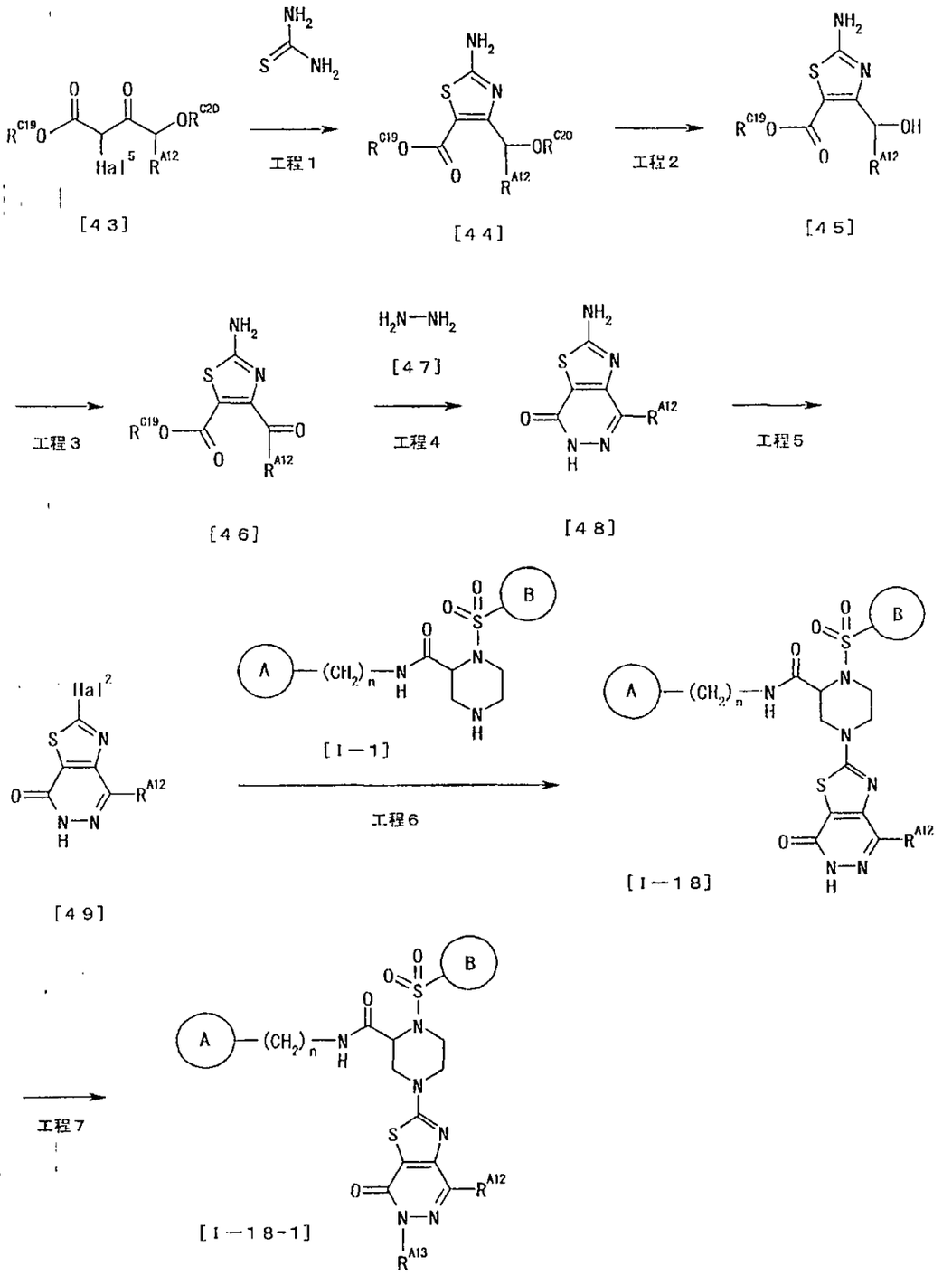
工程５

化合物［Ｉ－１７－２］を溶媒中、加熱することにより、化合物［Ｉ－１７－３］を得ることができる。

溶媒としては、ジフェニルエーテル、ジエチレングリコール等が挙げられる。

製法１－２－４

R^{C4}－Y^3－環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループ Ａから選ばれる置換基によって置換されてもよい７－オキソ－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。



（式中、R^{A12}は、水素原子又はグループAから選ばれる置換基であり、R^{A13}は、グループAから選ばれる置換基であり、R^{C19}は、カルボン酸保護基であり、R^{C20}は、水酸基保護基であり、Hal^5は、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子であり、その他記号は前述の通りである。）

水酸基保護基としては、メチル基、エチル基、ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル基、アセチル基、ベンジル基、メトキシエトキシメチル基等が挙げられる。

工程１

化合物［４３］を、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、又は、アセトニトリル溶媒中、加熱条件下でチオウレアと反応させることにより化合物［４４］を得ることができる。

工程２

化合物［４４］の水酸基の保護基を常法で脱保護することにより、化合物［４５］を得ることができる。

例えば、R^{C20}がメチル基の場合、ジクロロメタン溶媒中、三臭化ホウ素を加え、次いで水酸化ナトリウム水溶液を加えることにより化合物［４５］を得ることができる。

工程３

化合物［４５］を常法で酸化することにより、化合物［４６］を得ることができる。

例えば、クロロホルム、ジクロロエタン、１，４－ジオキサン、ＤＭＦ等の溶媒、或いは、それらの混合溶媒中、二酸化マンガンで処理することにより化合物［４６］を得ることができる。

工程４

化合物［４６］を、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒中、加熱条件下で化合物［４７］と反応させることにより化合物［４８］を得ることができる。

反応を促進させるために、酢酸を加えてもよい。

工程５

製法１－２－１の工程３と同様にして、化合物［４８］のアミノ基を脱離基に変換することにより化合物［４９］を得ることができる。

工程６

製法１－２の工程１と同様にして、化合物［４９］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［Ｉ－１８］を得ることができる。

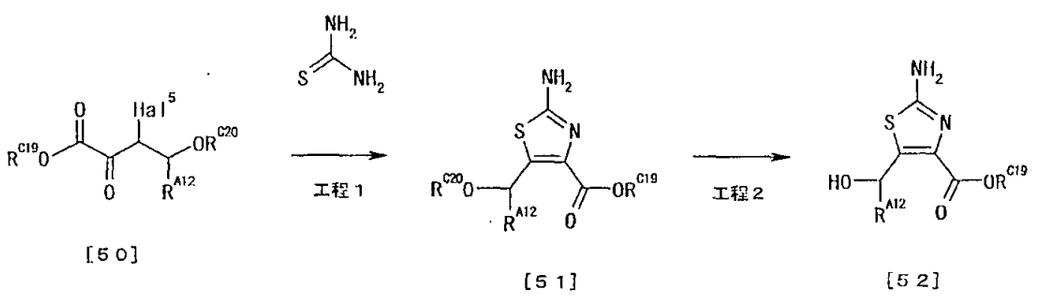
工程７

化合物［Ｉ－１８］の窒素原子上に、常法により、グループＡから選ばれる置換基を導入することにより、化合物［Ｉ－１８－１］を得ることができる。

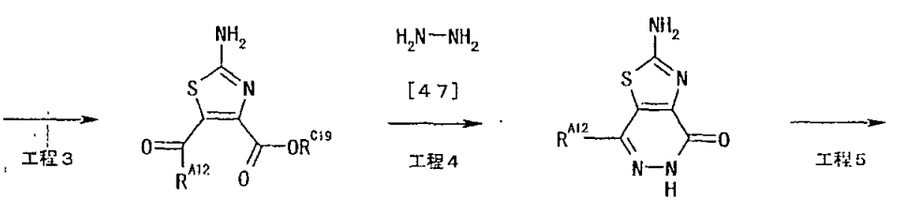
化合物［４７］に替えて、$R^{A13}-NH-NH_2$を用いて、本工程５及び工程６の製法を実施することにより、化合物［Ｉ－１８－１］を得ることもできる。

製法１－２－５

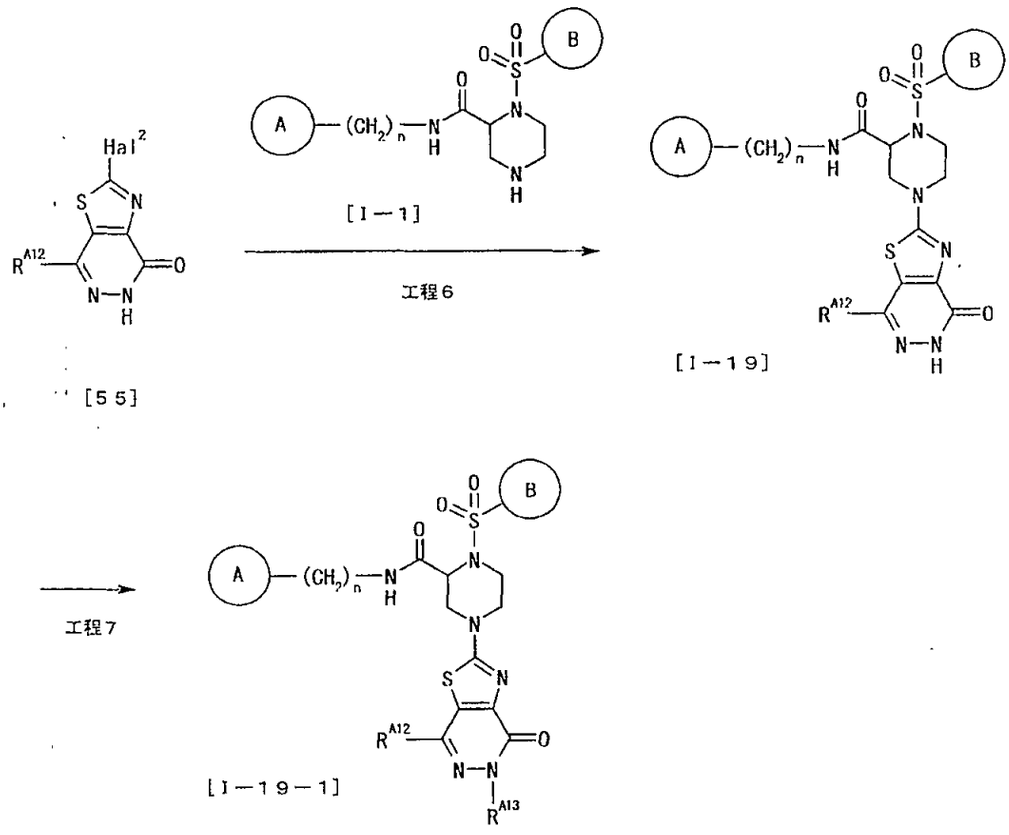
$R^{C4}-Y^3-$環Ｃ（化合物［９］）において、Y^3が結合であり、環Ｃがグループから選ばれる置換基によって置換されてもよい４－オキソ－４，５－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イルのとき、以下の方法によって化合物［Ｉ］を製造することもできる。



［５０］ ［５１］ ［５２］



［５３］ ［５４］



（式中、各記号は前述の通りである。）

工程１

製法１－２－４の工程１と同様にして、化合物［５０］をチオウレアと反応させることにより化合物［５１］を得ることができる。

工程２

製法１－２－４の工程２と同様にして、化合物［５１］の水酸基の保護基を常法で脱保護することにより、化合物［５２］を得ることができる。

工程３

製法１－２－４の工程３と同様にして、化合物［５２］を常法で酸化することにより、化合物［５３］を得ることができる。

工程４

製法１－２－４の工程４と同様にして、化合物［５３］と化合物［４７］を反応させることにより化合物［５４］を得ることができる。

工程５

製法１－２－１の工程３と同様にして、化合物［５４］のアミノ基を脱離基に変換することにより化合物［５５］を得ることができる。

工程６

製法１－２の工程１と同様にして、化合物［５５］と化合物［Ｉ－１］を反応させることにより化合物［Ｉ－１９］を得ることができる。

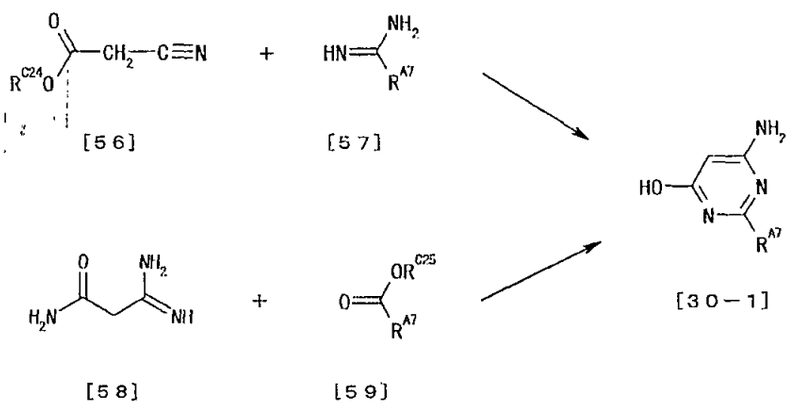
工程７

化合物［Ｉ－１９］の窒素原子上に、常法により、グループＡから選ばれる置換基を導入することにより、化合物［Ｉ－１９－１］を得ることができる。

化合物［４７］に替えて、$R^{A13}-NH-NH_2$を用いて、本工程５及び工程６の製法を実施することにより、化合物［Ｉ－１９－１］を得ることもできる。

製法１－２－６

化合物［３０］（R^{A6}が水酸基の場合）の製造例



（式中、R^{C24}及びR^{C25}は、それぞれ同一又は異なって、カルボン酸保護基であり、その他記号は前述の通りである。）

化合物［５６］を、メタノール溶媒中、加熱還流下、ナトリウムメトキシドの存在下、化合物［５７］と反応させることにより、化合物［３０－１］を得ることができる。

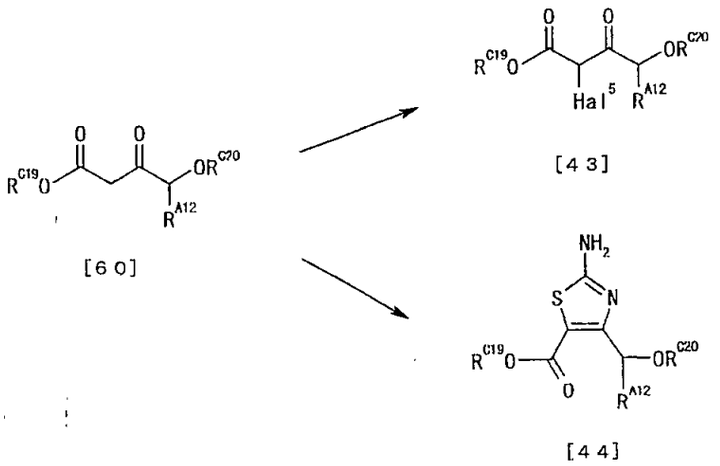
また、化合物［５８］を、溶媒中、塩基の存在下、化合物［５９］と反応させることにより、化合物［３０－１］を得ることができる。

溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム、ＴＨＦ、トルエン等が挙げられる。

塩基としては、トリエチルアミン、N，N－ジイソプロピルエチルアミン、N－メチルモルホリン、1，8－ジアザビシクロ［5．4．0］ウンデカー7－エン、1，5－ジアザビシクロ［4．3．0］ノナー5－エン等が挙げられる。

製法1－2－7

化合物［43］、及び、化合物［44］の製造例



［60］ ［43］ ［44］

（式中、各記号は前述の通りである。）

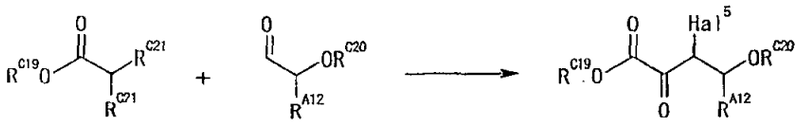
化合物［60］を、常法でハロゲン化することにより化合物［43］を得ることができる。

例えば、化合物［60］を、アセトニトリル溶媒中、臭化銅（II）及びヒドロキシ（トシルオキシ）ヨードベンゼンを用い臭素化することにより、化合物［43］を得ることができる。

また、化合物［60］を、アセトニトリル溶媒中、ヒドロキシ（トシルオキシ）ヨードベンゼンと加熱条件下で反応させた後、チオ尿素と過熱条件下で反応させることにより、化合物［44］を得ることもできる。

製法1－2－8

化合物［50］の製造例



［61］ ［62］ ［50］

(式中、R^{c21}は、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子であり、その他記号は前述の通りである。)

化合物［６１］を、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、又は、ジエチルエーテル、ＴＨＦ等のエーテル系溶媒中、或いは、これらの混合溶媒中、ナトリウムメトキシドの存在下、化合物［６２］と反応させることにより化合物［５０］を得ることができる。

R^{c21}として好ましくは、塩素原子である。

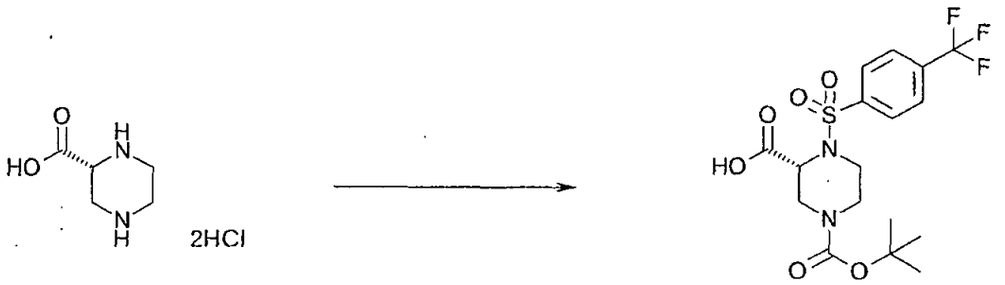
実施例

次に、本発明に係る一般式［Ｉ］で示される化合物及びその製造方法を実施例によって具体的に説明する。しかしながら、本発明はこれら実施例によって限定されるものではない。

実施例１

第１工程

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル

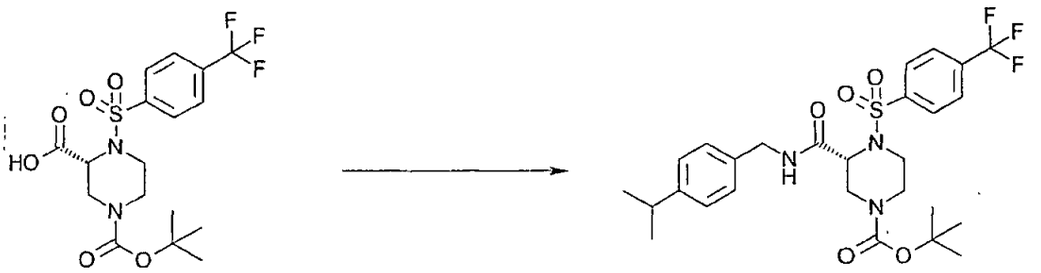


（Ｒ）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（４．９８ｇ）を１，４－ジオキサン（５０ｍｌ）及び水（２５ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、５０％水酸化ナトリウム水溶液（３．７９ｍｌ）を加えた後、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルジカルボナート（６．１９ｍｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、トリエチルアミン（６．８３ｍｌ）、４－トリフルオロメチルベンゼンスルホニルクロリド（５．９９ｇ）及び４－ジメチルアミノピリジン（６０ｍｇ）を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び１Ｎ塩酸水溶液を加えて分液した。水層を酢酸エチルで２回再抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄後、無水

硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（９．１６ｇ）を得た。

第２工程

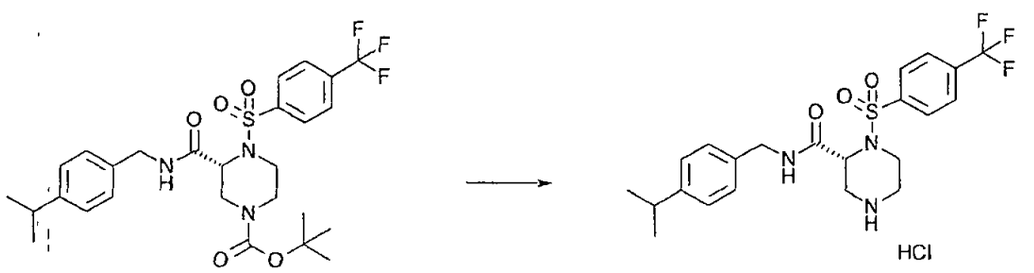
（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第１工程で得た化合物（２．１９ｇ）、４－イソプロピルベンジルアミン（７６１ｍｇ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（８０４ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０ｍｌ）混合溶液に、室温にて撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１．００ｇ）を加えた。室温にて３日間撹拌した後、反応液に１Ｎ塩酸水溶液及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２）で精製することにより、表題化合物（９７３ｍｇ）を得た。

第３工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド塩酸塩

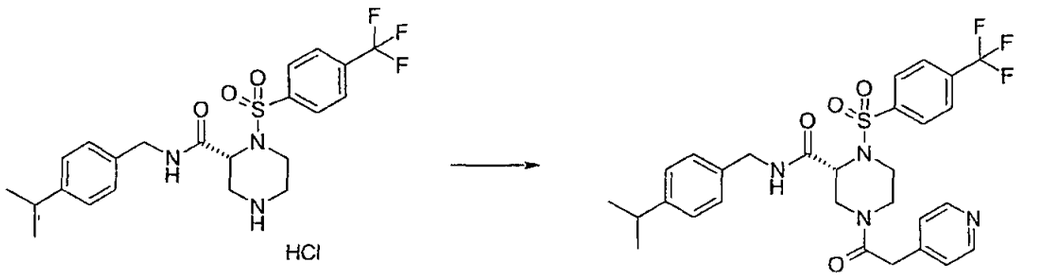


第２工程で得た化合物（９７３ｍｇ）の酢酸エチル（１０ｍｌ）溶液に、室温に

て撹拌下、４Ｎ塩化水素／酢酸エチル溶液（４．７３ｍｌ）を加えた。室温にて４時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮した。得られた粗結晶を酢酸エチルとジイソプロピルエーテルの混合溶媒に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（７４２ｍｇ）を得た。

実施例２

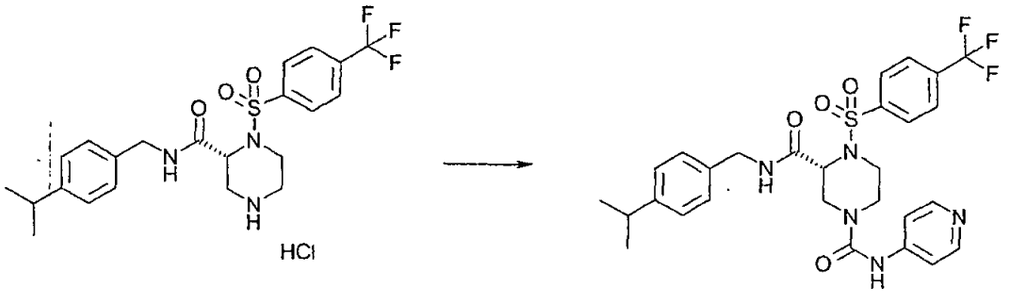
（Ｒ）－４－（２－ピリジン－４－イルーアセチル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピルーベンジルアミド



実施例１で得た化合物（２０ｍｇ）、４－ピリジル酢酸塩酸塩（７．５ｍｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（６．６ｍｇ）及びトリエチルアミン（１２μｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．４ｍｌ）混合溶液に、室温にて撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（８．３ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液とメタノールを加え室温にて撹拌した。析出した結晶をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（１４ｍｇ）を得た。

実施例３

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－（４－イソプロピルーベンジルアミド）　１－ピリジン－４－イルアミド

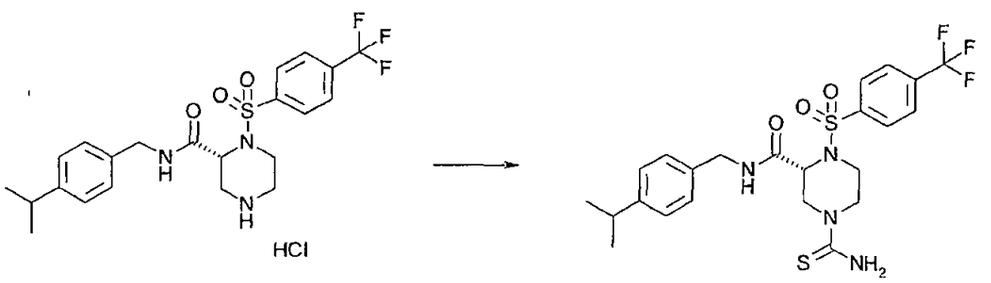


４－アミノピリジン（９４ｍｇ）のクロロホルム（２．０ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、Ｎ，Ｎ’－カルボニルジイミダゾール（１７８ｍｇ）を加え、室温にて終夜撹拌することにより、反応液Ａを得た。

別容器にて、実施例１で得た化合物（３０ｍｇ）のクロロホルム（１ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、トリエチルアミン（１２．５μｌ）を加えた後、反応液Ａ（２４０μｌ）を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層クロマトグラフィー（１０％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（３１ｍｇ）を得た。

実施例４

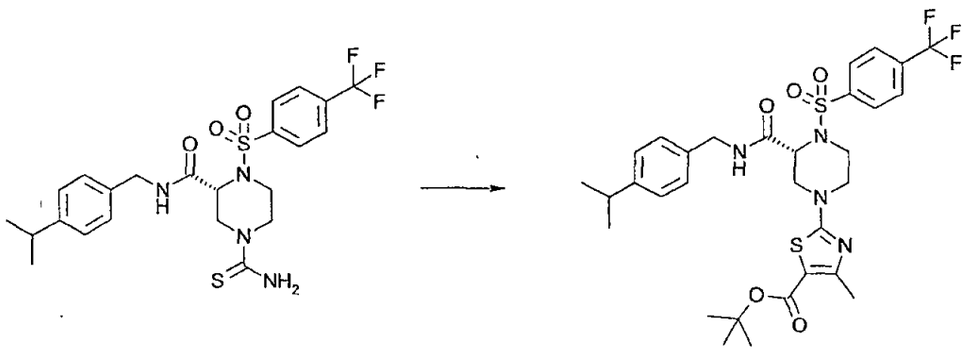
（Ｒ）－４－チオカルバモイル－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド



実施例１で得た化合物（５０６ｍｇ）のクロロホルム（５ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、トリエチルアミン（１６７μｌ）を加えた後、９－フルオレニルメトキシカルボニルイソチオシアナート（２８１ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、ピペリジン（１９８μｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、カラムクロマトグラフィー（３％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（４４２ｍｇ）を得た。

実施例５

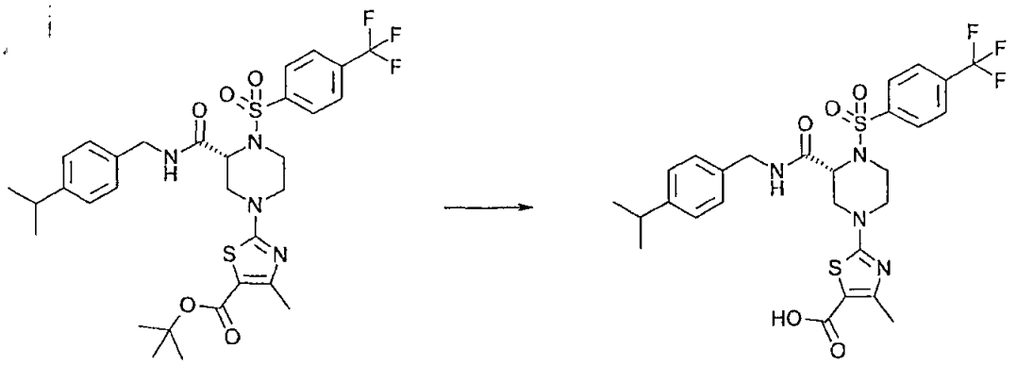
２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



実施例４で得た化合物（２５０ｍｇ）及び２－ブロモ－３－オキソ酪酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（１６８ｍｇ）のアセトニトリル（１．２５ｍｌ）混合液を８０℃で２０分撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝２：３）で精製することにより、表題化合物（２６８ｍｇ）を得た。

実施例６

２－［（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチルーチアゾール－５－カルボン酸

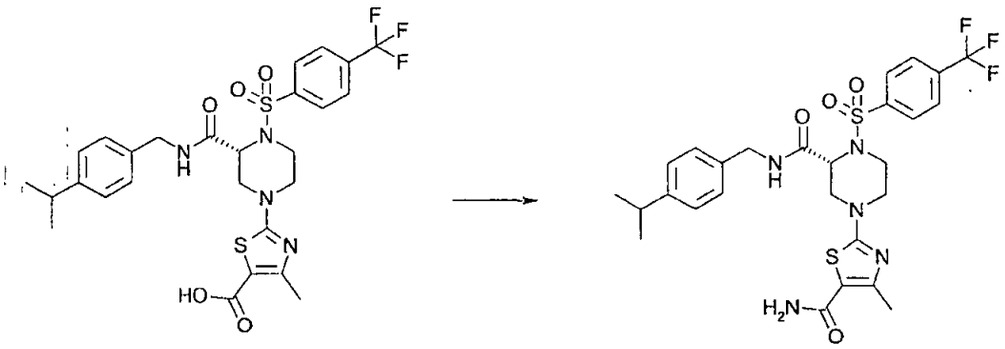


実施例５で得た化合物（２２４ｍｇ）のトリフルオロ酢酸（１．１ｍｌ）溶液を室温にて１時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にトルエンを加え、再度減圧

濃縮した。残渣にジイソプロピルエーテルを加え、室温にて撹拌した。析出した結晶をろ取し、乾燥することにより、表題化合物（９７ｍｇ）を得た。

実施例７

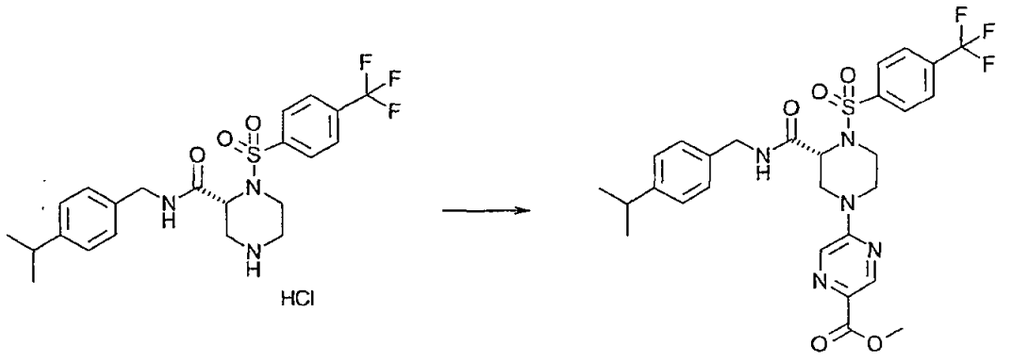
（Ｒ）－４－（５－カルバモイル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド



実施例６で得た化合物（３０ｍｇ）のテトラヒドロフラン（０．３ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、Ｎ，Ｎ’－カルボニルジイミダゾール（１０ｍｇ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、２８％アンモニア水溶液（１０μｌ）を加えた。室温にて２．５時間撹拌した後、２８％アンモニア水溶液（１０μｌ）を追加した。さらに室温にて２．５時間撹拌した後、２８％アンモニア水溶液（１０μｌ）を追加した。室温にて終夜撹拌した後、反応液に酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて、分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（１０％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（２０ｍｇ）を得た。

実施例８

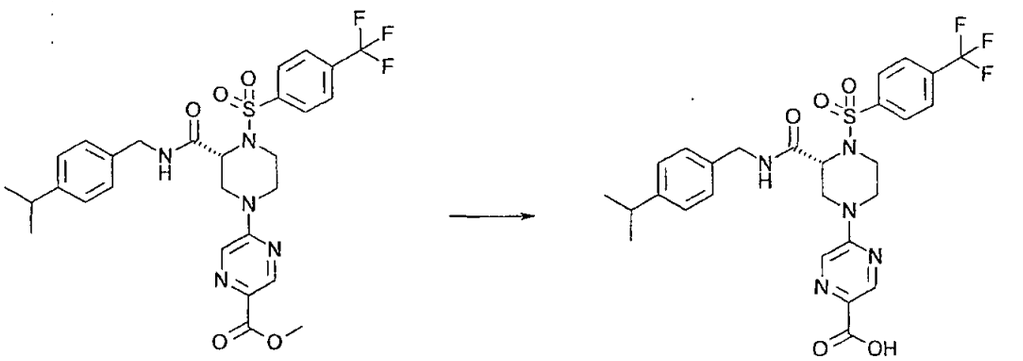
（Ｒ）－３－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸　メチルエステル



実施例１で得た化合物（６１ｍｇ）、５－クロロピラジン－２－カルボン酸メチルエステル（２５ｍｇ）及びトリエチルアミン（４２μｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．３ｍｌ）混合液を、６０℃にて１４時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層クロマトグラフィー（５％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（７５ｍｇ）を得た。

実施例９

（Ｒ）－３－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，２’］ビピラジニル－５’－カルボン酸

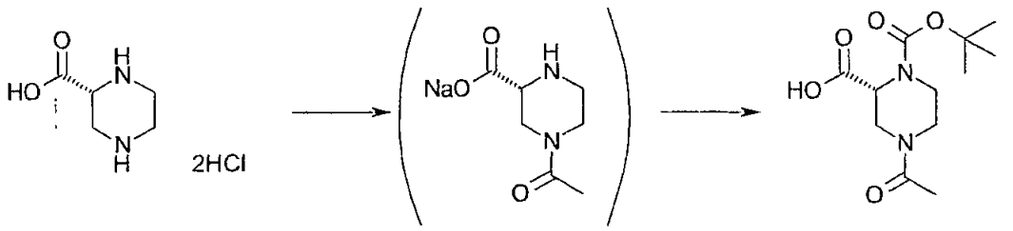


実施例８で得た化合物（７５ｍｇ）のテトラヒドロフラン（４００μｌ）及びメタノール（４００μｌ）混合溶液に、室温にて撹拌下、２Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（１８６μｌ）を加えた。室温にて３０分撹拌後、２Ｎ塩酸水溶液（１８６μｌ）を加えた後、減圧濃縮した。残渣にメタノール及び水を加え、室温にて撹拌した。析出した結晶をろ取し、乾燥することにより、表題化合物（６１ｍｇ）を得た。

実施例１０

第１工程

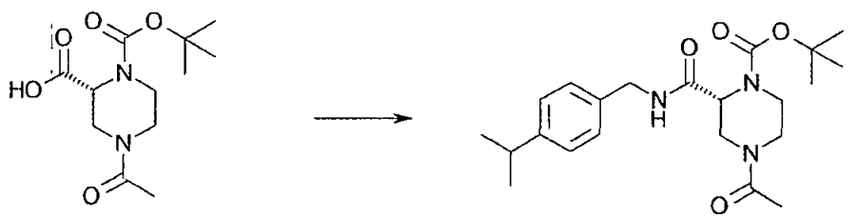
（Ｒ）－４－アセチル－ピペラジン－１，２－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



（Ｒ）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（５．０ｇ）を１，４－ジオキサン（２５ｍｌ）及び水（２８ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（２２ｍｌ）を加えた後、酢酸ｐ－ニトロフェノール（４．６９ｇ）の１，４－ジオキサン（２５ｍｌ）溶液を３０分かけて滴下した。室温にて３時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、１，４－ジオキサンを留去した。析出した不溶物をろ去し、得られたろ液（約７０ｍｌ）に、氷冷撹拌下、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルジカルボナート（８．５ｍｌ）の１，４－ジオキサン（３０ｍｌ）溶液を滴下した。室温にて３時間撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及びジエチルエーテルを加えて分液した。水層に２Ｎ塩酸水溶液を加えてｐＨ２にした後、飽和食塩水を加え、テトラヒドロフランで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（４．８３ｇ）を得た。

第２工程

（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル

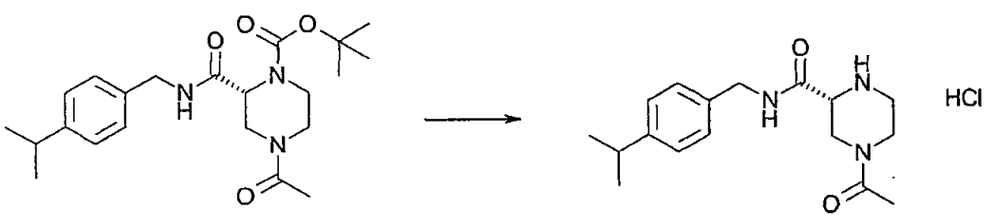


第１工程で得た化合物（４．８３ｇ）、４－イソプロピルベンジルアミン（３．１４ｍｌ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（２．６４ｇ）のＮ，Ｎ

ージメチルホルムアミド（１０ｍｌ）混合溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（３．７４ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液に水及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝０：１００→１６：１００）で精製することにより、表題化合物（４．７２ｇ）を得た。

第３工程

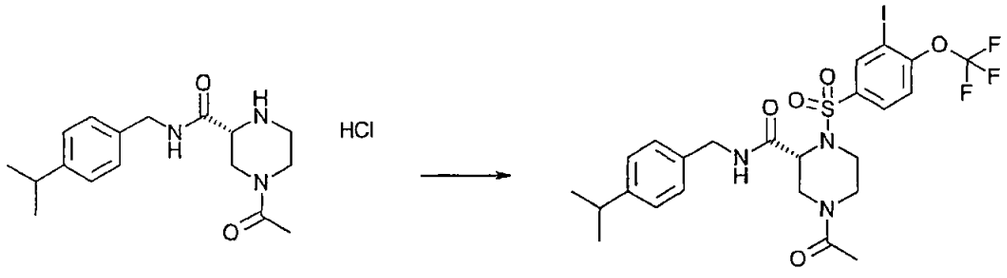
（Ｒ）－４－アセチル－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド.



第２工程で得た化合物（４．７２ｇ）のクロロホルム（５ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（２０ｍｌ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮した。得られた粗結晶をジイソプロピルエーテルに懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（３．２３ｇ）を得た。

第４工程

（Ｒ）－４－アセチル－１－（３－ヨード－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－イソプロピル－ベンジルアミド

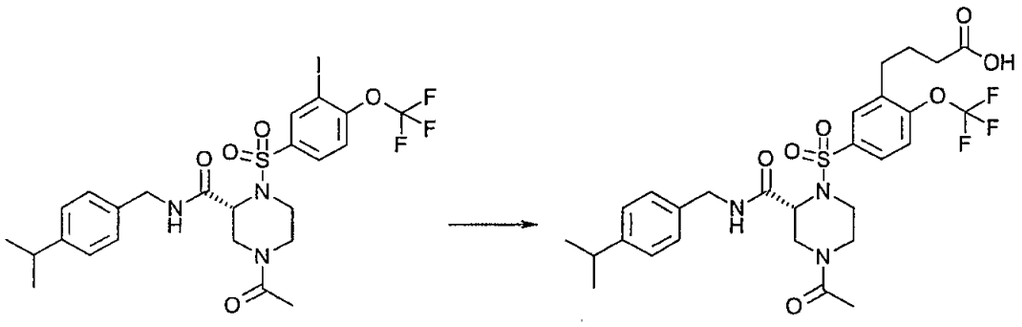


第３工程で得た化合物（４０ｍｇ）及びトリエチルアミン（６６μｌ）のクロロホルム（０．４ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、３－ヨード－４－トリフルオロメ

トキシベンゼンスルホニルクロリド（６８ｍｇ）を加えた。室温にて１時間撹拌した後、反応液をそのまま薄層クロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：１５）で精製し、含水メタノールで再結晶することにより、表題化合物（５３ｍｇ）を得た。

実施例１１

４－｛５－［（Ｒ）－４－アセチル－２－（４－イソプロピルーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－スルホニル］－２－トリフルオロメトキシ－フェニル｝－酪酸

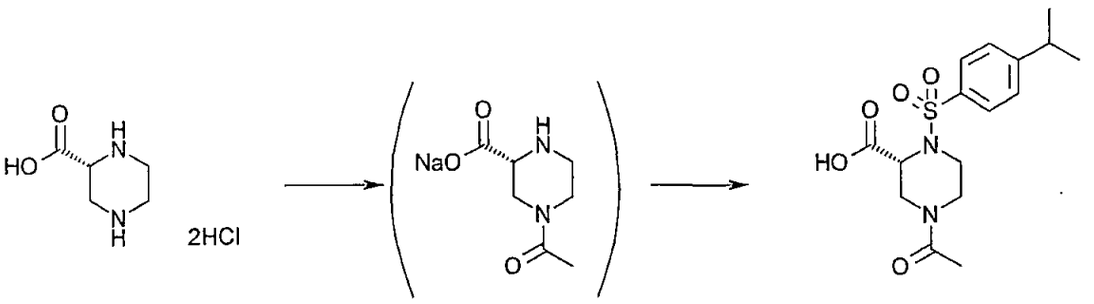


アルゴン気流下、実施例１０で得た化合物（４６ｍｇ）、１，２，３，４，５－ペンタフェニル－１’－（ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィノ）フェロセン（５ｍｇ）及びビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウム（０）（４ｍｇ）のテトラヒドロフラン懸濁液に、氷冷撹拌下、０．５Ｍ４－エトキシ－４－オキソブチルジンクブロミド／テトラヒドロフラン溶液（４２２μｌ）を加えた。室温にて２４時間撹拌した後、１Ｎ塩酸水溶液を加えた後、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣にメタノール（０．５ｍｌ）を加え、氷冷撹拌下、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（３５μｌ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、２Ｎ塩酸水溶液（７０μｌ）を加え、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：酢酸＝９０：１０：１）で精製した後、含水メタノールで再結晶することにより、表題化合物（２．４ｍｇ）を得た。

実施例１２

第１工程

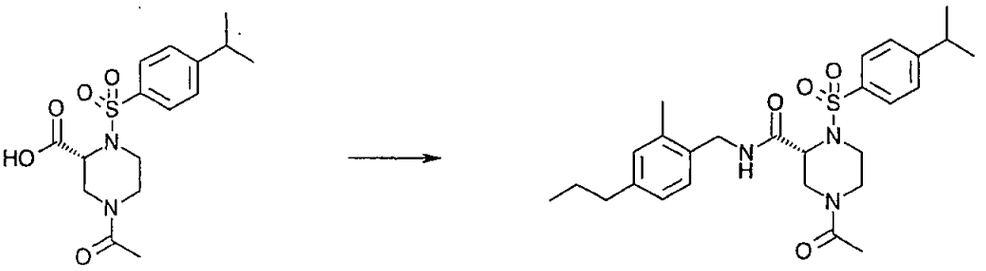
（Ｒ）－４－アセチル－１－（４－イソプロピルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸



（R）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（４．０６ｇ）を１，４－ジオキサン（２０ｍｌ）及び水（２０ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（１８ｍｌ）を加えた後、酢酸ｐ－ニトロフェノール（３．９９ｇ）の１，４－ジオキサン（２０ｍｌ）溶液を滴下した。室温にて終夜撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、１，４－ジオキサンを留去した。析出した不溶物をろ去し、水洗した。得られたろ液に、１，４－ジオキサン（４０ｍｌ）、トリエチルアミン（５．５７ｍｌ）を加えた後、氷冷撹拌下、４－イソプロピルベンゼンスルホニルクロリド（３．５９ｍｌ）を滴下した。室温にて終夜撹拌した後、反応液に２Ｎ塩酸水溶液を加えてｐＨ２にした後、減圧濃縮により１，４－ジオキサンを留去した。得られた水溶液をクロロホルムで４回抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶を酢酸エチルに懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（３．１０ｇ）を得た。

第２工程

（R）－４－アセチル－１－（４－イソプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　２－メチル－４－プロピル－ベンジルアミド



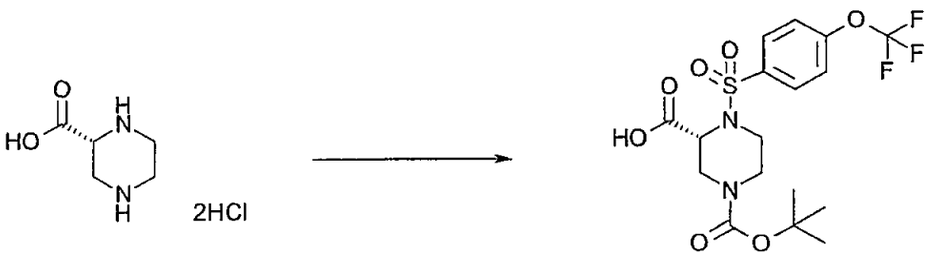
第１工程で得た化合物（３５．４ｍｇ）、２－メチル－４－プロピルベンジルア

ミン塩酸塩（２２．０ｍｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（１８．４ｍｇ）及びトリエチルアミン（１７．４μｌ）のN，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．２ｍｌ）混合溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（２３．０ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水及びクロロホルムを加えて分液した。有機層を水で２回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：２０）で精製することにより、表題化合物（４０．５ｍｇ）を得た。

実施例１３

第１工程

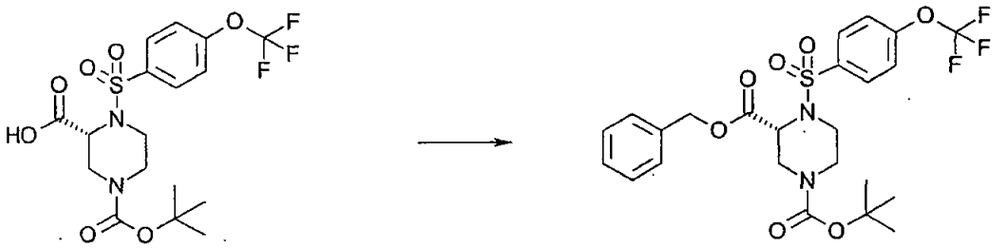
（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



（Ｒ）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（５．０８ｇ）を１，４－ジオキサン（４０ｍｌ）及び水（２５ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、５０％水酸化ナトリウム水溶液（３．８７ｍｌ）を加えた後、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルジカルボナート（６．３２ｍｌ）の１，４－ジオキサン（１０ｍｌ）溶液を滴下した。室温にて終夜撹拌した後、トリエチルアミン（６．９７ｍｌ）、４－トリフルオロメトキシベンゼンスルホニルクロリド（４．２４ｍｌ）及び４－ジメチルアミノピリジン（６１ｍｇ）を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮により１，４－ジオキサンを留去した。残渣に酢酸エチル及び１Ｎ塩酸水溶液を加えて分液した。水層を酢酸エチルで２回再抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１０．２ｇ）を得た。

第２工程

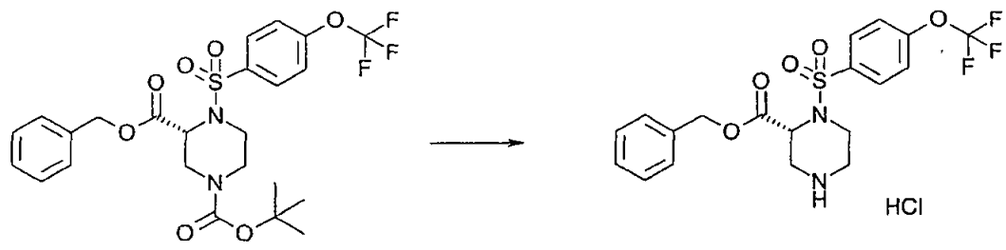
（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　３－ベンジルエステル　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第１工程で得た化合物（５．７７ｇ）、ベンジルアルコール（１．４５ｍｌ）及び４－ジメチルアミノピリジン（７７ｍｇ）のクロロホルム（６０ｍｌ）混合溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（２．６８ｇ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、減圧濃縮した。残渣に水及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２）で精製することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（３．６６ｇ）を得た。

第３工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　ベンジルエステル塩酸塩

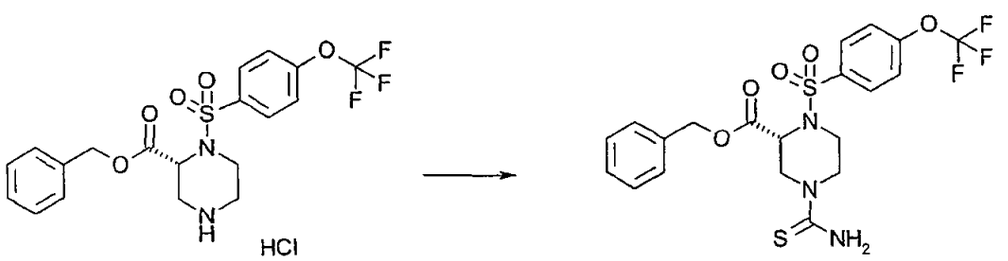


第２工程で得た化合物（３．６６ｇ）の酢酸エチル（１０ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、４Ｎ塩化水素／酢酸エチル溶液（１６．８ｍｌ）を加えた。室温にて４時間撹拌した後、不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（２．５８ｇ）を得た。

第４工程

（Ｒ）－４－チオカルバモイル－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスル

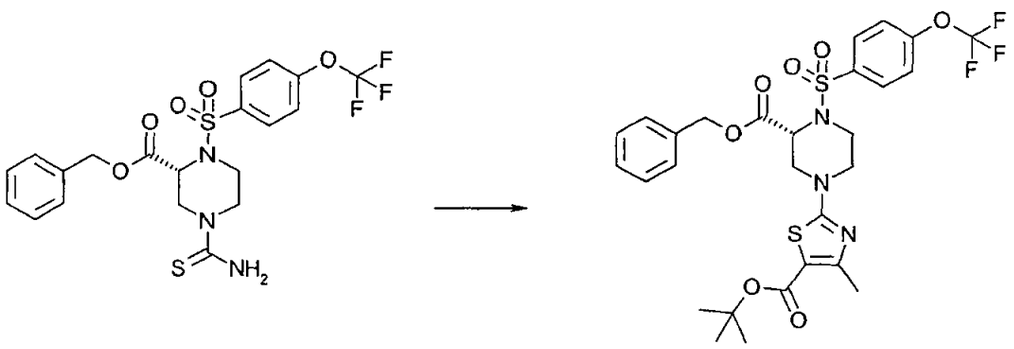
ホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　ベンジルエステル



第３工程で得た化合物（２．５８ｇ）のクロロホルム（２６ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、トリエチルアミン（８９６μｌ）を加えた後、９－フルオレニルメトキシカルボニルイソチオシアナート（１．６６ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、ピペリジン（１．１１ｍｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、カラムクロマトグラフィー（５％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（２．１２ｇ）を得た。

第５工程

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　ベンジルエステル

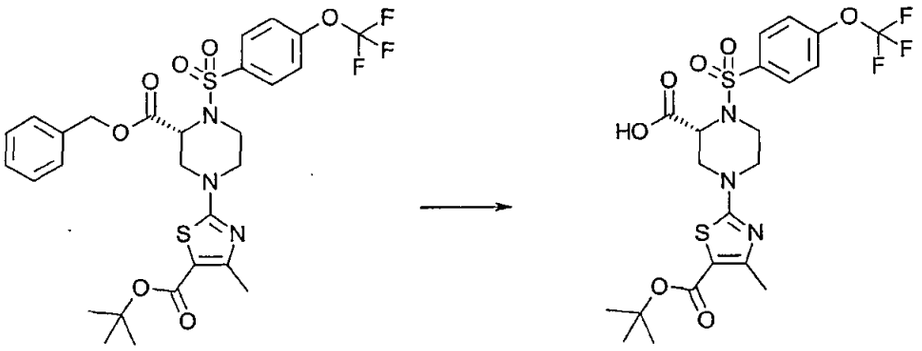


第４工程で得た化合物（２．１２ｇ）及び２－ブロモ－３－オキソ酪酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（２．０ｇ）のアセトニトリル（２０ｍｌ）混合液を８０℃で３０分撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル、飽和炭酸ナトリウム水溶液を加えて分液した。有機層を飽和炭酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２）で精製することにより、表題化

合物（１．８２ｇ）を得た。

第６工程

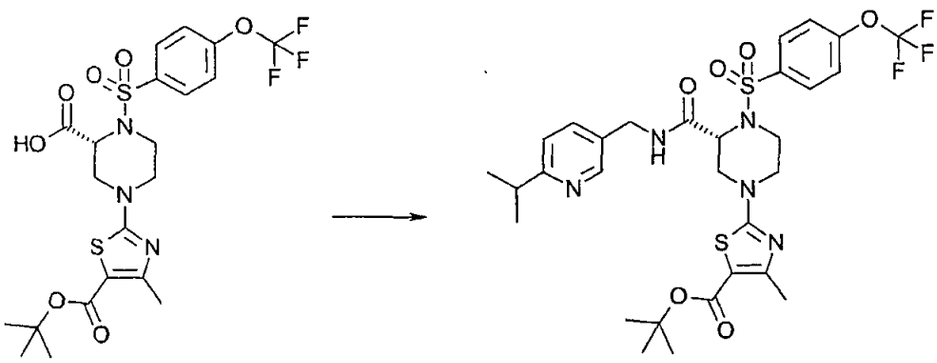
（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸



第５工程で得た化合物（１．８２ｇ）、１０％パラジウム炭素（２５０ｍｇ）及び酢酸（４．０ｍｌ）のメタノール（５０ｍｌ）混合液を、水素雰囲気下（４気圧）、室温にて３時間撹拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、減圧濃縮した。残渣に再度、１０％パラジウム炭素（１．８ｇ）、酢酸（４．０ｍｌ）及びメタノール（５０ｍｌ）を加え、水素雰囲気下（４気圧）、室温にて３０分撹拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、減圧濃縮した（４回繰り返し）。得られた粉体を水に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（１．２４ｇ）を得た。

第７工程

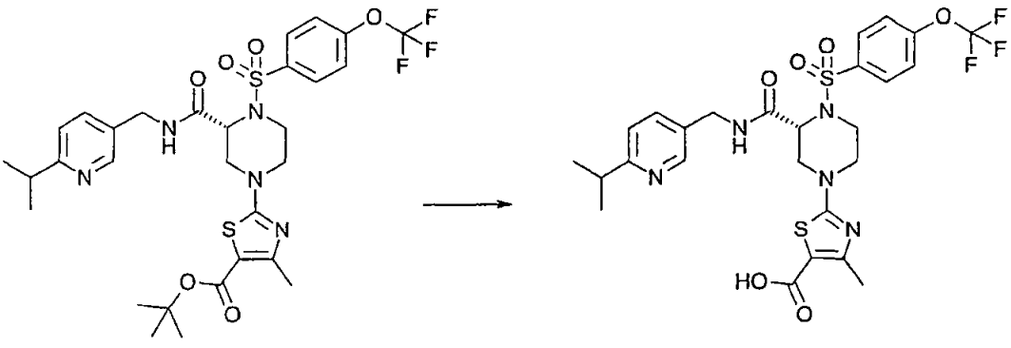
２－［（Ｒ）－３－［（６－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第６工程で得た化合物（５５ｍｇ）、［（６－イソプロピルピリジン－３－イル）メチル］アミン（２４ｍｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（２３ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（６６０μｌ）混合溶液に、室温にて撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（２９ｍｇ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝３：２）で精製することにより、表題化合物（５９ｍｇ）を得た。

第８工程

２－［（Ｒ）－３－［（６－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－カルバモイル］－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸



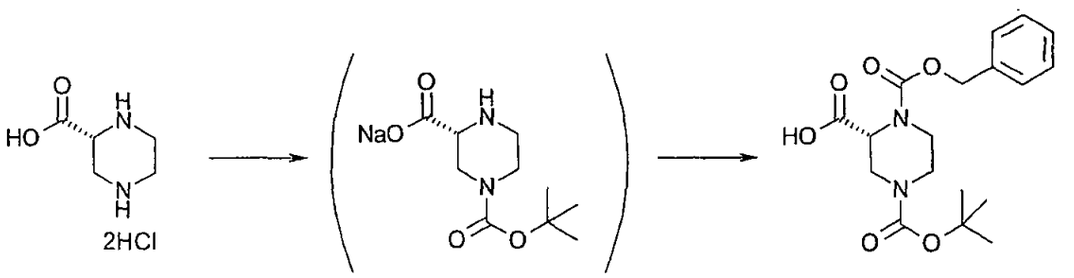
第７工程で得た化合物（５５ｍｇ）のトリフルオロ酢酸（３３０μｌ）溶液を室温にて１時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にクロロホルムを加え、再度減

圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：１０）で精製することにより、表題化合物（４３ｍｇ）を得た。

実施例１４

第１工程

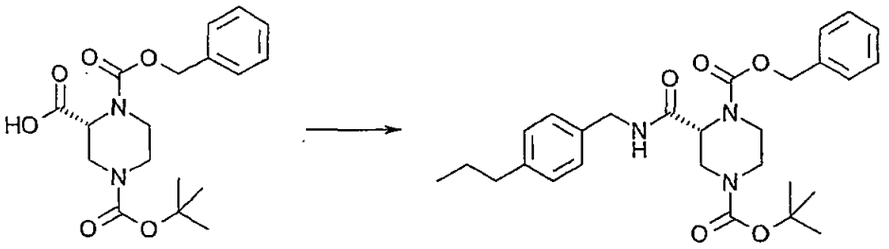
（Ｒ）－ピペラジン－１，２，４－トリカルボン酸　１－ベンジルエステル　４－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



（Ｒ）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（１０．０ｇ）を１，４－ジオキサン（５０ｍｌ）及び水（５０ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、５０％水酸化ナトリウム水溶液（７．６２ｍｌ）を加えた。氷冷下、３０分撹拌後、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルカルボナート（１１．８ｇ）の１，４－ジオキサン（５０ｍｌ）溶液を滴下した。室温にて７時間撹拌した後、反応液を再度氷冷撹拌し、トリエチルアミン（１３．７ｍｌ）を加えた後、クロロギ酸ベンジル（７．０３ｍｌ）を滴下した。室温にて終夜撹拌した後、トリエチルアミン（６．８５ｍｌ）及びクロロギ酸ベンジル（３．５２ｍｌ）を追加した。室温にて４時間撹拌した後、減圧濃縮し、１，４－ジオキサンを留去した。残渣に０．５Ｎ塩酸水溶液を加えてｐＨ５－６にした後、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、有機層中の不溶物をろ去した。ろ液を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１７．１ｇ）を得た。

第２工程

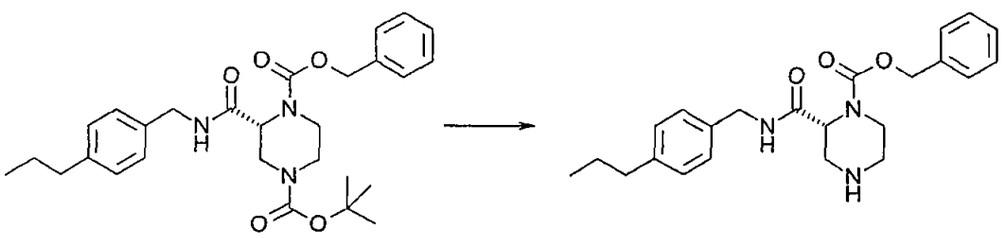
（Ｒ）－２－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１，４－ジカルボン酸　１－ベンジルエステル　４－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第１工程で得た化合物（３．４１ｇ）、４－ｎ－プロピルベンジルアミン塩酸塩（１．７４ｇ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（１．４３ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３４ｍｌ）混合溶液に、室温にて撹拌下、トリエチルアミン（１．９６ｍｌ）を加えた後、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１．８０ｇ）を加えた。室温にて４時間撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝２：５）で精製することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（２．６４ｇ）を得た。

第３工程

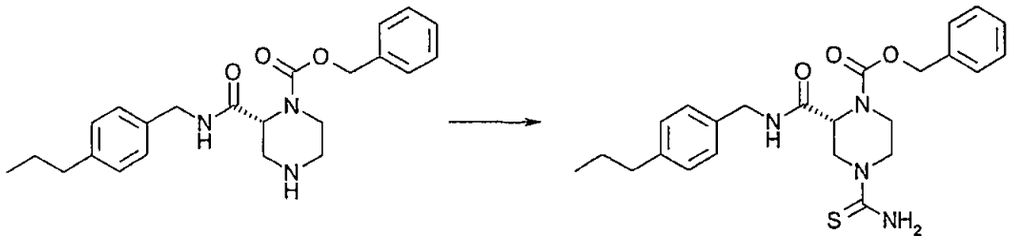
（Ｒ）－２－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ベンジルエステル



第２工程で得た化合物（２．６４ｇ）の１，４－ジオキサン（１３ｍｌ）に、室温にて撹拌下、４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン（１３ｍｌ）を加えた。室温にて３時間撹拌した後、減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮した。残渣に酢酸エチル及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（５％－１０％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（１．５９ｇ）を得た。

第４工程

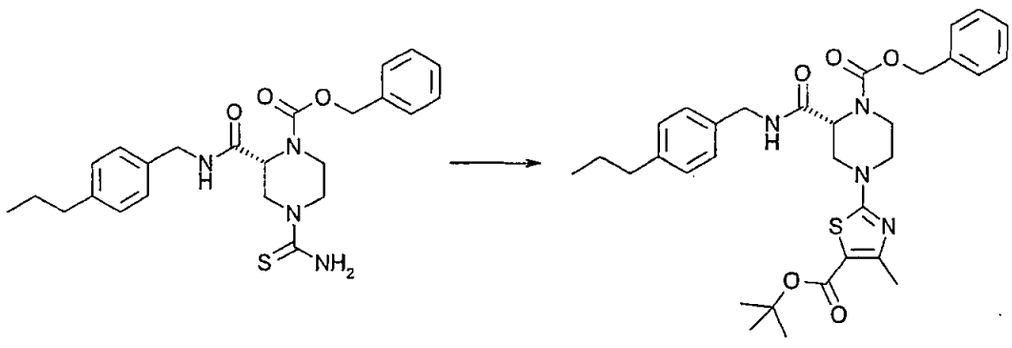
（Ｒ）－２－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－チオカルバモイル－ピペラジン－１－カルボン酸　ベンジルエステル



第３工程で得た化合物（１．５９ｇ）のクロロホルム（１６ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、トリエチルアミン（８４０μｌ）を加えた後、９－フルオレニルメトキシカルボニルイソチオシアナート（１．１３ｇ）を加えた。室温にて４時間撹拌した後、ピペリジン（８０５μｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液を減圧濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：１－４：１）で精製することにより、表題化合物（１．６２ｇ）を得た。

第５工程

（Ｒ）－４－（５－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－４－メチル－チアゾール－２－イル）－２－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ベンジルエステル

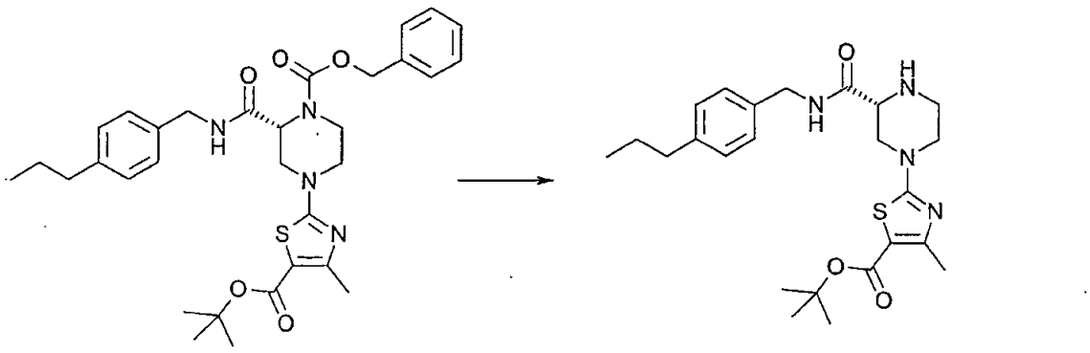


第４工程で得た化合物（１．５１ｇ）及び２－ブロモ－３－オキソ酪酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（１．５８ｇ）のアセトニトリル（１５ｍｌ）混合液を８０℃で

１５分撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２－２：３）で精製することにより、表題化合物（１．２９ｇ）を得た。

第６工程

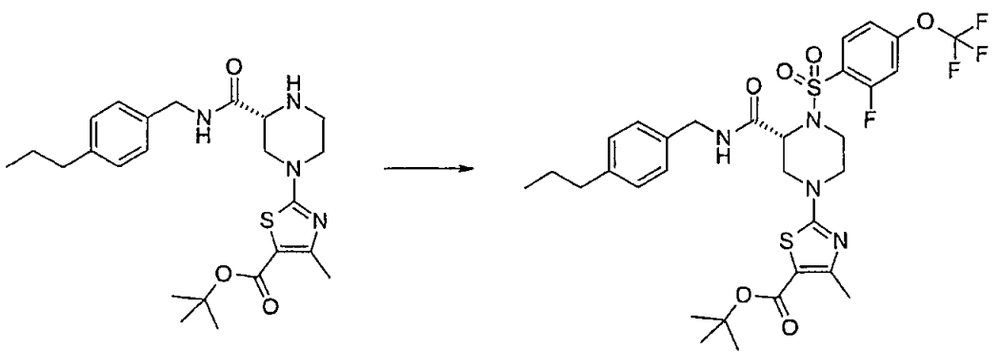
４－メチル－２－［（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－チアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第５工程で得た化合物（１．００ｇ）及び７．５％パラジウム炭素（１．０ｇ）のメタノール（１５ｍｌ）混合液を、水素雰囲気下（５気圧）、室温にて４時間撹拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、減圧濃縮した。残渣に再度、１０％パラジウム炭素（５００ｍｇ）及びメタノール（１５ｍｌ）を加え、水素雰囲気下（５気圧）、室温にて６時間撹拌した。反応液をセライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（３％－５％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（６８８ｍｇ）を得た。

第７工程

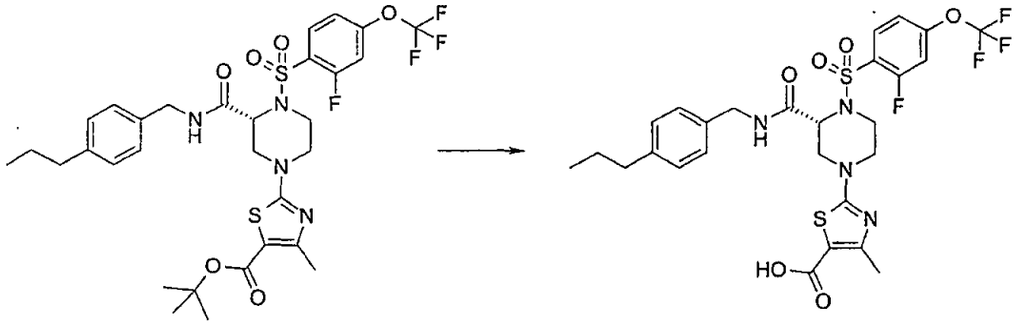
２－［（Ｒ）－４－（２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



第６工程で得た化合物（５０ｍｇ）のピリジン（０．５ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシベンゼンスルホニルクロリド(４６ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、減圧濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を１Ｎ塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２）で精製することにより、表題化合物（５９ｍｇ）を得た。

第８工程

２－［（Ｒ）－４－（２－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－イル］－４－メチル－チアゾール－５－カルボン酸

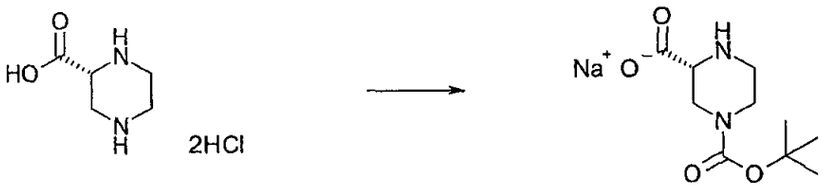


第７工程で得た化合物（５９ｍｇ）のクロロホルム（０．３ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、トリフルオロ酢酸（０．３ｍｌ）を加えた。室温にて７時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２－１０％メタノール／クロロホルム）で精製することにより、表題化合物（４５ｍｇ）を得た。

実施例７８３

第１工程

（R）－４－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－ピペラジン－２－カルボン酸ナトリウム

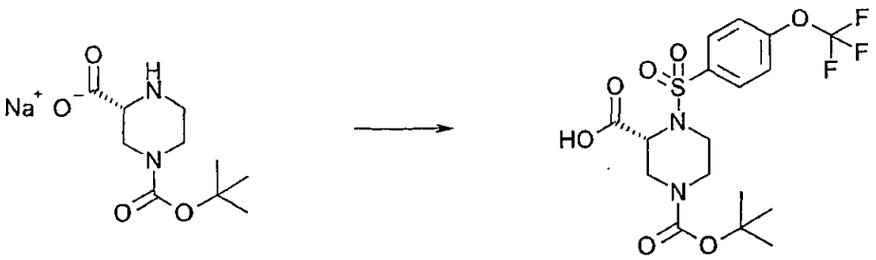


（R）－ピペラジン－２－カルボン酸二塩酸塩（２０．０ｇ）を１，４－ジオキサン（１４０ｍｌ）及び水（６０ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、５０％水酸化ナトリウム水溶液（１５．２ｍｌ）を滴下した後、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルジカルボナート（２３．６ｇ）の１，４－ジオキサン（６０ｍｌ）溶液を滴下した。そのまま１５分撹拌した後、室温にて７時間撹拌した。反応液に酢酸エチル（６０ｍｌ）を加え、室温にて３０分撹拌した。析出した結晶をろ取し、酢酸エチル（４０ｍｌ）で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１３．３ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (D_2O, 400MHz) δ：1.49 (9H, s), 3.02-3.13 (1H, m), 3.21-3.44 (3H, m), 3.66-3.73 (1H, m), 3.89-4.12 (1H, br m), 4.28 (1H, dd, J = 14.2, 4.1 Hz).

第２工程

（R）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



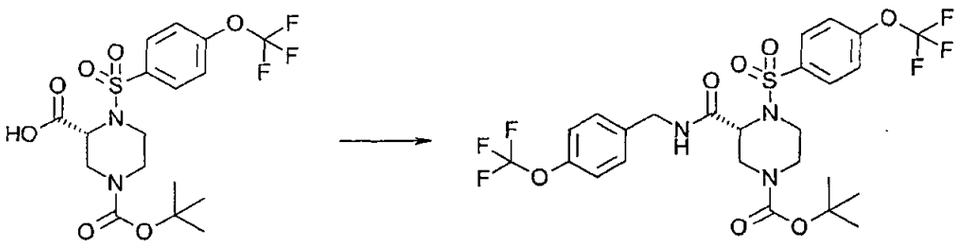
第１工程で得た化合物（６．８ｇ）を１，４－ジオキサン（６８ｍｌ）及び水（２０ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、トリエチルアミン（５．６ｇ）と４－ジメチルアミノピリジン（６６ｍｇ）を加えた後、４－トリフルオロメトキシベン

ゼンスルホニルクロリド（７．４ｇ）を滴下した。そのまま２０分撹拌した後、室温にて５．５時間撹拌した。再度氷冷撹拌下、２Ｎ塩酸水溶液（２３．５ｍｌ）と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（約５ｍｌ）を加えることにより、反応液をｐＨ３に合わせた後、酢酸エチル（７０ｍｌ）と水（３０ｍｌ）を加えた。反応液を分液し、水層を酢酸エチル（５０ｍｌ）で２回再抽出した。有機層を合わせて、水（２０ｍｌ）で２回洗浄した後、飽和食塩水（２０ｍｌ）で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（９．０１ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：1.33 (9H, s), 2.66-2.87 (1H, br m), 3.03-3.17 (1H, br m), 3.21-3.31 (1H, m), 3.58-3.64 (1H, m), 3.83-3.99 (1H, br m), 4.31 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.49 (1H, d, J = 3.3 Hz), 7.56 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.9 Hz), 13.05 (1H, s).

第３工程

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



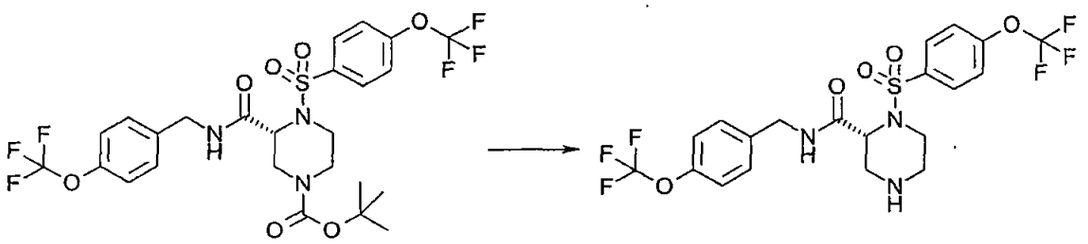
第２工程で得た化合物（２．４０ｇ）、４－トリフルオロメトキシベンジルアミン（１．２１ｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（１．２１ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２４ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１．２１ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、１０％クエン酸水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をジイソプロピルエーテルとｎ－ヘキサンの混合溶液に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表

題化合物（２．２０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.39 (9H, s), 2.60-3.10 (2H, br m), 3.31 (1H, m), 3.69 (1H, m), 3.84 (1H, d, J = 14.0 Hz), 4.35-4.50 (3H, m), 4.56 (1H, d, J = 13.6 Hz), 6.83 (1H, br s), 7.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.27 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.7 Hz).

第４工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド



第３工程で得た化合物（２．２０ｇ）に４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（４０ｍｌ）を加え、室温にて１．５時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にクロロホルム及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。有機層を無水炭酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルとｎ－ヘキサンの混合溶媒より結晶化し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（１．５７ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.45-2.58 (2H, m), 2.86 (1H, d, J = 13.2 Hz), 3.16 (1H, dt, J = 3.3, 6.8 Hz), 3.54 (1H, d, J = 12.9 Hz), 3.76 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.35 (1H, d, J = 3.9 Hz), 4.40-4.55 (2H, m), 7.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.20 (1H, m), 7.28 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.9 Hz).

実施例９７５

第１工程

６－アミノ－２－シクロプロピル－ピリミジン－４－オール

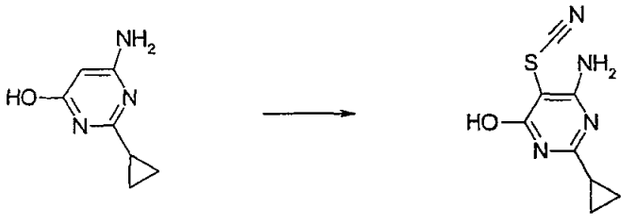


シクロプロパンカルボキシアミジン塩酸塩（０．３０ｇ）、シアノ酢酸エチル（０．２７ｍｌ）及びメタノール（１．５ｍｌ）の混合溶液を２８％ナトリウムメトキシドメタノール溶液（２．０ｍｌ）に氷冷下、加えた。１時間加熱還流後、室温まで冷却し、反応液を減圧濃縮し、得られた残渣に水及び酢酸を加えｐＨ５に合わせ、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（０．３０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：0.91 (4H, d, J = 6.0 Hz), 1.73-1.81 (1H, m), 4.79 (1H, s), 6.21 (2H, s), 11.53 (1H, br s).

第２工程

６－アミノ－２－シクロプロピル－５－チオシアナト－ピリミジン－４－オール



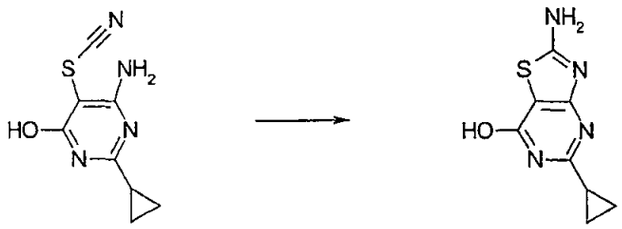
第１工程で得た化合物（０．３０ｇ）、チオシアン酸カリウム（０．７７ｇ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（６．０ｍｌ）の混合溶液に９０℃にてピリジン（０．２９ｍｌ）を加えた。４０℃まで放冷した後、臭素（０．１５ｍｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１．０ｍｌ）の混合溶液を加え、室温にて１時間撹拌した。反応溶液に氷冷下、水（１２ｍｌ）を加え、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（０．４０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：0.97-1.05 (4H, m), 1.76-1.87 (1H, m), 7.42 (2H, br s), 12.21 (1H, br s).

第３工程

２－アミノ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－オー

ル

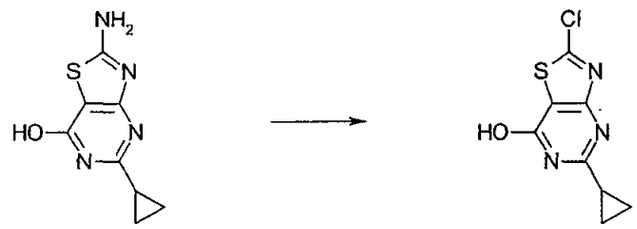


第２工程で得た化合物（０．２０ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（７．０ｍｌ）溶液を１３５℃で終夜加熱撹拌した。反応液を室温まで冷却し、氷冷下、水（７．０ｍｌ）を加え、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（０．１５ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：0.96-1.03 (4H, m), 1.88-1.98 (1H, m), 8.02 (2H, s), 12.40 (1H, br s).

第４工程

２－クロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－オール

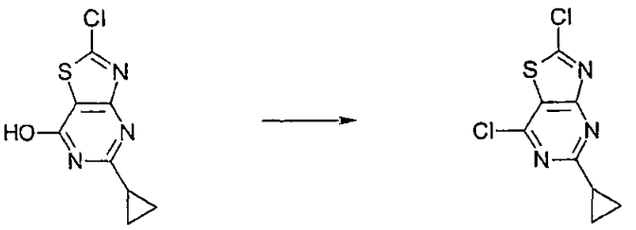


第３工程で得た化合物（１．２ｇ）を２Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（１８ｍｌ）に懸濁し、氷冷下、亜硝酸ナトリウム（１．２ｇ）を数回に分けて加えた後、得られた懸濁液を８０℃に加熱した濃塩酸水溶液（１８ｍｌ）にゆっくりと滴下し、同温度で１時間撹拌した。反応液を室温まで冷却し、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（０．６０ｇ）を得た。さらにろ液を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（０．３４ｇ）を得た。得られた粗結晶をヘキサンと酢酸エチルの混合溶媒に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（０．２６ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：1.08-1.13 (4H, m), 2.01-2.06 (1H, m), 13.15 (1H, br s).

第５工程

２，７－ジクロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン

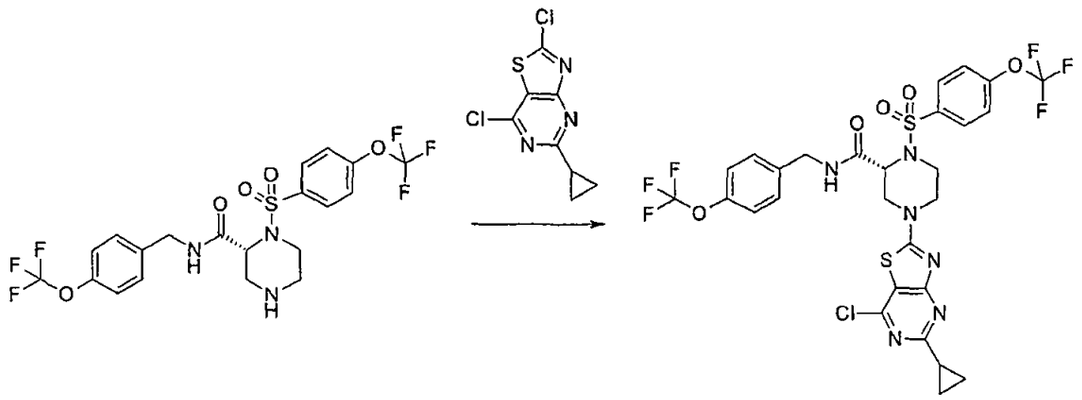


第４工程で得た化合物（０．８２ｇ）のオキシ塩化リン（２．５ｍｌ）溶液に、氷冷下、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（０．２５ｍｌ）を加えた後、２時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、氷水に注いだ後、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：８）で精製することにより、表題化合物（０．７９ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.15-1.31 (4H, m), 2.32-2.43 (1H, m).

第６工程

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド

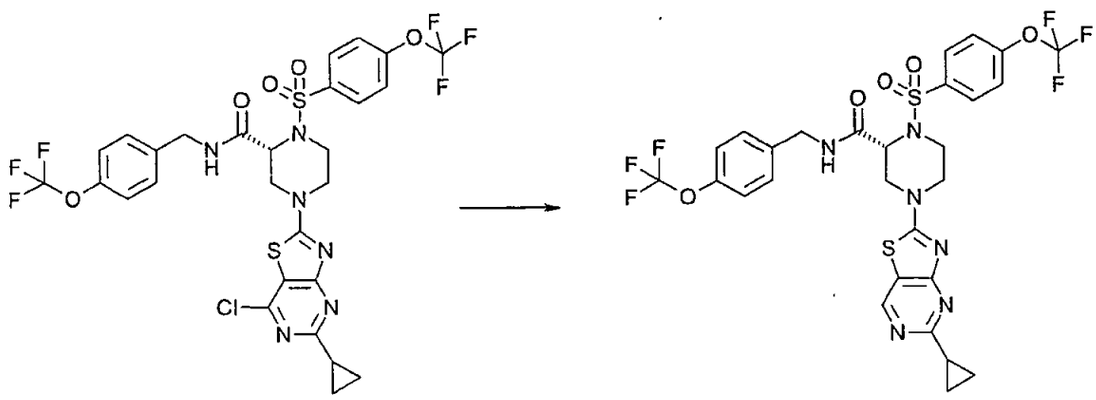


実施例７８３で得た化合物（０．９４ｇ）、第５工程で得た化合物（０．４８ｇ）及びクロロホルム（２．８ｍｌ）の混合溶液に、室温にてＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（０．３０ｍｌ）を加えた。室温にて３０分撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：クロロホルム＝１：２）で精製することにより、表題化合物（１．３ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.03-1.24 (4H, m), 2.16-2.28 (1H, m), 3.11-3.37 (2H, m), 3.39-3.54 (1H, m), 3.92 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.23-4.60 (4H, m), 4.64 (1H, s), 6.90 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.7 Hz).

第７工程

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



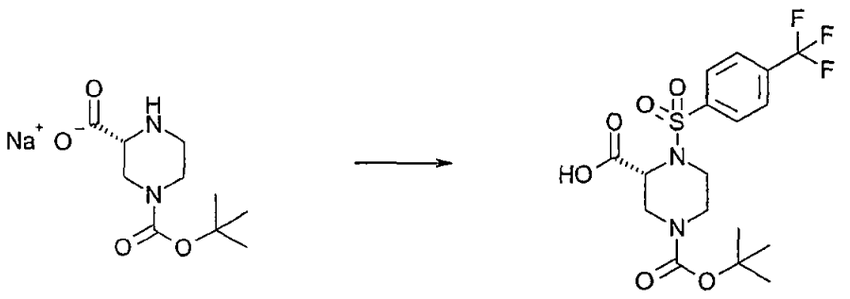
第６工程で得た化合物（１．３ｇ）、ギ酸アンモニウム（１．２ｇ）及びエタノール（１３ｍｌ）の混合溶液に、８０℃にて１０％パラジウム炭素（１．３ｇ）を加えた。同温度にて３０分間撹拌した後、ギ酸アンモニウム（１．３ｇ）及び１０％パラジウム炭素（０．５０ｇ）を加えた。８０℃にて３０分間撹拌した後、さらにギ酸アンモニウム（１．２ｇ）及び１０％パラジウム炭素（０．６５ｇ）を加えた。同温度にて１．５時間撹拌した後、反応液を室温に戻し、クロロホルムにて希釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：クロロホルム＝１：２）で精製することにより、表題化合物（０．９１ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.01-1.09 (2H, m), 1.16-1.21 (2H, m), 2.21-2.30 (1H, m), 3.12-3.36 (2H, m), 3.42-3.51 (1H, m), 3.91 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.24-4.52 (3H, m), 4.55-4.67 (2H, m), 6.90-6.98 (1H, m), 7.09 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.36 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.61 (1H, s).

実施例１００１

第１工程

（Ｒ）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル

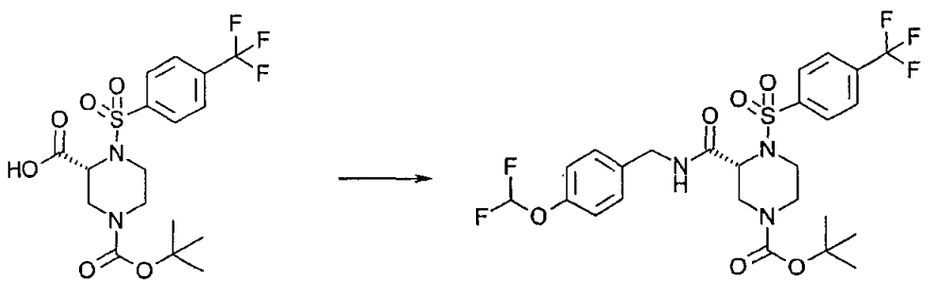


（R）－４－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－ピペラジン－２－カルボン酸ナトリウム（１０．０ｇ）を１，４－ジオキサン（１００ｍｌ）及び水（３０ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、トリエチルアミン（１１．３ｍｌ）と４－ジメチルアミノピリジン（９７ｍｇ）を加えた後、４－トリフルオロメチルベンゼンスルホニルクロリド（１０．２ｇ）を滴下した。室温にて終夜撹拌した後、氷冷撹拌下、２Ｎ塩酸水溶液を加えることにより、反応液をｐＨ３に合わせた後、酢酸エチルと水を加えた。反応液を分液し、有機層を、水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１０．２ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：1.32 (9H, s), 2.68-2.87 (1H, m), 3.01-3.17 (1H, m), 3.25 (1H, d, J = 13.6 Hz), 3.64 (1H, d, J = 10.2 Hz), 3.84-4.03 (1H, m), 4.32 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.51 (1H, s), 7.97 (4H, s), 13.08 (1H, s).

第２工程

（R）－３－（４－ジフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



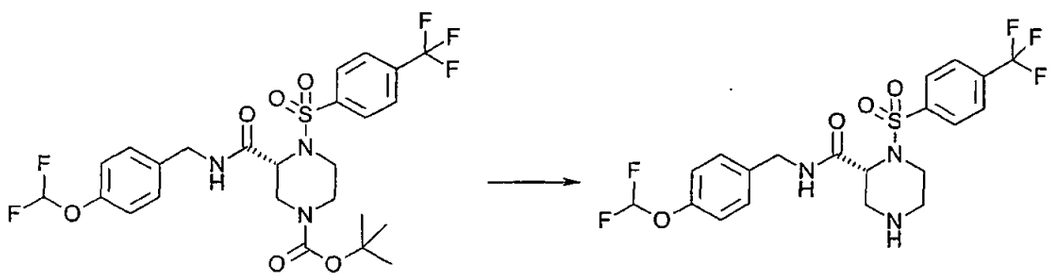
第１工程で得た化合物（１．００ｇ）、４－ジフルオロメトキシベンジルアミン

（４７４ｍｇ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（４２０ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（５２４ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、１０％クエン酸水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をジイソプロピルエーテルとｎ－ヘキサンの混合溶液に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（９５６ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：1.39 (9H, s), 2.60-3.20 (2H, br m), 3.20-3.40 (1H, m), 3.65-3.80 (1H, m), 3.86 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.35-4.55 (3H, m), 4.56 (1H, d, J = 14.0 Hz), 6.50 (1H, t, J = 73.8 Hz), 6.77 (1H, br s), 7.09 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.24 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.3 Hz).

第３工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド



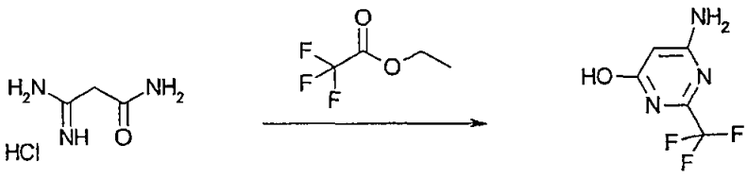
第２工程で得た化合物（９５０ｍｇ）に４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（２０ｍｌ）を加え、室温にて１．５時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にクロロホルム及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。有機層を無水炭酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（８０７ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.45-2.60 (2H, m), 2.87 (1H, d, J = 12.4 Hz), 3.18 (1H, dt, J = 3.3, 13.1 Hz), 3.53 (1H, d, J = 12.7 Hz), 3.77 (1H, d, J = 13.3

Hz), 4.35-4.50 (3H, m), 6.50 (1H, t, J = 73.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.19 (1H, br s), 7.24 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.4 Hz).

第４工程

６－アミノ－２－トリフルオロメチル－ピリミジン－４－オール

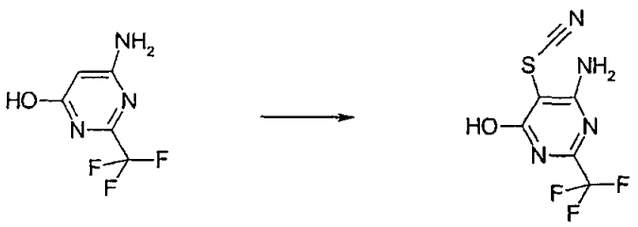


テトラヒドロフラン（２Ｌ）中に室温撹拌下、マロンアミジン塩酸塩（４０６ｇ）及び１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカー７－エン（８７０ｍｌ）を加えた後、トリフルオロ酢酸エチル（１０４０ｍｌ）を滴下した。バス温６５℃で１７時間半、加熱撹拌した後、水（２００ｍｌ）を加え、反応液を濃縮した。濃縮残渣に水（１Ｌ）を加え、室温撹拌下で濃塩酸（４８５ｍｌ）を滴下した後、更に１時間撹拌した。内温を０℃以下まで冷却後、析出した結晶をろ取し、水（６００ｍｌ）で２回洗浄し、乾燥することにより、表題化合物（２５１ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：5.68 (1H, s), 7.10 (2H, br s), 11.64 (1H, br s).

第５工程

６－アミノ－５－チオシアナト－２－トリフルオロメチル－ピリミジン－４－オール



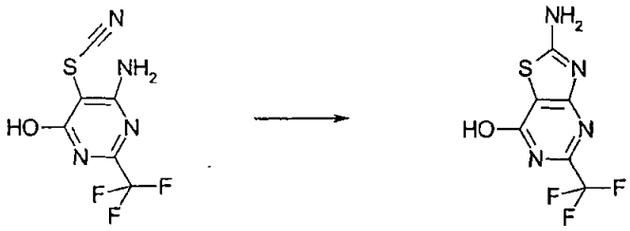
チオシアン酸カリウム（６．７８ｇ）及びピリジン（３．３７ｍｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（７５ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、臭素（１．７２ｍｌ）を滴下した。氷冷下で１時間撹拌した後、第４工程で得た化合物（５．００ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２５ｍｌ）溶液を滴下した。氷冷下でさらに１時間撹

拌した後、水を加え、不溶物をろ去した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（４．４０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：8.17 (2H, br s), 13.58 (1H, br s).

第６工程

２－アミノ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－オール

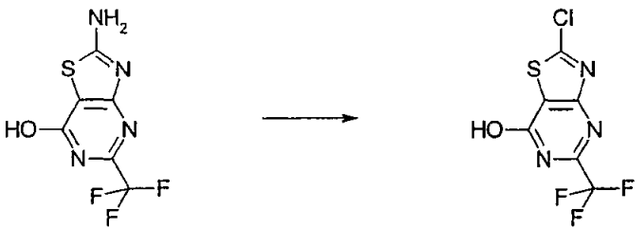


第５工程で得た化合物（４．２５ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１２８ｍｌ）溶液を１３０℃で１４時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にキシレンを加え、再度減圧濃縮した。得られた粗結晶を酢酸エチルに懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（３．３５ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：8.58 (2H, s).

第７工程

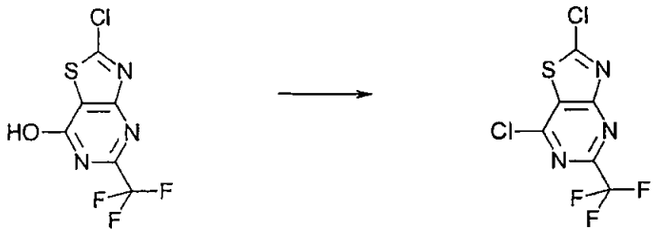
２－クロロ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－７－オール



第６工程で得た化合物（３．００ｇ）の６Ｎ塩酸（４５ｍｌ）溶液に、室温にて撹拌下、亜硝酸ナトリウム（８．７６ｇ）を数回に分けて加えた後、室温でさらに３０分間撹拌した。析出した結晶をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（１．４６ｇ）を得た。

第８工程

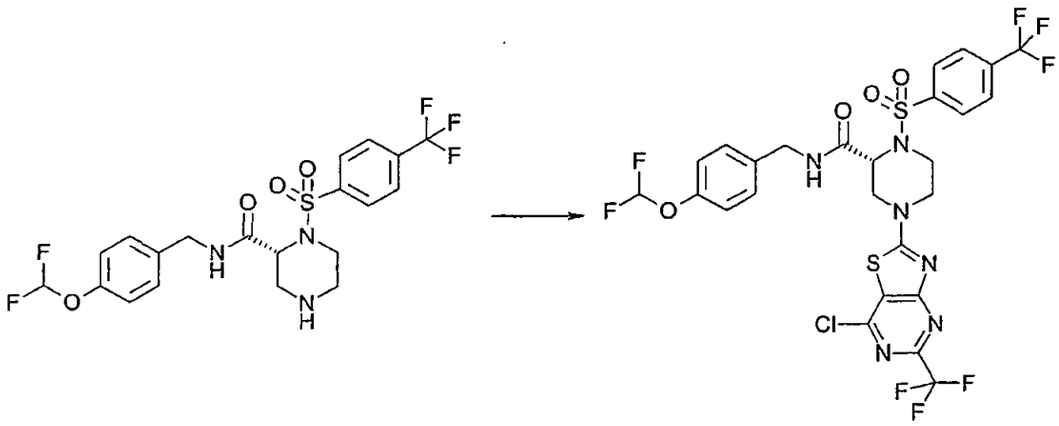
２，７－ジクロロ－５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン



第７工程で得た化合物（１．３５ｇ）のオキシ塩化リン（２０ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、水（１９０ｍｇ）を加えた後、１００℃で３時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、クロロホルム及び水を加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：１０）で精製することにより表題化合物（１．１７ｇ）を得た。

第９工程

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド



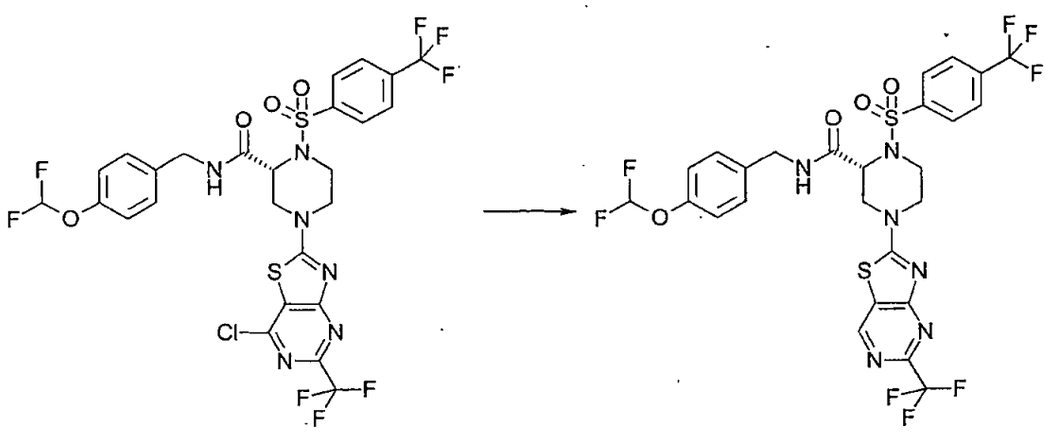
第３工程で得た化合物（７００ｍｇ）及びＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（３７１ｍｇ）のクロロホルム（１１ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、第８工程で得た化合物（３８９ｍｇ）を加えた。室温にて１時間撹拌した後、クロロホルム及び水を加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ

ウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１．０９ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 3.45-3.48 (3H, m), 3.99 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.44-4.59 (5H, m), 6.49 (1H, t, J = 73.5 Hz), 6.81 (1H, t, J = 10.0 Hz), 7.03 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.18 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.02 (2H, d, J = 8.3 Hz).

第１０工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシーベンジルアミド



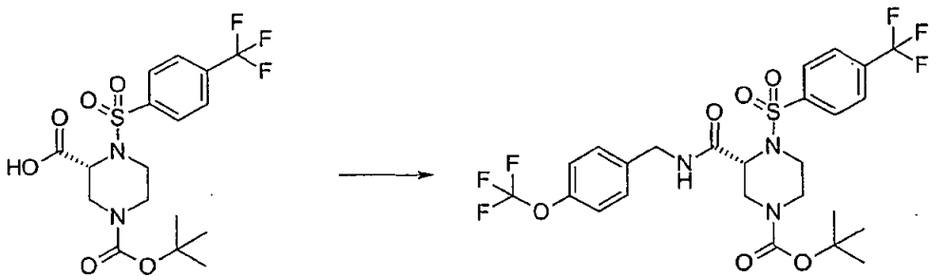
窒素雰囲気下、第９工程で得た化合物（１．０９ｇ）及びギ酸アンモニウム（８９５ｍｇ）のエタノール（１５ｍｌ）－メタノール（５ｍｌ）溶液に１０％パラジウム炭素（１．０ｇ）を加えた。８５℃にて１時間撹拌した後、触媒をろ去した。ろ液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：１）で精製することにより、表題化合物（５９６ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 3.34-3.50 (3H, m), 3.98 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.42-4.58 (5H, m), 6.47 (1H, t, J = 73.7 Hz), 6.88 (1H, t, J = 10.0 Hz), 7.00 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.16 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.87 (1H, s).

実施例９８３

第１工程

（Ｒ）－３－（４－トリフルオロメトキシーベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル

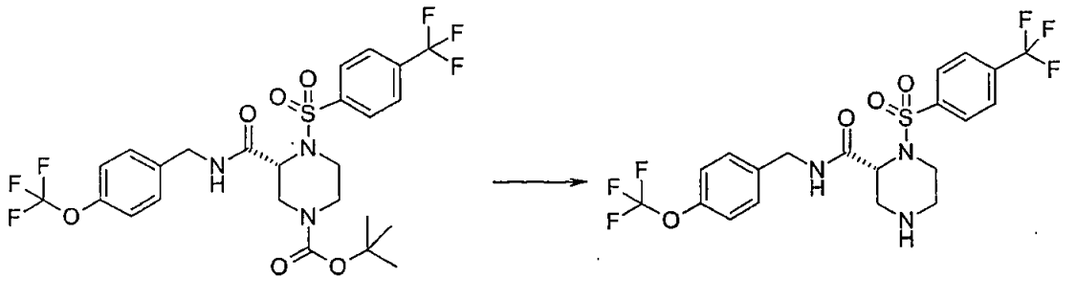


実施例１００１の第１工程で得た化合物（２．９８ｇ）、４－トリフルオロメトキシベンジルアミン（１．５６ｇ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（１．２５ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３０ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１．５６ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、１０％クエン酸水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をジイソプロピルエーテルとｎ－ヘキサンの混合溶液に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（２．７９ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.39 (9H, s), 2.60-3.20 (2H, br m), 3.20-3.40 (1H, br m), 3.65-3.80 (1H, br m), 3.86 (1H, d, J = 13.3 Hz), 4.35-4.55 (3H, m), 4.56 (1H, d, J = 14.0 Hz), 6.80 (1H, br s), 7.18 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.27 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.4 Hz).

第２工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド

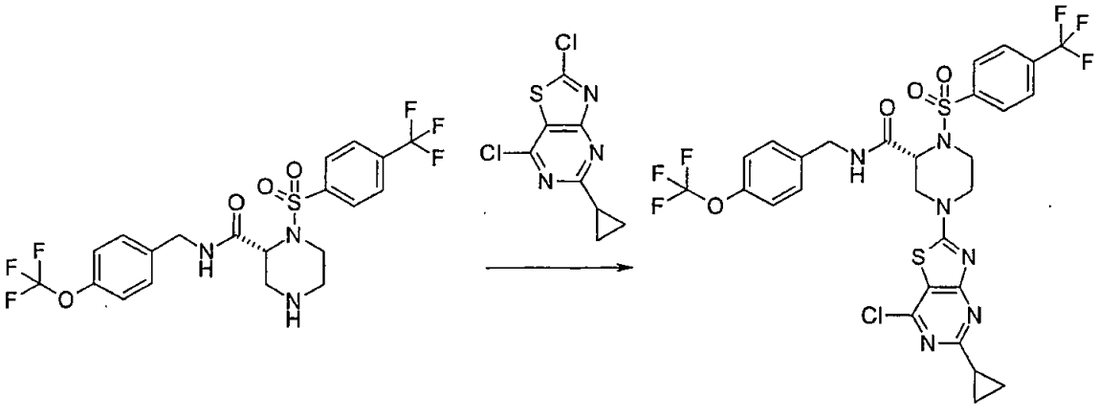


第１工程で得た化合物（２．７８ｇ）に４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（３０ｍｌ）を加え、室温にて１．５時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にクロロホルム及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。有機層を無水炭酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（２．３１ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.45-2.56 (2H, m), 2.87 (1H, d, J = 13.0 Hz), 3.17 (1H, dt, J = 3.2, 13.1 Hz), 3.53 (1H, d, J = 12.9 Hz), 3.78 (1H, d, J = 11.6 Hz), 4.38 (1H, d, J = 3.9 Hz), 4.38-4.53 (2H, m), 7.18 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.23 (1H, br s), 7.27 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.4 Hz).

第３工程

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



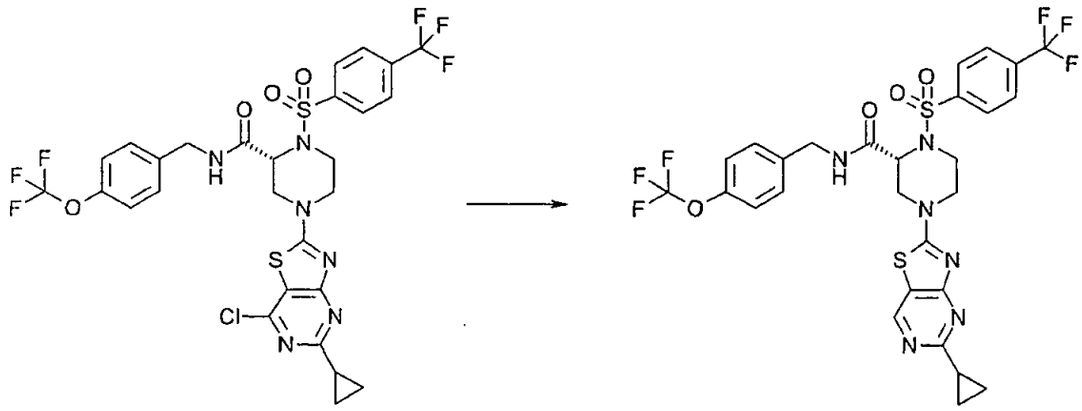
第２工程で得た化合物（０．７５ｇ）と２，７－ジクロロ－５－シクロプロピル

ーチアゾロ［4，5－d］ピリミジン（0．36g）のクロロホルム（7．5ml）混合溶液に、室温にてN，Nージイソプロピルエチルアミン（0．31ml）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：nーヘキサン＝2：3－3：2）で精製することにより、表題化合物（0．99g）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.03-1.10 (2H, m), 1.17-1.22 (2H, m), 2.17-2.27 (1H, m), 3.13-3.35 (2H, m), 3.42-3.53 (1H, m), 3.94 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.23-4.38 (2H, m), 4.48 (1H, dd, J = 15.1, 6.0 Hz), 4.54-4.68 (2H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (2H, d, J = 7.9 Hz).

第4工程

（R）－4－（5－シクロプロピルーチアゾロ［4，5－d］ピリミジンー2ーイル）－1－（4－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジンー2ーカルボン酸　4－トリフルオロメトキシーベンジルアミド



第3工程で得た化合物（0．99g）とギ酸アンモニウム（0．86g）のエタノール（10ml）混合液に、80℃にて10％パラジウム炭素（0．50g）を加えた。80℃にて30分間撹拌した後、ギ酸アンモニウム（0．43g）及び10％パラジウム炭素（0．50g）を加えた。80℃にて30分間撹拌した後、さらにギ酸アンモニウム（0．43g）及び10％パラジウム炭素（0．50g）を加えた。80℃にて30分間撹拌した後、反応液を室温に戻し、酢酸エチルにて希

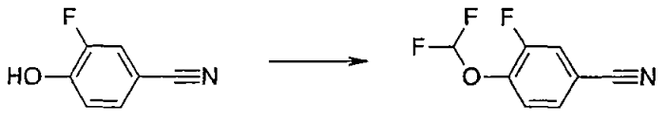
釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝７：３－８：２）で精製することにより、表題化合物（０．７１ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.03-1.08 (2H, m), 1.17-1.21 (2H, m), 2.22-2.29 (1H, m), 3.21 (1H, t, J = 10.9 Hz), 3.32 (1H, d, J = 11.6 Hz), 3.46-3.53 (1H, m), 3.90-3.98 (1H, m), 4.22-4.52 (3H, m), 4.59-4.73 (2H, m), 7.00 (1H, t, J = 5.9 Hz), 7.09 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.62 (1H, s).

実施例１０６１

第１工程

４－ジフルオロメトキシー３－フルオローベンゾニトリル

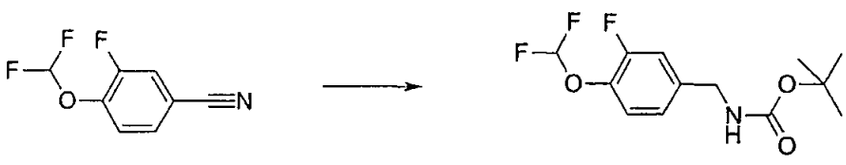


３－フルオロ－４－ヒドロキシベンゾニトリル（３．１０ｇ）のN，N－ジメチルホルムアミド（３１ｍｌ）／水（３．１ｍｌ）混合溶液に、炭酸セシウム（１０．３ｇ）、クロロジフルオロ酢酸ナトリウム（７．９３ｇ）を順次加えた。１１０℃にて２時間撹拌した後、トルエン及び水を加えて分液した。水層をトルエンで抽出した後、合わせた有機層を水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物（４．０９ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：6.64 (1H, t, J = 72.0 Hz), 7.34-7.41 (1H, m), 7.45-7.53 (2H, m).

第２工程

（４－ジフルオロメトキシー３－フルオローベンジル）－カルバミン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



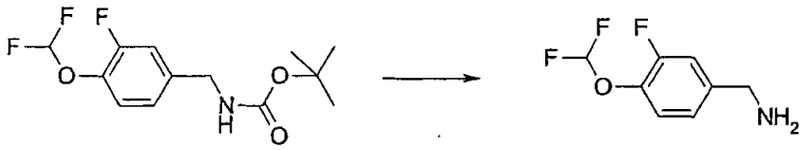
アルゴン雰囲気下、第１工程で得た化合物（４．０９ｇ）のメタノール（３０ｍ

１）溶液に、ジ－ｔｅｒｔ－ブチルジカルボナート（１０．５ｇ）のメタノール（１０ｍｌ）溶液及び塩化ニッケル（II）六水和物（５２０ｍｇ）を加えた。氷冷撹拌下、水素化ホウ素ナトリウム（４．９６ｇ）を少量ずつ約３０分かけて添加し、メタノール（８ｍｌ）を追加した。室温にて終夜撹拌した後、ジエチレントリアミン（５．２ｍｌ）及びメタノール（８ｍｌ）を加えた。そのまま１時間撹拌した後、反応液を濃縮した。残渣に酢酸エチル及び炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、室温にて１時間撹拌した後、分液した。水層を酢酸エチルで抽出後、合わせた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１０：１－４：１）で精製することにより表題化合物（４．５２ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.46 (9H, s), 4.29 (2H, d, J = 6.0 Hz), 4.89 (1H, br s), 6.52 (1H, t, J = 73.6 Hz), 7.04 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 11.0, 2.0 Hz), 7.19 (1H, t, J = 8.0 Hz).

第３工程

４－ジフルオロメトキシー３－フルオローベンジルアミン

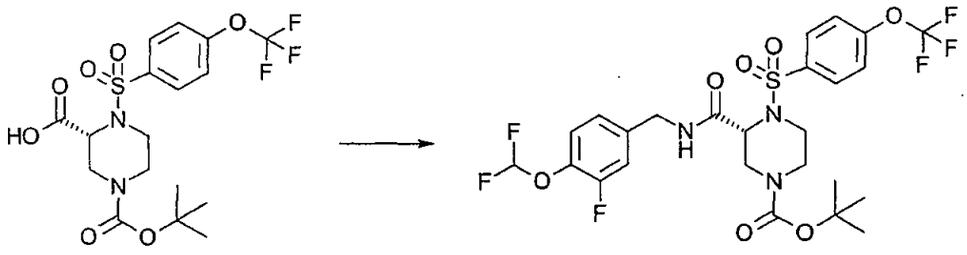


第２工程で得た化合物（４．５２ｇ）の１，４－ジオキサン（５ｍｌ）溶液に、４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン（１５ｍｌ）溶液を加え、室温にて１時間撹拌した。反応液にジイソプロピルエーテル（４０ｍｌ）を加え、室温にて３０分撹拌した。析出した固体をろ取し、ジイソプロピルエーテルで洗浄後、乾燥することにより白色固体（２．８０ｇ）を得た。氷冷撹拌下、得られた白色固体を酢酸エチルに懸濁し、炭酸水素ナトリウム水溶液で中和した。分液後、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物（２．０３ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 3.87 (2H, s), 6.53 (1H, t, J = 73.7 Hz), 7.07 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.14-7.23 (2H, m).

第４工程

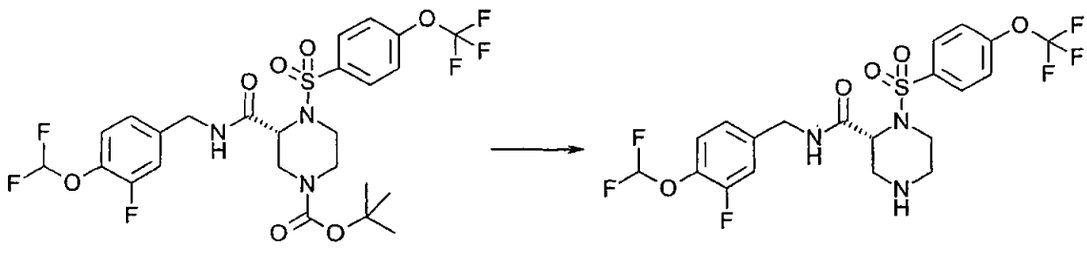
（Ｒ）－３－（４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



実施例７８３の第２工程で得た化合物（１．８３ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（６７７ｍｇ）、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（８４７ｍｇ）、及び４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロベンジルアミン（８０６ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３ｍｌ）溶液を順次加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチル及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。水層を酢酸エチルで抽出した後、合わせた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物（２．７６ｇ）を得た。

第５工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド



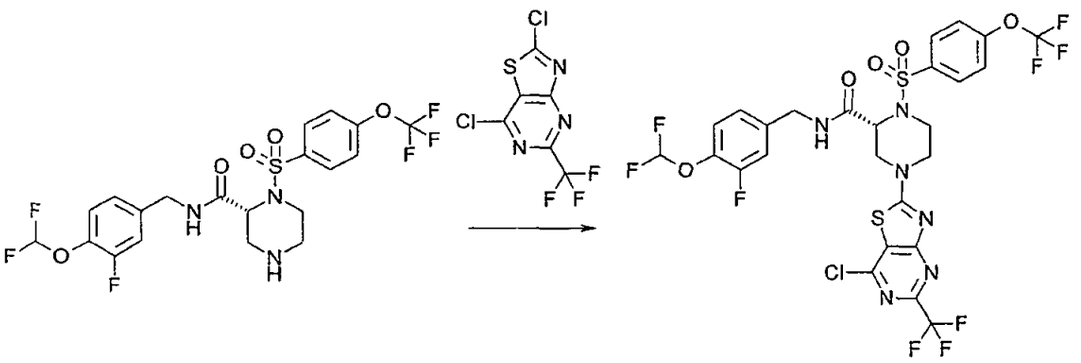
第４工程で得た化合物（２．７６ｇ）の酢酸エチル（４ｍｌ）溶液に４Ｎ塩化水素／酢酸エチル溶液（２０ｍｌ）を加え、室温にて２．５時間撹拌した。反応液を

減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。水層を酢酸エチルで抽出した後、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１．９４ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.46-2.59 (2H, m), 2.86 (1H, d, J = 13.0 Hz), 3.13-3.21 (1H, m), 3.53 (1H, d, J = 13.0 Hz), 3.76 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.32-4.50 (3H, m), 6.54 (1H, t, J = 73.4 Hz), 7.01 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 10.9, 2.1 Hz), 7.19 (1H, t, J = 8.2 Hz), 7.28 (1H, br s), 7.36 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.91 (2H, dt, J = 9.3, 2.4 Hz).

第６工程

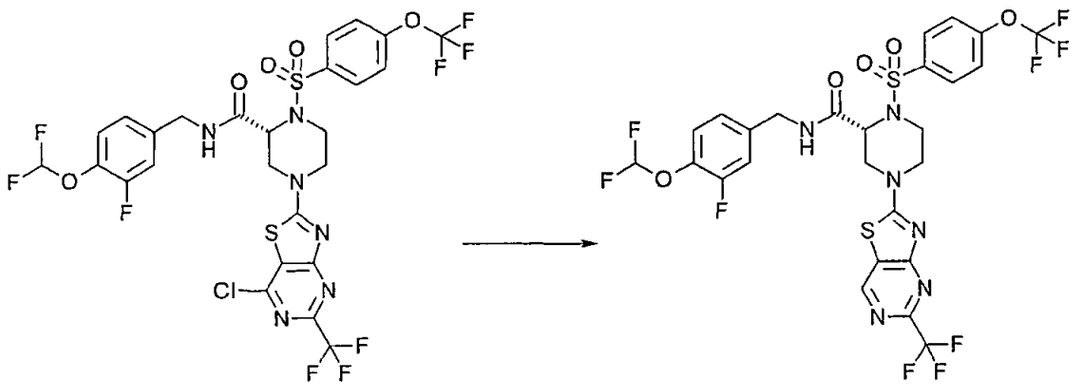
（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド



第５工程で得た化合物（７９６ｍｇ）のクロロホルム（８ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（２３４ｍｇ）、２，７－ジクロロ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン（４１４ｍｇ）を順次加えた。室温にて１時間撹拌した後、クロロホルム及び水を加えて分液した。水層をクロロホルムで抽出した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝６：１－１：２）で精製することにより、表題化合物（９１２ｍｇ）を得た。

第７工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－ジフルオロメトキシ－３－フルオロ－ベンジルアミド



アルゴン雰囲気下、第６工程で得た化合物（９１２ｍｇ）及びギ酸アンモニウム（７５０ｍｇ）のエタノール（１８ｍｌ）溶液に１０％パラジウム炭素（９１２ｍｇ）を加えた。還流条件下にて１時間撹拌した後、触媒をろ去した。ろ液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１０：１－１：２）で精製することにより、表題化合物（６２５ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ：3.16-3.42 (2H, m), 3.47 (1H, t, J = 12.4 Hz), 3.97 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.22-4.77 (2H, br m), 4.28 (1H, dd, J = 15.1, 5.4 Hz), 4.48 (1H, dd, J = 15.1, 6.7 Hz), 4.68 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.51 (1H, t, J = 73.3 Hz), 6.93-7.00 (3H, m), 7.13 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.95 (2H, dt, J = 9.4, 2.4 Hz), 8.88 (1H, s).

実施例１１０１

第１工程

（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－フェニル）－メタノール

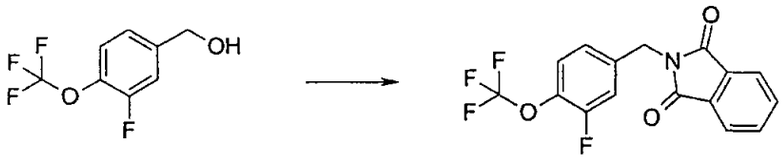


３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシベンズアルデヒド（３．００ｇ）のＴＨＦ（１５ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下にて水素化ホウ素ナトリウム（６５５ｍｇ）を加えた。室温にて１時間撹拌した後、酢酸エチル及び飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（２．９９ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.80 (1H, t, J = 5.8 Hz), 4.71 (2H, d, J = 5.3 Hz), 7.14 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.23-7.32 (2H, m).

第２工程

２－（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジル）－イソインドール－１，３－ジオン

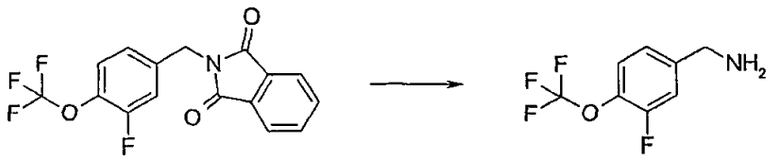


第１工程で得た化合物（２．９５ｇ）のＴＨＦ（３０ｍｌ）溶液に室温撹拌下、フタルイミド（３．１０ｇ）及びトリフェニルホスフィン（５．５２ｇ）を加えた後、氷冷下撹拌した。氷冷撹拌下、アゾジカルボン酸ジイソプロピル（４．１５ｍｌ）を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝２：８－３：７）で精製することにより、表題化合物（４．３０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：4.83 (2H, s), 7.21-7.31 (3H, m), 7.71-7.77 (2H, m), 7.84-7.90 (2H, m).

第３工程

３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミン

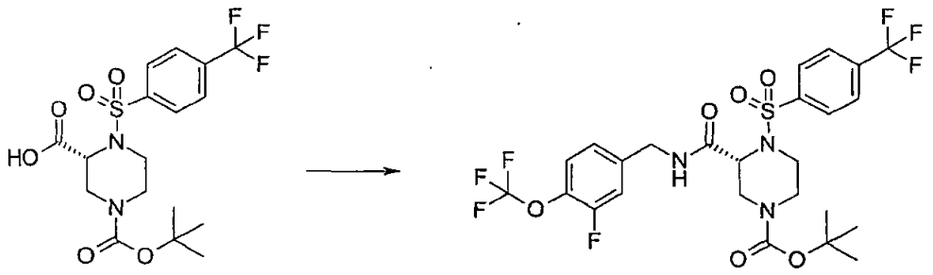


第２工程で得た化合物（４．３０ｇ）のエタノール（６５ｍｌ）懸濁液に、室温にてヒドラジン一水和物（１．８４ｍｌ）を加えた。加熱還流下、１時間撹拌した後、不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１．２８ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.48 (2H, br s), 3.89 (2H, s), 7.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.19-7.29 (2H, m).

第４工程

（Ｒ）－３－（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



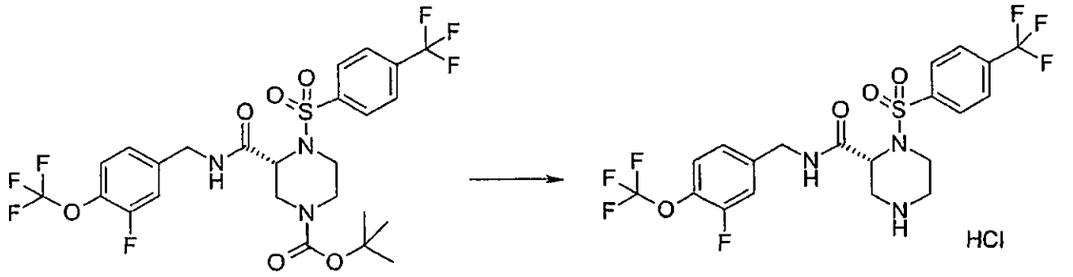
実施例１００１の第１工程で得た化合物（１．２４ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１２ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（０．６５ｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（０．５２ｇ）及び第３工程で得た化合物（０．５９ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および酢酸エチルを加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝４：９６－６：９４）で精製することにより表題化合物（１．７０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.38 (9H, s), 2.63-3.12 (3H, m), 3.20-3.37 (1H, m),

3.64-3.79 (1H, m), 3.87 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.32-4.62 (3H, m), 6.93 (1H, t, J = 6.6 Hz), 7.02-7.13 (2H, m), 7.24-7.29 (1H, m), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.7 Hz).

第５工程

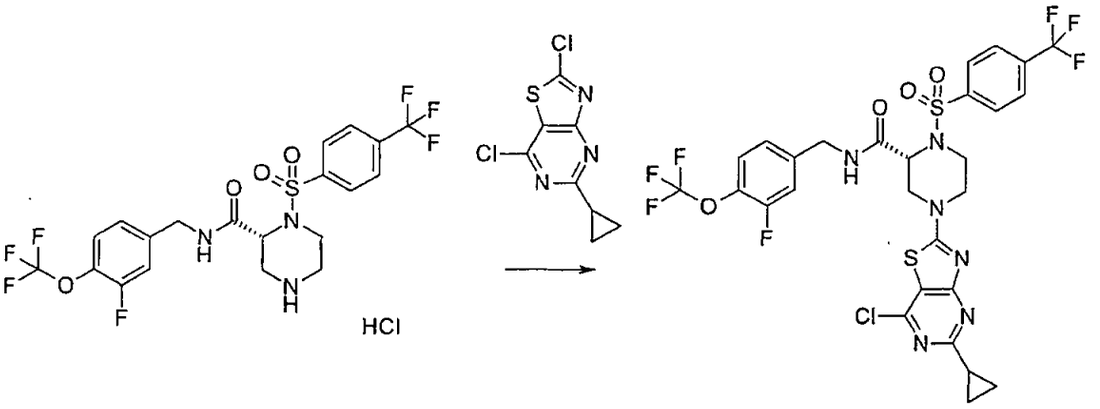
（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド塩酸塩



第４工程で得た化合物（６０ｍｇ）の１，４－ジオキサン（０．６ｍｌ）溶液に、室温撹拌下、４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（０．６ｍｌ）を加えた。室温にて２日間撹拌した後、反応液を減圧濃縮した。残渣にトルエンを加え、再度減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（約０．０９５ｍｍｏｌ）を得た。得られた粗生成物をそのまま次反応に用いた。

第６工程

（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－シクロプロピルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチルーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド

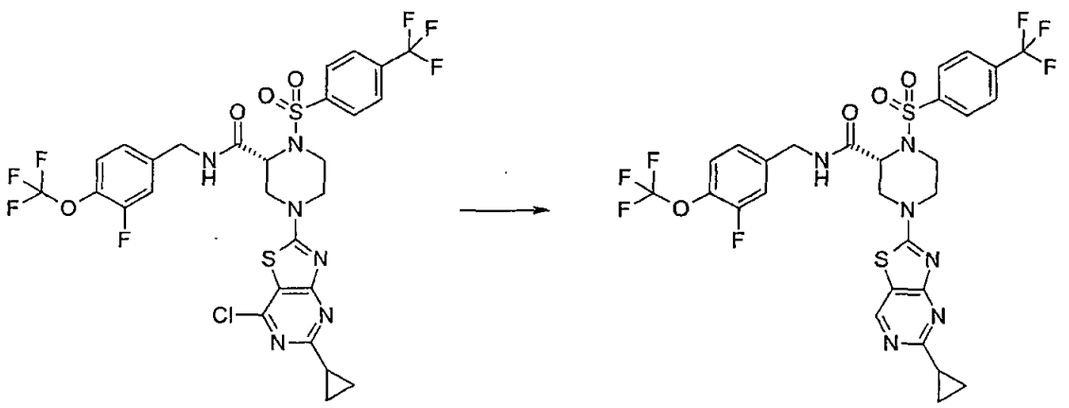


第５工程で得た粗生成物（約０．０９５ｍｍｏｌ）と２，７－ジクロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン（２４ｍｇ）のクロロホルム（１．０ｍｌ）混合液に、室温にてＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（４２μｌ）を加えた。室温にて２時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：１０）で精製することにより、表題化合物（５２ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.03-1.09 (2H, m), 1.17-1.22 (2H, m), 2.18-2.27 (1H, m), 3.14-3.35 (2H, m), 3.43-3.53 (1H, m), 3.96 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.22-4.36 (2H, m), 4.45-4.69 (3H, m), 6.97-7.06 (3H, m), 7.20 (1H, t, J = 8.5 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.02 (2H, d, J = 8.3 Hz).

第７工程

（Ｒ）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



第６工程で得た化合物（４９ｍｇ）とギ酸アンモニウム（４２ｍｇ）のエタノール（１．０ｍｌ）混合液に、８０℃にて１０％パラジウム炭素（２５ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間撹拌した後、１０％パラジウム炭素（２５ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間撹拌した後、ギ酸アンモニウム（４２ｍｇ）及び１０％パラジウム炭素（２５ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間撹拌した後、１０％パラジウ

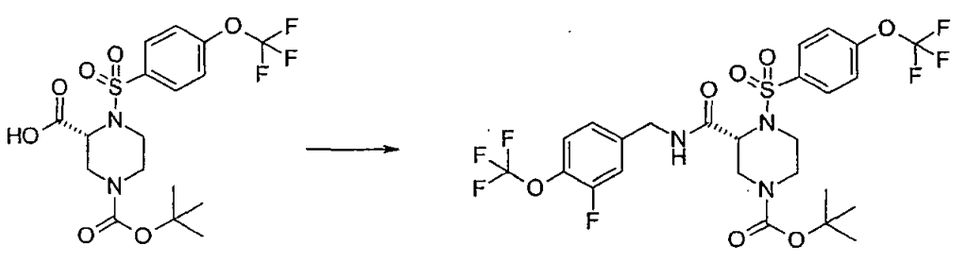
ム炭素（２５ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間撹拌した後、反応液を室温に戻し、酢酸エチルにて希釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：１０）で精製することにより、表題化合物（２９ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.02-1.08 (2H, m), 1.15-1.20 (2H, m), 2.20-2.29 (1H, m), 3.16-3.27 (1H, m), 3.29-3.37 (1H, m), 3.44-3.54 (1H, m), 3.95 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.20-4.33 (2H, m), 4.50 (1H, dd, J = 15.3, 6.6 Hz), 4.59-4.71 (2H, m), 6.94-7.04 (2H, m), 7.08 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.16 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.02 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.61 (1H, s).

実施例１１０２

第１工程

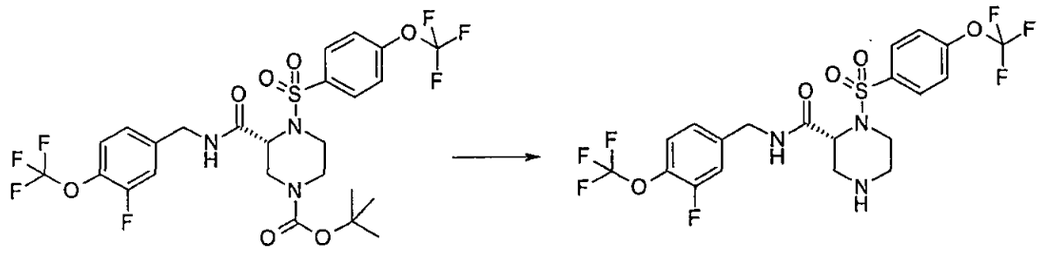
（Ｒ）－３－（３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



実施例７８３の第２工程で得た化合物（１．３５ｇ）のクロロホルム（１５ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（６２５ｍｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（４９９ｍｇ）、３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシベンジルアミン（６２０ｍｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液およびクロロホルムを加えて分液した。さらに水層をクロロホルムで２回再抽出した。有機層を合わせて無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製することにより、表題化合物（１．５０ｇ）を得た。

第２工程

(R)－１－(４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル)－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド

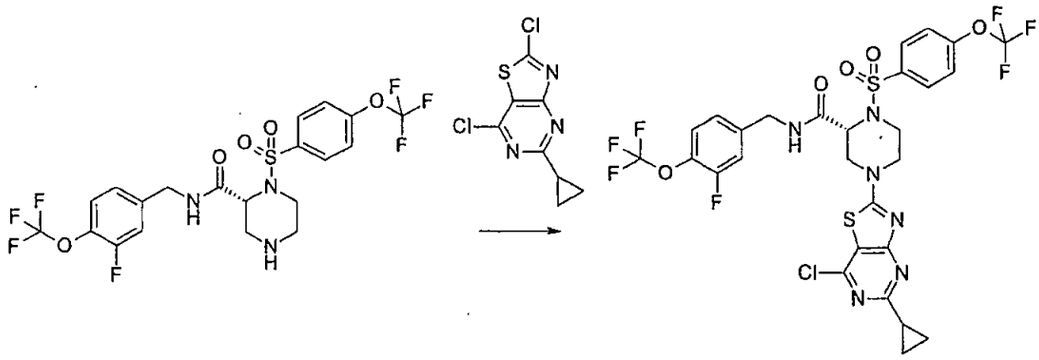


第１工程で得た化合物（１．５０ｇ）の４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（２０ｍｌ）を室温にて２日間撹拌した後、反応液を減圧濃縮した。残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え分液した。水層をクロロホルムで２回再抽出した。有機層を合わせて無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（１．３６ｇ）を得た。この一部を次反応に用いた。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.46-2.58 (2H, m), 2.87 (1H, d, J = 11.6 Hz), 3.12-3.22 (1H, m), 3.54 (1H, d, J = 12.8 Hz), 3.74-3.81 (1H, m), 4.34-4.52 (3H, m), 7.01-7.14 (2H, m), 7.29-7.40 (3H, m), 7.92 (2H, dt, J = 9.4, 2.5 Hz).

第３工程

（R）－４－（７－クロロ－５－シクロプロピルーチアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド

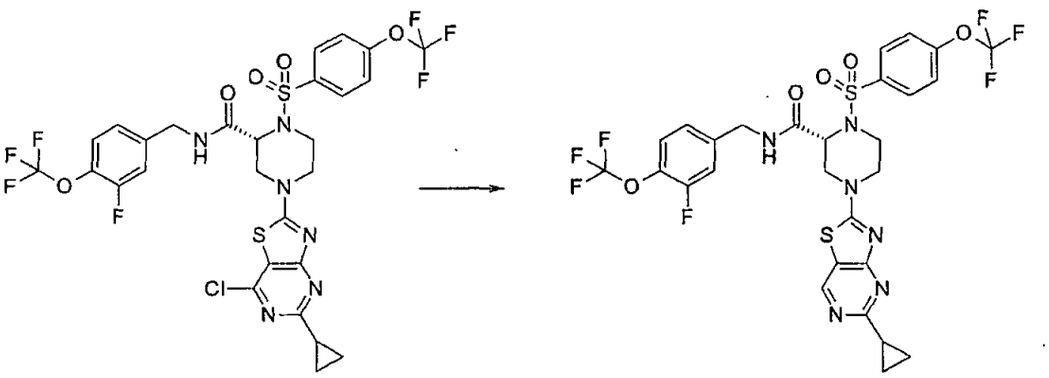


第２工程で得た粗生成物（３８ｍｇ）と２，７－ジクロロ－５－シクロプロピル

－チアゾロ［4，5－d］ピリミジン（１８ｍｇ）のクロロホルム（１．０ｍｌ）溶液に、室温にてN，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（１５μｌ）を加えた。室温にて２時間撹拌した後、反応液を減圧濃縮し、表題化合物を主成分とする粗生成物（約０．０７０ｍｍｏｌ）を得た。これをそのまま次反応に用いた。

第４工程

（R）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　３－フルオロ－４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



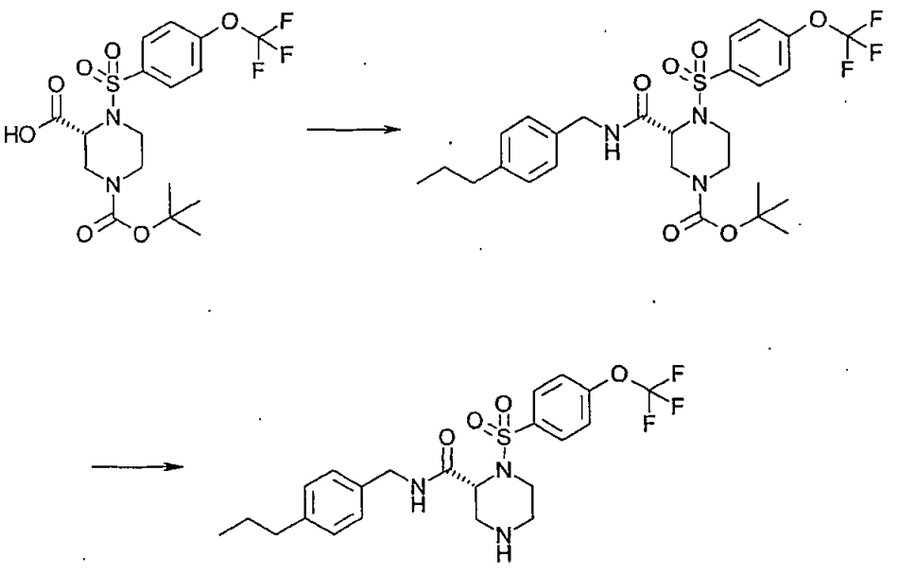
第３工程で得た化合物（約０．０７０ｍｍｏｌ）と大過剰のギ酸アンモニウムのエタノール（２．０ｍｌ）溶液に、加熱還流下、１０％パラジウム炭素（２５ｍｇ）を加えた。その後１０分毎に、加熱還流下、１０％パラジウム炭素（２５ｍｇ）を２回加えた。合計で３０分間加熱還流した後、反応液を室温に戻し、クロロホルムにて希釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣にクロロホルム及び水を加え分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：２０）で精製することにより、表題化合物（２１ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ：1.01-1.08 (2H, m), 1.15-1.21 (2H, m), 2.25 (1H, tt, J = 8.1, 3.9 Hz), 3.15-3.37 (2H, m), 3.43-3.53 (1H, m), 3.92 (1H, dt, J = 14.1, 3.1 Hz), 4.21-4.69 (5H, m), 6.96 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.03 (1H, dd, J = 10.3, 2.0 Hz), 7.08-7.21 (2H, m), 7.37 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.94 (2H, dt, J = 9.5, 2.4 Hz), 8.62 (1H, s).

実施例５７４

第１工程

（Ｒ）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド



実施例７８３の第２工程で得た化合物（６．６５ｇ）、４－プロピルベンジルアミン（３．２６ｇ）及び１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（２．６９ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３３ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（３．３７ｇ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、氷冷下、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水を加え、室温で撹拌した。析出した固体をろ取し、水で洗浄後、減圧乾燥することにより粗生成物（７．４０ｇ）を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：２）で精製することにより、（Ｒ）－３－（４－プロピル－ベンジルカルバモイル）－４－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステルを主成分とする粗生成物を得た。得られた粗生成物を１，４－ジオキサン（４０ｍｌ）に溶解し、室温にて４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（５０ｍｌ）を加え、室温にて２時間撹拌した。さらに４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（２０ｍｌ）を加え、室温にて１時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び酢酸エチルを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水炭酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分と

する粗生成物（３．７０ｇ）を得た。残渣をジイソプロピルエーテルとｎ－ヘキサンの混合溶媒より結晶化し、ろ取した。得られた粗結晶をジイソプロピルエーテルに懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（３．０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：0.94 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.58-1.71 (2H, m), 2.48-2.63 (4H, m), 2.86 (1H, d, J = 12.1 Hz), 3.11-3.24 (1H, m), 3.53 (1H, d, J = 13.2 Hz), 3.74 (1H, d, J = 12.4 Hz), 4.34 (1H, d, J = 4.1 Hz), 4.40 (2H, d, J = 5.7 Hz), 6.97-7.05 (1H, br m), 7.14 (4H, s), 7.33 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.89 (2H, d, J = 8.7 Hz).

第２工程

プテリジン－７－オール



ピリミジン－４，５－ジアミン（４．４ｇ）、酢酸ナトリウム（６．１ｇ）、水（４０ｍｌ）及び５Ｎ酢酸水溶液（１０ｍｌ）の混合溶液に、２－ヒドロキシ－２－メトキシ酢酸メチル（７．２ｇ）を９０℃にて加え、同温度で１時間加熱撹拌した。反応液を室温まで冷却し、５Ｎ硫酸水溶液（９．０ｍｌ）を加えｐＨ２に合わせ、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（４．７ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：8.26 (1H, s), 8.99 (1H, s), 9.13 (1H, s), 13.20 (1H, br s).

第３工程

７－クロロープテリジン



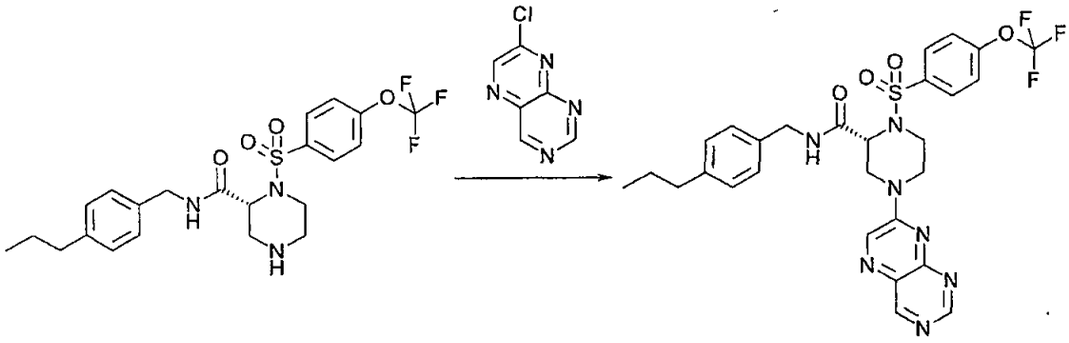
第２工程で得た化合物（０．５０ｇ）及びペンタクロロエタン（２７．５ｍｌ）

の混合溶液を加熱還流した。五塩化リン（８．７ｇ）を加え、１５分加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、析出した固体をろ取し、乾燥することにより、表題化合物（０．４２ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：9.28 (1H, s), 9.61 (1H, s), 9.88 (1H, s).

第４工程

（Ｒ）－４－プテリジン－７－イル－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－プロピル－ベンジルアミド



第１工程で得た化合物（０．０５０ｇ）、第３工程で得た化合物（０．０３４ｇ）及びイソプロパノール（１．０ｍｌ）の混合溶液に、室温にてトリエチルアミン（０．０１６ｍｌ）を加え、３．５時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、減圧濃縮した。得られた残渣に酢酸エチルを加え、水を注いだ後、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：酢酸エチル＝１：２０）で精製し、得られた残渣をヘキサンとジイソプロピルエーテルの混合溶媒に懸濁し、ろ取後、乾燥することにより表題化合物（０．０２６ｇ）を得た。

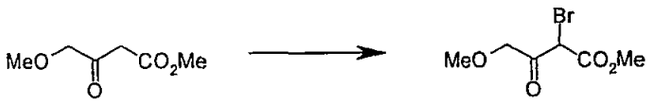
^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：0.91 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.51-1.65 (2H, m), 2.50 (2H, t, J = 7.7 Hz), 2.92-3.07 (1H, m), 3.20 (1H, dd, J = 13.6, 3.4 Hz), 3.36-3.50 (1H, m), 3.90-4.00 (1H, m), 4.25-4.38 (2H, m), 4.66 (1H, s), 4.77-4.90 (1H, m), 5.08 (1H, d, J = 13.6 Hz), 6.82 (1H, t, J = 5.3 Hz), 6.97 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.00 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.95 (2H, d, J = 8.3

Hz), 8.79 (1H, s), 9.22 (1H, s), 9.26 (1H, s).

実施例８０５

第１工程

２－ブロモ－４－メトキシ－３－オキソ－ブチル酸　メチルエステル



臭化銅(II)（７．３７ｇ）をアセトニトリル（３９ｍｌ）に懸濁し、氷冷撹拌下、４－メトキシ－３－オキソブチル酸　メチルエステル（３．８８ｍｌ、３０ｍｍｏｌ）とヒドロキシ（トシロキシ）ヨードベンゼン（１１．８ｇ）を加えた。この反応混合物をそのまま３時間撹拌し、水とクロロホルムを加えた。反応液を分液し、水層をクロロホルムで２回再抽出した。有機層を合わせて、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（約３０ｍｍｏｌ）を得た。得られた粗生成物をそのまま次反応に用いた。

第２工程

２－アミノ－４－メトキシメチルチアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル



第１工程で得た粗生成物（約３０ｍｍｏｌ）とチオ尿素（２．２８ｇ）のエタノール（６０ｍｌ）溶液を一晩、加熱還流した。室温まで冷却後、反応混合物に酢酸エチルと水を加えて分液した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。続いて、イソプロパノール、クロロホルム、酢酸エチルとジイソプロピルエーテルを適量加え、室温にて30分撹拌した。析出した結晶をろ取し、乾燥することにより、表題化合物（３．２７ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 3.47 (3H, s), 3.81 (3H, s), 4.74 (2H, s), 5.45 (2H, br s).

第３工程

２－アミノ－４－ヒドロキシメチルチアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル

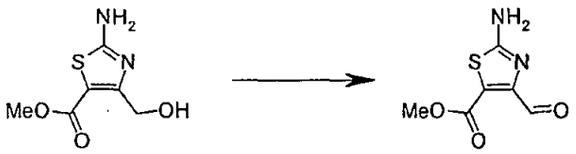


第２工程で得た化合物（４．６８ｇ）をジクロロメタン（１６０ｍｌ）に懸濁し、氷冷撹拌下、三臭化ホウ素（１．０Ｍ　ジクロロメタン溶液、３５ｍｌ）を滴下した。この反応混合物をそのまま９０分撹拌後、氷冷撹拌下、４Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（２６ｍｌ）を滴下し、室温で３０分撹拌した。析出した固体をろ取し、水、アセトンで洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（３．１５ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (CD_3OD, 400MHz) δ：3.78 (3H, s), 4.73 (2H, s).

第４工程

２－アミノ－４－ホルミルチアゾール－５－カルボン酸　メチルエステル

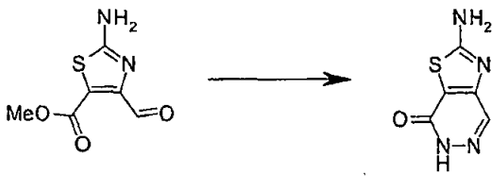


第３工程で得た化合物（１．３５ｇ）の１，４－ジオキサン（６８ｍｌ）／Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１３ｍｌ）溶液に室温で二酸化マンガン（３．６８ｇ）を加え、同温度で４０時間撹拌した。不溶物をろ去し、ろ液を減圧濃縮することにより、表題化合物（１．２０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：3.81 (3H, s), 8.05 (2H, br s), 10.28 (1H, s).

第５工程

２－アミノ－６Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－７－オン



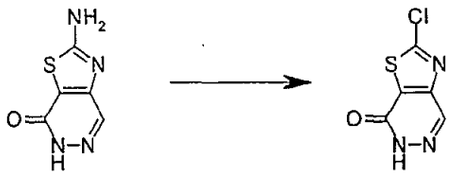
第４工程で得た化合物（１．２０ｇ）のエタノール（１２０ｍｌ）溶液に、ヒドラジン一水和物（３７４μｌ）を加えた後、２４時間加熱還流した。反応が完結していなかったので酢酸（１．０ｍｌ）を加え、さらに２０時間加熱還流した。反応液を液量が５ｍｌになるまで減圧濃縮し、少量のエタノールを加え、室温にて３０

分撹拌した。析出した固体をろ取し、少量のエタノールで洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（８２２ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：8.08 (1H, s), 8.26 (2H, br s), 12.75 (1H, br s).

第６工程

２－クロロ－６Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－７－オン

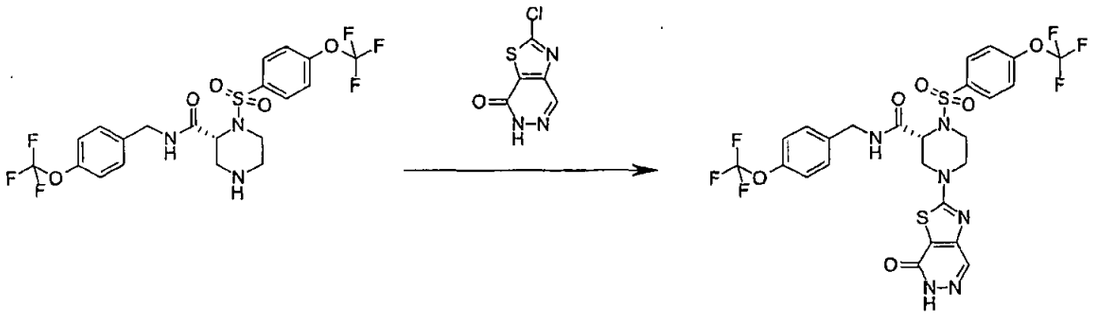


第５工程で得た化合物（８２２ｍｇ）を６Ｎ塩酸水溶液（６．６ｍｌ）に懸濁し、室温にて、亜硝酸ナトリウム（１．６９ｇ）を数回に分けて加えた後、得られた懸濁液をそのまま３０分撹拌した。反応液に水を加えて希釈後、固体をろ取し、水と少量のアセトンで洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（７７０ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：8.61 (1H, s), 13.41 (1H, br s).

第７工程

（Ｒ）－４－（７－オキソ－６，７－ジヒドロチアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



実施例７８３で得た化合物（２６ｍｇ）、第６工程で得た化合物（１０ｍｇ）及びイソプロパノール（１．０ｍｌ）の混合溶液に、室温にてトリエチルアミン（１４μｌ）を加え、一晩加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：２０、二重展開）で精製す

ることにより、表題化合物（３１ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ：3.33-3.40 (1H, m), 3.60-3.85 (3H, m), 3.95-4.20 (3H, m), 4.39 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.64 (1H, dd, J = 4.8, 2.4 Hz), 7.23 (4H, dd, J = 22.3, 8.6 Hz), 7.50 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.93 (2H, dt, J = 9.7, 2.5 Hz), 8.13 (1H, s), 8.81 (1H, t, J = 5.9 Hz), 12.87 (1H, s).

実施例１０１９

第１工程

５－ブロモー［１，３，４］チアジアゾール－２－イルアミン

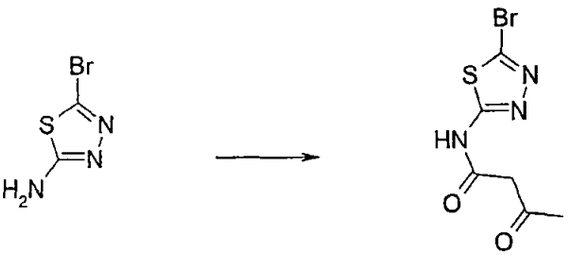


［１，３，４］－チアジアゾール－２－イルアミン（１１ｇ）及び酢酸ナトリウム（３６ｇ）の酢酸（１６０ｍｌ）懸濁液に、室温下、臭素（６．０ｍｌ）の酢酸（４０ｍｌ）溶液を３０分かけてゆっくり滴下した。滴下後さらに３時間攪拌後、反応液に水（２００ｍｌ）を加え、析出した固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（１７ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：7.51 (2H, br s).

第２工程

Ｎ－（５－ブロモー［１，３，４］チアジアゾール－２－イル）－３－オキソーブチルアミド



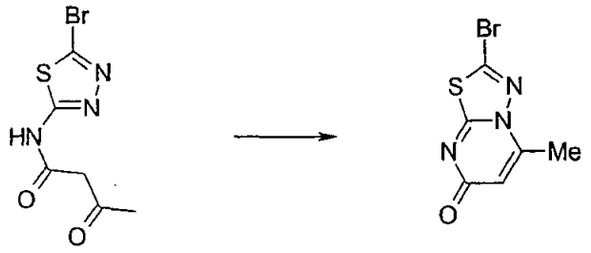
第１工程で得た化合物（２．８ｇ）のトルエン（２００ｍｌ）懸濁液に１００℃にて４－メチレンオクタセン－２－オン（１０ｍｌ）をゆっくり滴下し、同温度で６時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた表題化合物を主成分とする粗生成物（３．５ｇ）を含水メタノールで洗浄後、乾燥することにより、表題化合物（２．

０ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：2.21 (3H, s), 3.79 (2H, s), 12.95 (1H, s).

第３工程

２－ブロモ－５－メチル－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－７－オン

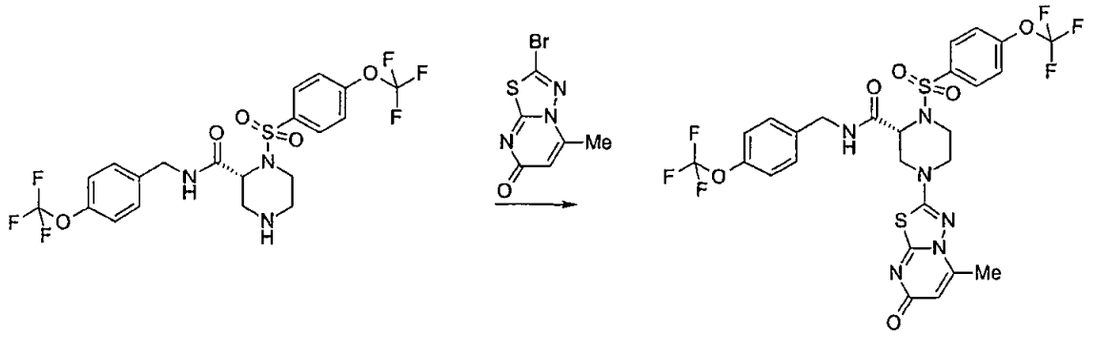


６０℃に加熱した濃硫酸（１０ｍｌ）に第２工程で得た化合物（１．３ｇ）を分割して加え、同温度で３時間撹拌した。反応液を氷（１００ｇ）に注ぎ、炭酸ナトリウム（２０ｇ）水溶液（１００ｍｌ）で中和した。有機層をクロロホルム（５０ｍｌ）で抽出し、乾燥することにより、表題化合物（８１０ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.52 (3H, s), 6.14 (1H, s).

第４工程

（Ｒ）－４－（５－メチル－７－オキソ－７Ｈ－［１，３，４］チアジアゾロ［３，２－ａ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメトキシーベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド



実施例７８３で得た化合物（０．０３８ｇ）、第３工程で得た化合物（０．０２３ｇ）及びエタノール（１．０ｍｌ）の混合溶液に、室温にてＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（０．０１９ｍｌ）を加えた。１００℃にて３時間撹拌した後、

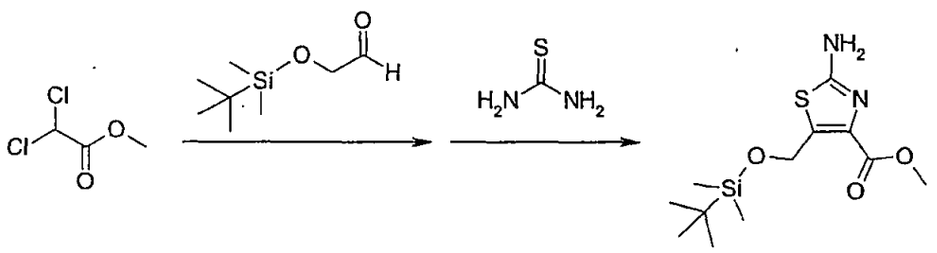
反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：９）で精製することにより、表題化合物（０．０３２ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.36 (3H, s), 3.01 (1H, td, J = 12.2, 3.1 Hz), 3.15 (1H, dd, J = 13.2, 4.1 Hz), 3.57 (1H, ddd, J = 13.8, 10.7, 2.4 Hz), 3.90 (2H, tt, J = 16.4, 3.0 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.36 (1H, dd, J = 13.6, 5.3 Hz), 4.43 (1H, dd, J = 14.1, 5.5 Hz), 4.66 (1H, d, J = 1.9 Hz), 6.05 (1H, d, J = 0.8 Hz), 7.15 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.26 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.32 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.57 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.7 Hz).

実施例１０３０

第１工程

２－アミノ－５－（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシメチル）－チアゾール－４－カルボン酸　メチルエステル



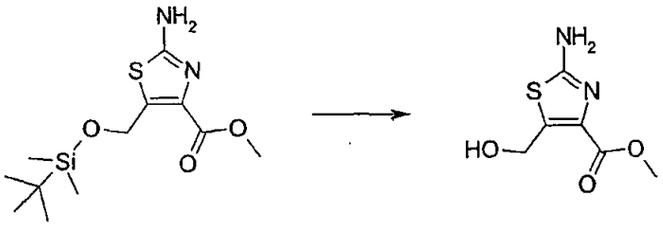
ジクロロ酢酸メチル（３．０８ｇ）のジエチルエーテル（１２ｍｌ）－メタノール（６ｍｌ）溶液中に、氷冷撹拌下、（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリルオキシ）アセトアルデヒド（５．０ｇ）を加えた。氷冷撹拌下、２８％ナトリウムメトキシドメタノール溶液（４．８３ｍｌ）を滴下した後、更に３時間撹拌した。氷冷撹拌下、水を加え、そのまま室温まで昇温した。ジエチルエーテルを加え分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。濃縮残渣のアセトニトリル（３０ｍｌ）溶液中に、室温撹拌下、チオ尿素（１．６４ｇ）を加えた。バス温７０℃で３時間撹拌後、室温に戻した。反応液を減圧濃縮し、その濃縮残渣に酢酸エチル及び水を加え、不溶物をろ去した。ろ液に塩化ナトリウムを加え、分液した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝３：７）で精製することにより、表題化合

物（２．０５ｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：0.08 (6H, s), 0.89 (9H, s), 3.72 (3H, s), 4.99 (2H, s), 7.02 (2H, br s).

第２工程

２－アミノ－５－ヒドロキシメチル－チアゾール－４－カルボン酸　メチルエステル

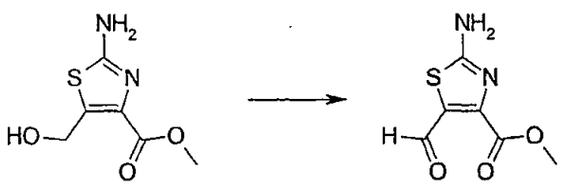


第１工程で得た化合物（２．０３ｇ）のテトラヒドロフラン（４０ｍｌ）溶液中に、氷冷撹拌下、１．０Ｍフッ化テトラブチルアンモニウムテトラヒドロフラン溶液（７．３８ｍｌ）を滴下した。室温にて１時間撹拌後、反応液を減圧濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：メタノール＝９：１）で精製することにより、表題化合物（１．０６ｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：3.42 (1H, t, J = 7.0 Hz), 3.93 (3H, s), 4.87 (2H, d, J = 7.0 Hz), 4.98 (2H, br s).

第３工程

２－アミノ－５－ホルミル－チアゾール－４－カルボン酸　メチルエステル



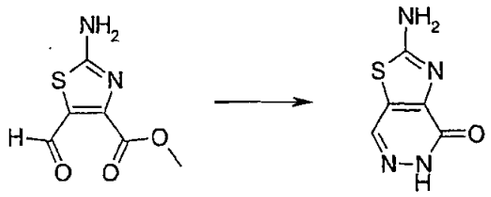
第２工程で得た化合物（１．０５ｇ）をクロロホルム（５０ｍｌ）に懸濁し、室温撹拌下、二酸化マンガン（４．８６ｇ）を加え、同温度で３日間撹拌した。反応液を濃縮後、テトラヒドロフラン（１５０ｍｌ）及び活性炭を加え、加熱還流した。熱時で不溶物をろ去し、ろ去物を熱した混合溶媒（テトラヒドロフラン：Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド：メタノール＝８：１：１）にて洗浄した。ろ液を減圧濃縮

し、得られた粗結晶をジエチルエーテルで懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（７８２ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：3.85 (3H, s), 8.41 (2H, br s), 10.14 (1H, s).

第４工程

２－アミノ－５Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－オン

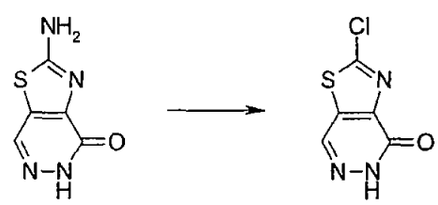


第３工程で得た化合物（７８８ｍｇ）をエタノール（７．８ｍｌ）に懸濁し、室温撹拌下、ヒドラジン一水和物（２４３μｌ）及び酢酸（７８０μｌ）を加えた。バス温１００℃で終夜撹拌した後、室温に戻した。反応液を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をメタノールで懸濁し、ろ取後、乾燥することにより、表題化合物（６９０ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：8.07 (2H, br s), 8.25 (1H, s), 12.67 (1H, br s).

第５工程

２－クロロ－５Ｈ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－４－オン



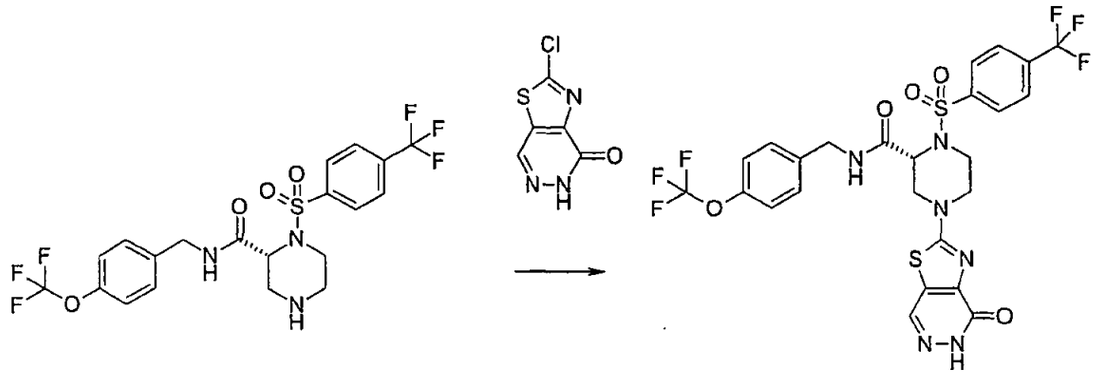
第４工程で得た化合物（６８８ｍｇ）を６Ｎ塩酸水溶液（１０ｍｌ）に懸濁し、室温撹拌下、亜硝酸ナトリウム（１．４１ｇ）を数回に分けて加えた後、室温で更に１時間撹拌した。室温撹拌下、水を加え、固体をろ取し、水で洗浄後、乾燥することにより表題化合物（５７１ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：8.61 (1H, s), 13.25 (1H, br s).

第６工程

（Ｒ）－４－（４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラ

ジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド

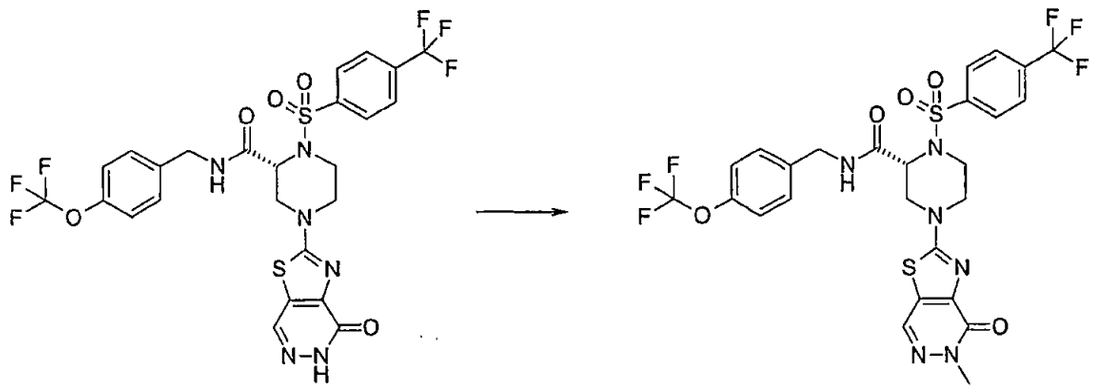


実施例９８３の第２工程で得た化合物（８７ｍｇ）と第５工程で得た化合物（３２ｍｇ）のイソプロパノール（０．９ｍｌ）混合液に、室温にてＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（３０μｌ）を加えた。室温にて終夜攪拌した後、加熱還流下、５時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝５：９５）で精製することにより、表題化合物（８４ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：3.07-3.17 (1H, m), 3.27 (1H, dd, J = 13.4, 4.3 Hz), 3.44-3.54 (1H, m), 3.95 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28-4.39 (2H, m), 4.47 (1H, dd, J = 15.3, 6.2 Hz), 4.56 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.67 (1H, br s), 6.99 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.22 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.04 (1H, s), 10.28 (1H, br s).

第７工程

（Ｒ）－４－（５－メチル－４－オキソ－４，５－ジヒドロ－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリダジン－２－イル）－１－（４－トリフルオロメチル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



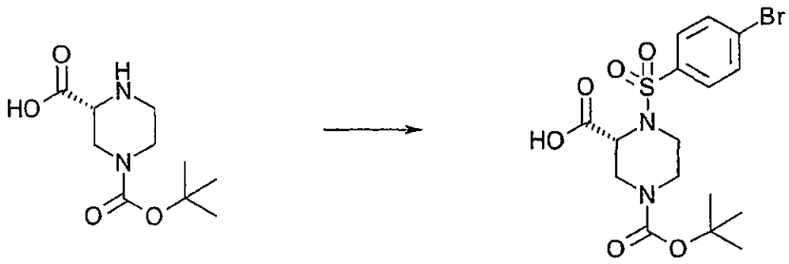
第６工程で得た化合物（４０ｍｇ）のＴＨＦ（０．８ｍｌ）溶液に氷冷撹拌下、メタノール（３．７μｌ）、トリフェニルホスフィン（２４ｍｇ）及びアゾジカルボン酸ジイソプロピル（１８μｌ）を加え、室温にて終夜撹拌した。室温にてメタノール（１．２μｌ）、トリフェニルホスフィン（８ｍｇ）及びアゾジカルボン酸ジイソプロピル（６μｌ）を追加し、３時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝５：９５）で精製することにより、表題化合物（２９ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：3.08-3.17 (1H, m), 3.27 (1H, dd, J = 13.4, 4.3 Hz), 3.45-3.55 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.93 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.25-4.37 (2H, m), 4.46 (1H, dd, J = 15.1, 6.4 Hz), 4.56 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.68 (1H, br s), 7.05-7.13 (3H, m), 7.20 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.98-8.02 (3H, m).

実施例１１００

第１工程

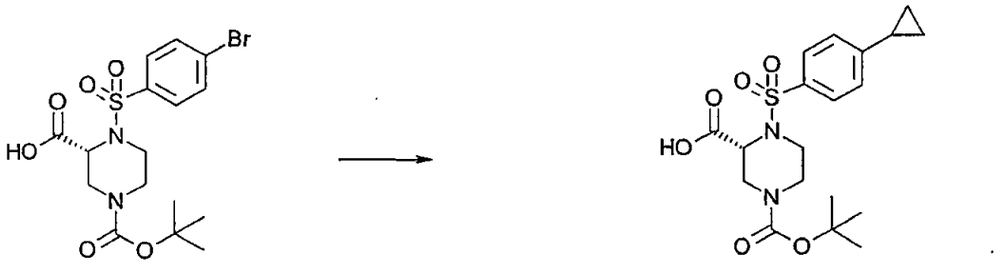
（Ｒ）－４－（４－ブロモ－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－１，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



（R）－4－ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル－ピペラジン－２－カルボン酸（５００ｍｇ）を1，４－ジオキサン（５．０ｍｌ）及び水（２．５ｍｌ）の混合溶媒に懸濁し、氷冷撹拌下、２N水酸化ナトリウム水溶液（１．１ｍｌ）及びトリエチルアミン（４４０ｍｇ）を順次加えた後、４－ブロモベンゼンスルホニルクロリド（６１０ｍｇ）の1，４－ジオキサン（１．０ｍｌ）溶液を滴下した。室温で終夜撹拌した後，氷冷撹拌下、１０％クエン酸水溶液、酢酸エチルを加えた。反応液を分液し、有機層を水で洗浄した後、飽和食塩水で洗浄し、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（５４８ｍｇ）を得た。この一部をそのまま次反応に用いた。

第２工程

（R）－4－（4－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－1，３－ジカルボン酸　１－ｔｅｒｔ－ブチルエステル



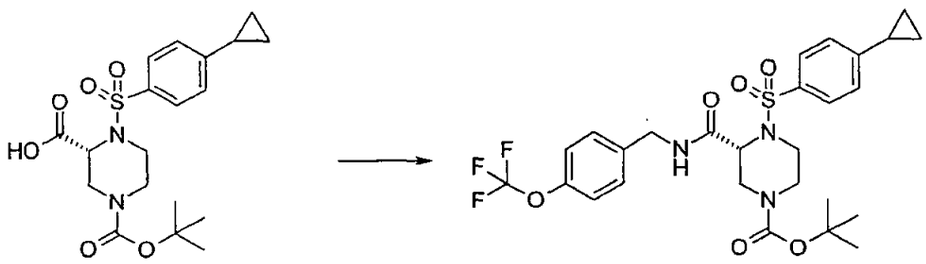
アルゴン雰囲気下、二酢酸パラジウム（１５ｍｇ）と２－ジシクロヘキシルホスフィノ－2’，4’，6’－トリイソプロピルビフェニル（６１ｍｇ）のトルエン（５．８ｍｌ）懸濁液に第１工程で得た化合物（２９０ｍｇ）、シクロプロピルボロン酸（８３ｍｇ）及びリン酸三カリウム（１．２１ｇ）を順次加えた。１００℃にて１時間撹拌した。室温で酢酸エチルを加えた後に氷冷撹拌下で１N塩酸水溶液を加えることにより、反応液をｐＨ４に合わせた。得られた懸濁液をセライトろ過した後に分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾

燥し、ろ過後、減圧濃縮することにより、表題化合物を主成分とする粗生成物（３２８ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：0.72-0.81 (2H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.29-1.45 (9H, m), 1.88-2.01 (1H, m), 2.75-2.96 (1H, m), 3.01-3.16 (1H, m), 3.29-3.46 (1H, m), 3.58-3.69 (1H, m), 3.93-4.12 (1H, m), 4.46-4.67 (2H, m), 7.13 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.3 Hz).

第３工程

（Ｒ）－４－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－３－（４－トリフルオロメトキシ－ベンジルカルバモイル）－ピペラジン－１－カルボン酸　ｔｅｒｔ－ブチルエステル



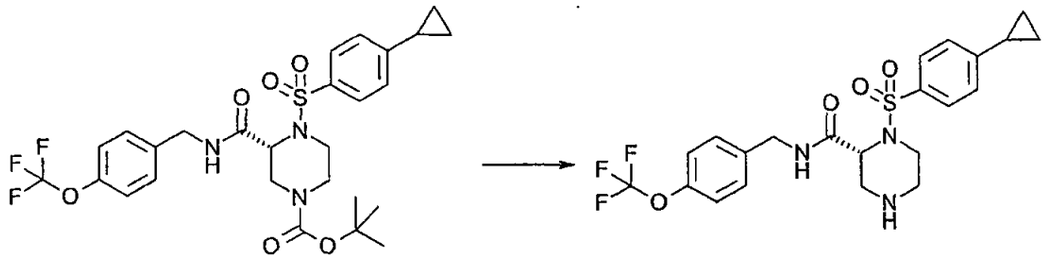
第２工程で得た化合物（１６８ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１．７ｍｌ）溶液に、氷冷撹拌下、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（９４ｍｇ）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（７５ｍｇ）及び４－トリフルオロメトキシベンジルアミン（８５ｍｇ）を順次加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチル、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び水を加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製することにより、表題化合物（１３２ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ：0.78-0.84 (2H, m), 1.10-1.17 (2H, m), 1.93-2.01 (1H, m), 2.62-2.82 (2H, br m), 3.24-3.35 (1H, m), 3.60-3.83 (2H, br m), 4.37-4.64 (4H, m), 6.94-7.01 (1H, m), 7.16-7.21 (4H, m), 7.25-7.30 (2H, m), 7.71 (2H, d, J = 8.6 Hz).

第４工程

（Ｒ）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カ

ルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド

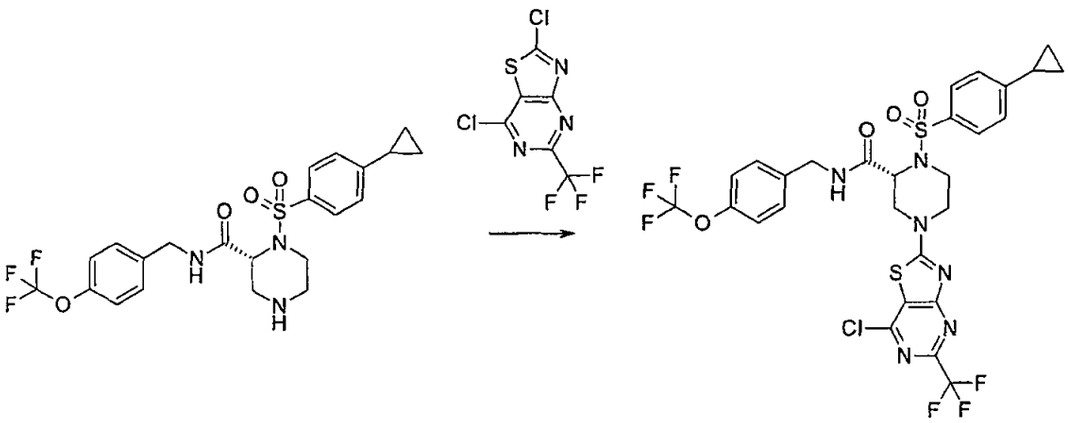


第３工程で得た化合物（１３０ｍｇ）に４Ｎ塩化水素／１，４－ジオキサン溶液（１．３ｍｌ）を加え、室温にて６時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び水を加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝９：１）で精製することにより、表題化合物（８８ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：0.74-0.83 (2H, m), 1.08-1.17 (2H, m), 1.90-2.01 (1H, m), 2.38-2.50 (2H, m), 2.76 (1H, d, J = 12.8 Hz), 3.04-3.17 (1H, m), 3.54 (1H, d, J = 12.8 Hz), 3.71-3.80 (1H, m), 4.31 (1H, d, J = 3.8 Hz), 4.40-4.55 (2H, m), 7.11-7.21 (5H, m), 7.28 (2H, t, J = 5.8 Hz), 7.69-7.72 (2H, m).

第５工程

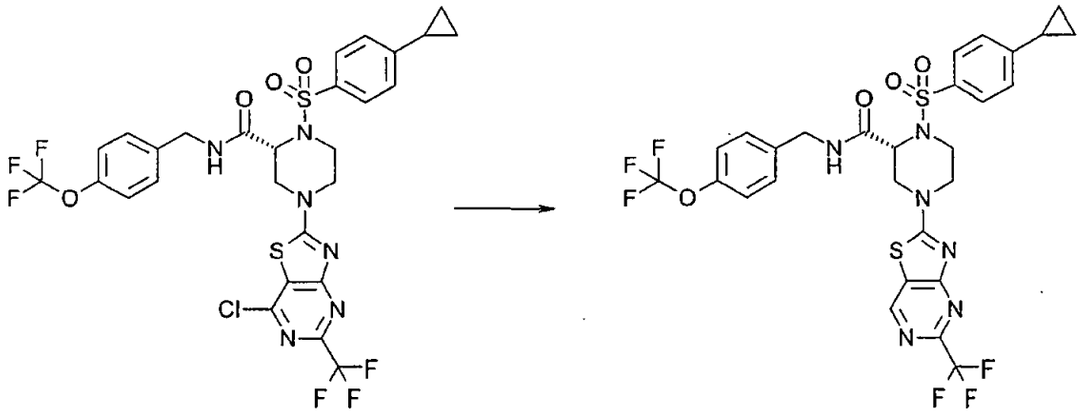
（Ｒ）－４－（７－クロロ－５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシーベンジルアミド



実施例１００１の第８工程で得た化合物（２７ｍｇ）、第４工程で得た化合物（４３ｍｇ）及びクロロホルム（０．５０ｍｌ）の混合溶液に、氷冷下、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（１９μｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝２０：１）で精製することにより、表題化合物（６６ｍｇ）を得た。

第６工程

（Ｒ）－４－（５－トリフルオロメチル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



第５工程で得た化合物（６６ｍｇ）、ギ酸アンモニウム（２８ｍｇ）及びエタノール（１．３ｍｌ）の混合溶液に、加熱還流下、１０％パラジウム炭素（３３ｍｇ）を加えた。同温度にて１０分間撹拌した後、ギ酸アンモニウム（２８ｍｇ）及び１０％パラジウム炭素（３３ｍｇ）を加え１０分間撹拌した後、さらにギ酸アンモニウム（２８ｍｇ）及び１０％パラジウム炭素（３３ｍｇ）を加えた。反応液を室温に戻し、エタノールにて希釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝２０：１）で精製し、得られた粗生成物をヘキサンに懸濁し、ろ取後、乾燥することにより表題化合物（３１ｍｇ）を得た。

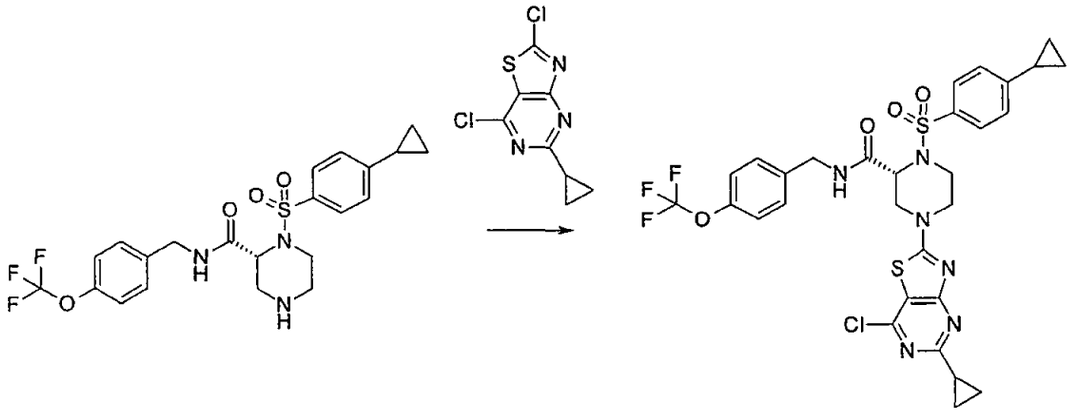
1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：0.74-0.82 (2H, m), 1.07-1.18 (2H, m), 1.89-1.99 (1H,

m), 3.07-3.30 (2H, m), 3.33-3.48 (1H, m), 3.98 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.30-4.54 (4H, m), 4.65 (1H, br s), 7.02 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.18-7.24 (4H, m), 7.74 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.85 (1H, s).

実施例１０９９

第１工程

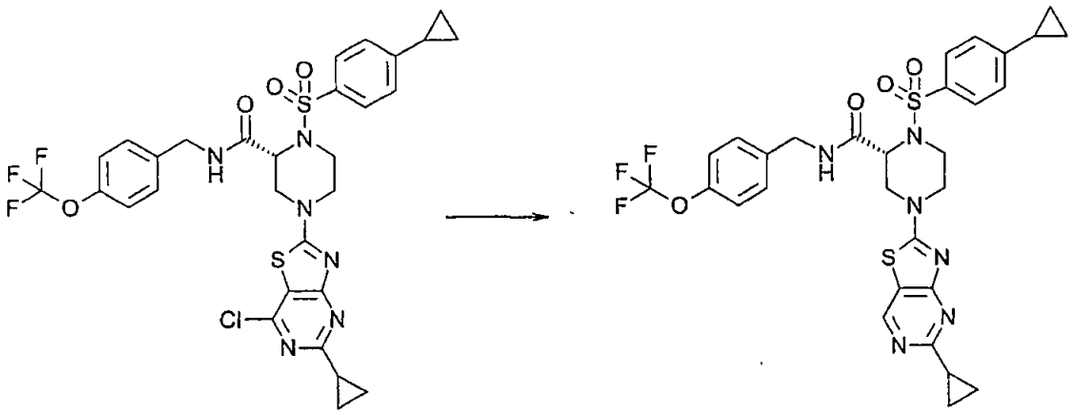
（R）－４－（７－クロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



実施例１１００の第４工程で得た（R）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド（３９ｍｇ）と２，７－ジクロロ－５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン（２０ｍｇ）のクロロホルム（１．０ｍｌ）混合液に、室温にてN，N－ジイソプロピルエチルアミン（２０μｌ）を加えた。室温にて終夜撹拌した後、酢酸エチルで希釈し、水を加えて分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：１）で精製することにより、表題化合物（５４ｍｇ）を得た。

第２工程

（R）－１－（４－シクロプロピル－ベンゼンスルホニル）－４－（５－シクロプロピル－チアゾロ［４，５－ｄ］ピリミジン－２－イル）－ピペラジン－２－カルボン酸　４－トリフルオロメトキシ－ベンジルアミド



第１工程で得た化合物（５４ｍｇ）とギ酸アンモニウム（４９ｍｇ）のエタノール（２．０ｍｌ）混合液に、８０℃にて１０％パラジウム炭素（５０ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間攪拌した後、ギ酸アンモニウム（４９ｍｇ）及び１０％パラジウム炭素（５０ｍｇ）を加えた。８０℃にて３０分間攪拌した後、反応液を室温に戻し、酢酸エチルにて希釈した。セライトを用いてろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル）で精製することにより、表題化合物（２４ｍｇ）を得た。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ：0.76-0.80 (2H, m), 1.02-1.07 (2H, m), 1.10-1.16 (2H, m), 1.17-1.22 (2H, m), 1.89-1.97 (1H, m), 2.21-2.29 (1H, m), 3.06-3.14 (1H, m), 3.17-3.25 (1H, m), 3.37-3.45 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.27-4.51 (4H, m), 4.62 (1H, br s), 7.05 (1H, br s), 7.12 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.6 Hz), 8.61 (1H, s).

上記実施例で得られた化合物、及びそれらと同様の方法により、必要に応じその他常法を用いることにより合成した化合物を表１～表２２６に示す。

表２２７～表４５９に本発明化合物のＮＭＲデータ及びマススペクトルデータを示す。

表1

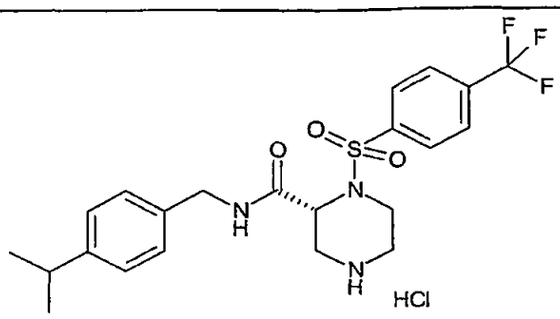
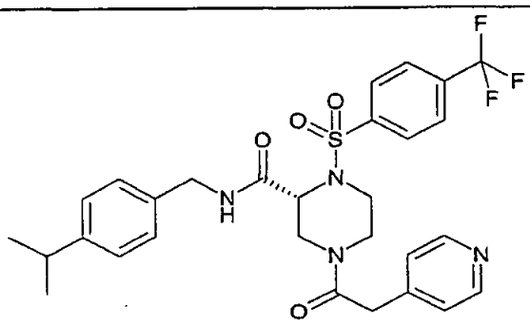
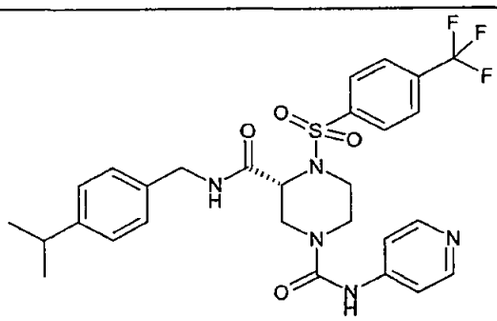
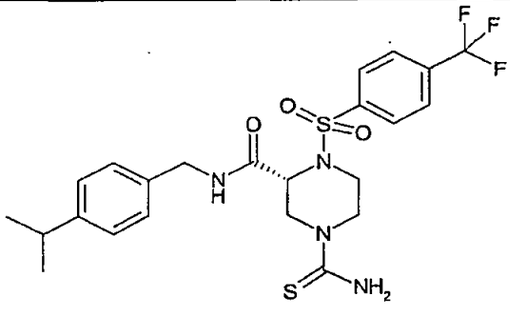
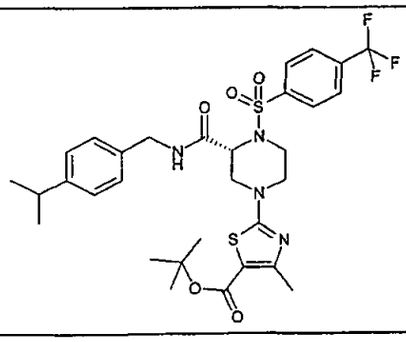
実施例番号	構造式
1	
2	
3	
4	
5	

表2

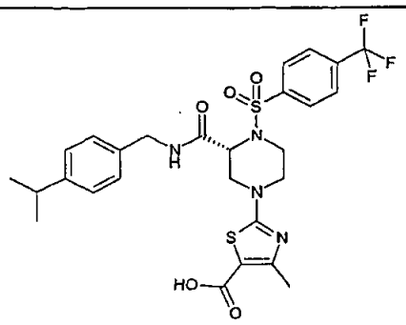
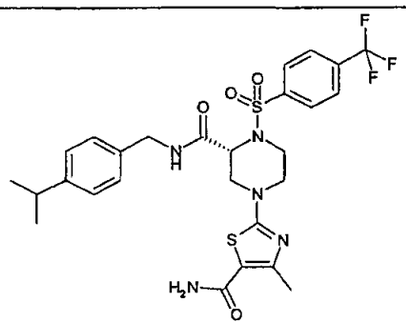
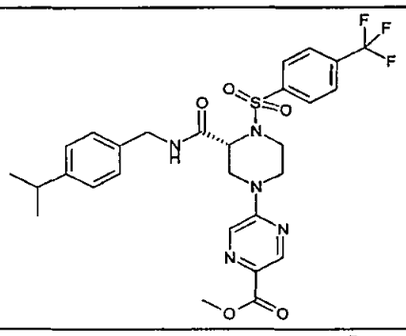
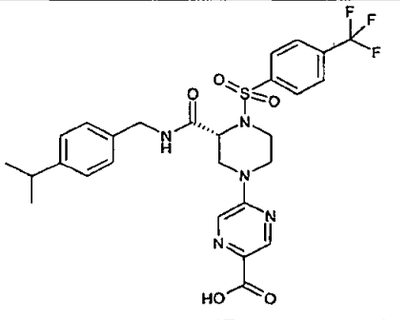
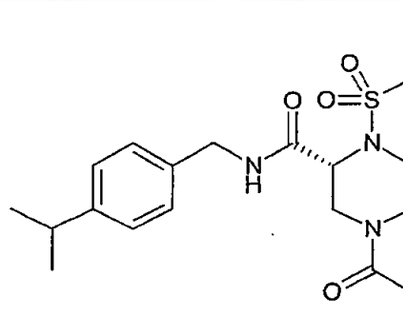
実施例番号	構造式
6	
7	
8	
9	
10	

表3

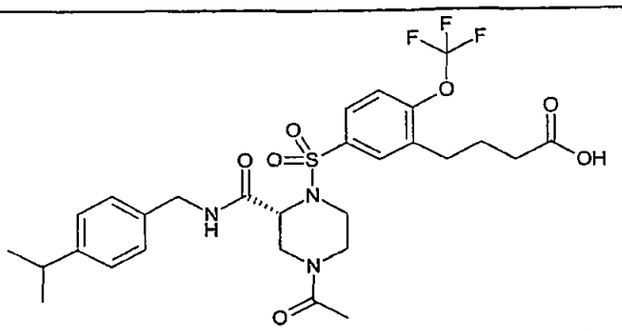
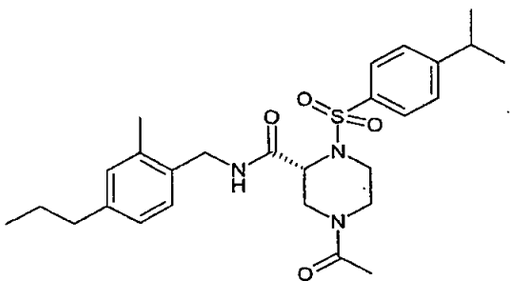
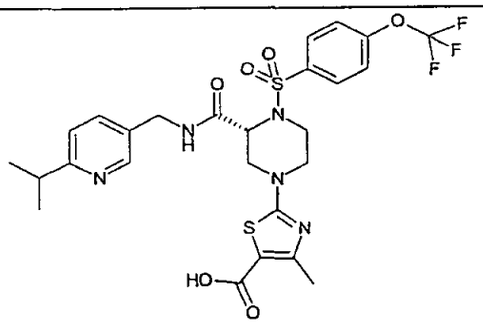
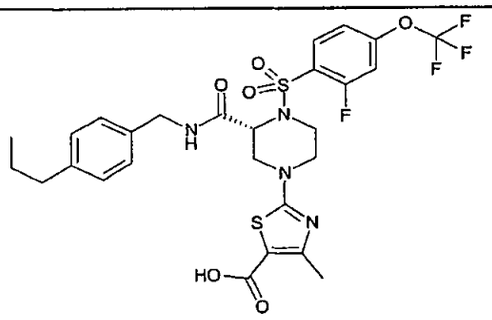
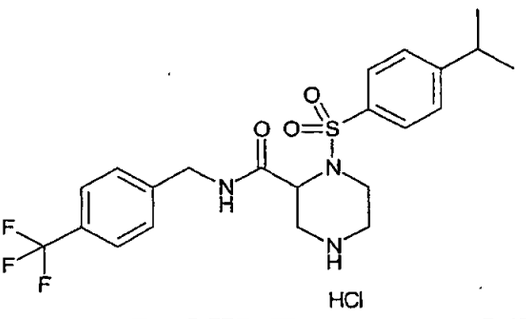
実施例番号	構造式
11	
12	
13	
14	
15	

表4

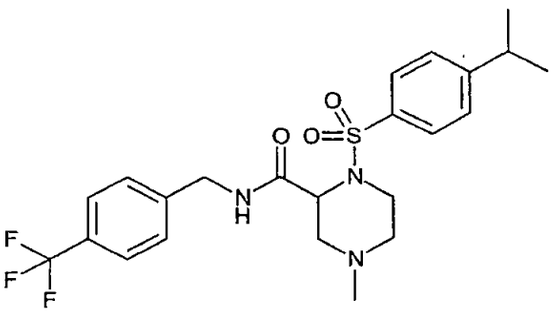
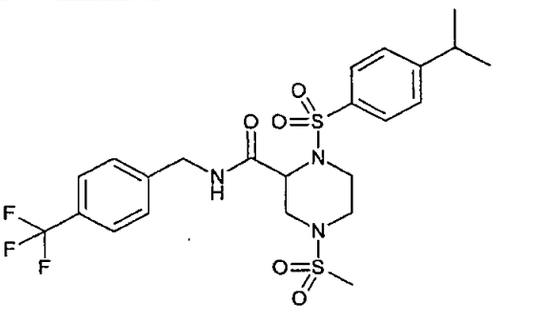
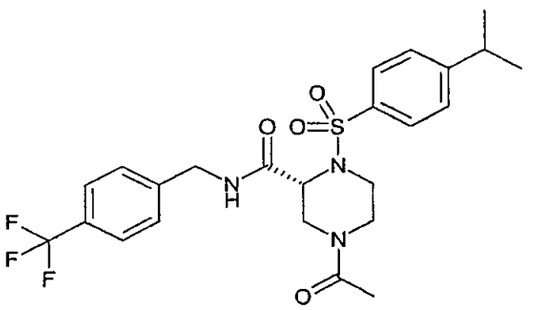
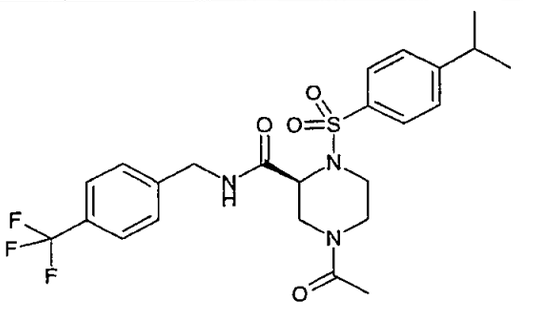
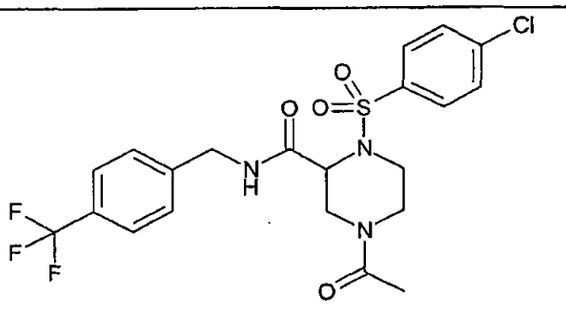
実施例番号	構造式
16	
17	
18	
19	
20	

表5

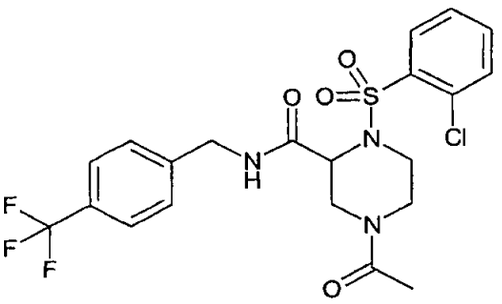
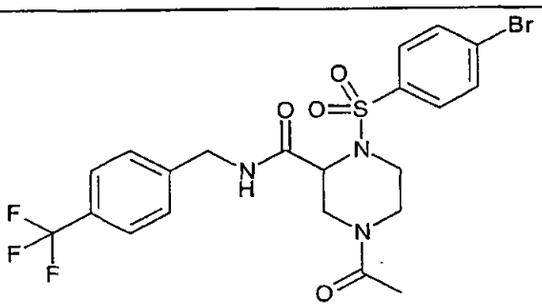
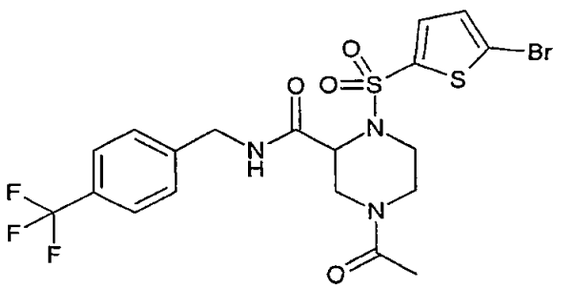
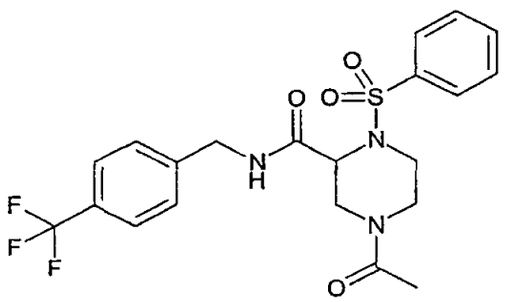
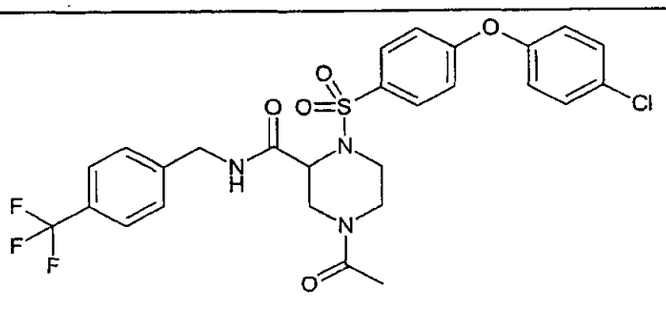
実施例番号	構造式
21	
22	
23	
24	
25	

表6

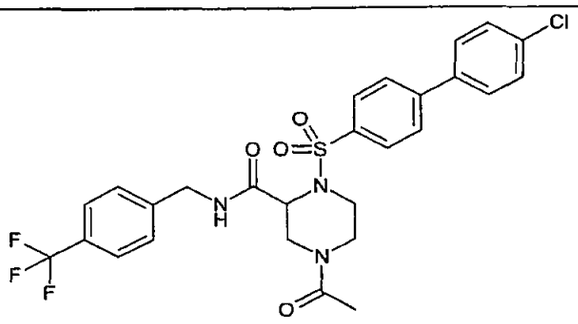
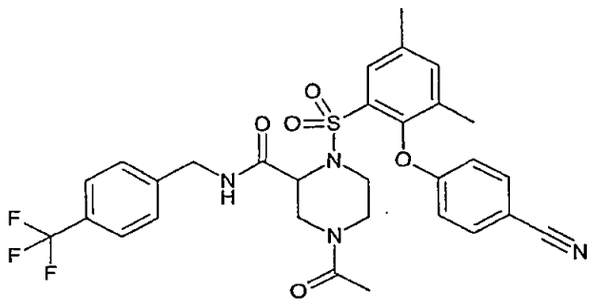
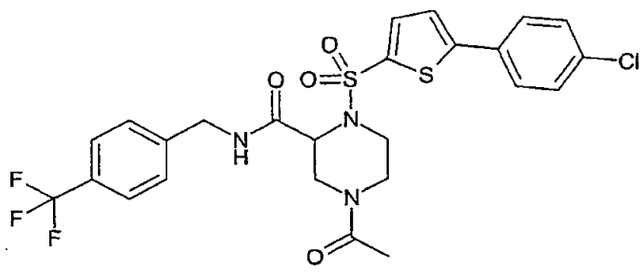
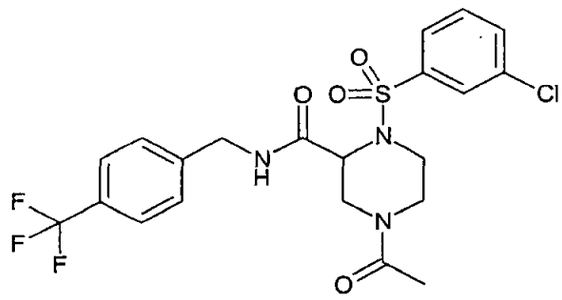
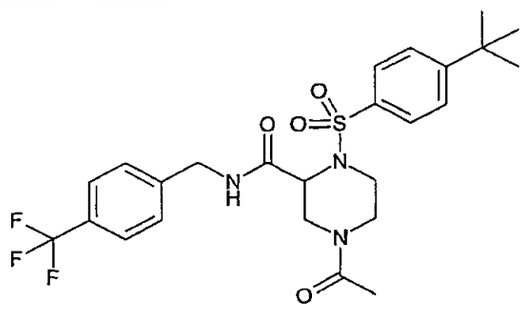
実施例番号	構造式
26	
27	
28	
29	
30	

表7

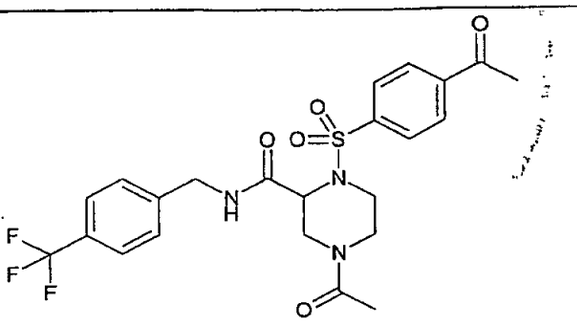
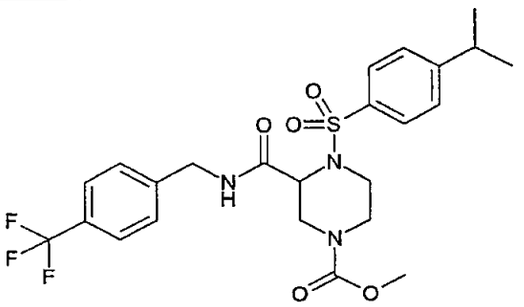
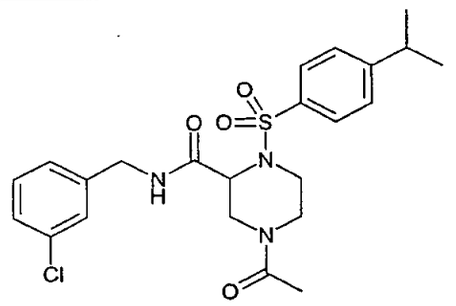
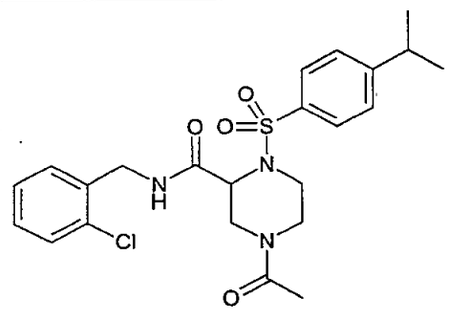
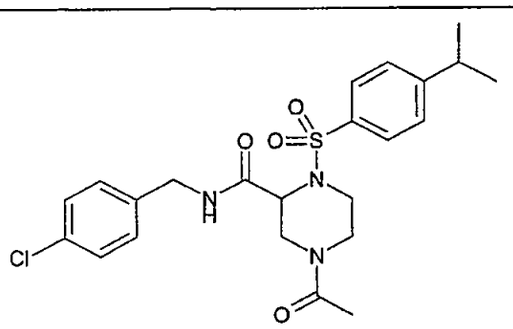
実施例番号	構造式
31	
32	
33	
34	
35	

表8

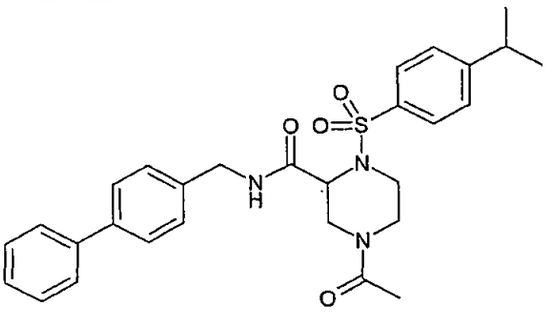
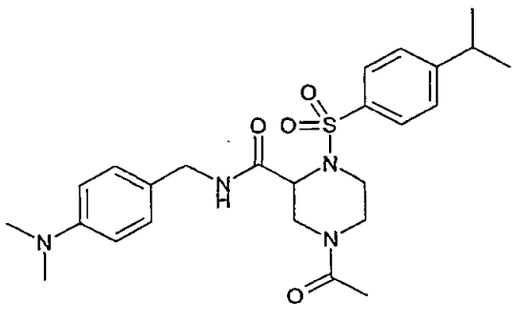
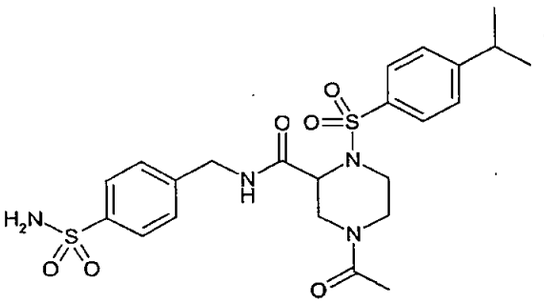
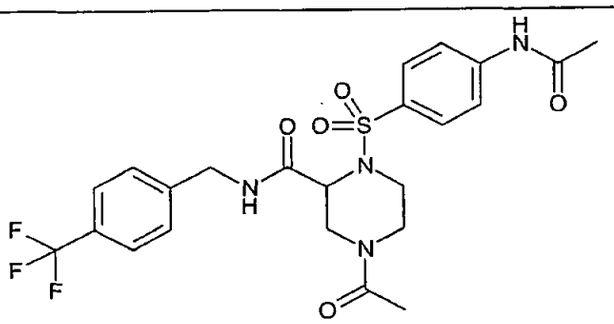
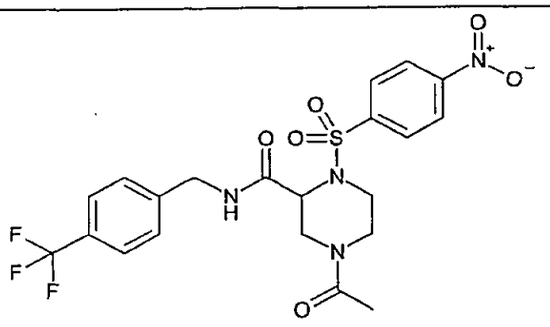
実施例番号	構造式
36	
37	
38	
39	
40	

表9

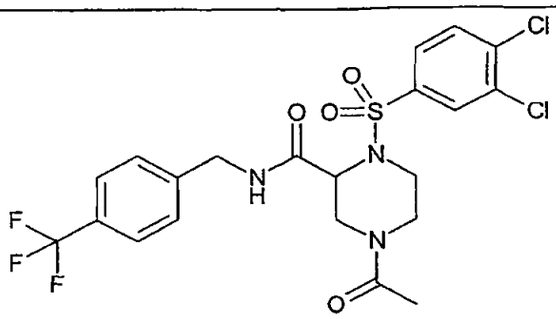
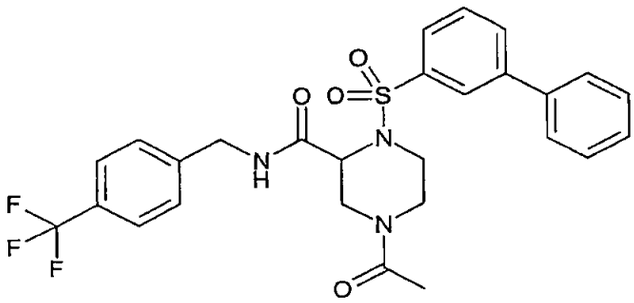
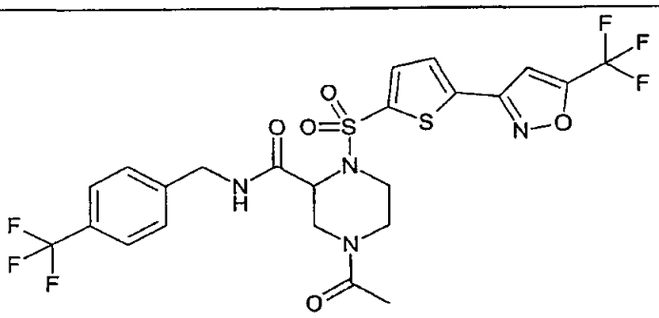
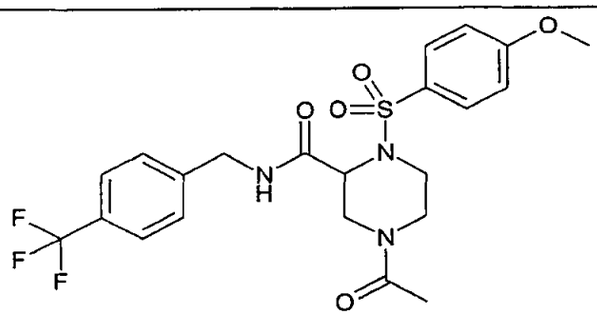
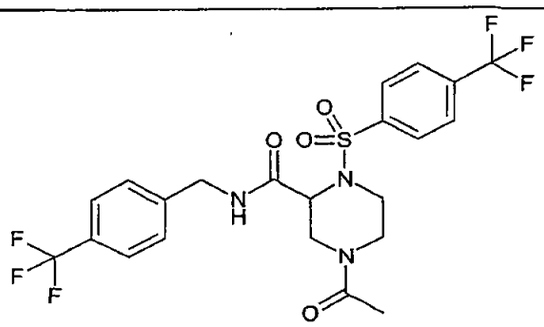
実施例番号	構造式
41	
42	
43	
44	
45	

表10

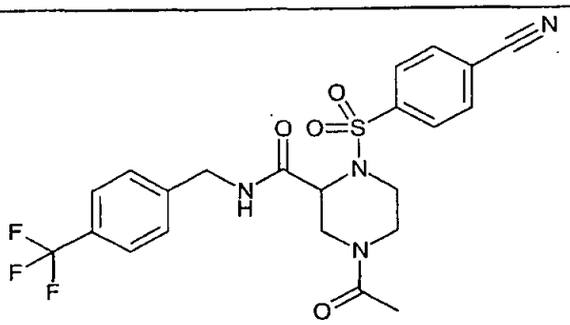
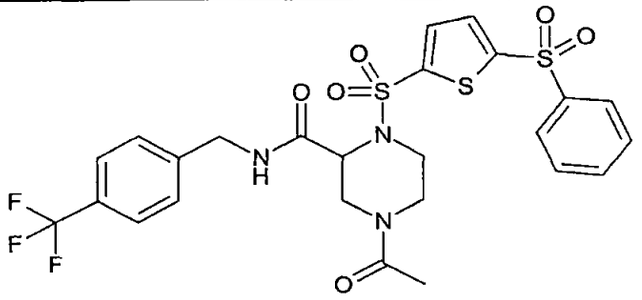
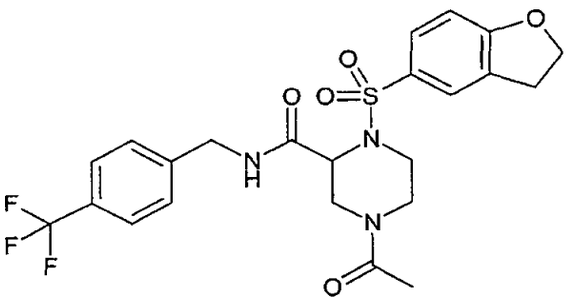
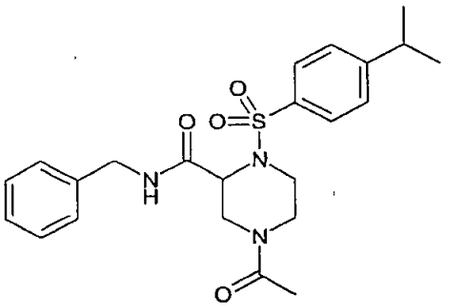
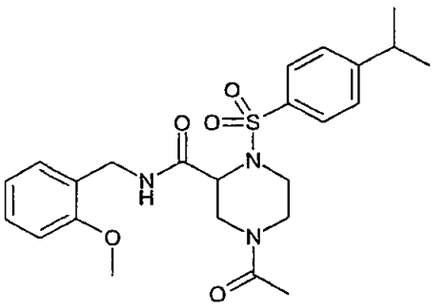
実施例番号	構造式
46	
47	
48	
49	
50	

表11

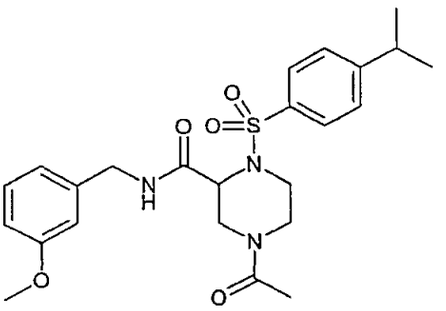
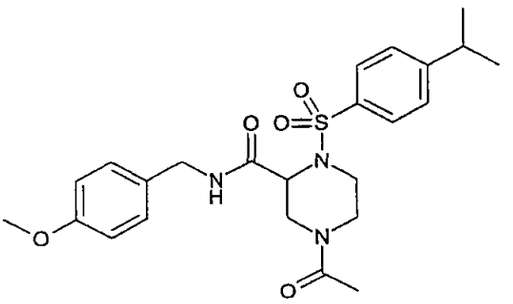
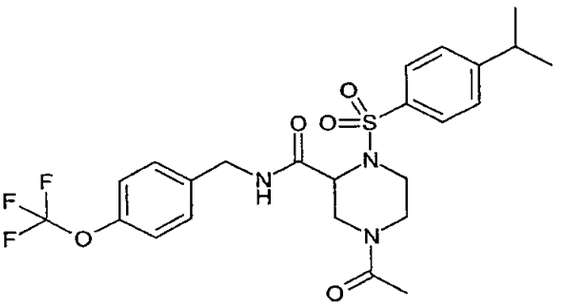
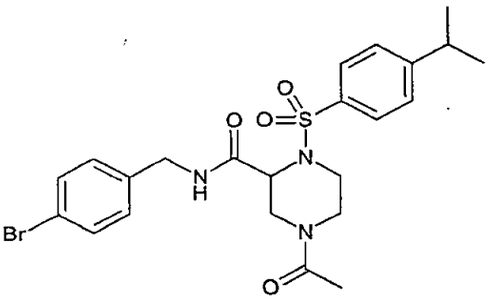
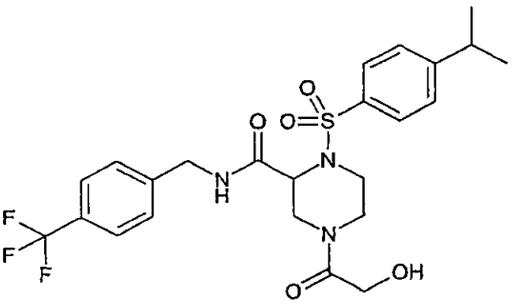
実施例番号	構造式
51	
52	
53	
54	
55	

表12

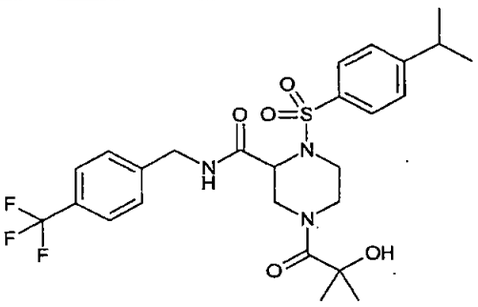
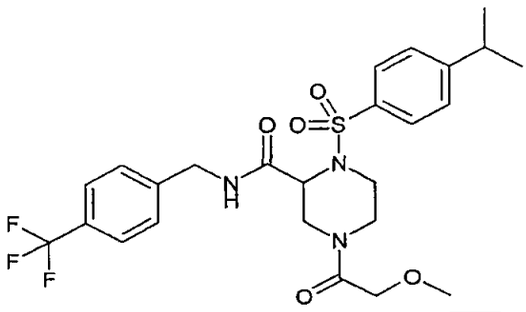
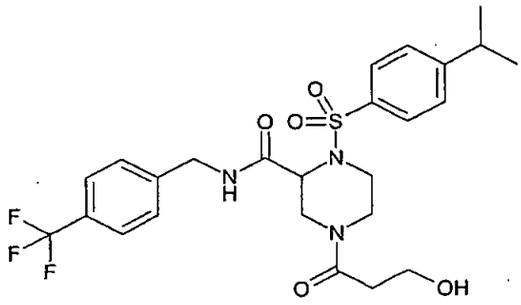
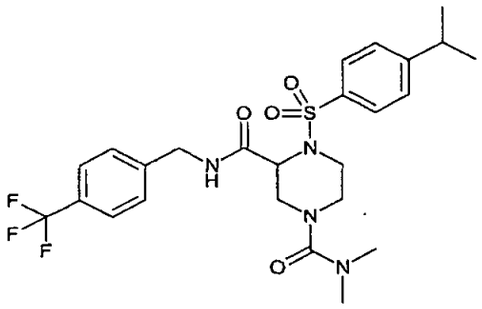
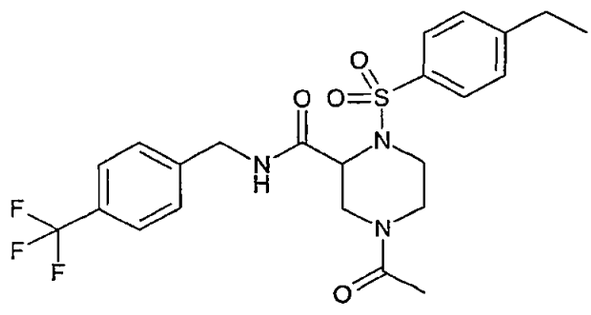
実施例番号	構造式
56	
57	
58	
59	
60	

表13

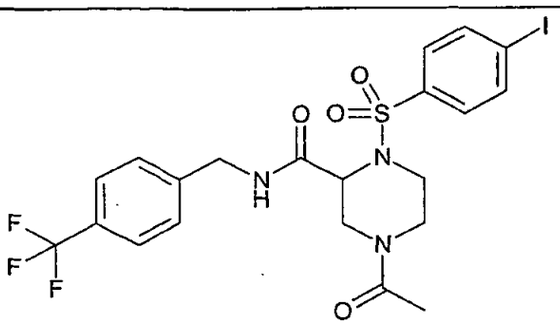
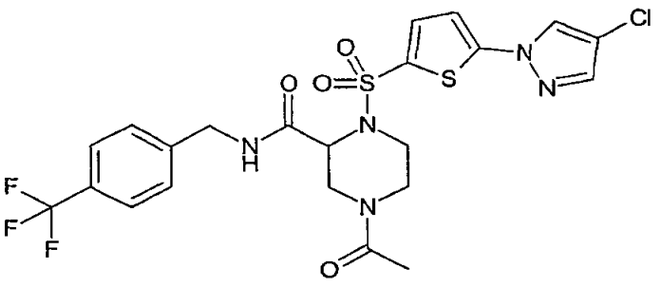
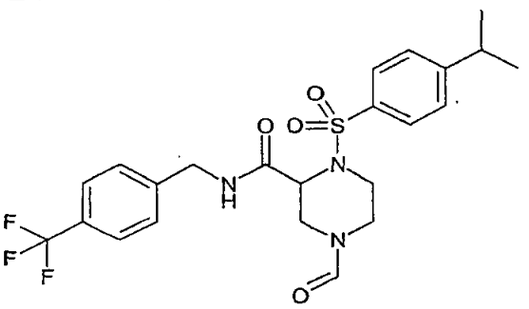
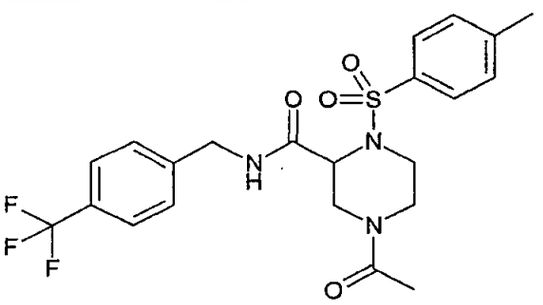
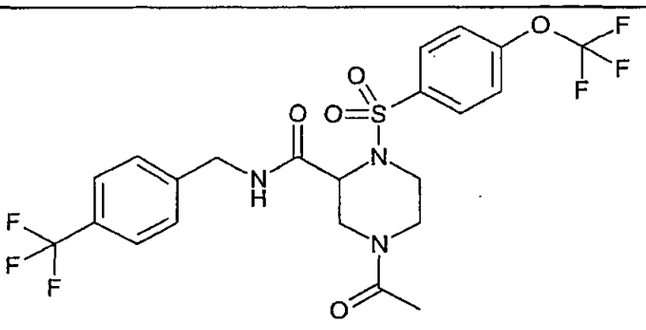
実施例番号	構造式
61	
62	
63	
64	
65	

表14

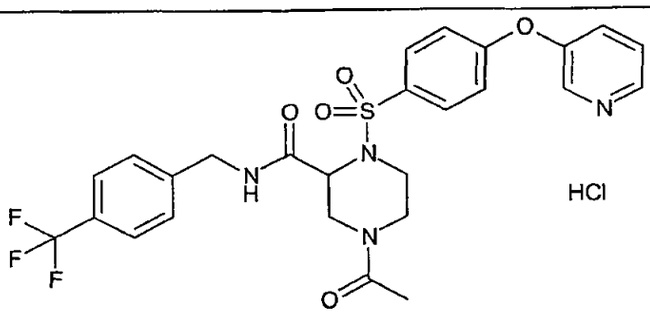
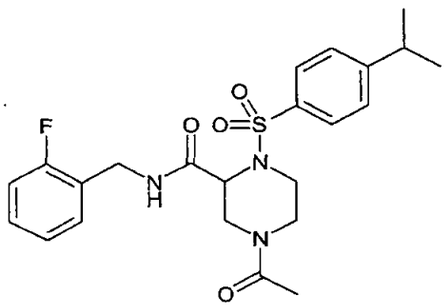
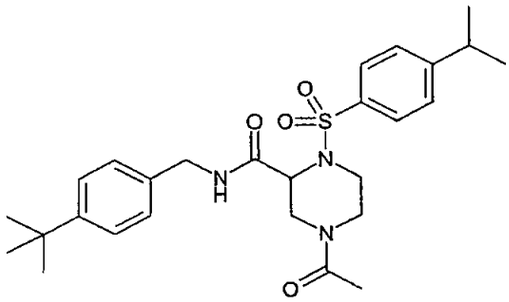
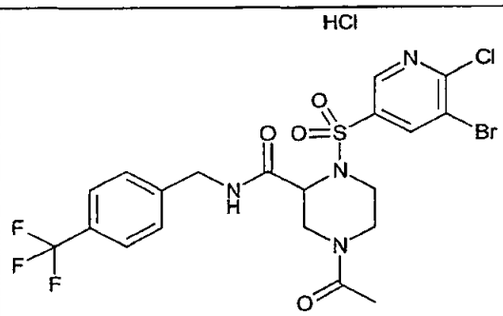
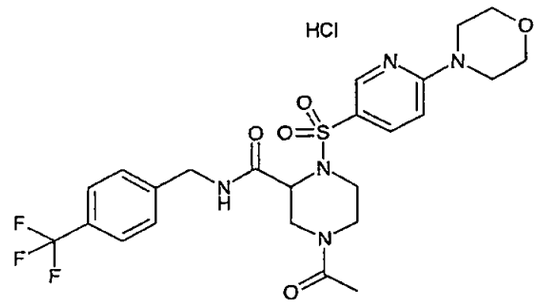
実施例番号	構造式
66	
67	
68	
69	
70	

表15

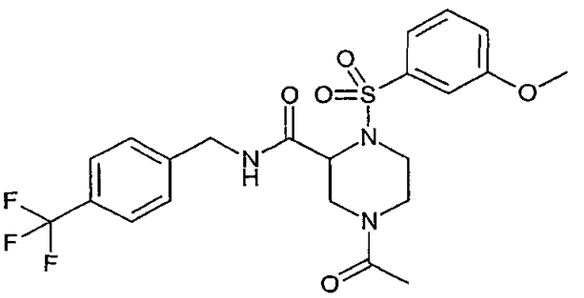
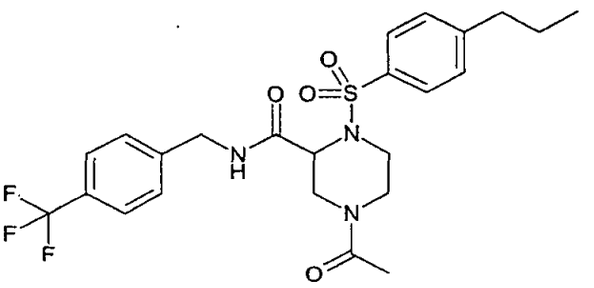
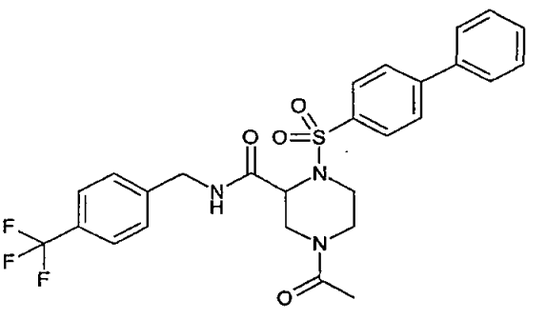
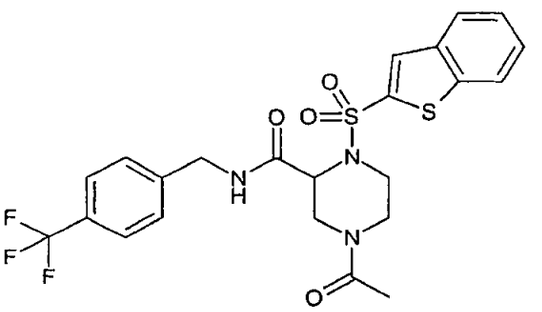
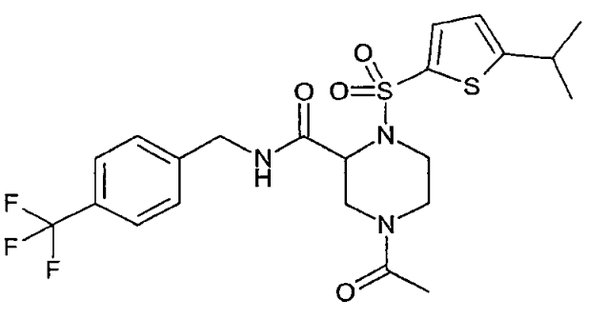
実施例番号	構造式
71	
72	
73	
74	
75	

表16

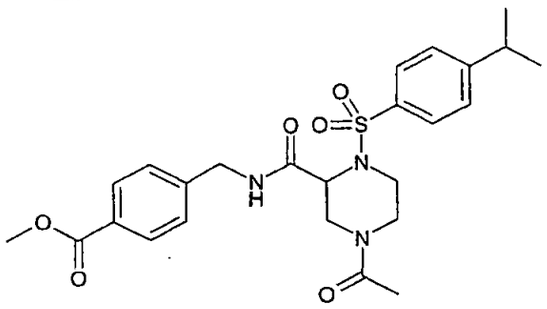
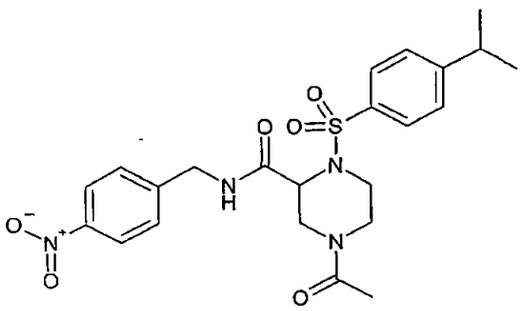
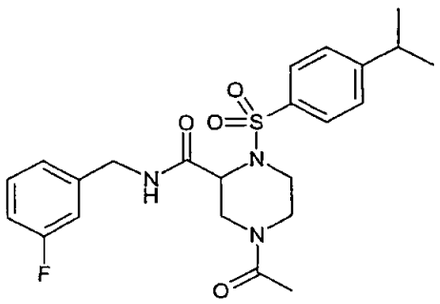
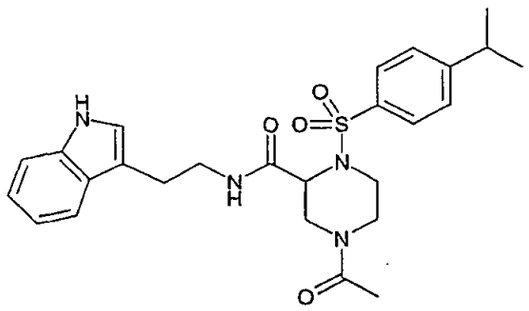
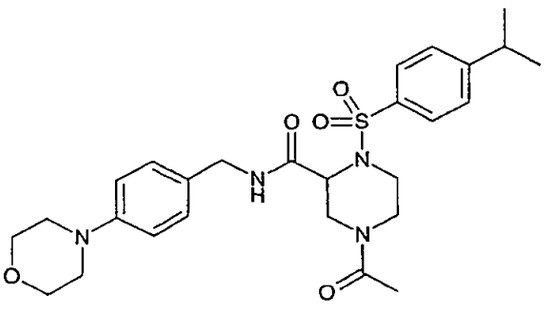
実施例番号	構造式
76	
77	
78	
79	
80	

表17

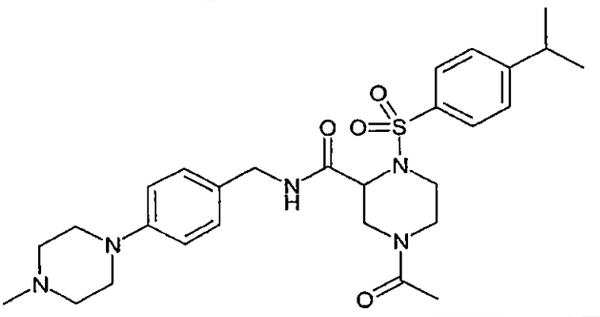
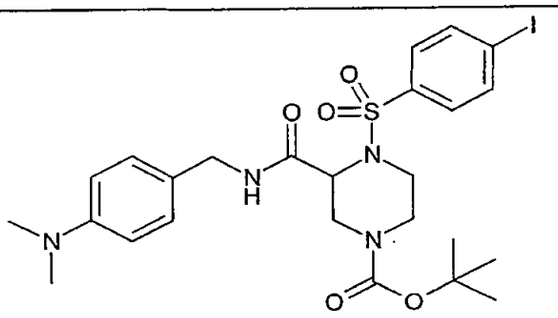
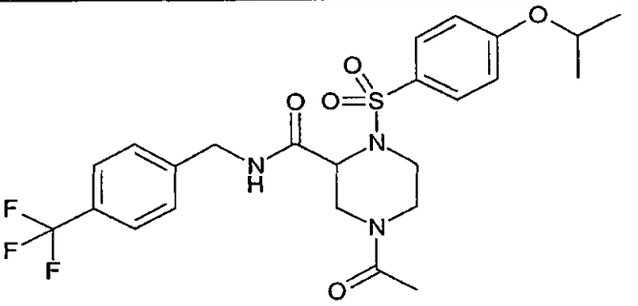
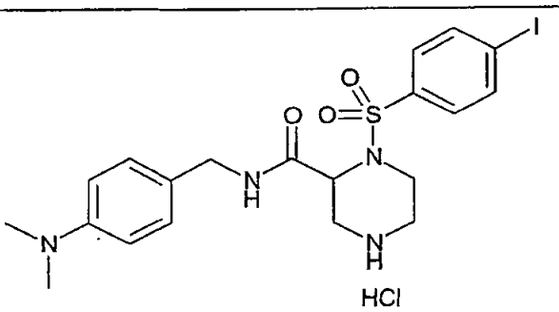
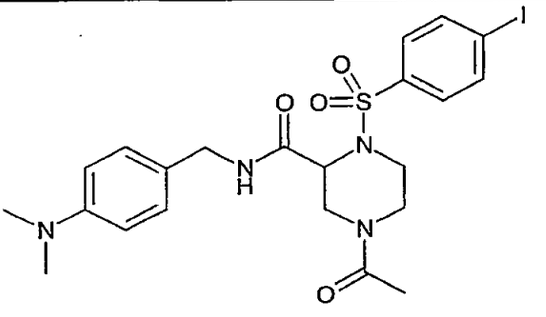
実施例番号	構造式
81	
82	
83	
84	 HCl
85	

表18

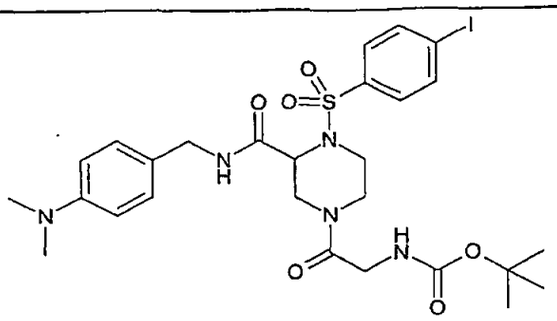
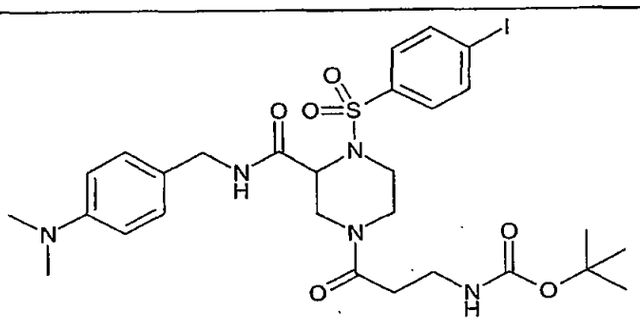
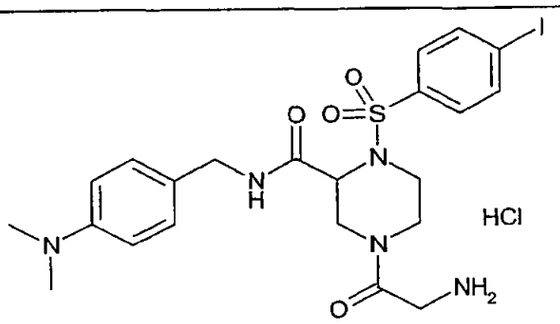
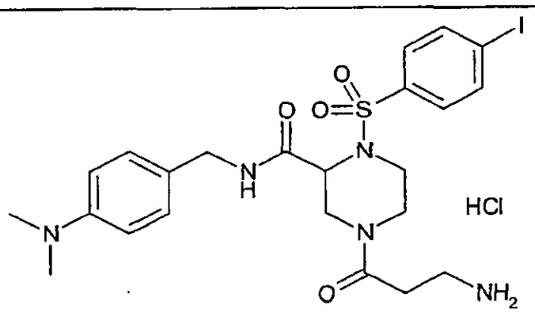
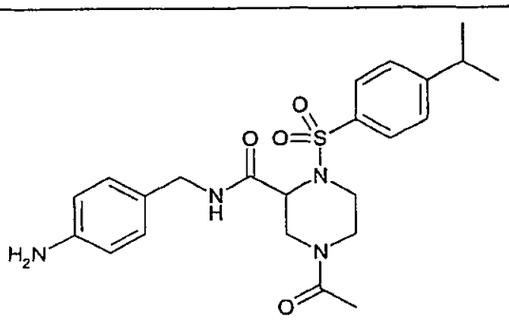
実施例番号	構造式
86	
87	
88	
89	
90	

表19

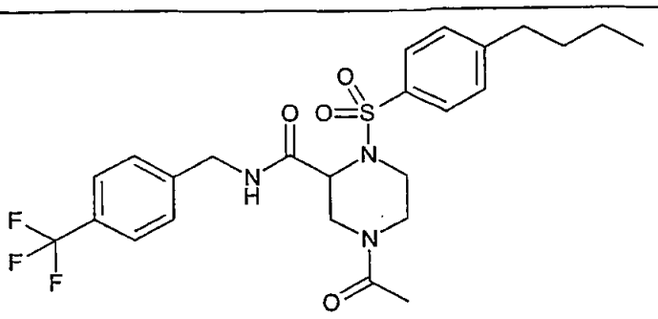
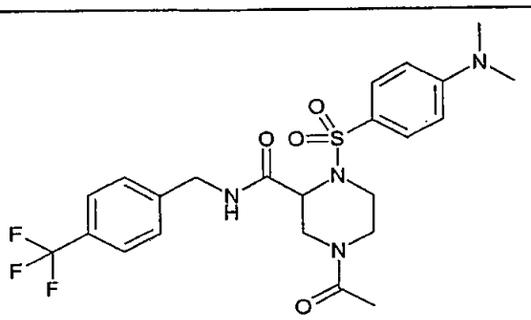
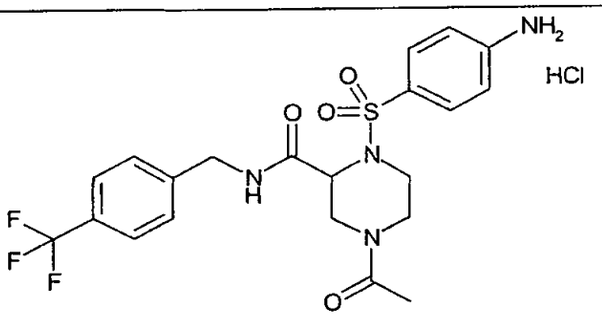
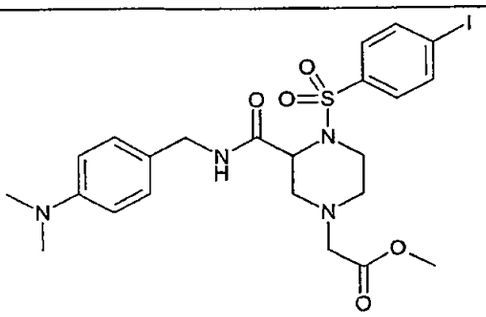
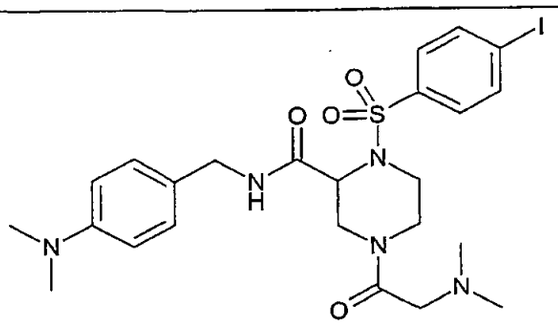
実施例番号	構造式
91	
92	
93	
94	
95	

表20

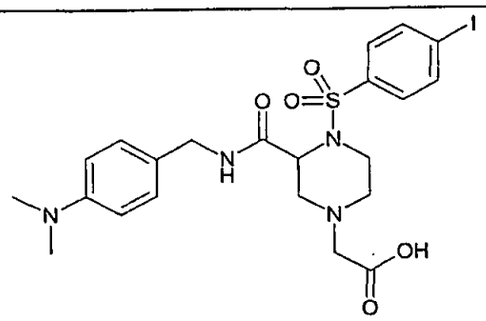
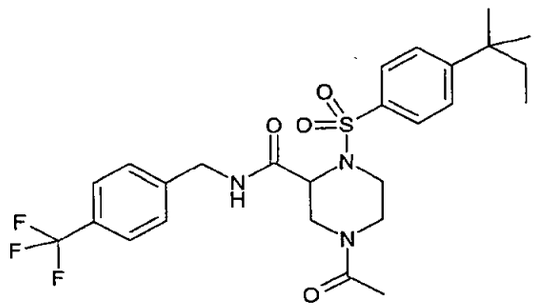
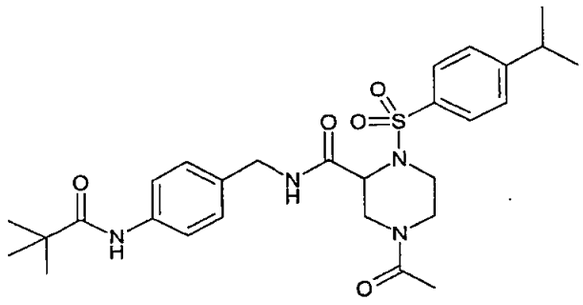
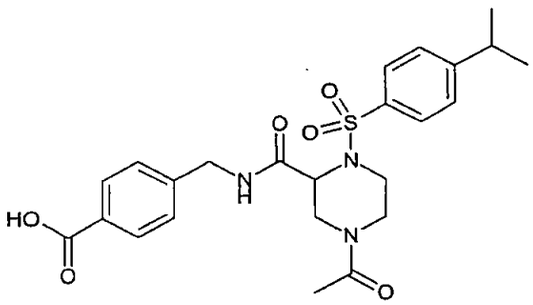
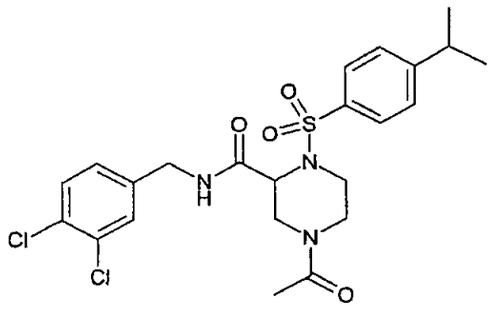
実施例番号	構造式
96	
97	
98	
99	
100	

表21

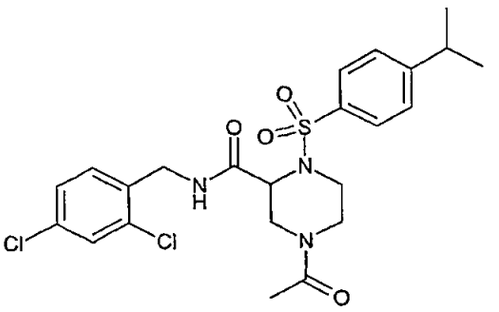
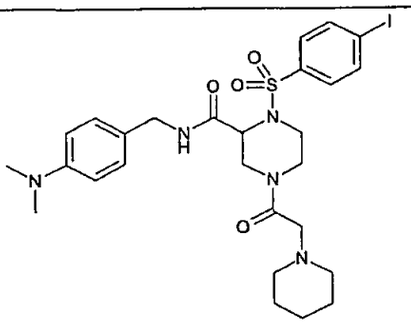
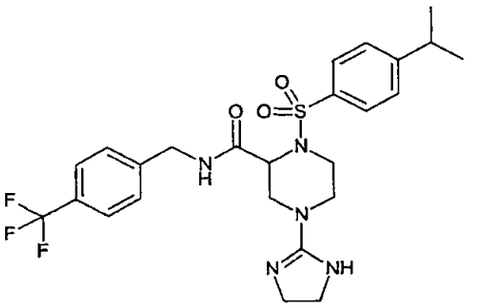
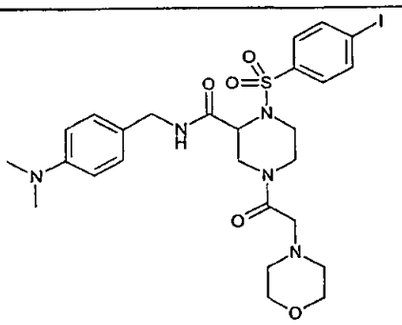
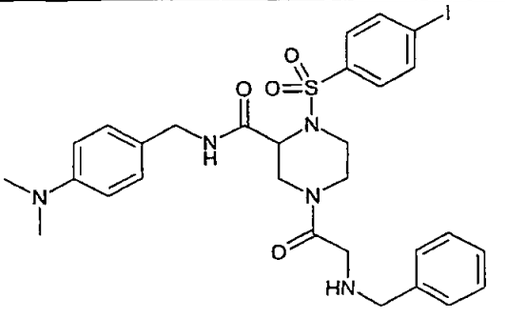
実施例番号	構造式
101	
102	
103	
104	
105	

表22

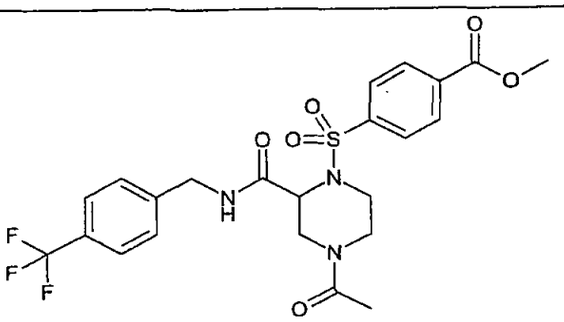
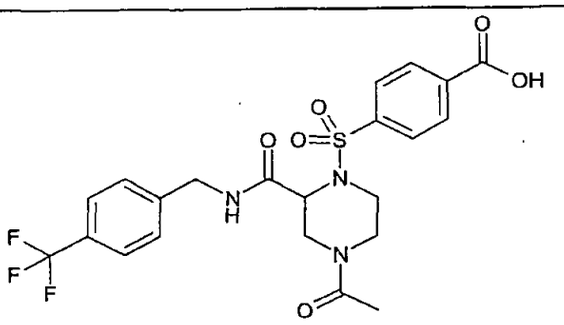
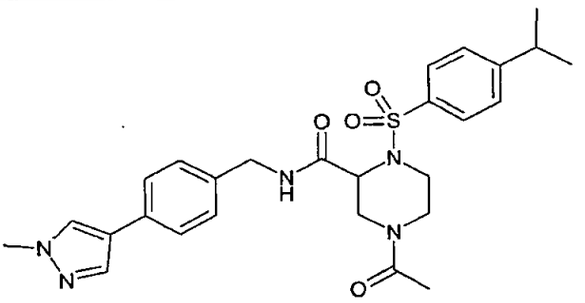
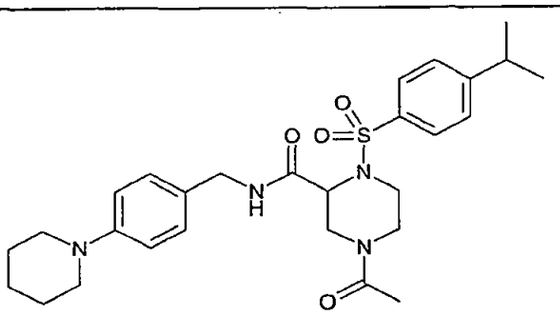
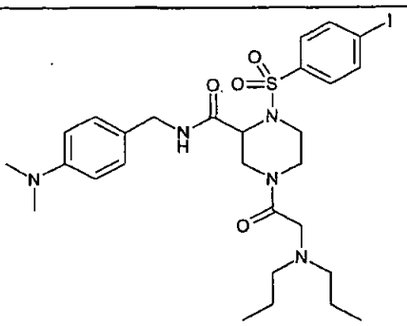
実施例番号	構造式
106	
107	
108	
109	
110	

表23

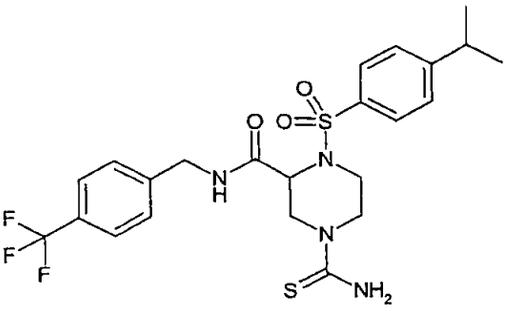
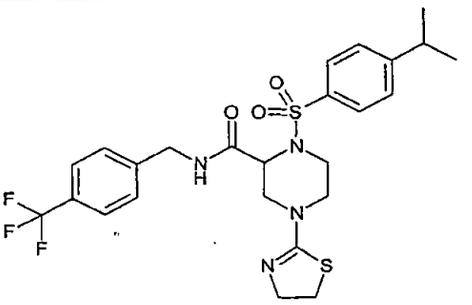
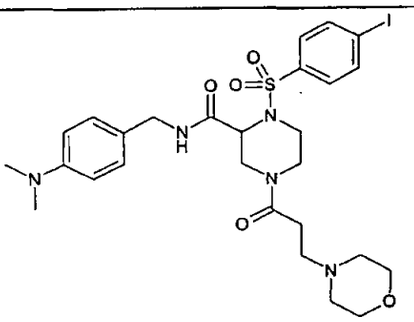
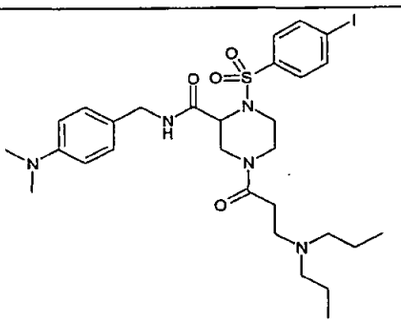
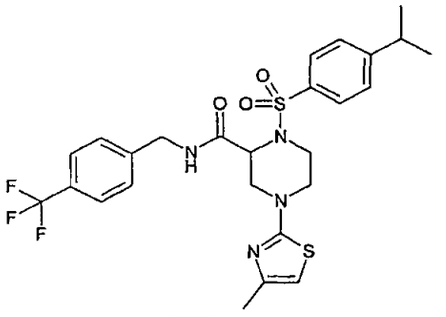
実施例番号	構造式
111	
112	
113	
114	
115	

表24

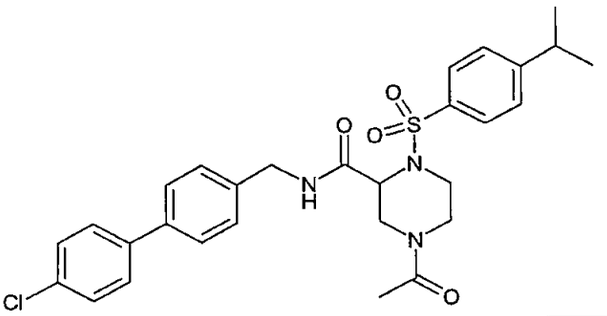
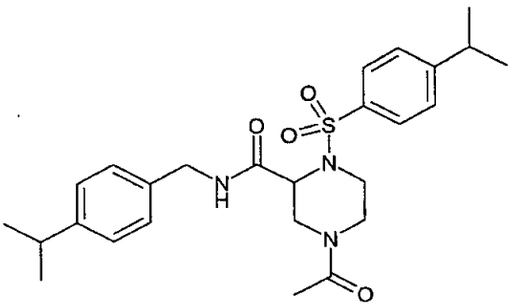
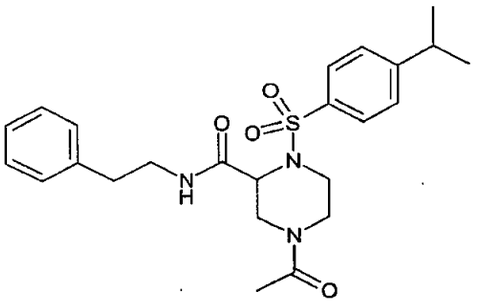
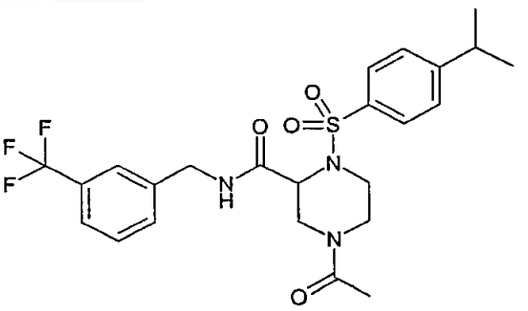
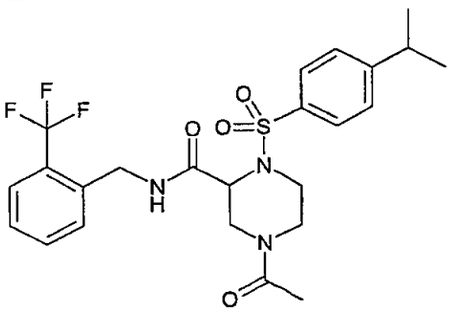
実施例番号	構造式
116	
117	
118	
119	
120	

表25

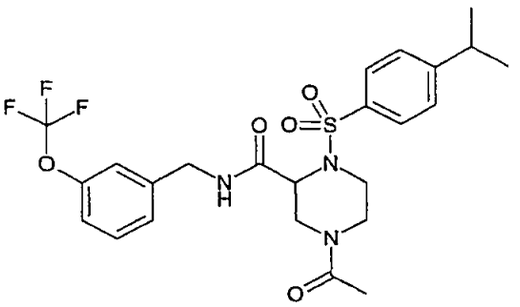
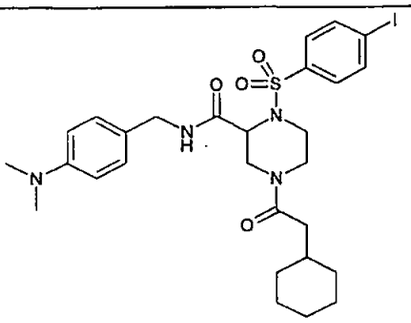
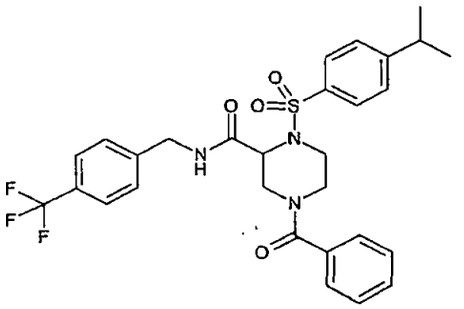
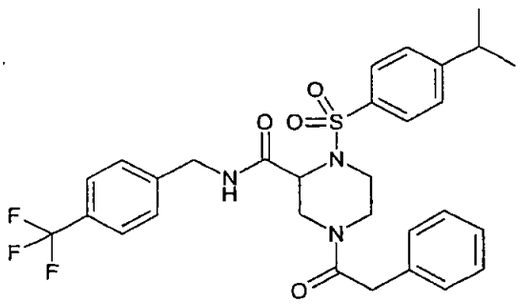
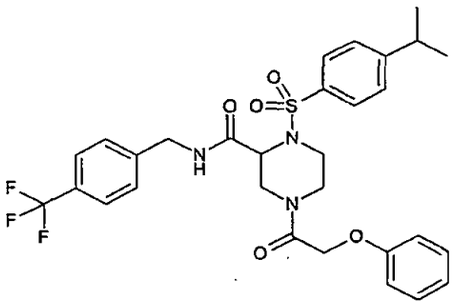
実施例番号	構造式
121	
122	
123	
124	
125	

表26

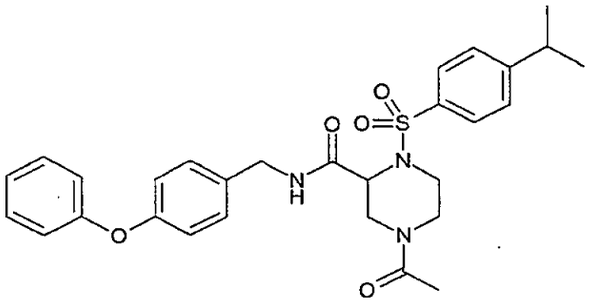
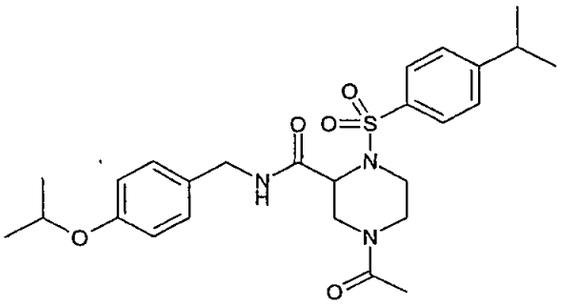
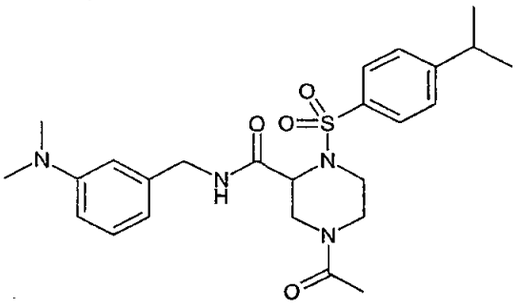
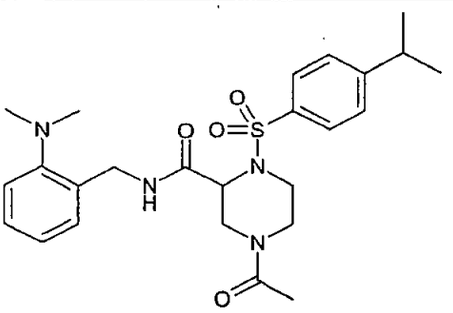
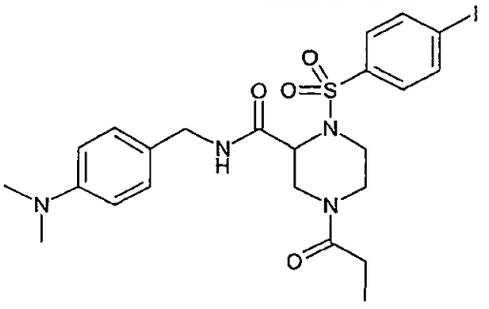
実施例番号	構造式
126	
127	
128	
129	
130	

表27

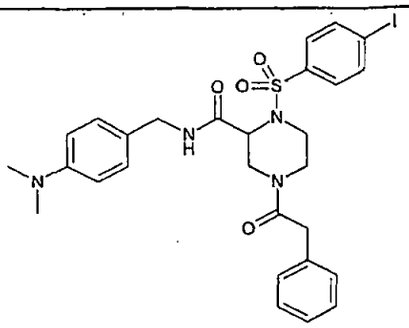
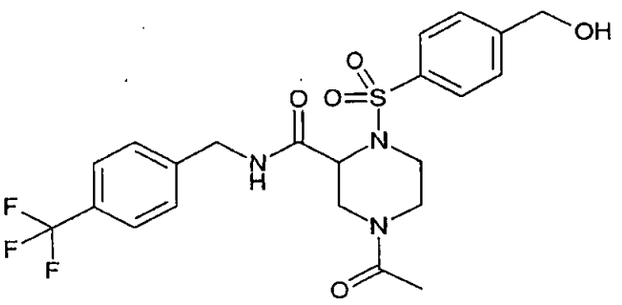
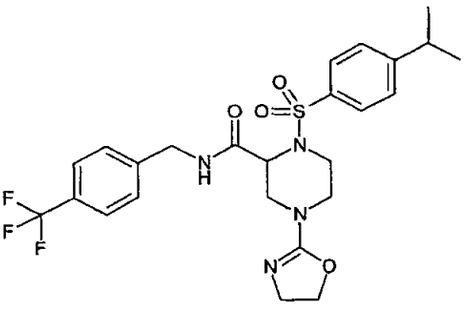
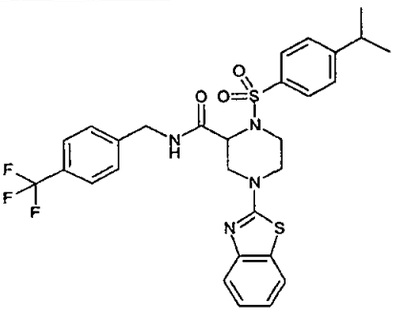
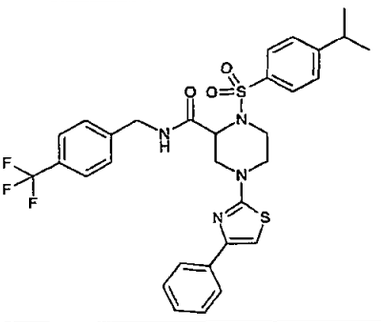
実施例番号	構造式
131	
132	
133	
134	
135	

表28

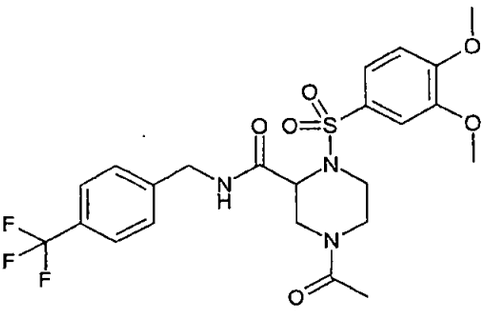
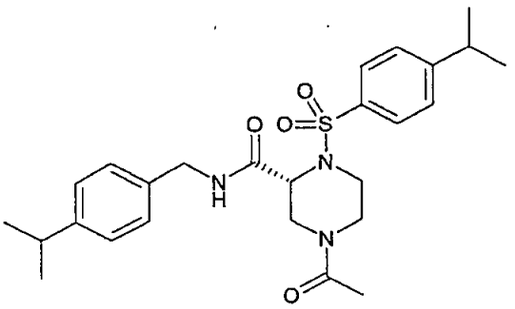
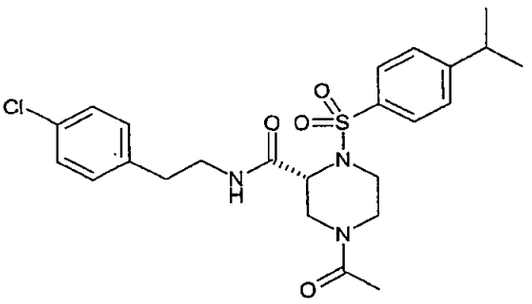
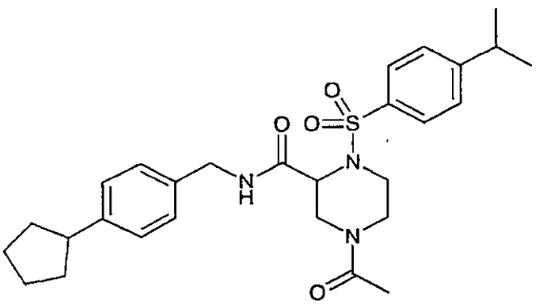
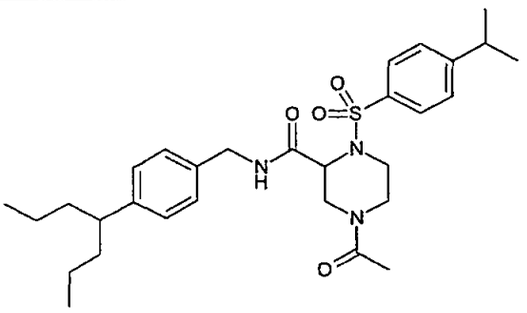
実施例番号	構造式
136	
137	
138	
139	
140	

表29

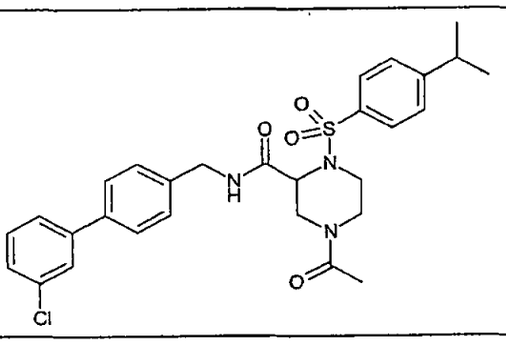
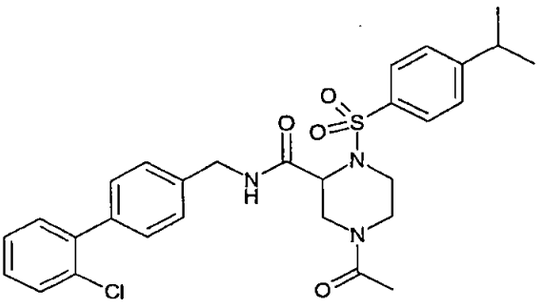
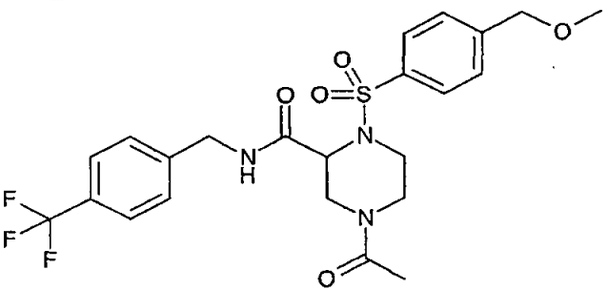
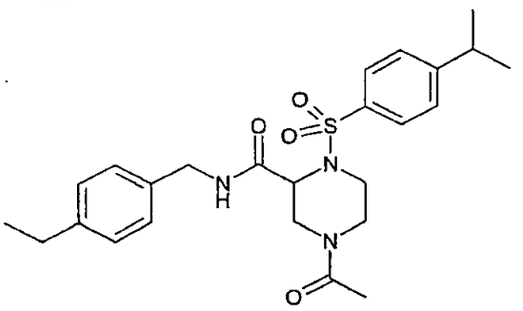
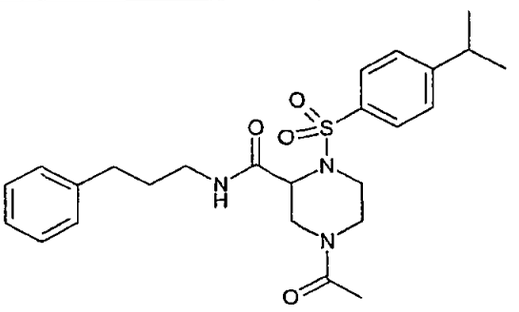
実施例番号	構造式
141	
142	
143	
144	
145	

表30

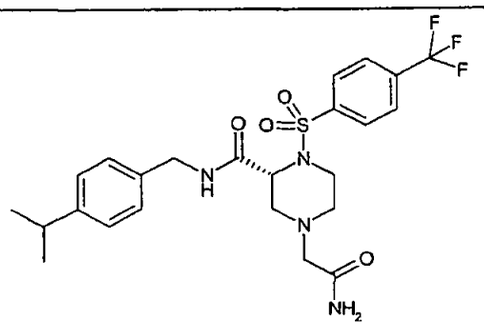
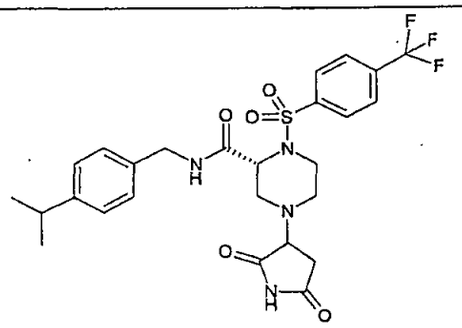
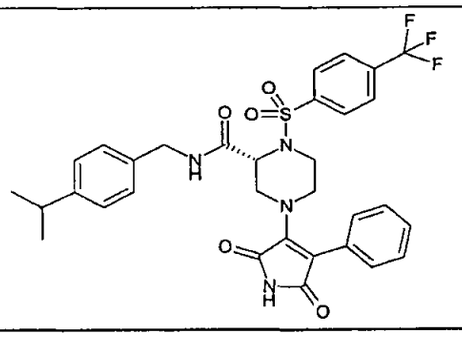
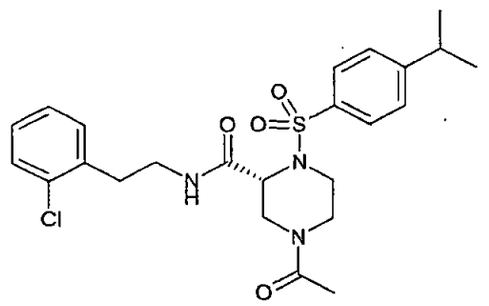
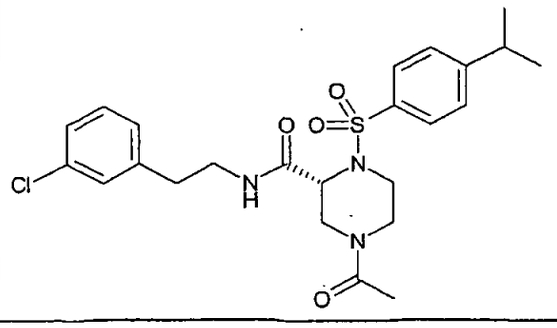
実施例番号	構造式
146	
147	
148	
149	
150	

表31

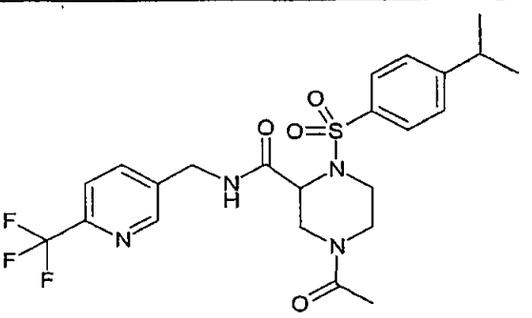
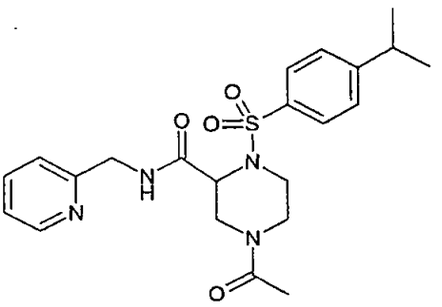
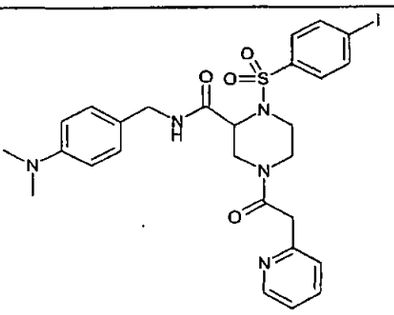
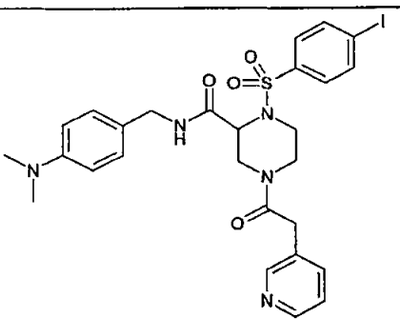
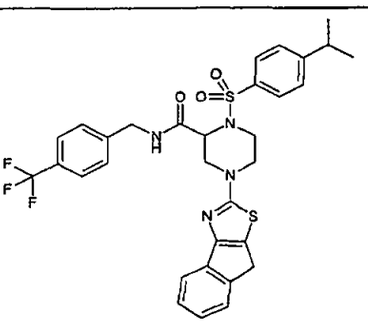
実施例番号	構造式
151	
152	
153	
154	
155	

表32

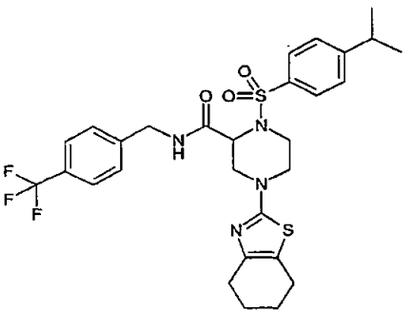
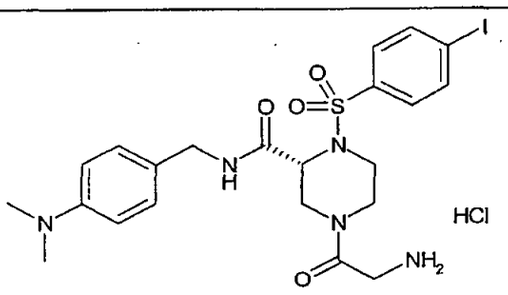
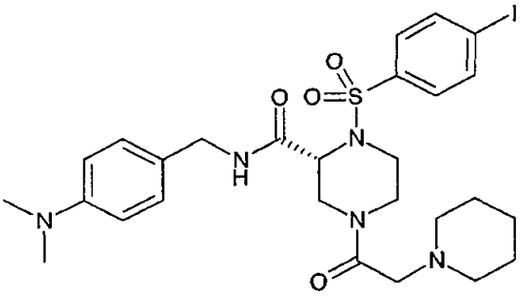
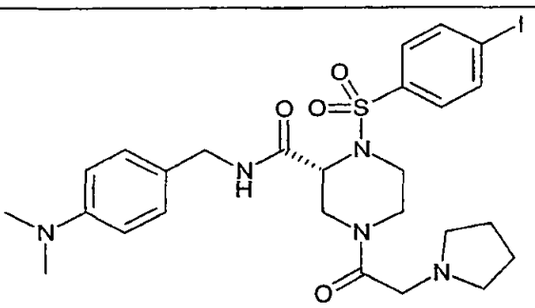
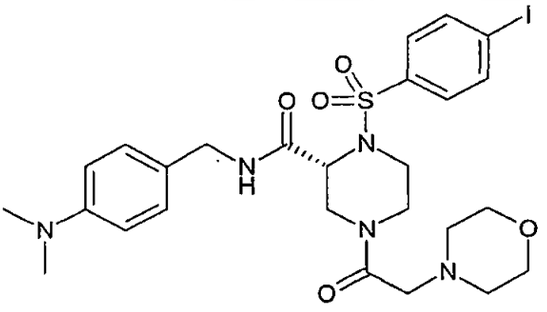
実施例番号	構造式
156	
157	
158	
159	
160	

表33

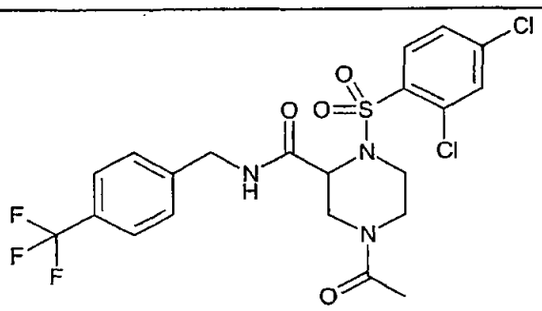
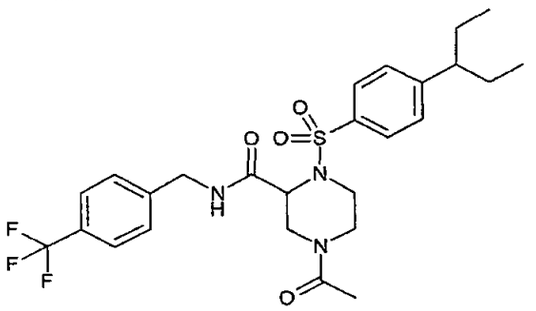
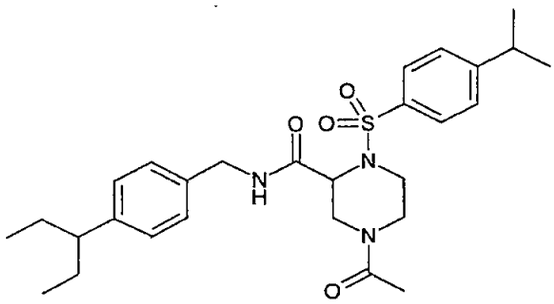
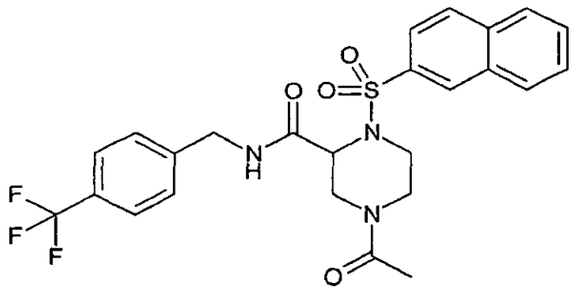
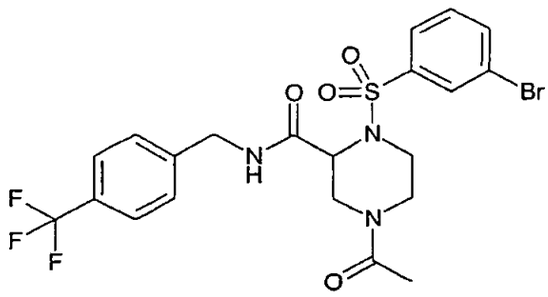
実施例番号	構造式
161	
162	
163	
164	
165	

表34

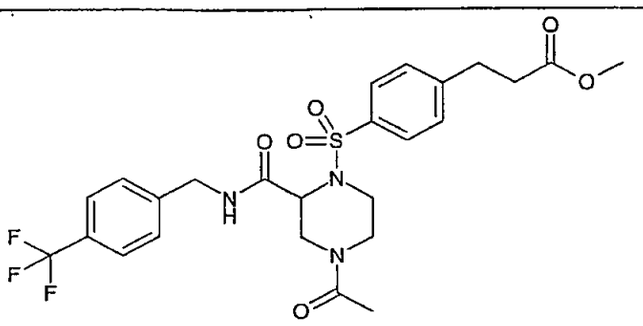
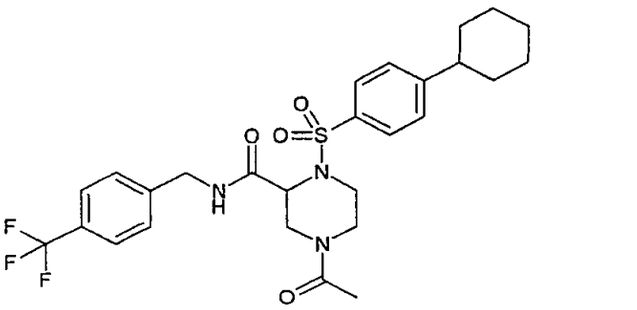
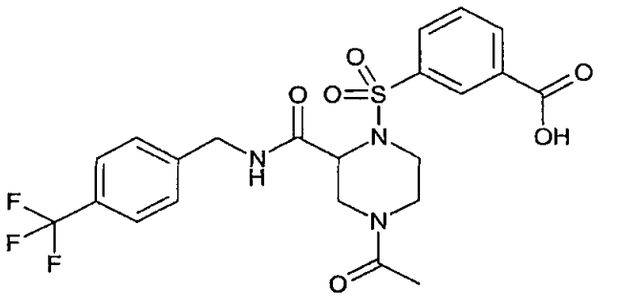
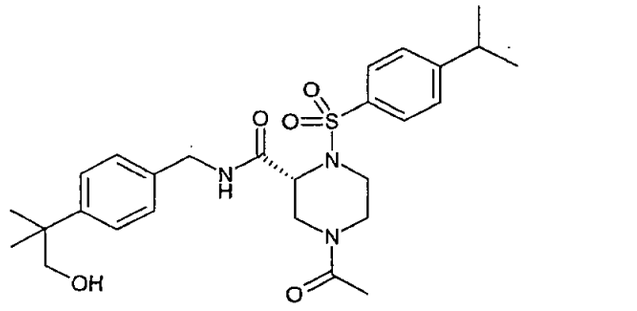
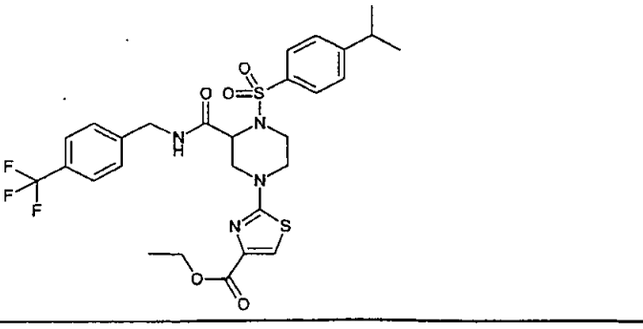
実施例番号	構造式
166	
167	
168	
169	
170	

表35

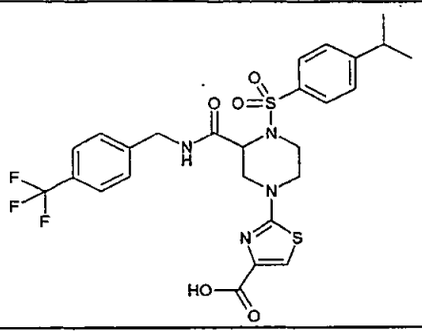
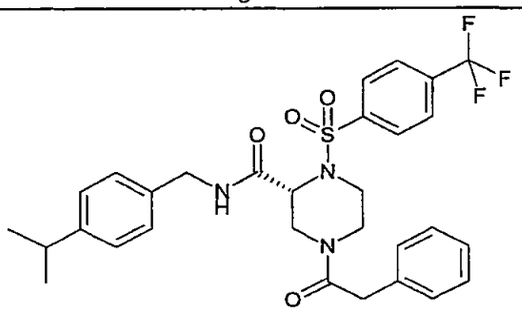
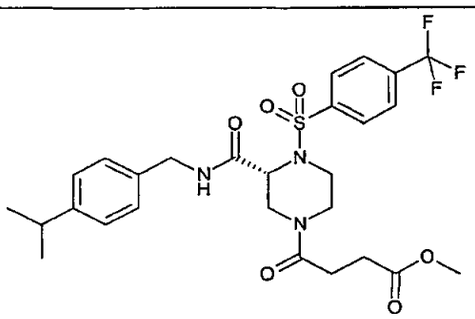
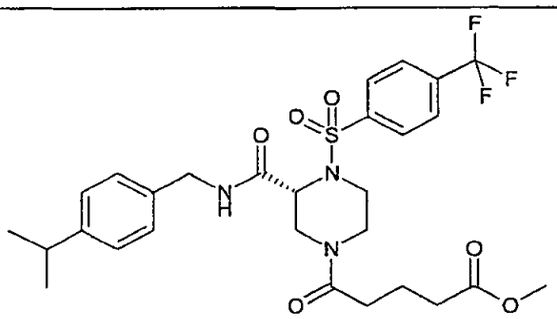
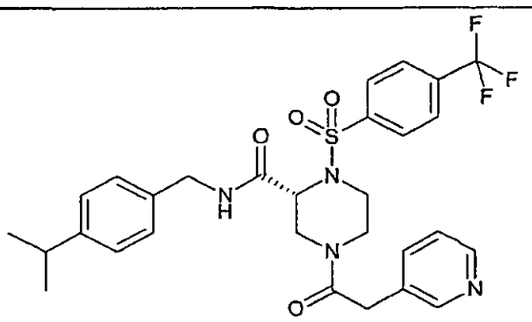
実施例番号	構造式
171	
172	
173	
174	
175	

表36

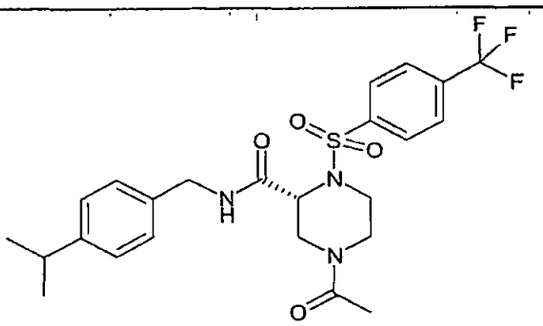
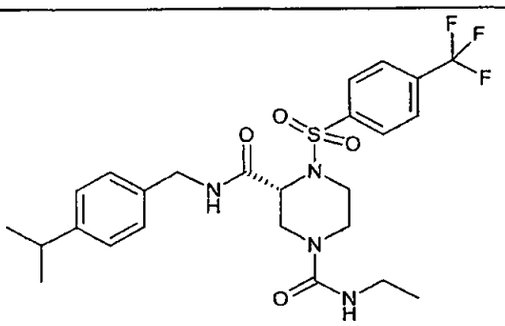
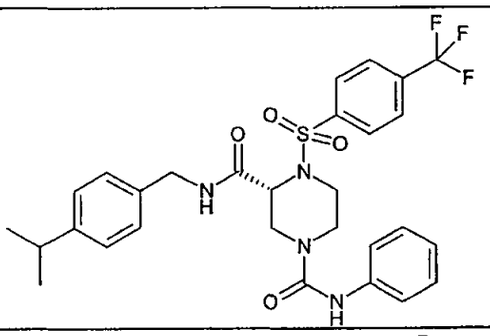
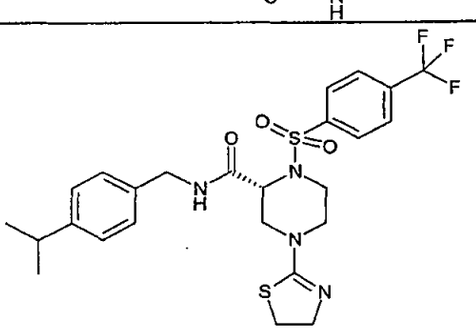
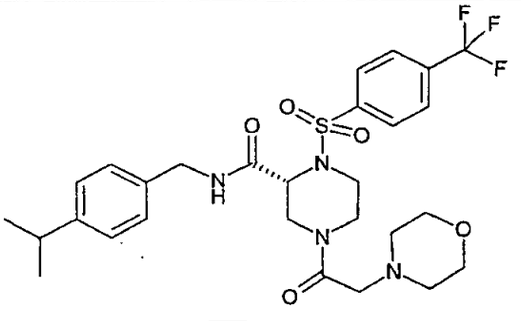
実施例番号	構造式
176	
177	
178	
179	
180	

表37

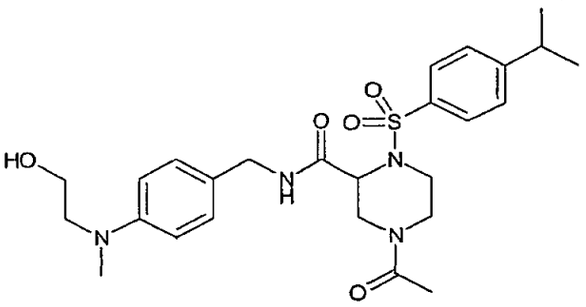
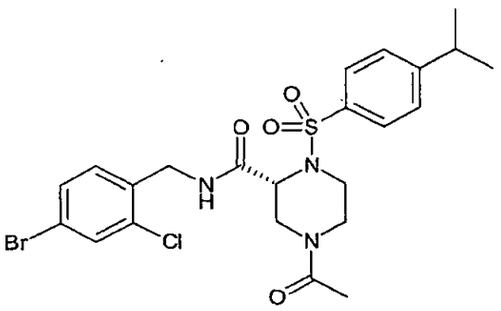
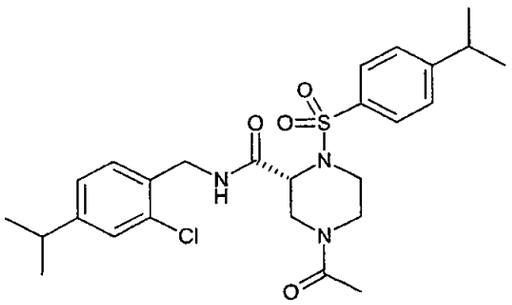
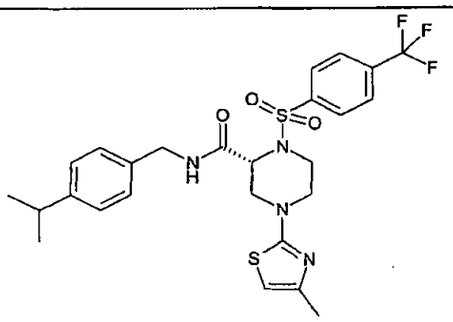
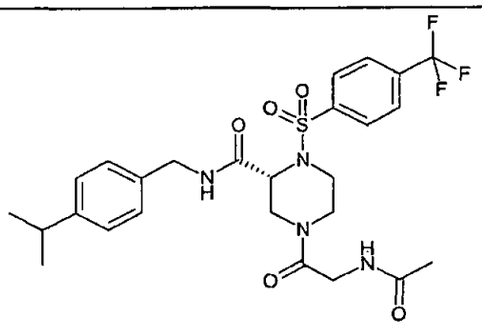
実施例番号	構造式
181	
182	
183	
184	
185	

表38

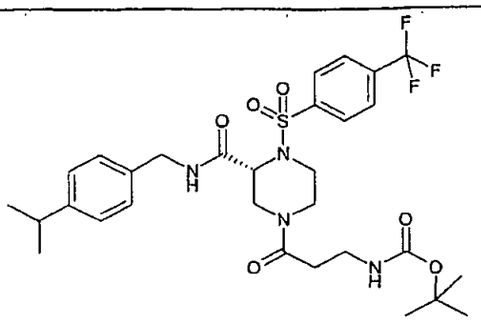
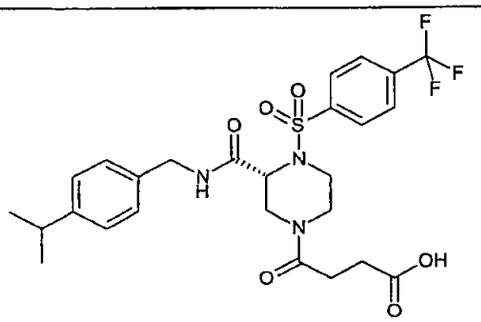
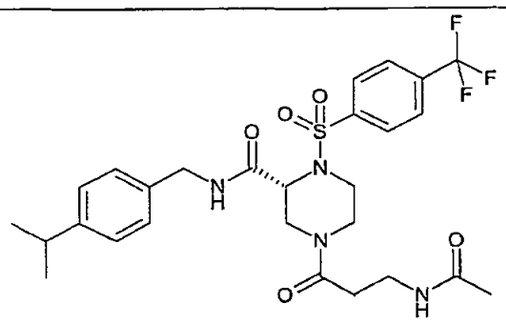
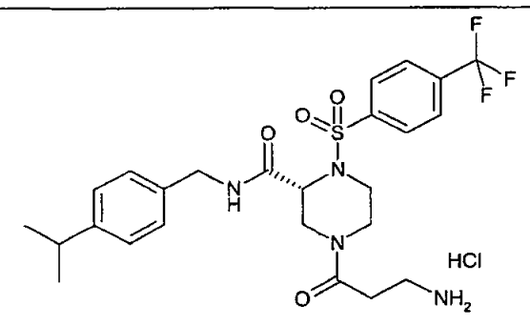
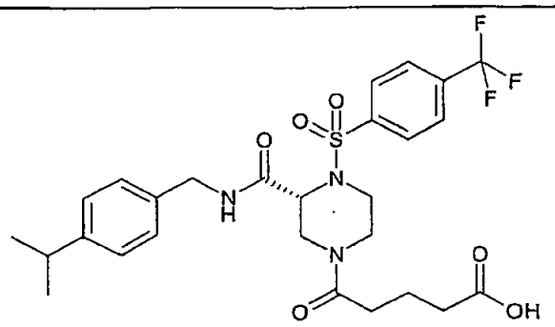
実施例番号	構造式
186	
187	
188	
189	
190	

表39

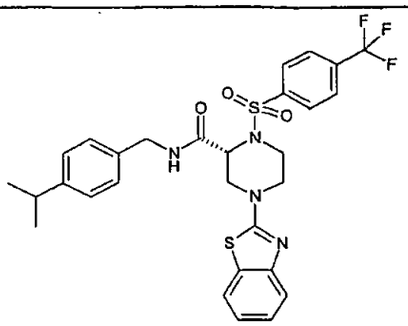
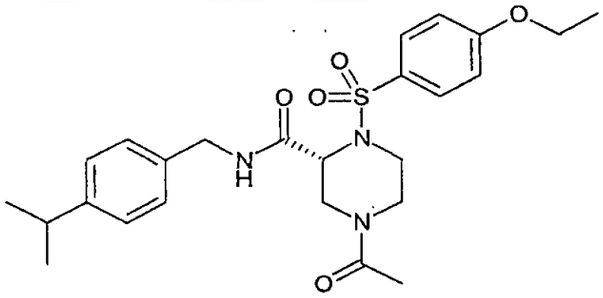
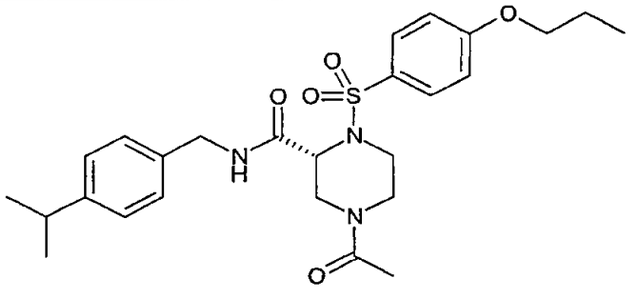
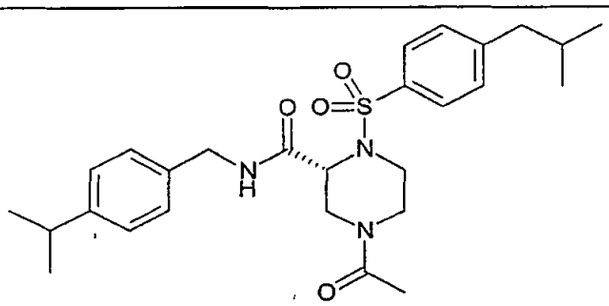
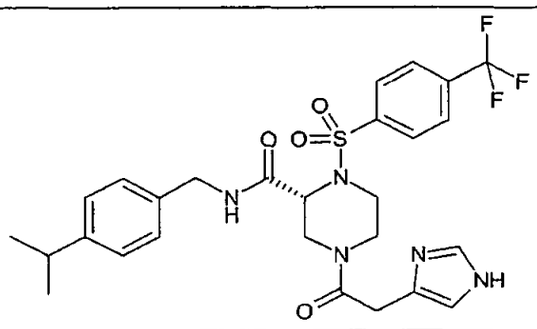
実施例番号	構造式
191	
192	
193	
194	
195	

表40

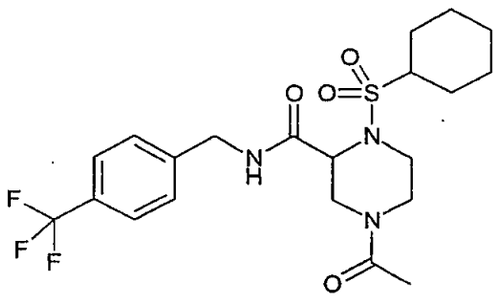
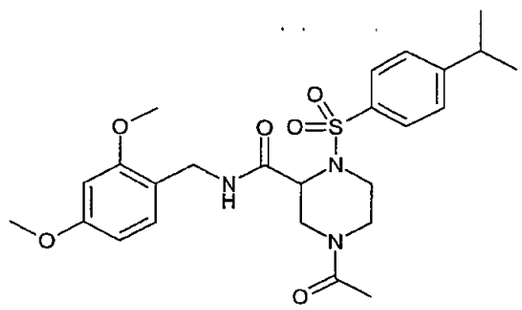
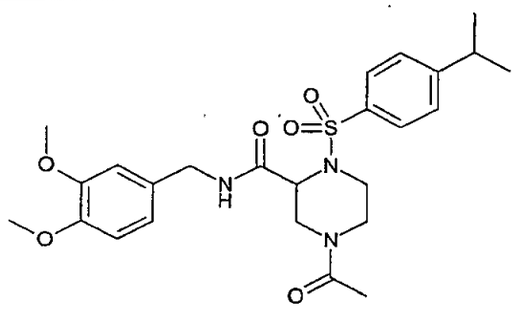
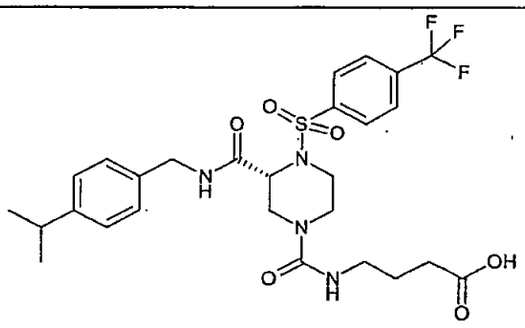
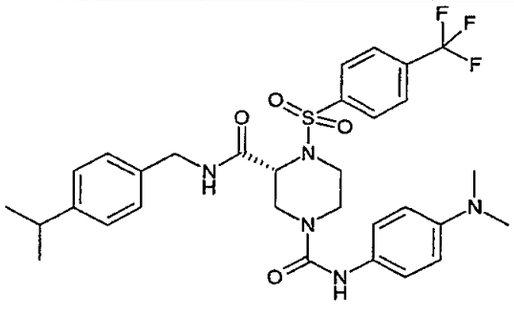
実施例番号	構造式
196	
197	
198	
199	
200	

表41

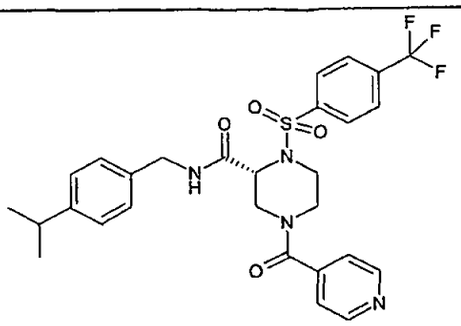
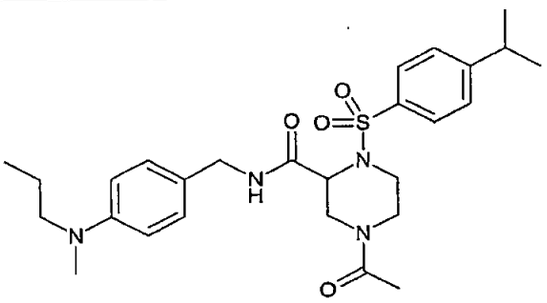
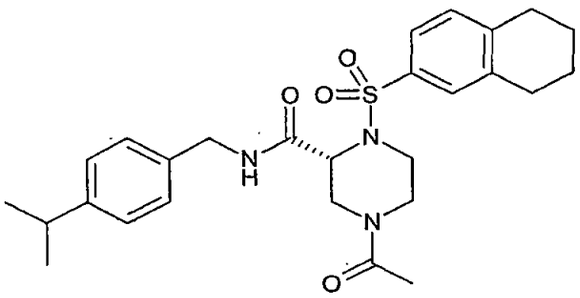
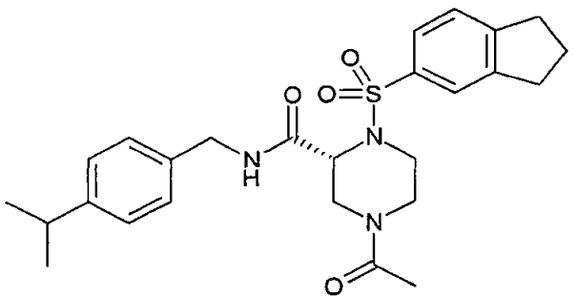
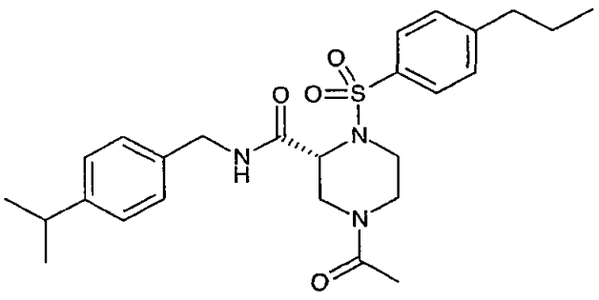
実施例番号	構造式
201	
202	
203	
204	
205	

表42

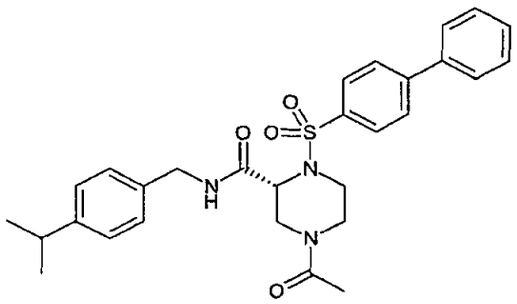
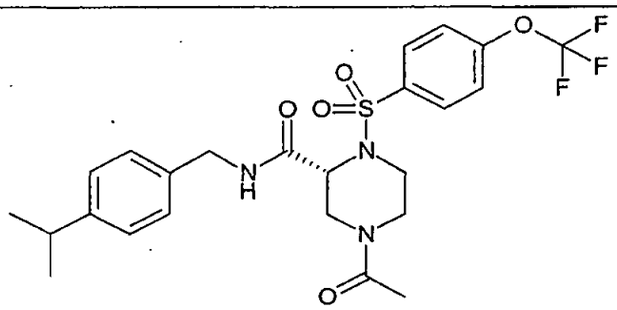
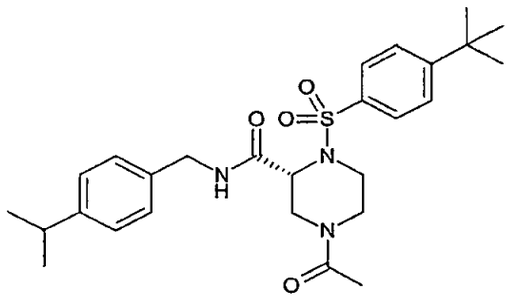
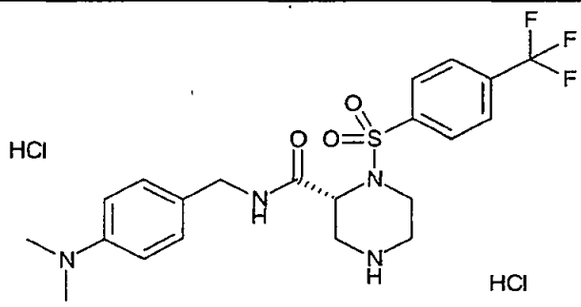
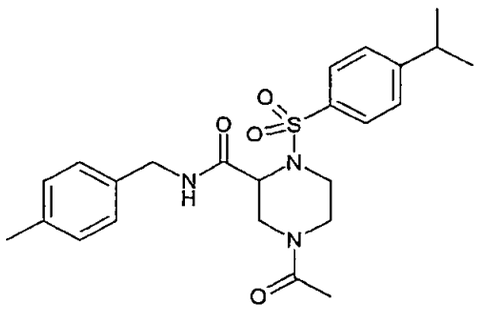
実施例番号	構造式
206	
207	
208	
209	
210	

表43

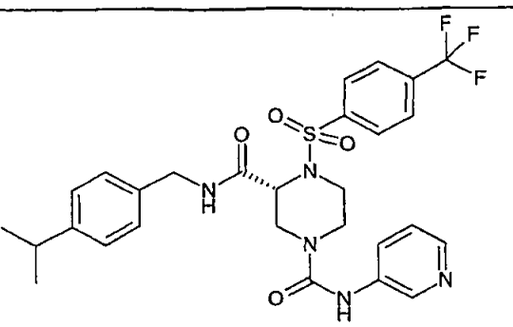
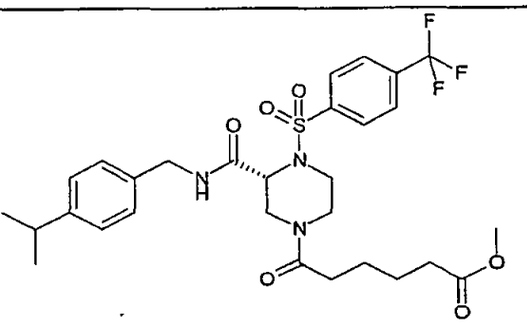
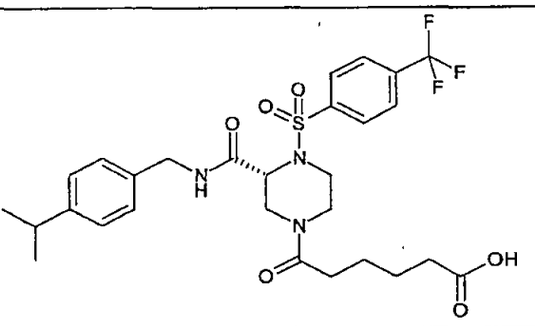
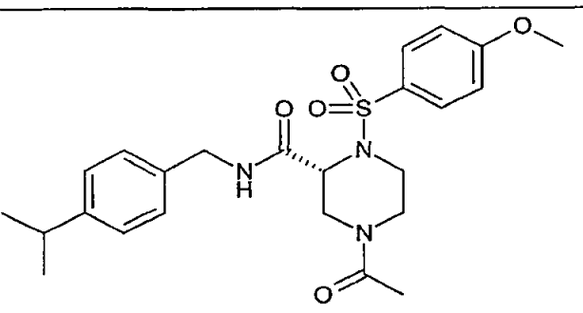
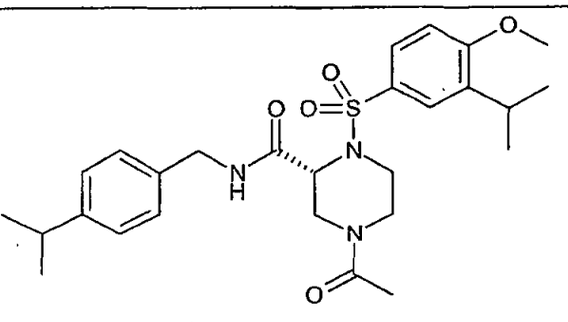
実施例番号	構造式
211	
212	
213	
214	
215	

表44

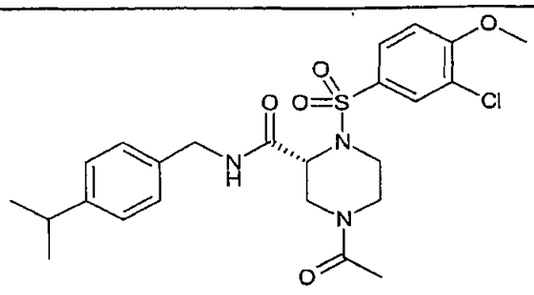
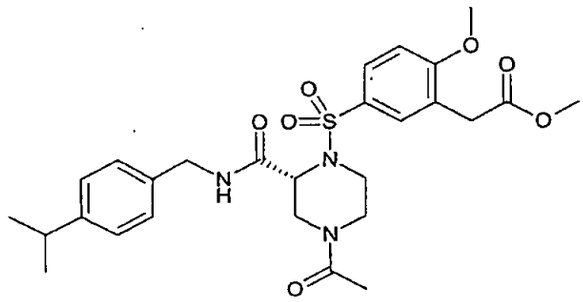
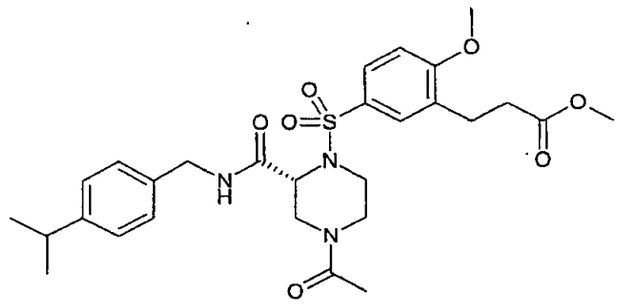
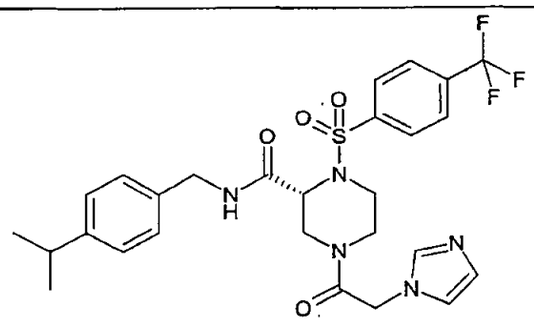
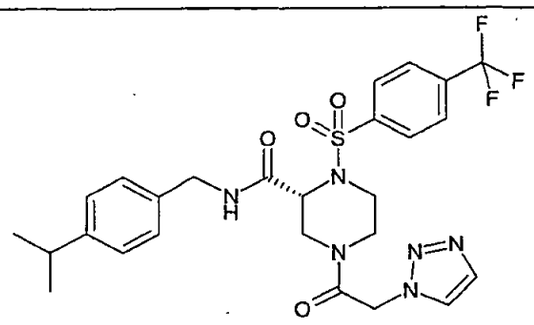
実施例番号	構造式
216	
217	
218	
219	
220	

表45

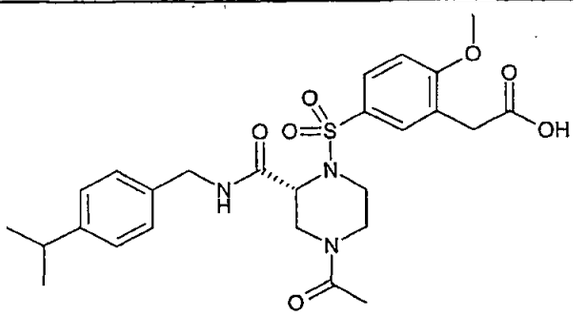
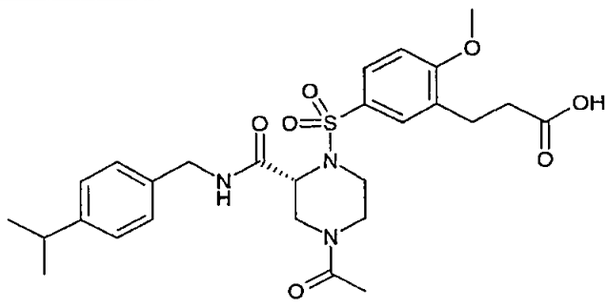
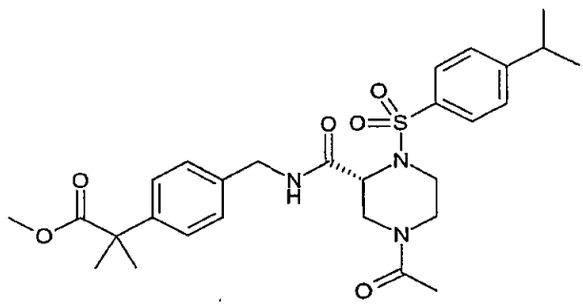
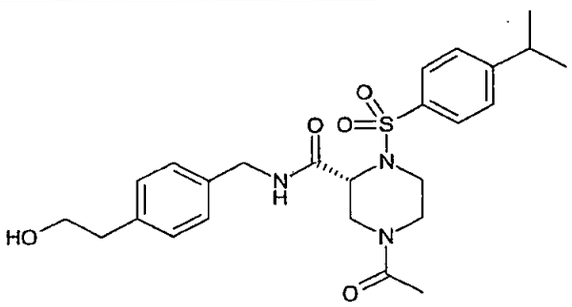
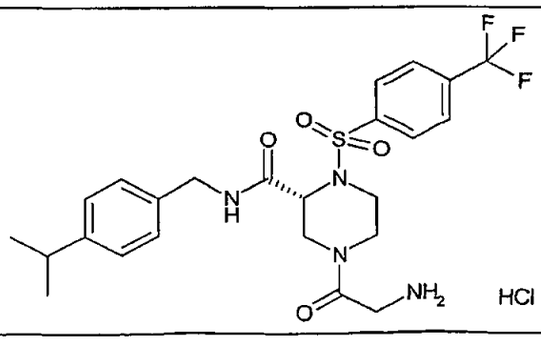
実施例番号	構造式
221	
222	
223	
224	
225	

表46

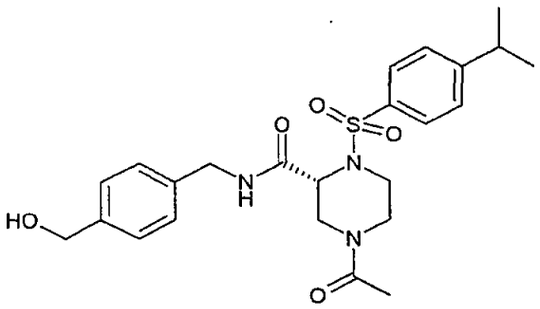
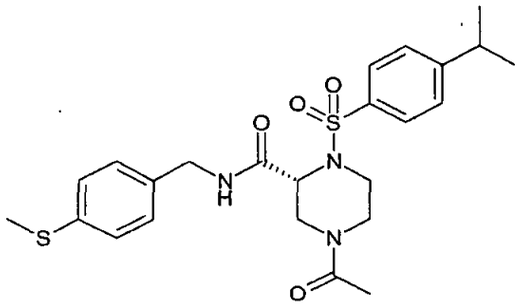
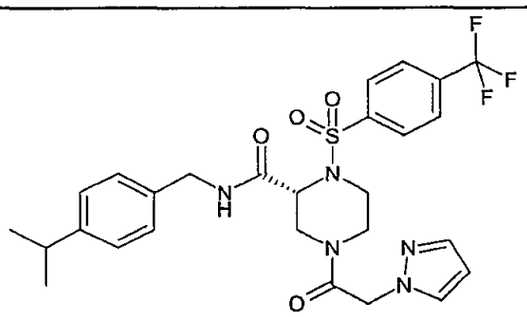
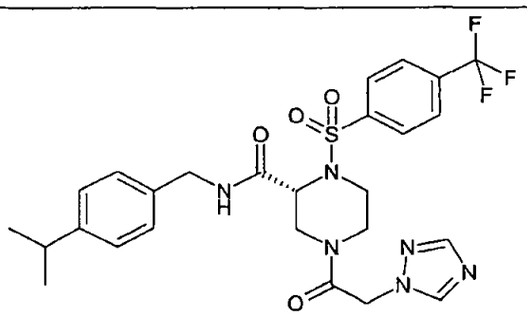
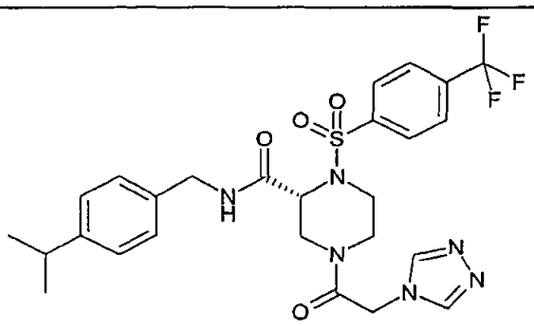
実施例番号	構造式
226	
227	
228	
229	
230	

表47

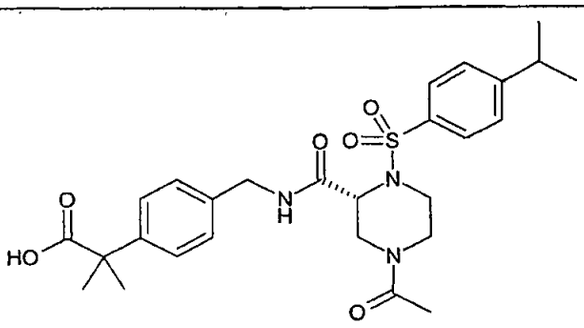
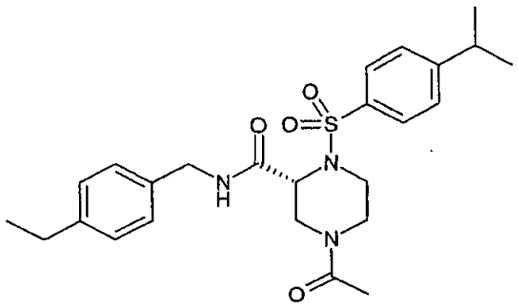
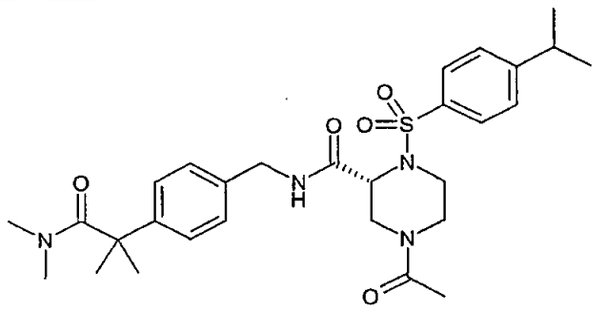
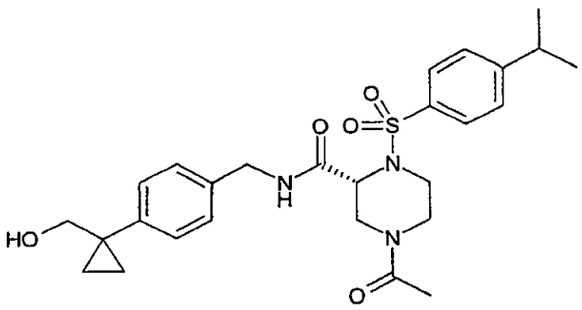
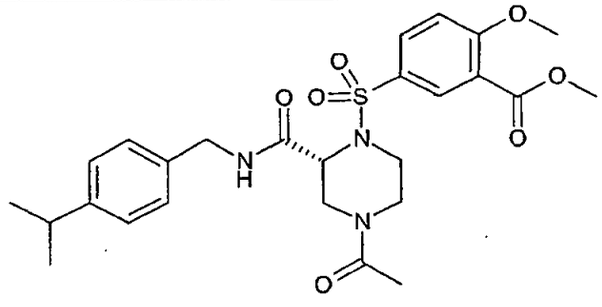
実施例番号	構造式
231	
232	
233	
234	
235	

表48

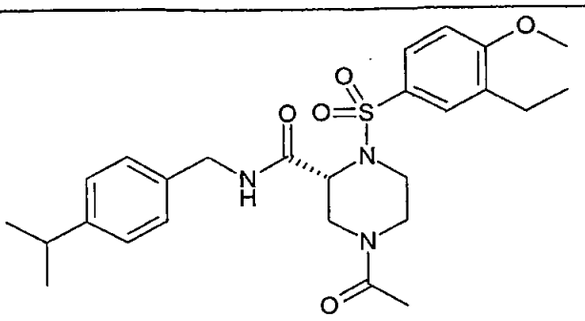
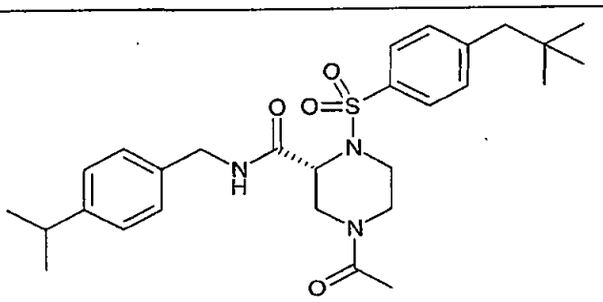
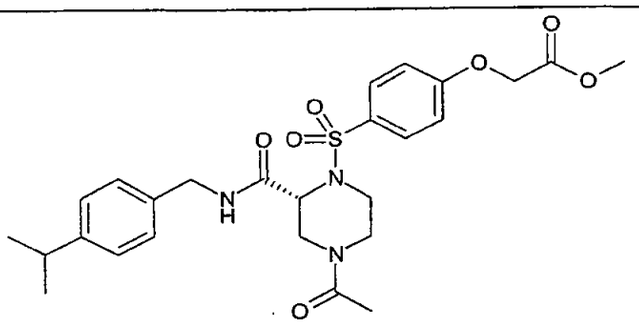
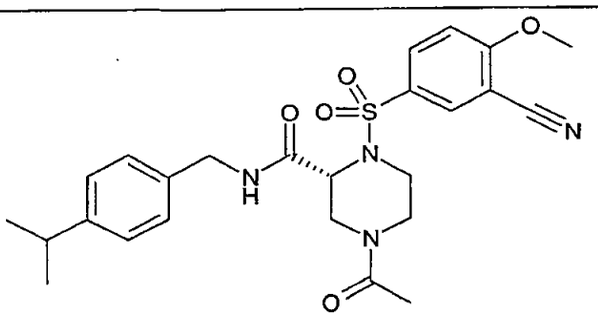
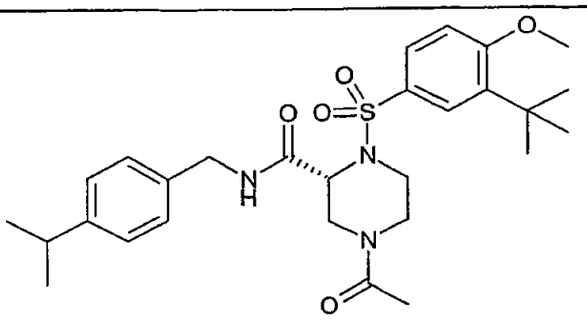
実施例番号	構造式
236	
237	
238	
239	
240	

表49

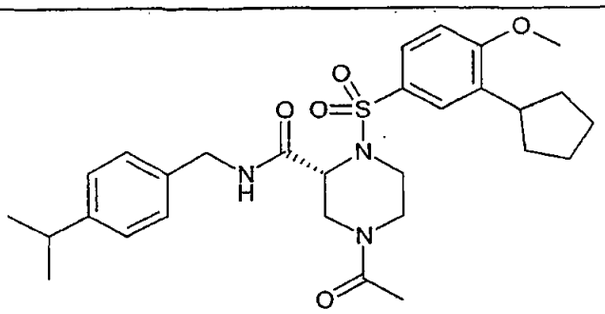
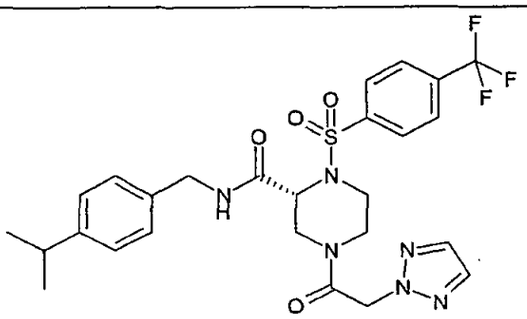
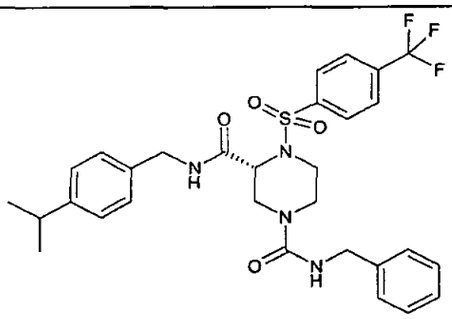
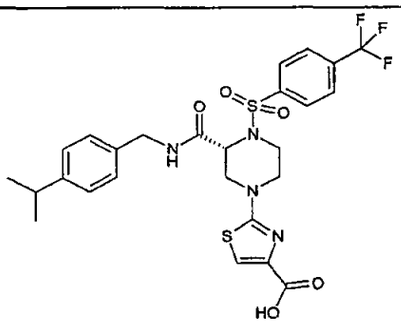
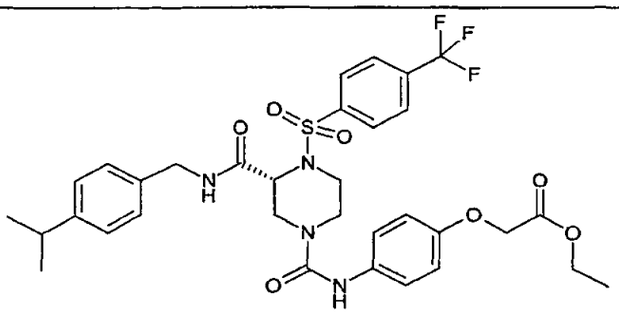
実施例番号	構造式
241	
242	
243	
244	
245	

表50

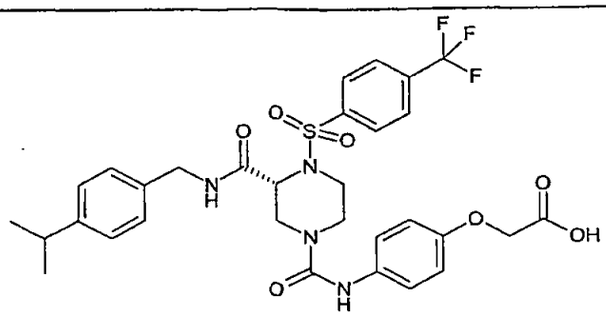
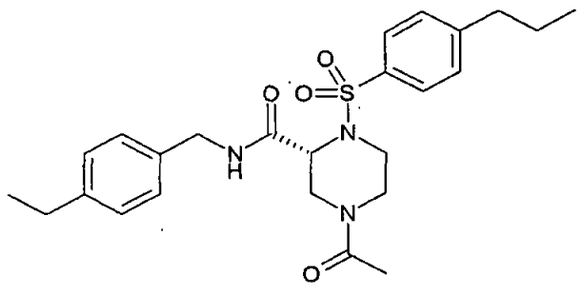
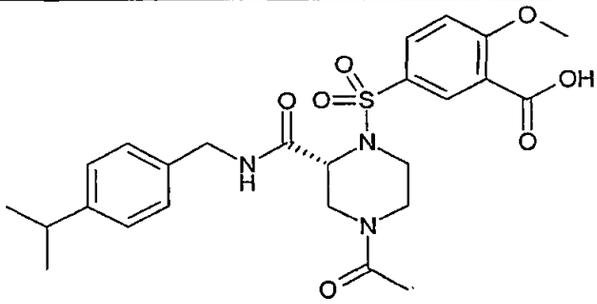
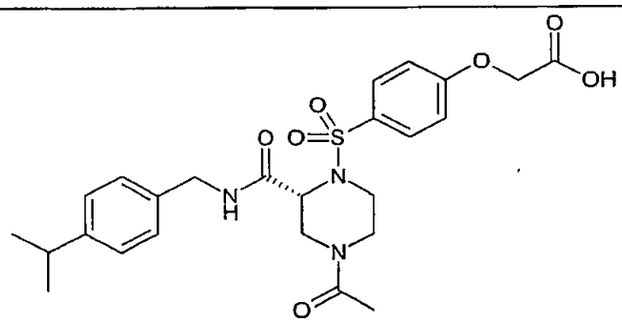
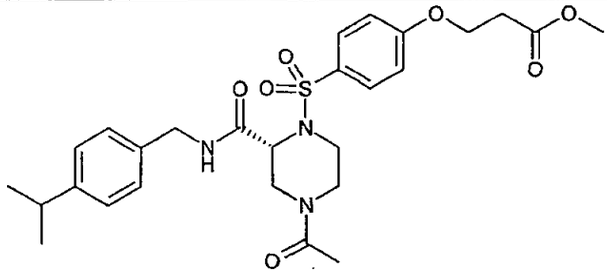
実施例番号	構造式
246	
247	
248	
249	
250	

表51

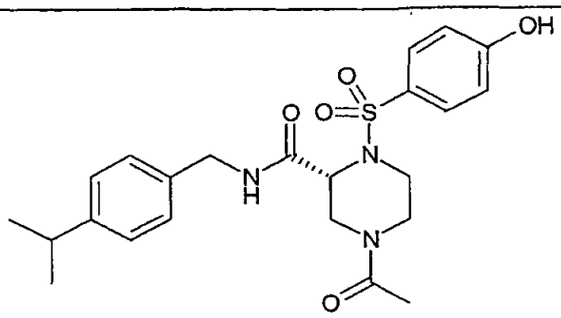
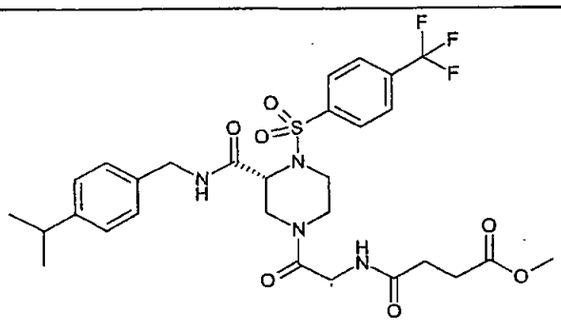
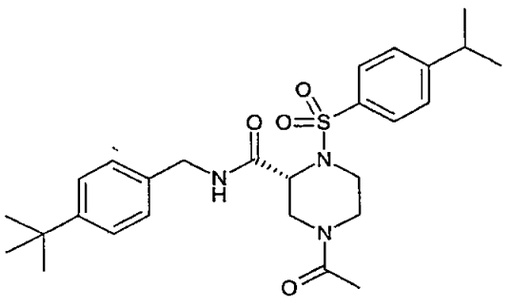
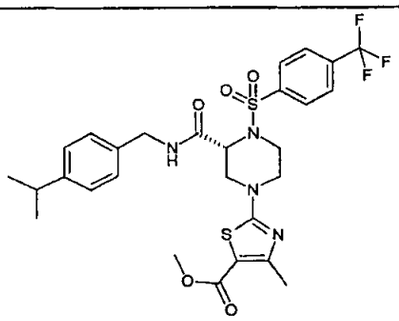
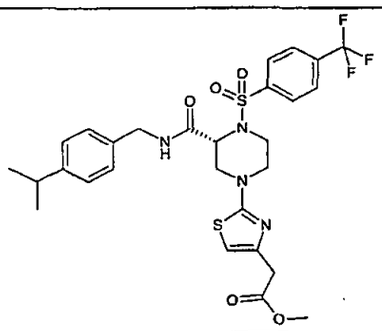
実施例番号	構造式
251	
252	
253	
254	
255	

表52

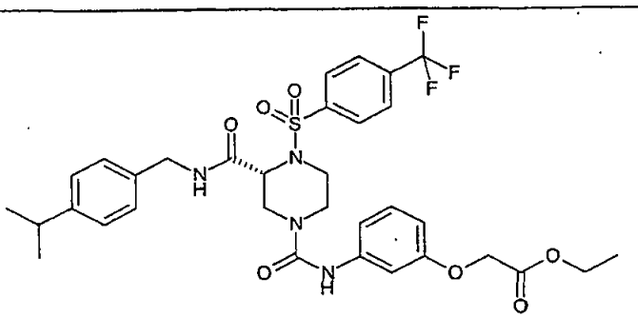
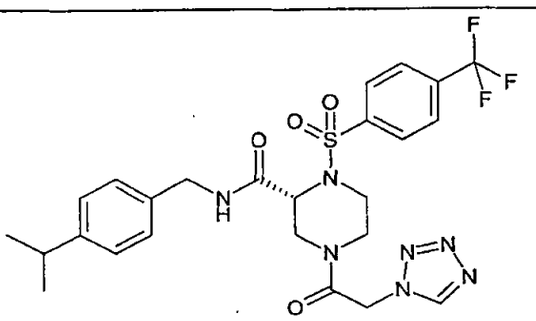
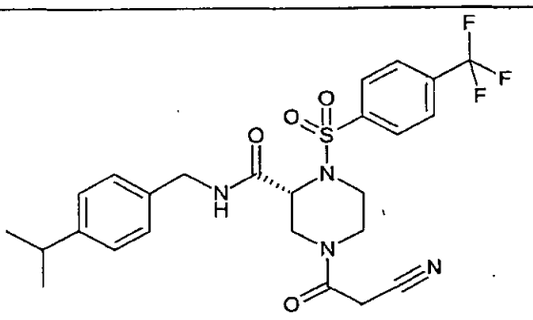
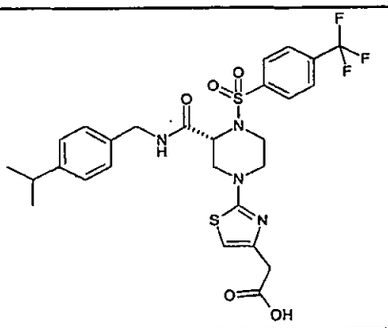
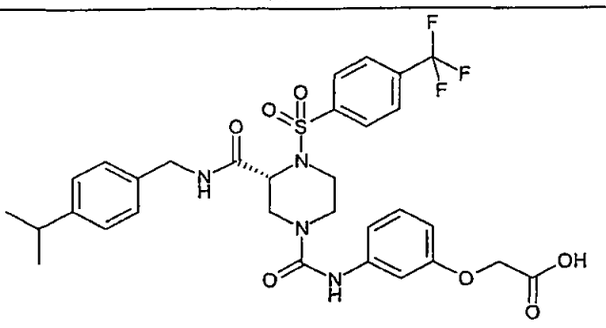
実施例番号	構造式
256	
257	
258	
259	
260	

表53

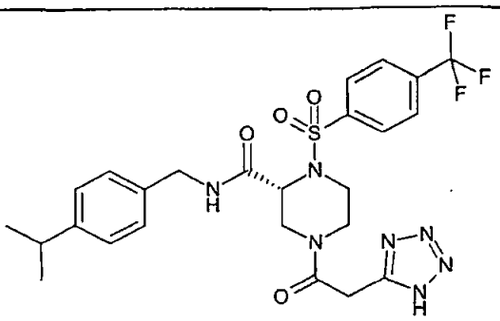
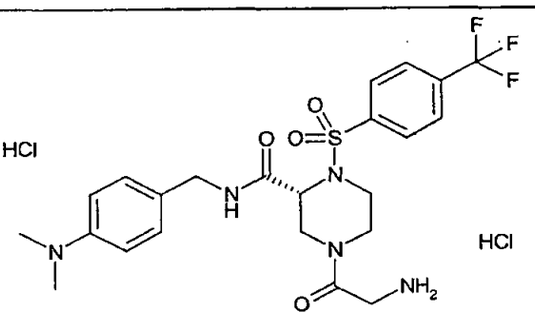
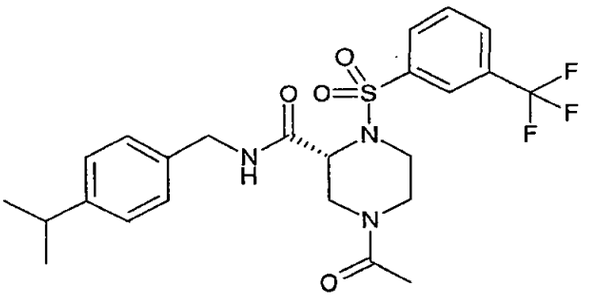
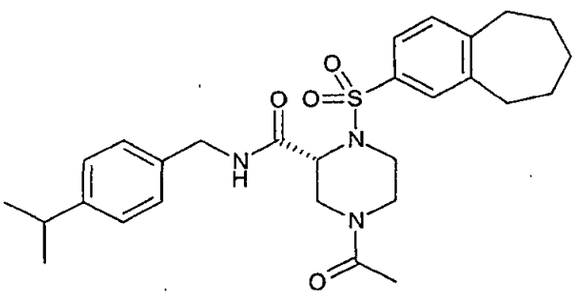
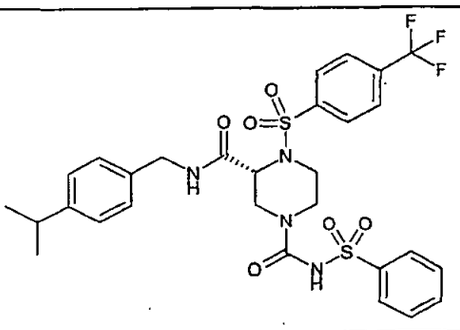
実施例番号	構造式
261	
262	
263	
264	
265	

表54

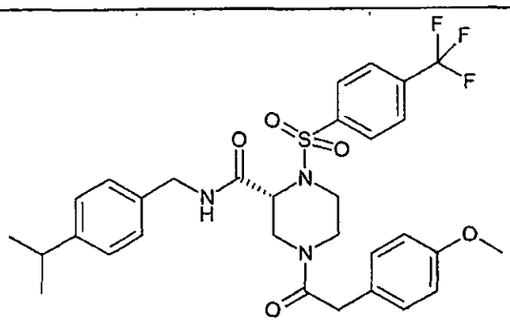
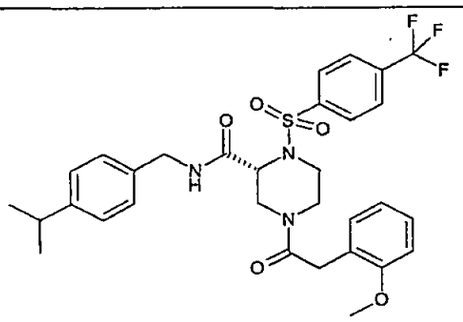
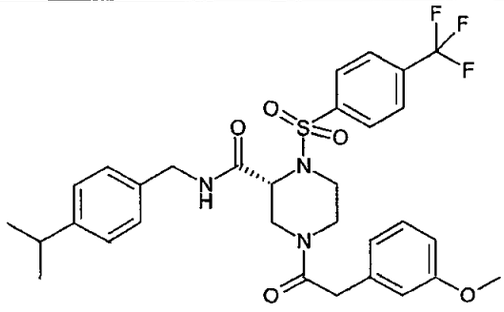
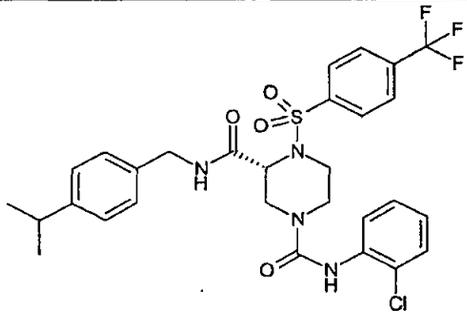
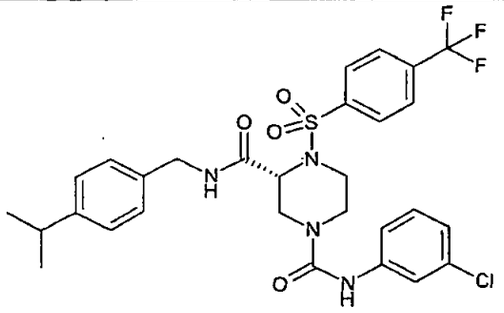
実施例番号	構造式
266	
267	
268	
269	
270	

表55

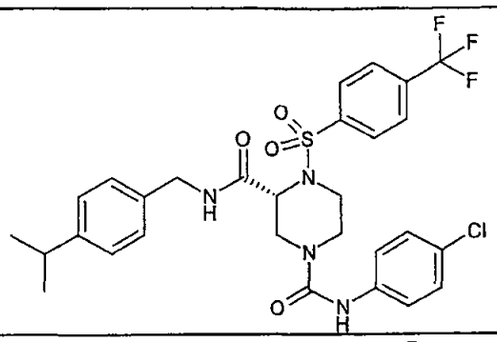
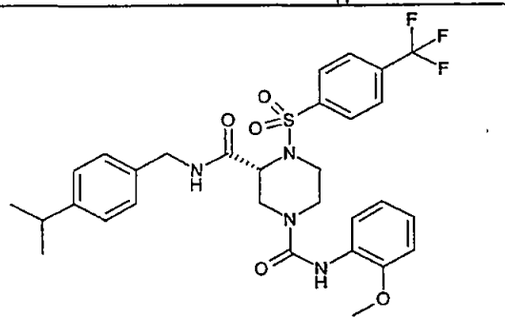
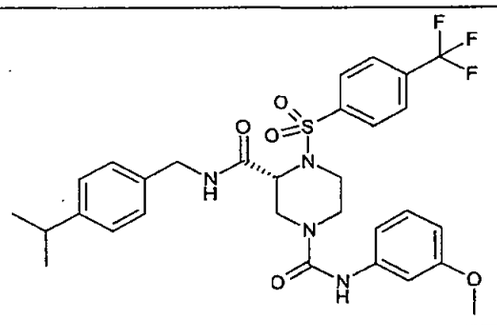
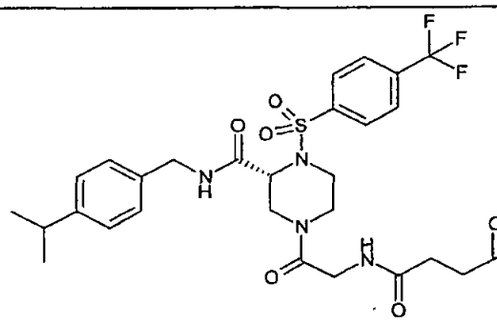
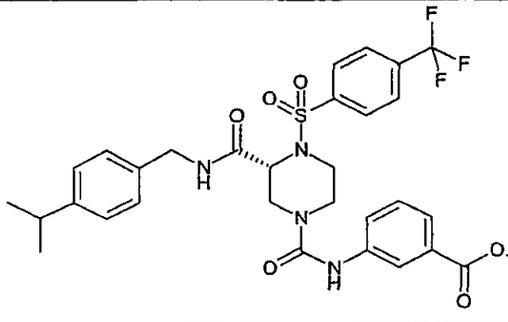
実施例番号	構造式
271	
272	
273	
274	
275	

表56

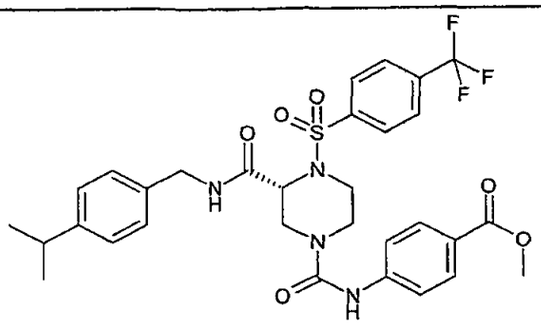
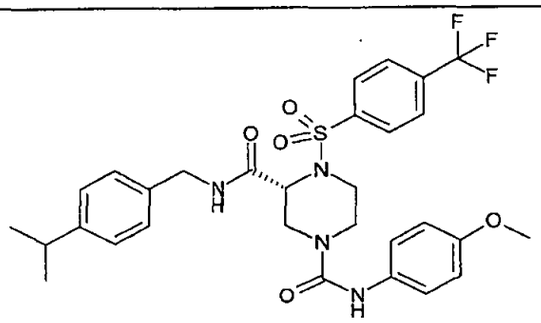
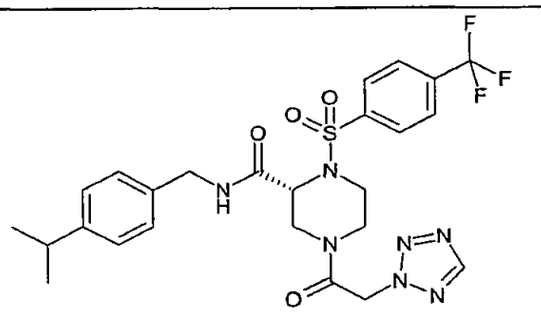
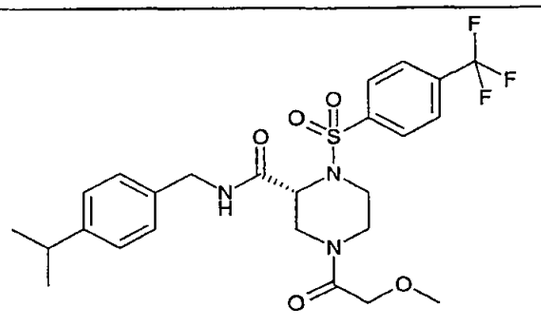
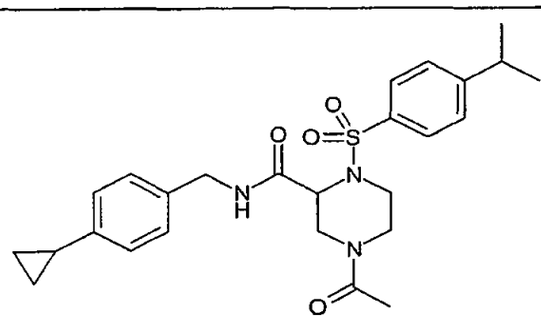
実施例番号	構造式
276	
277	
278	
279	
280	

表57

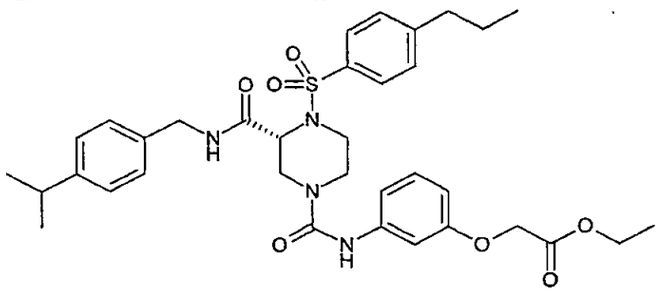
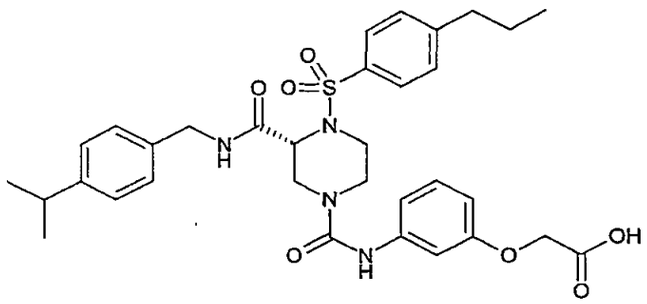
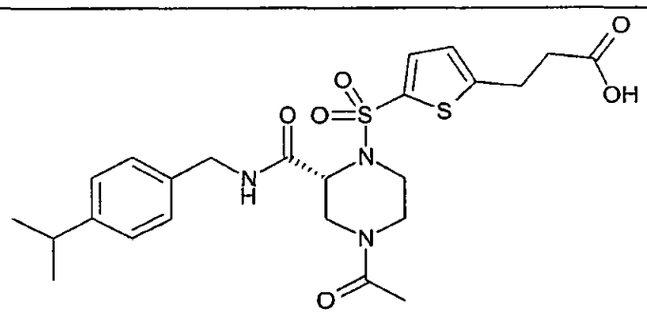
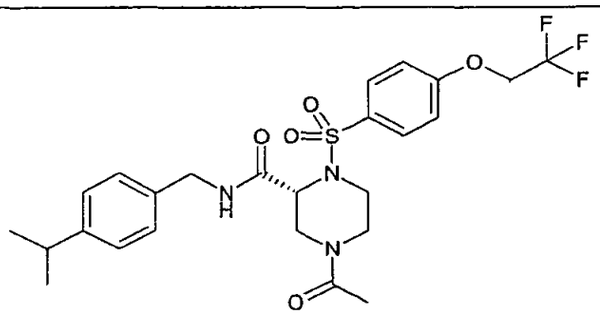
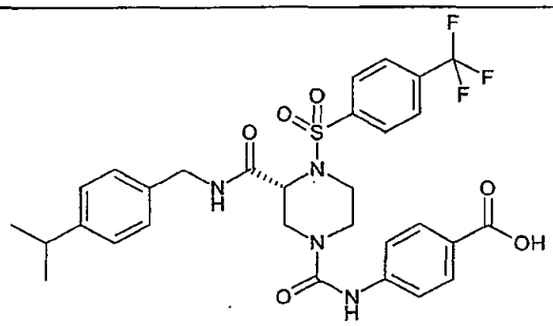
実施例番号	構造式
281	
282	
283	
284	
285	

表58

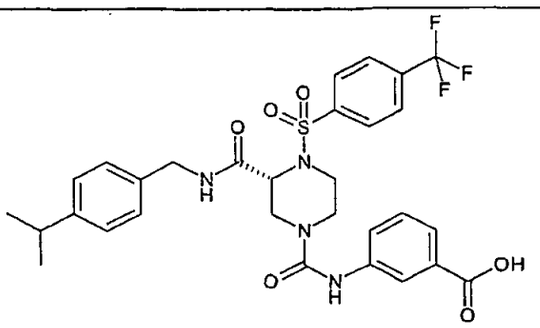
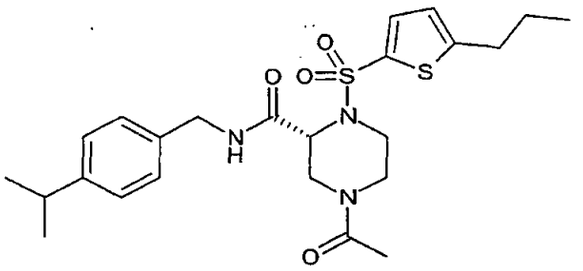
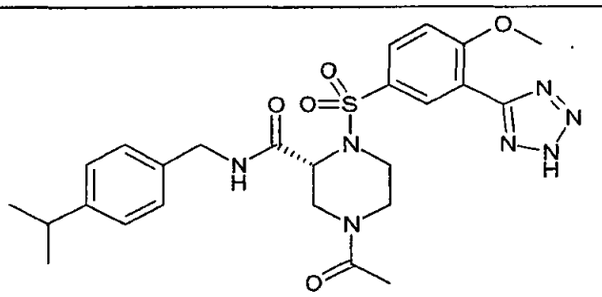
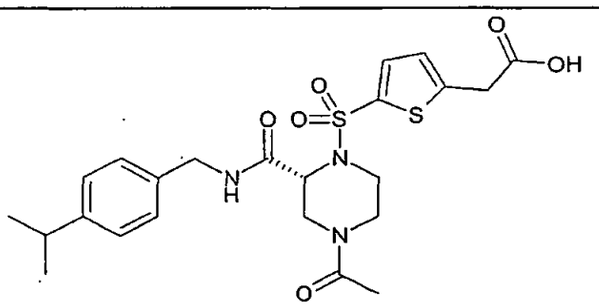
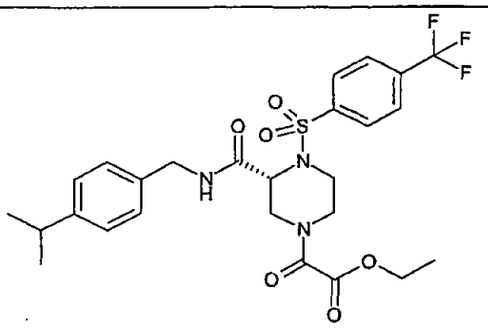
実施例番号	構造式
286	
287	
288	
289	
290	

表59

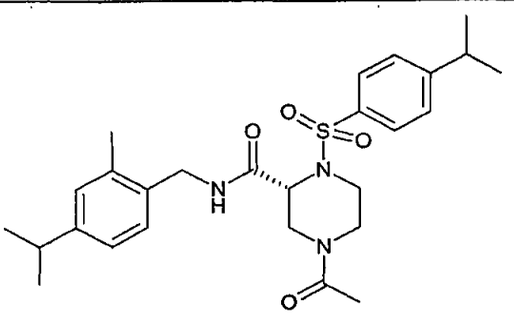
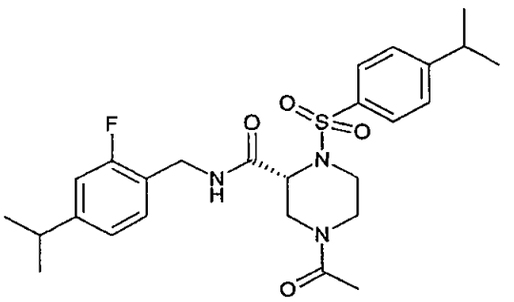
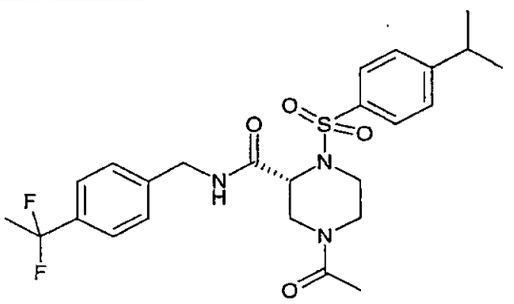
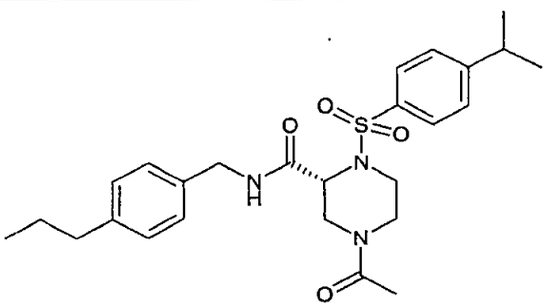
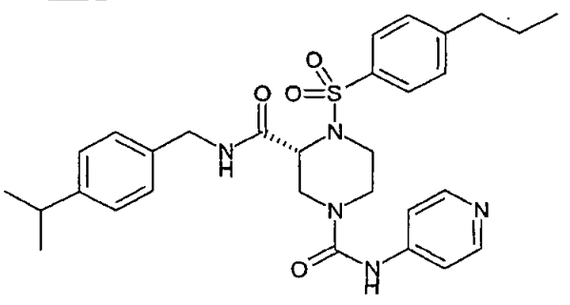
実施例番号	構造式
291	
292	
293	
294	
295	

表60

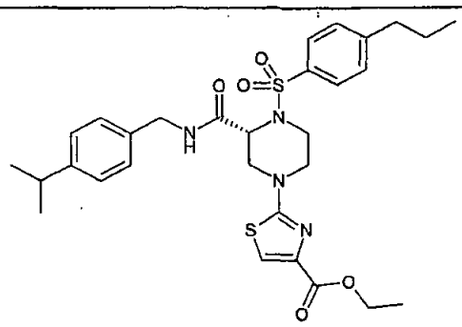
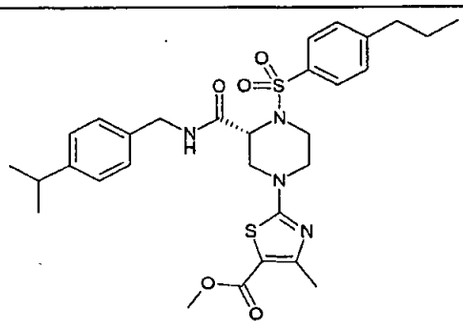
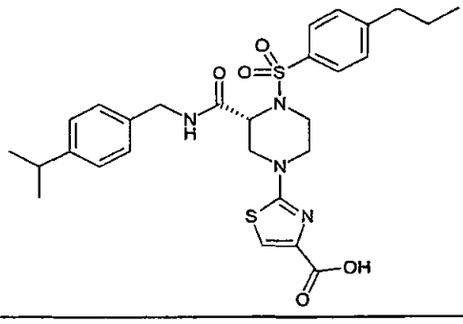
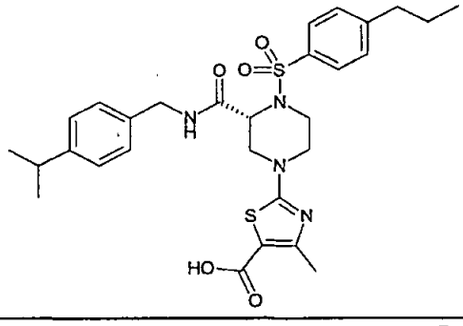
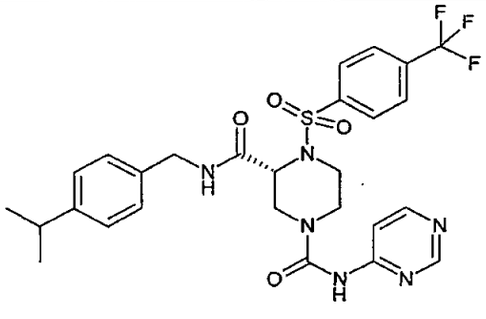
実施例番号	構造式
296	
297	
298	
299	
300	

表61

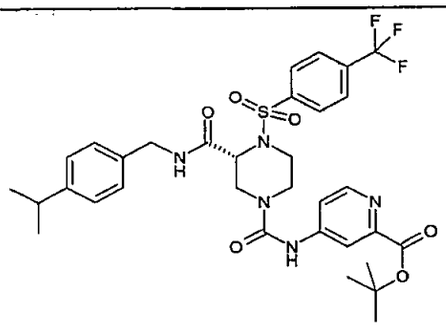
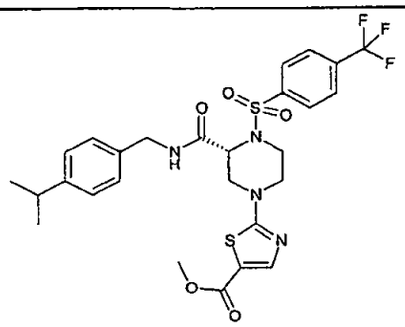
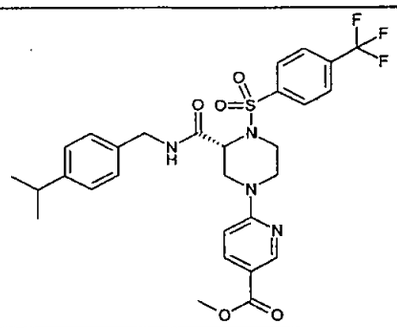
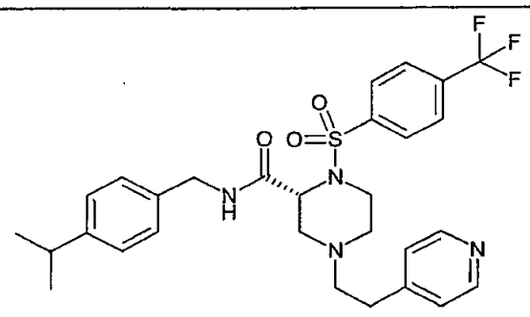
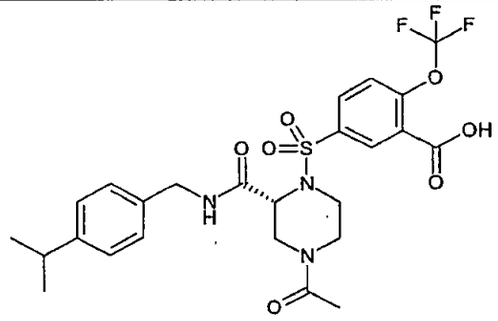
実施例番号	構造式
301	
302	
303	
304	
305	

表62

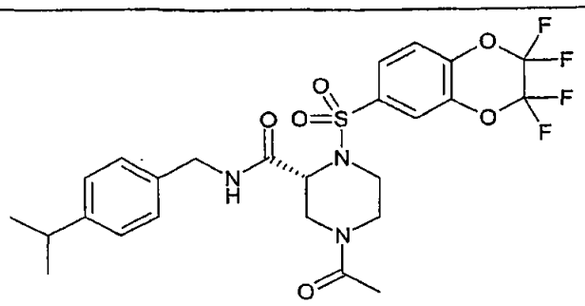
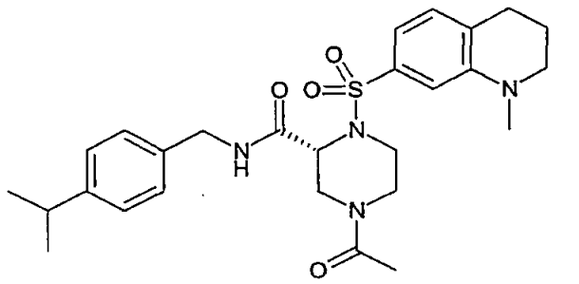
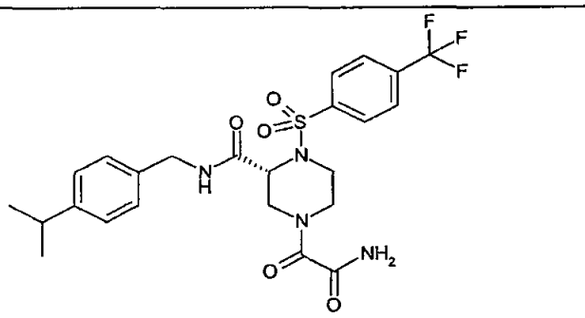
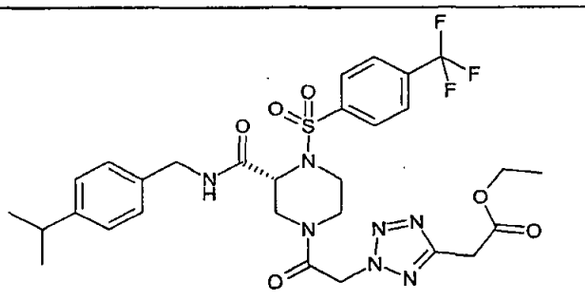
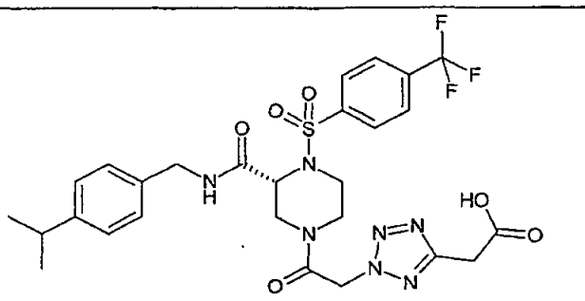
実施例番号	構造式
306	
307	
308	
309	
310	

表63

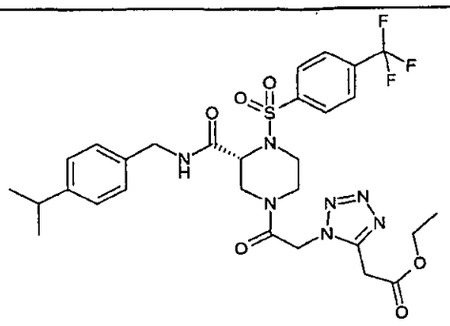
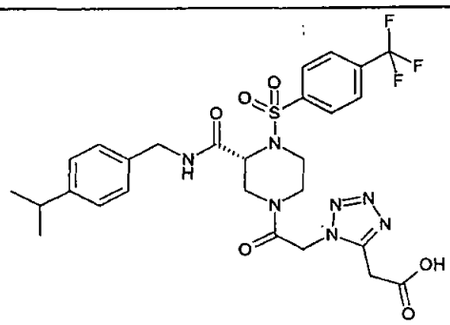
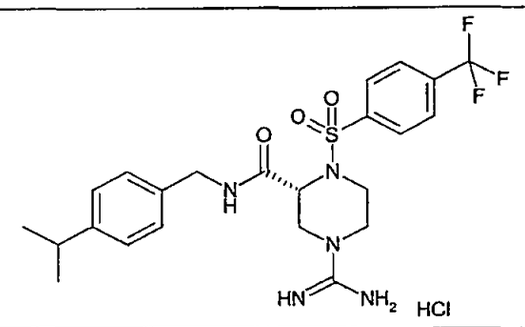
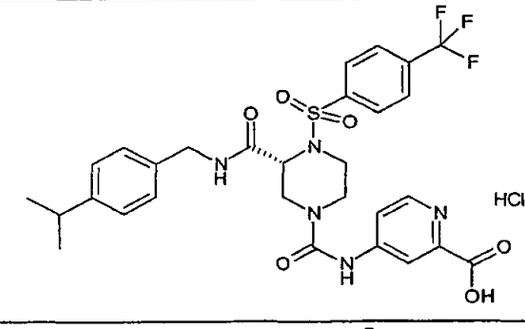
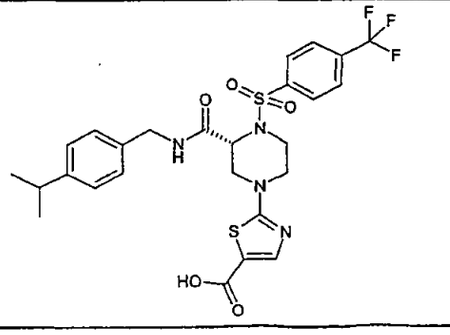
実施例番号	構造式
311	
312	
313	
314	
315	

表64

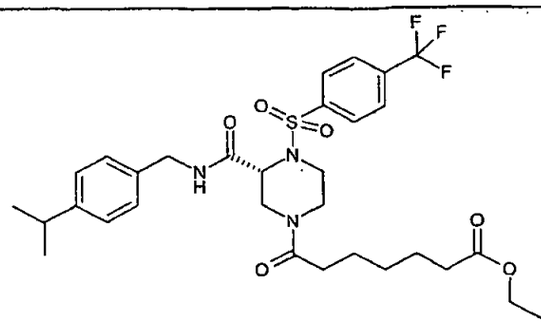
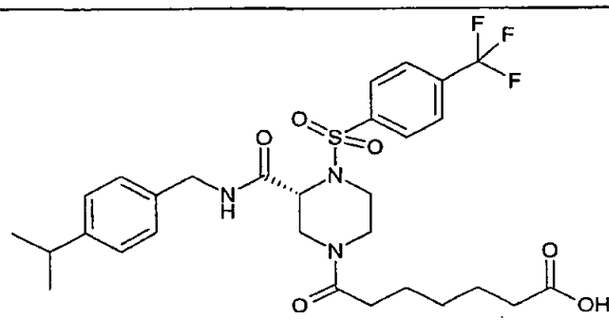
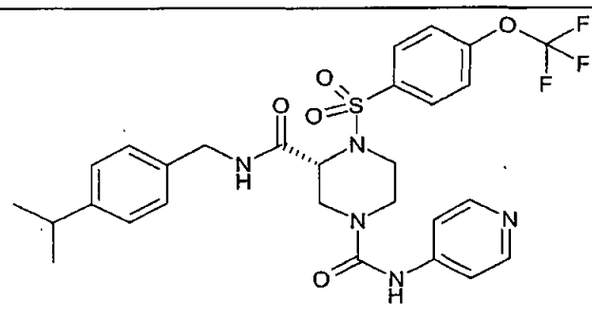
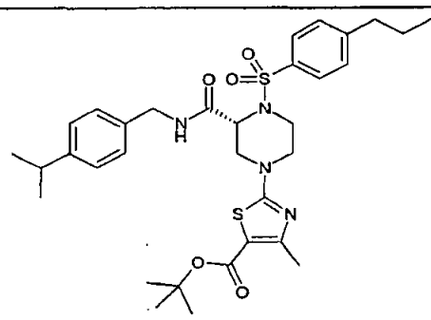
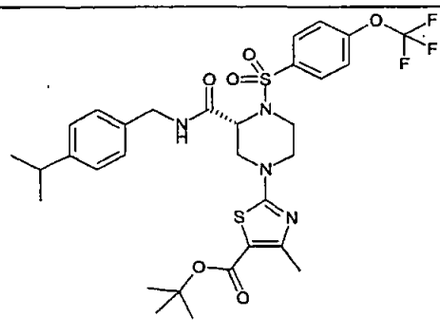
実施例番号	構造式
316	
317	
318	
319	
320	

表65

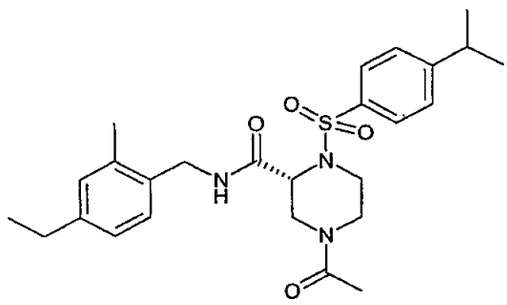
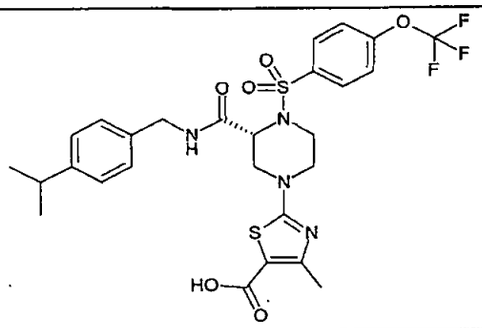
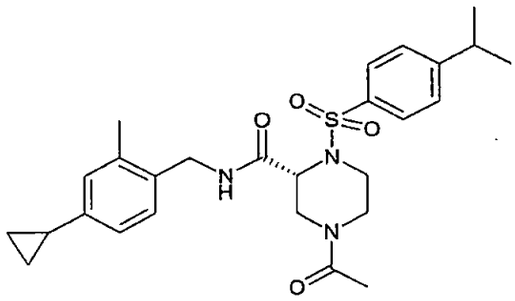
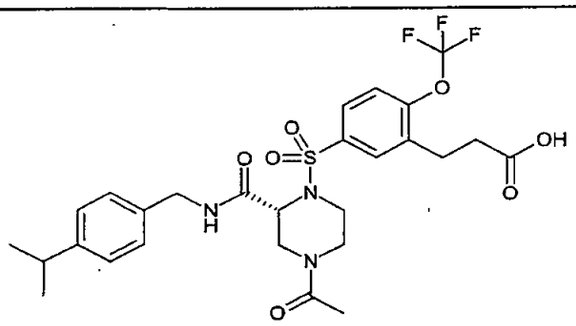
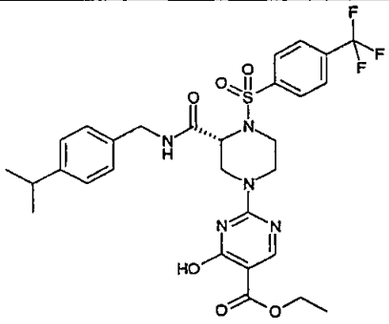
実施例番号	構造式
321	
322	
323	
324	
325	

表66

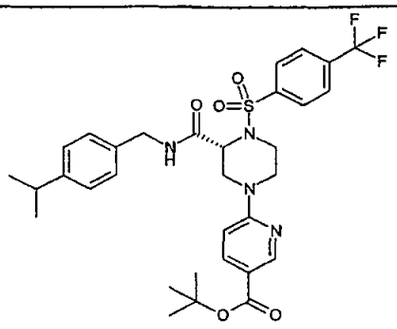
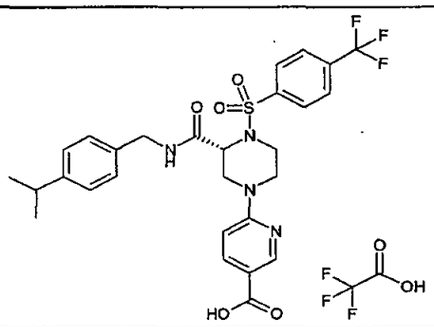
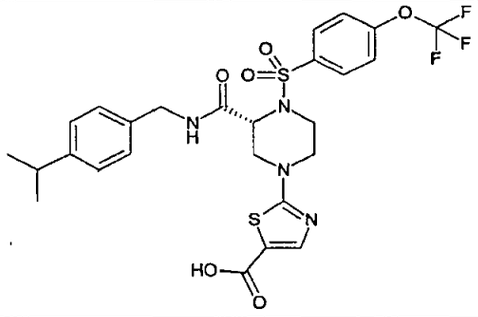
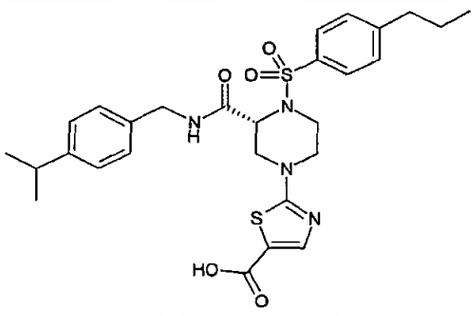
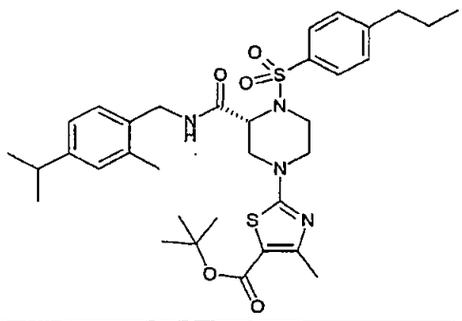
実施例番号	構造式
326	
327	
328	
329	
330	

表67

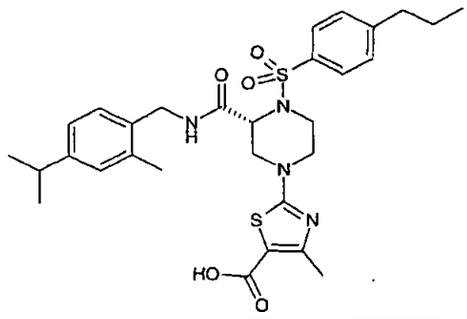
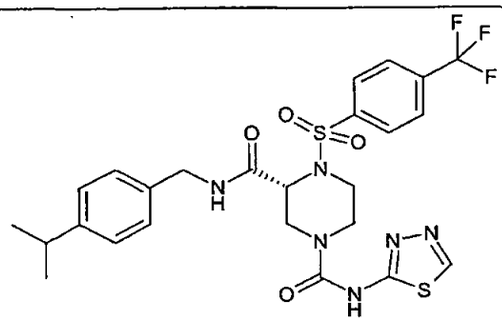
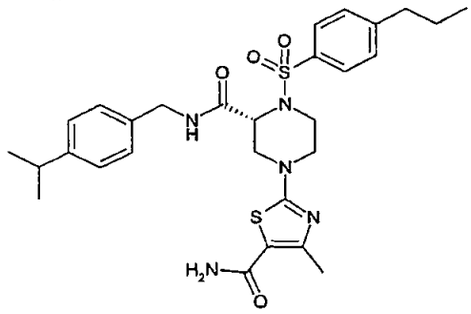
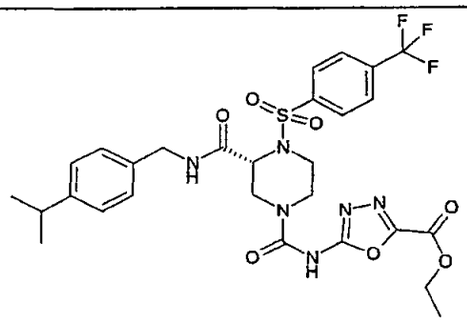
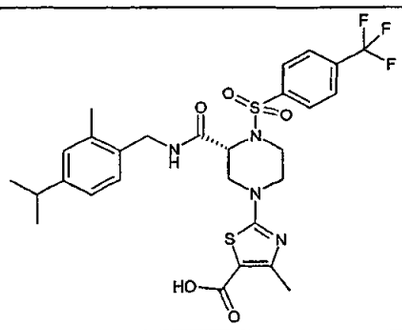
実施例番号	構造式
331	
332	
333	
334	
335	

表68

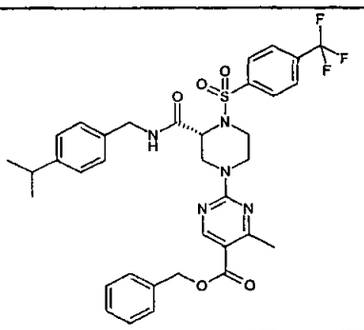
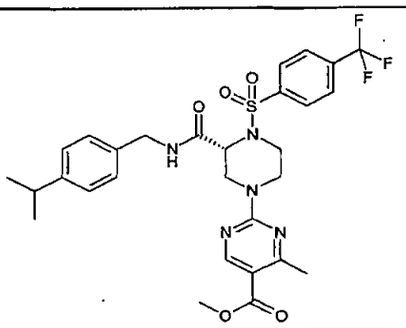
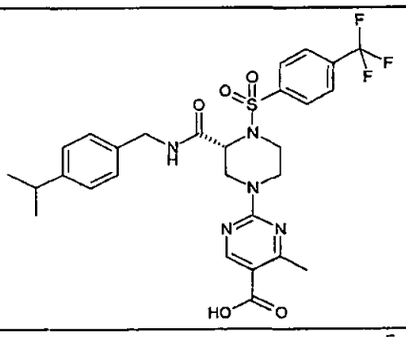
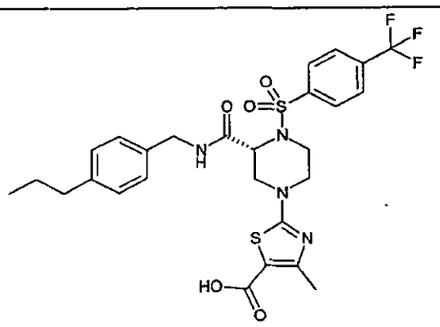
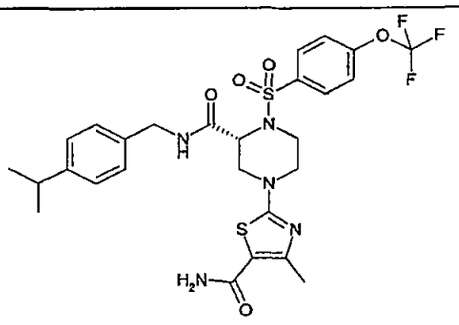
実施例番号	構造式
336	
337	
338	
339	
340	

表69

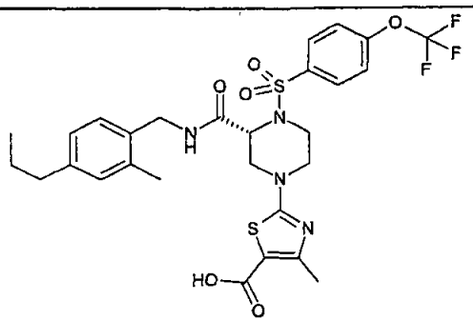
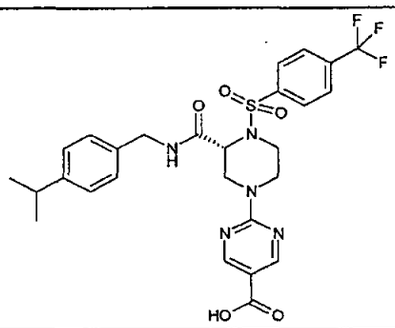
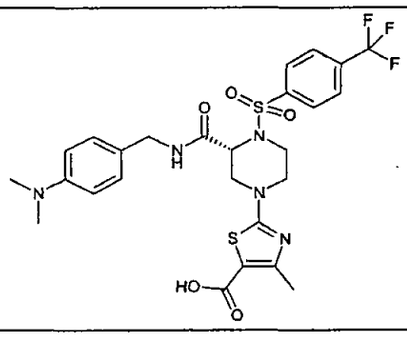
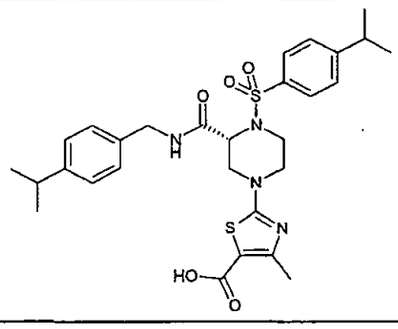
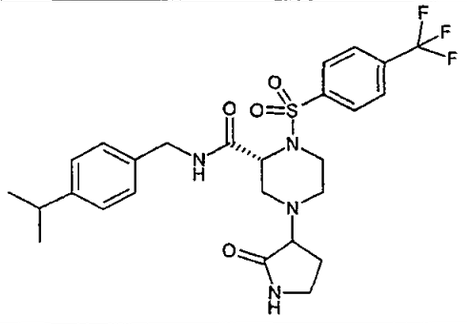
実施例番号	構造式
341	
342	
343	
344	
345	

表70

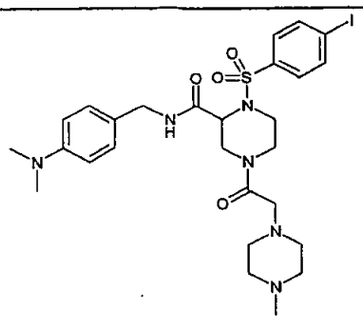
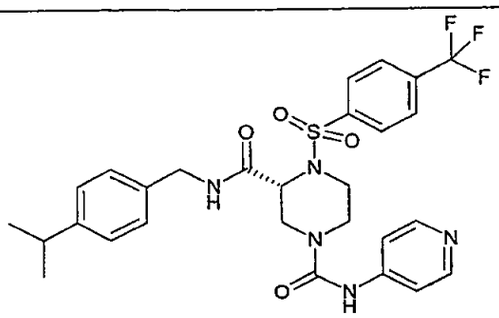
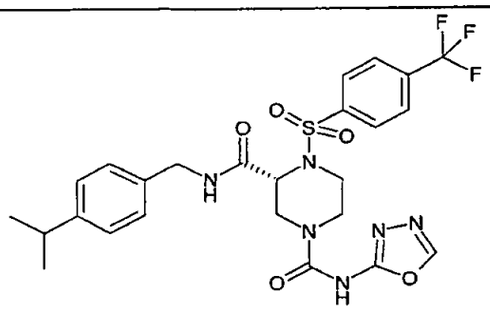
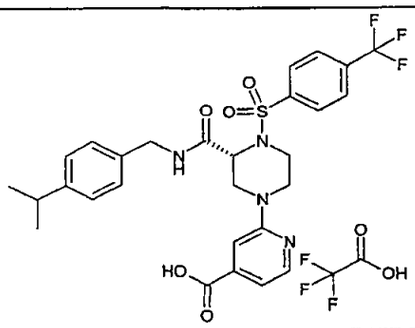
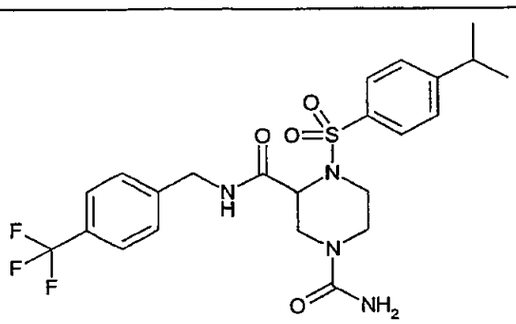
実施例番号	構造式
346	
347	
348	
349	
350	

表71

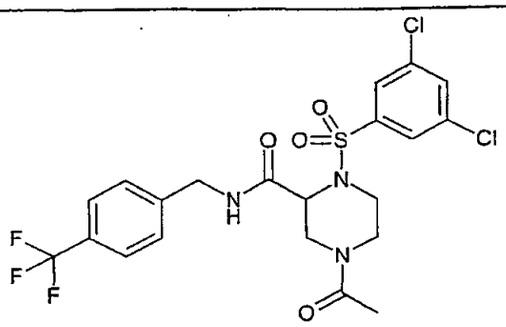
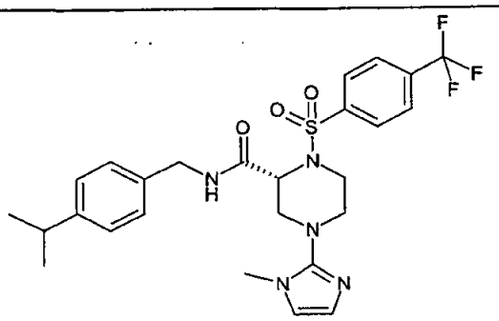
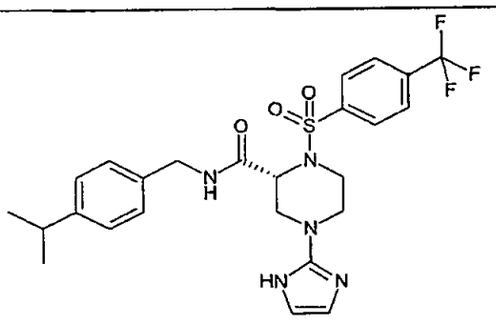
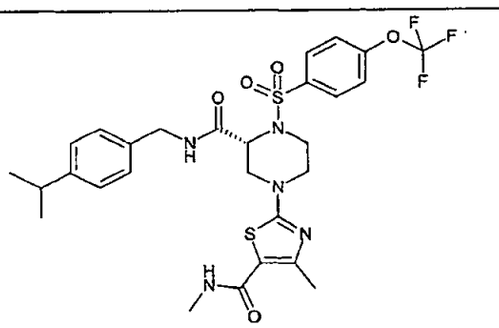
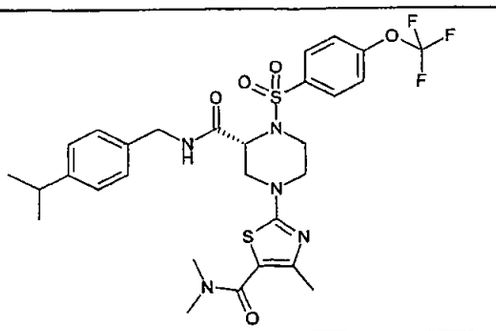
実施例番号	構造式
351	
352	
353	
354	
355	

表72

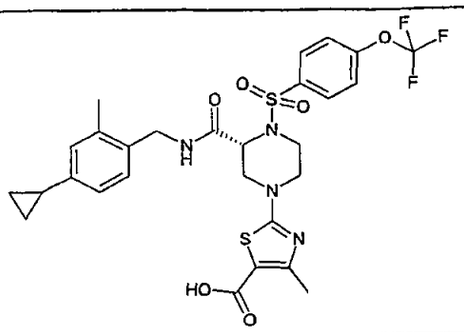
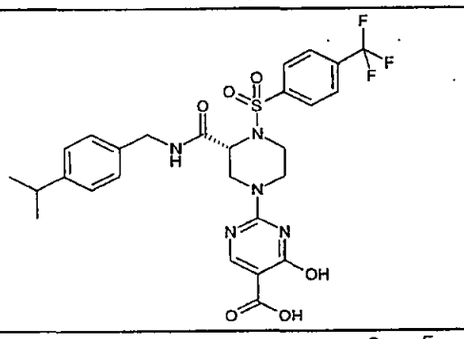
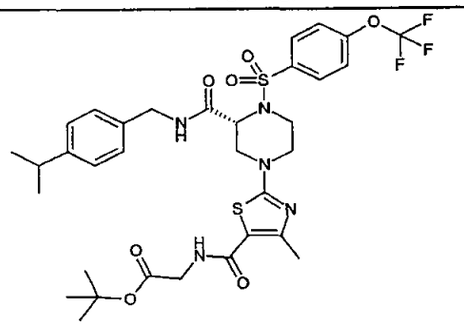
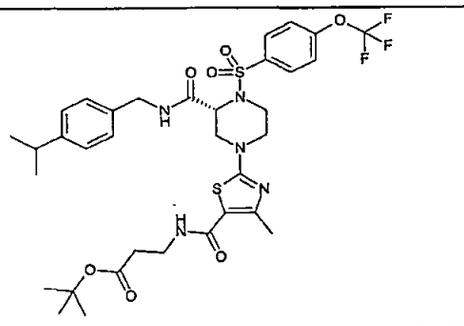
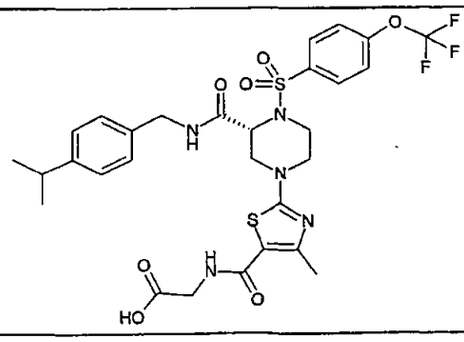
実施例番号	構造式
356	
357	
358	
359	
360	

表73

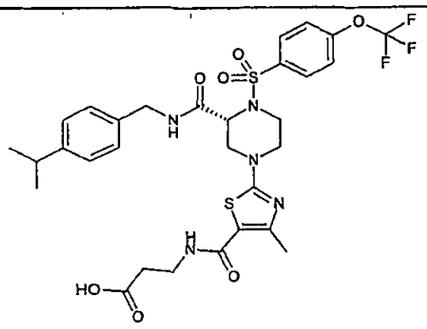
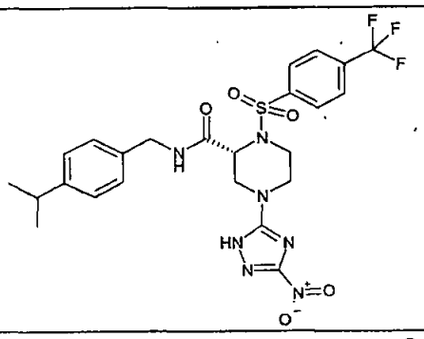
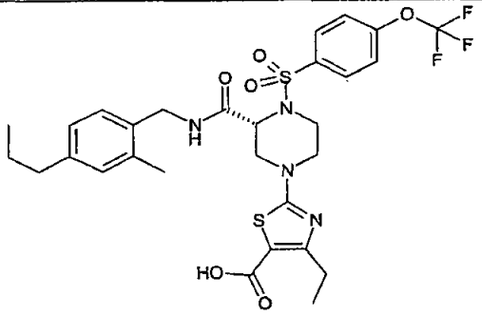
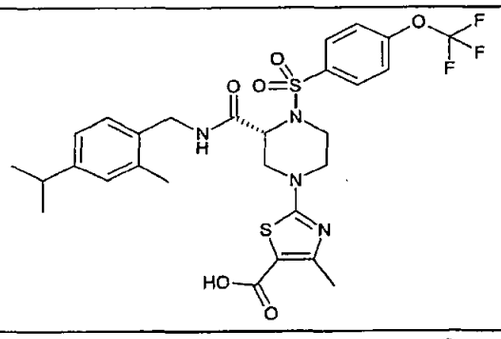
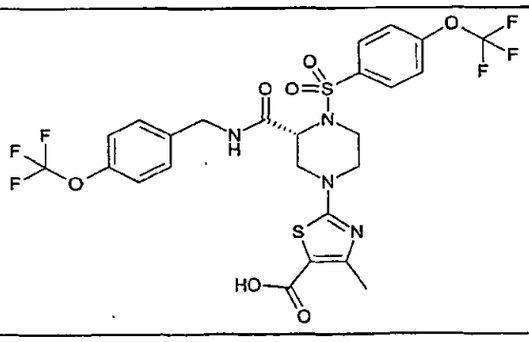
実施例番号	構造式
361	
362	
363	
364	
365	

表74

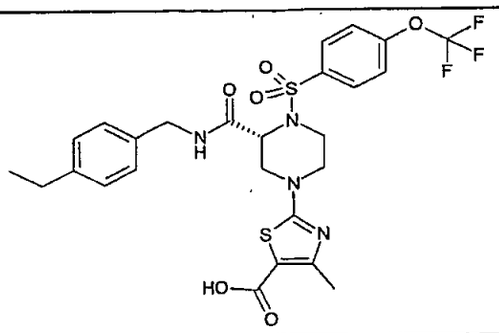
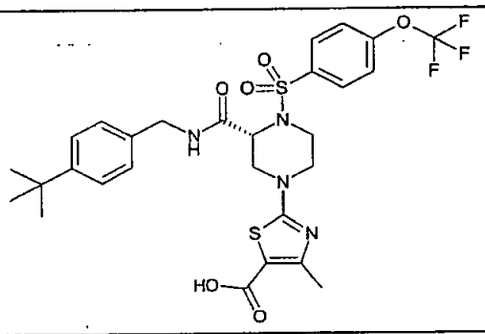
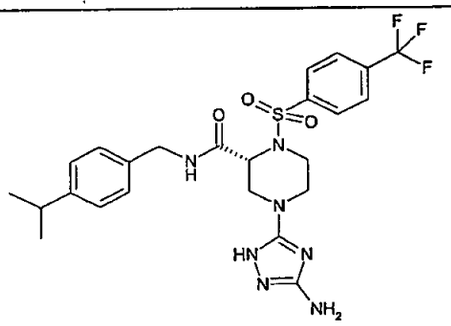
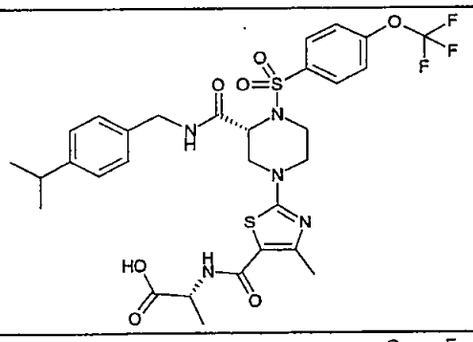
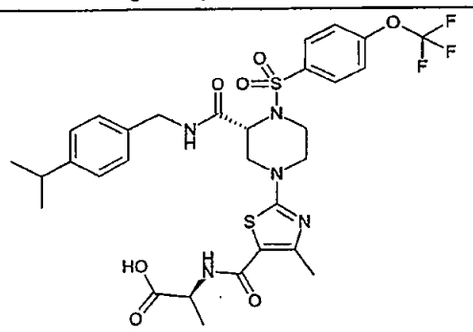
実施例番号	構造式
366	
367	
368	
369	
370	

表75

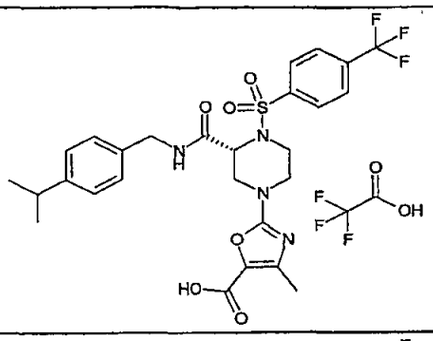
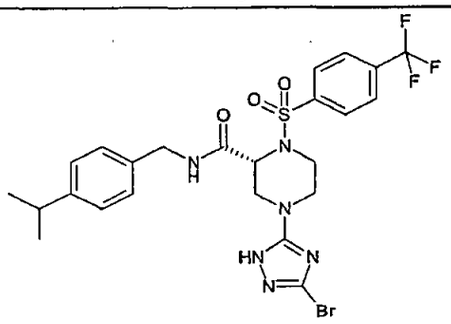
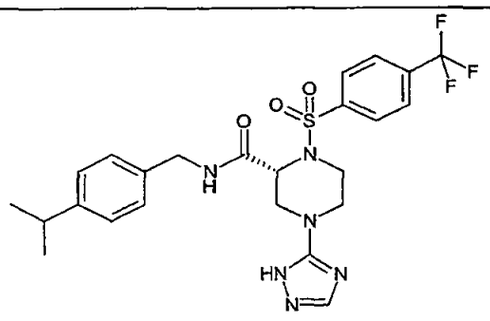
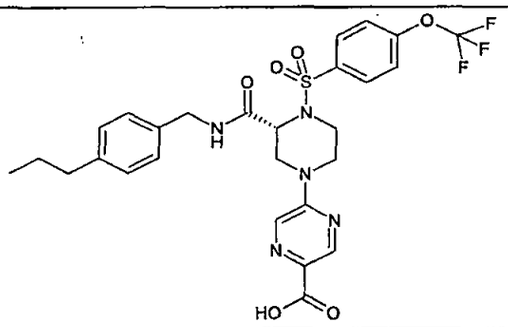
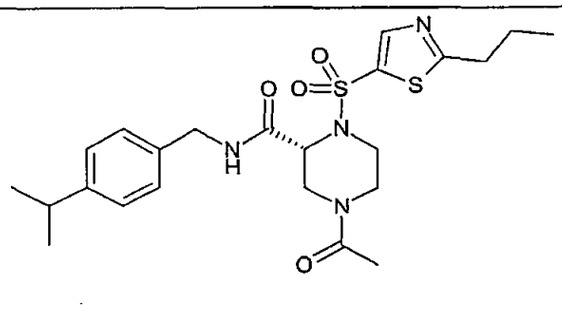
実施例番号	構造式
371	
372	
373	
374	
375	

表76

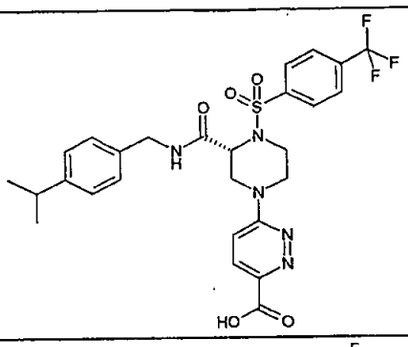
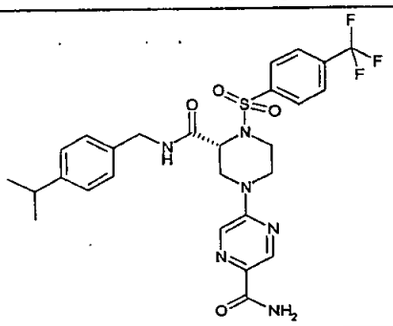
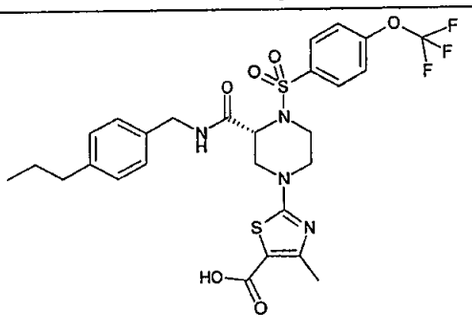
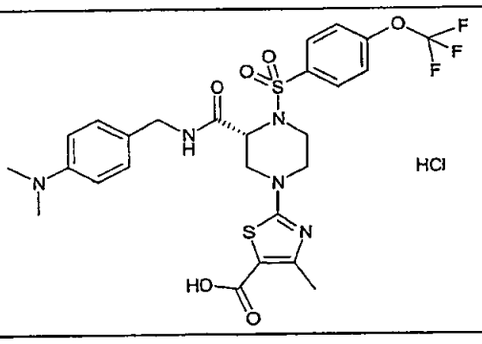
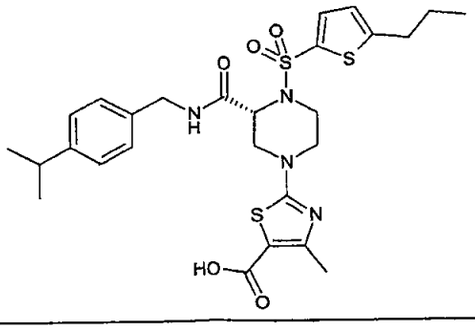
実施例番号	構造式
376	
377	
378	
379	
380	

表77

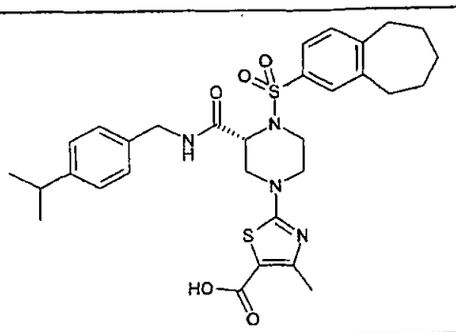
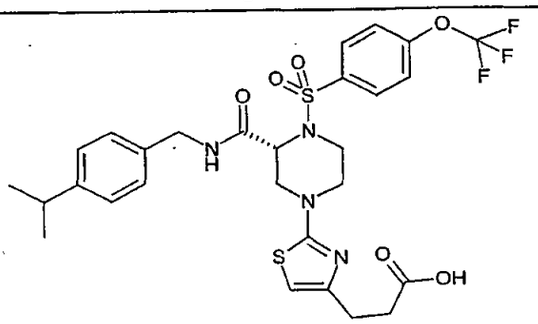
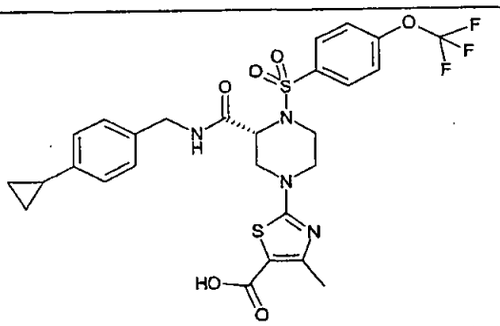
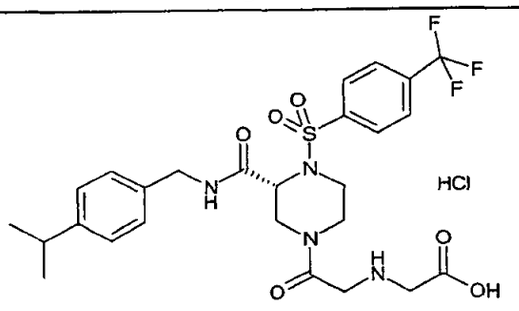
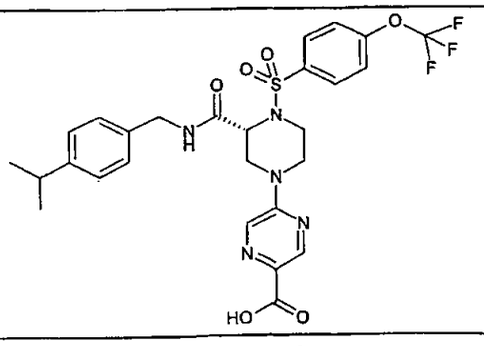
実施例番号	構造式
381	
382	
383	
384	
385	

表78

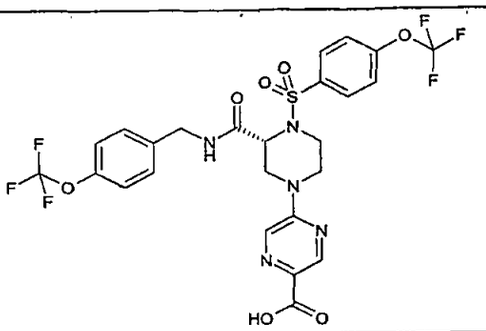
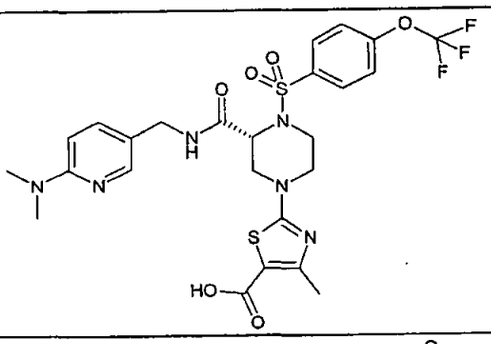
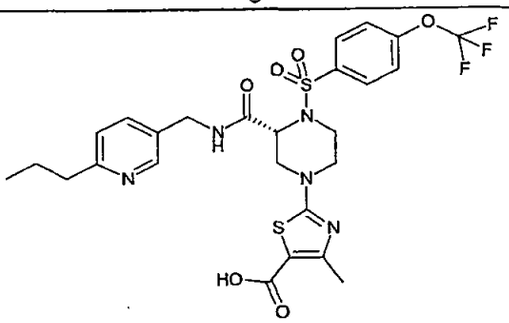
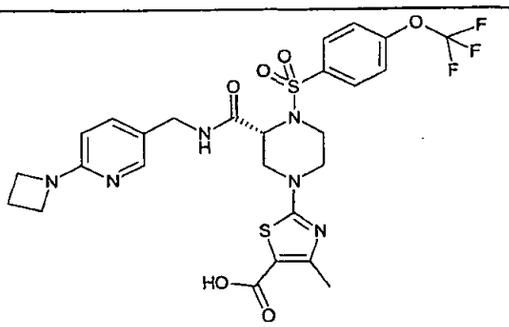
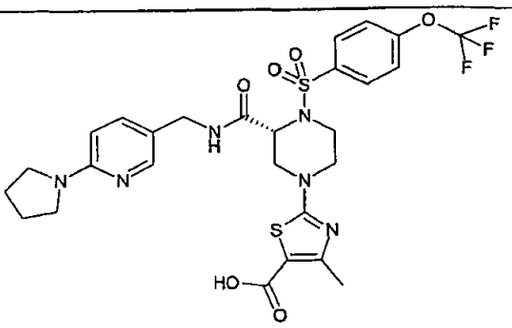
実施例番号	構造式
386	
387	
388	
389	
390	

表79

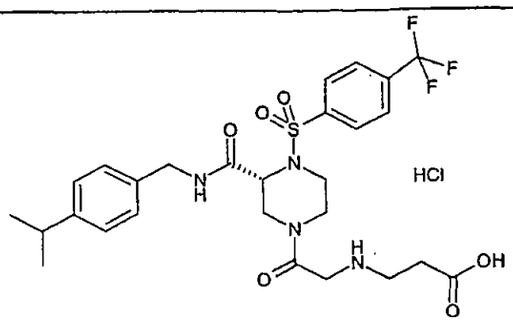
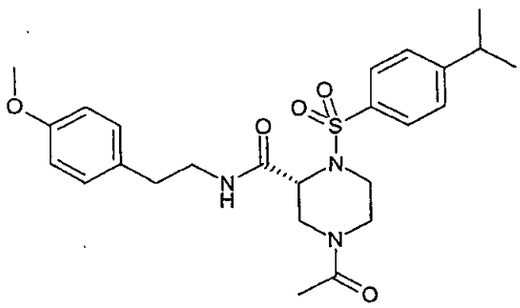
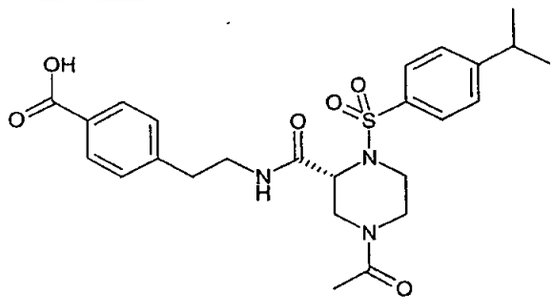
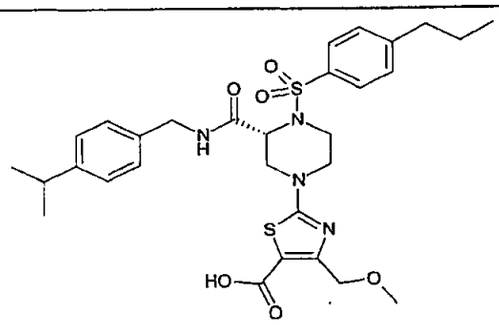
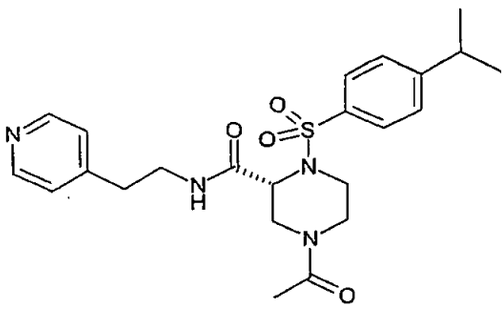
実施例番号	構造式
391	
392	
393	
394	
395	

表80

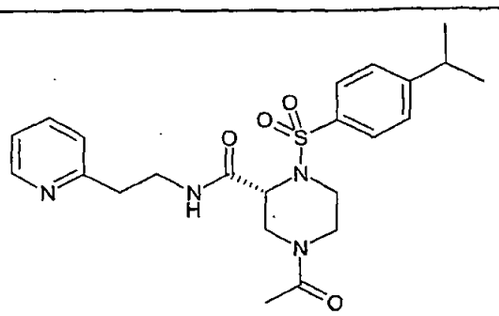
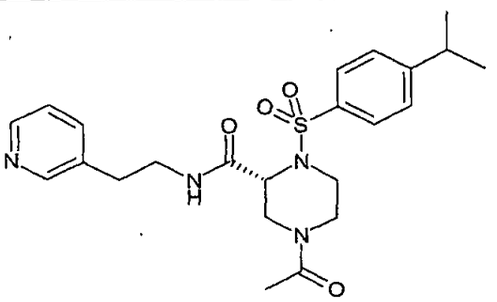
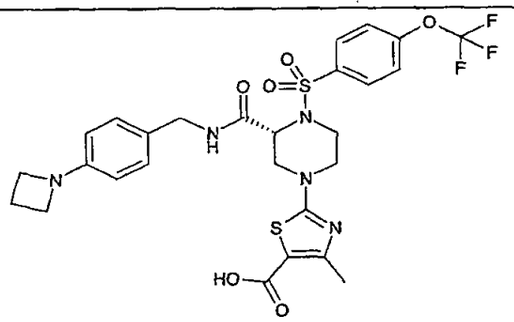
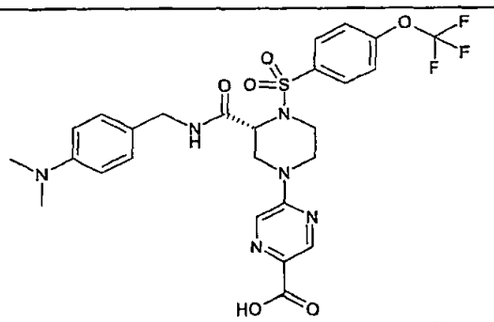
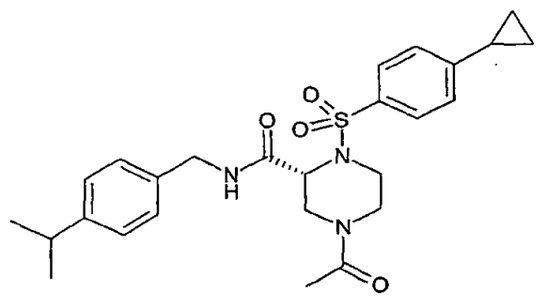
実施例番号	構造式
396	
397	
398	
399	
400	

表81

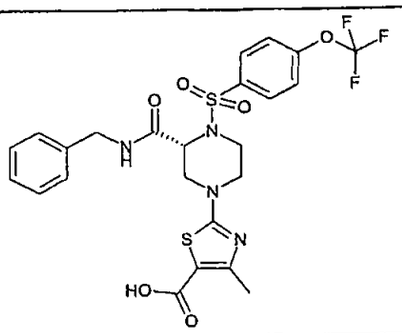
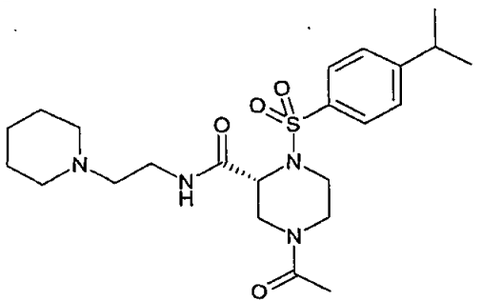
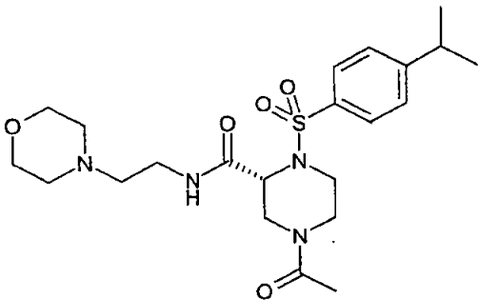
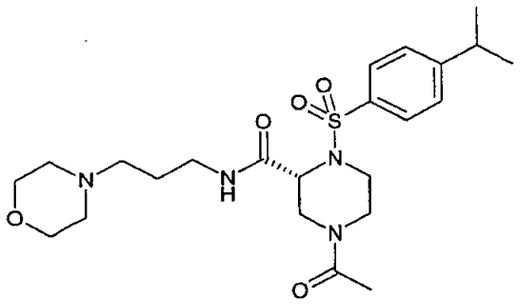
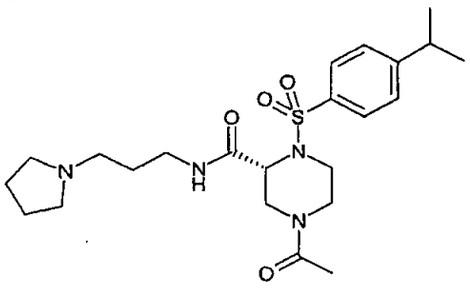
実施例番号	構造式
401	
402	
403	
404	
405	

表82

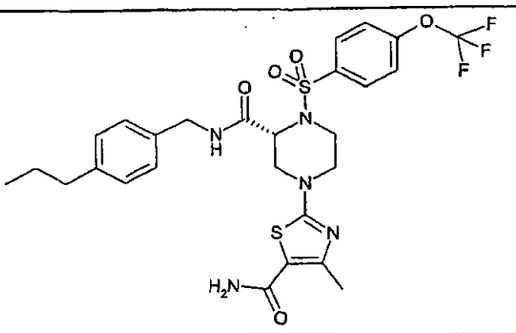
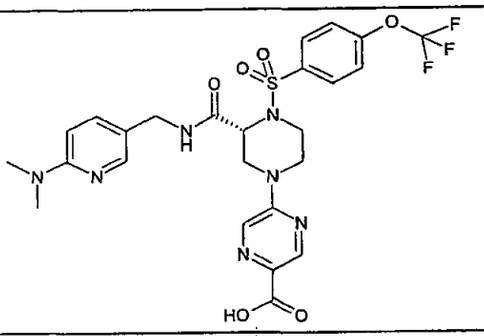
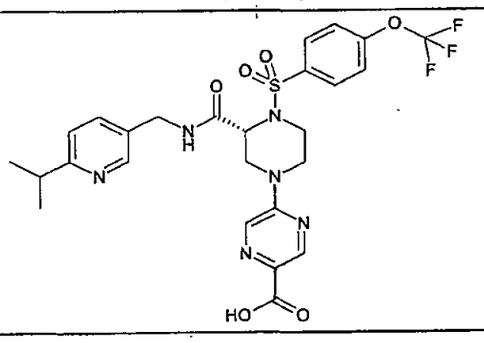
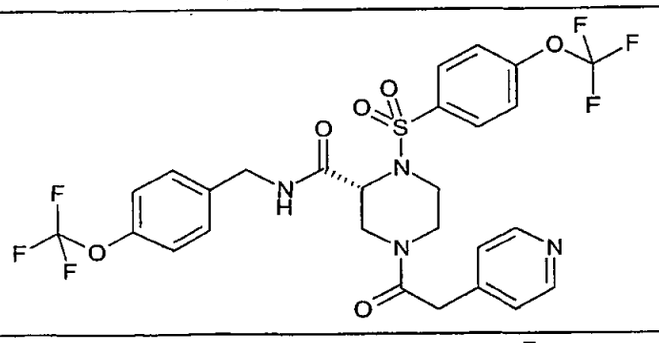
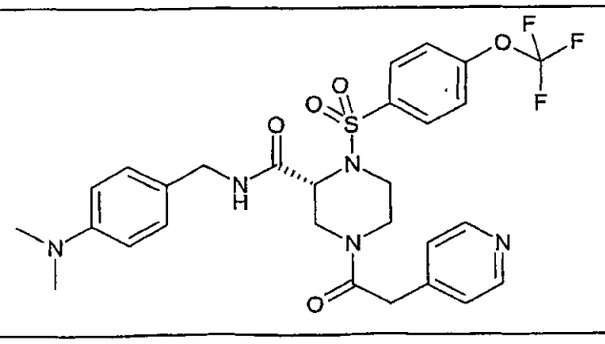
実施例番号	構造式
406	
407	
408	
409	
410	

表83

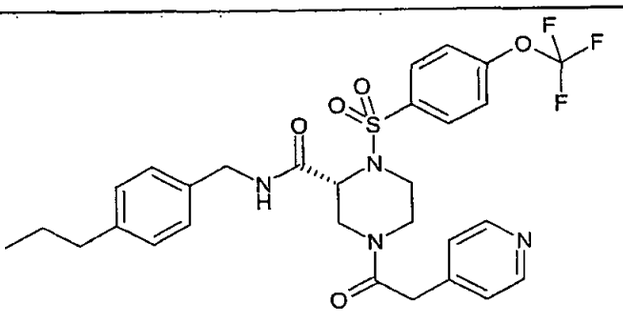
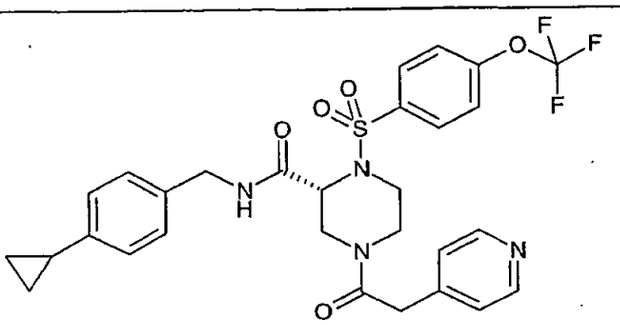
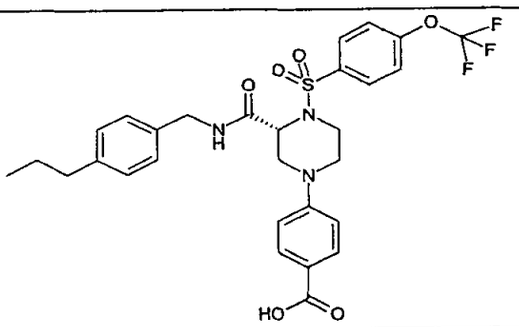
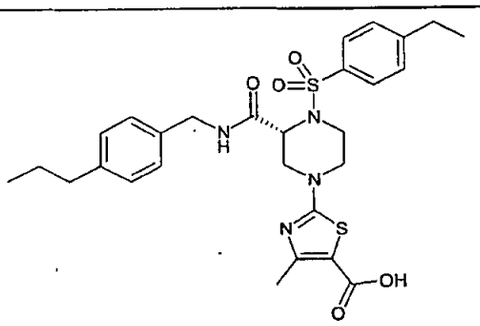
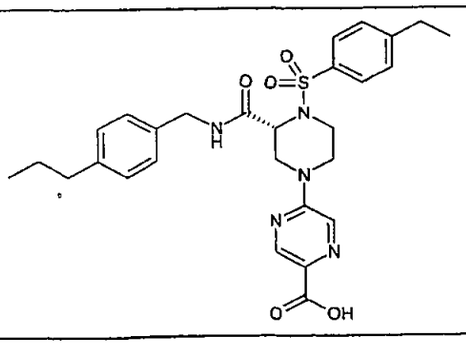
実施例番号	構造式
411	
412	
413	
414	
415	

表84

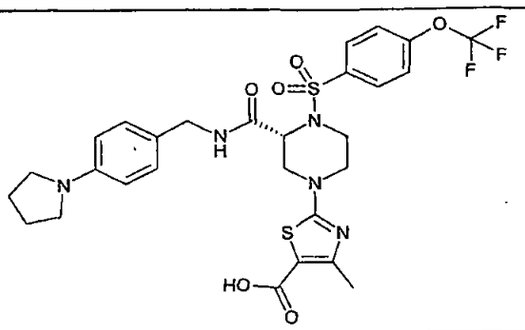
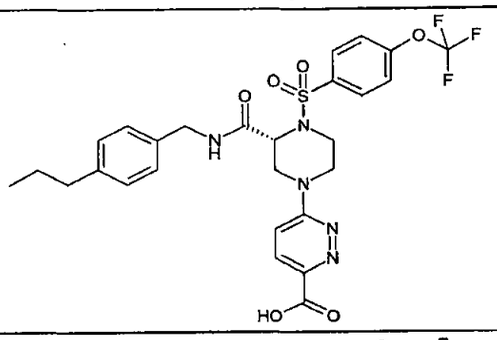
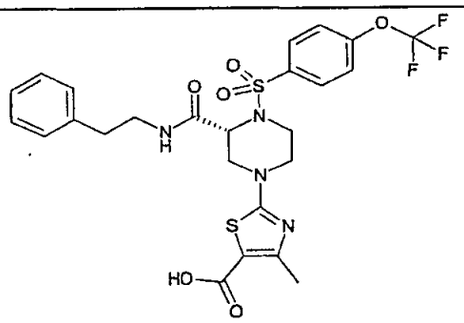
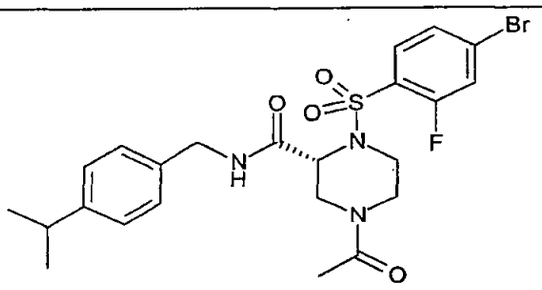
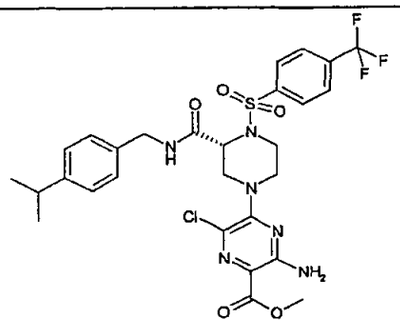
実施例番号	構造式
416	
417	
418	
419	
420	

表85

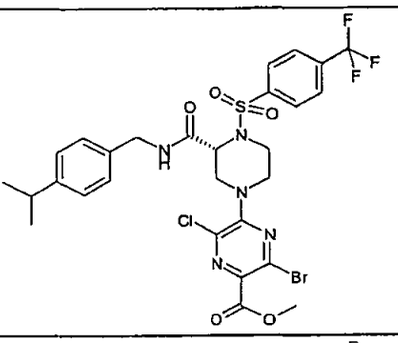
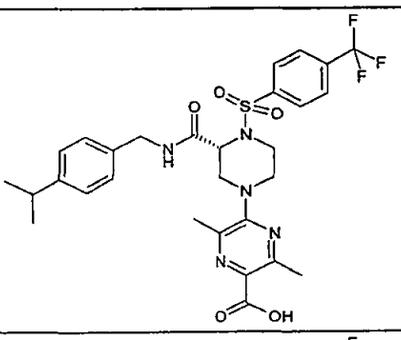
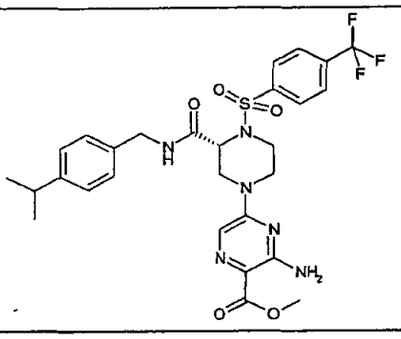
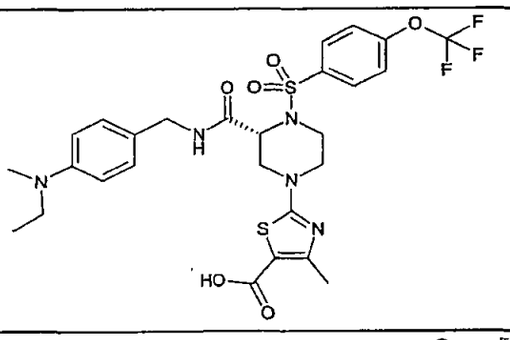
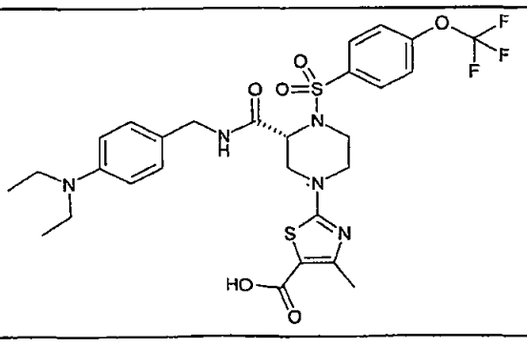
実施例番号	構造式
421	
422	
423	
424	
425	

表86

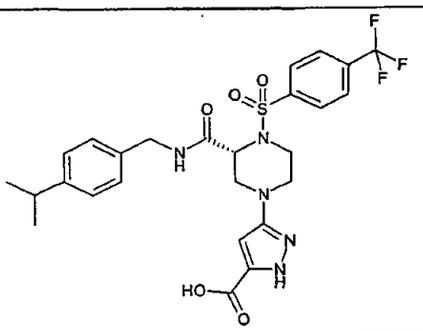
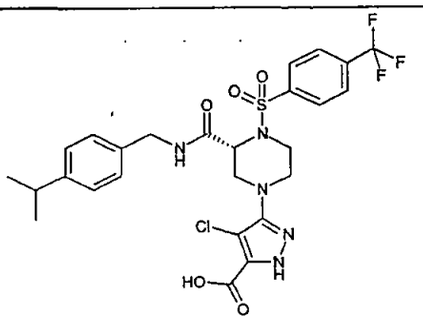
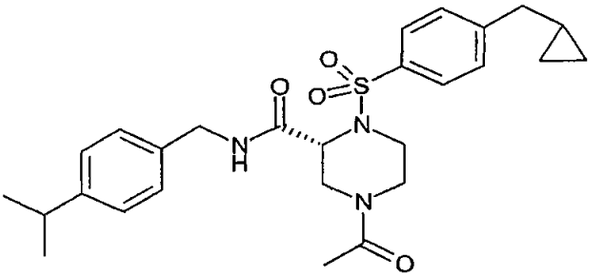
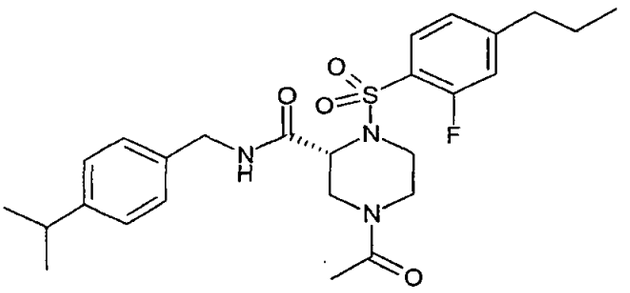
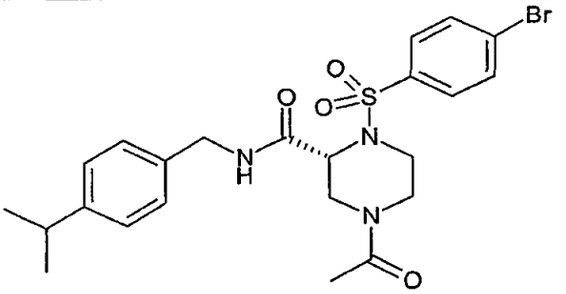
実施例番号	構造式
426	
427	
428	
429	
430	

表87

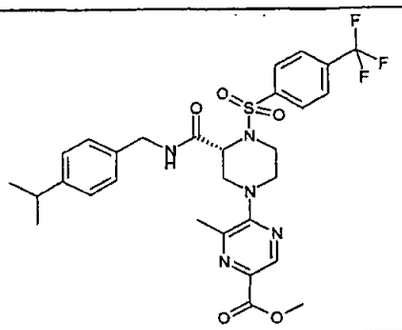
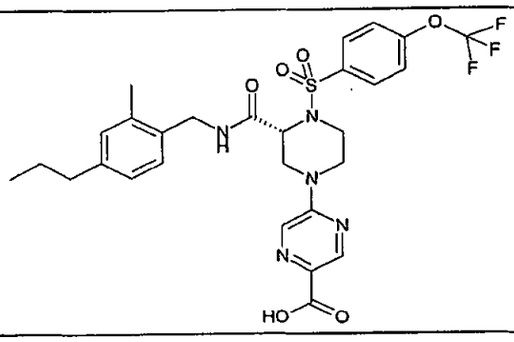
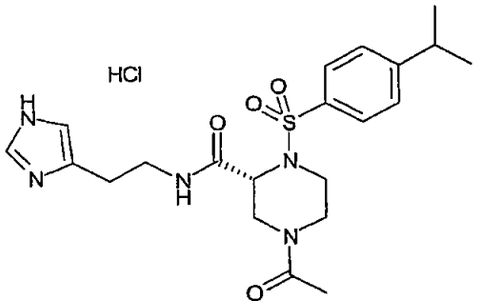
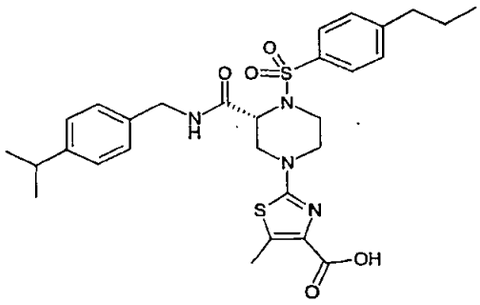
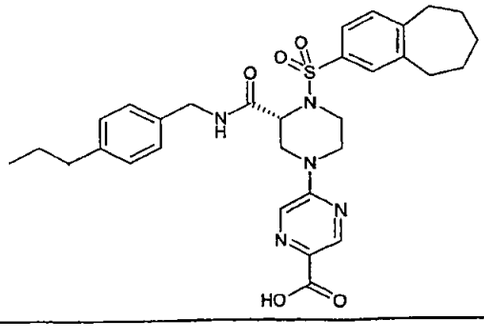
実施例番号	構造式
431	
432	
433	
434	
435	

表88

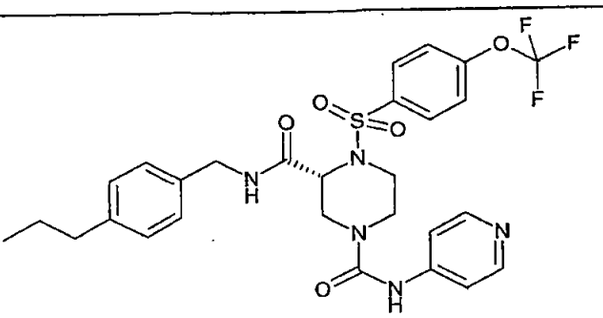
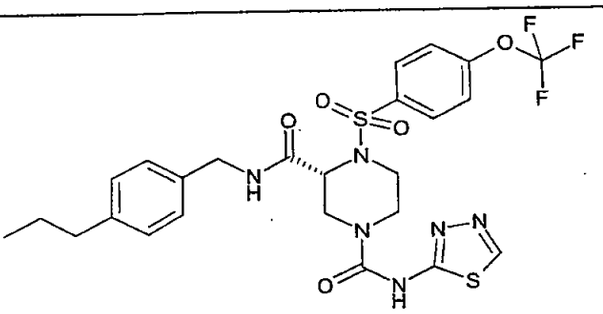
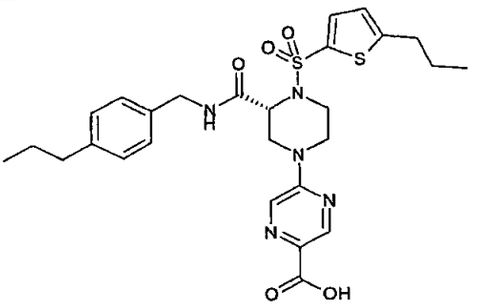
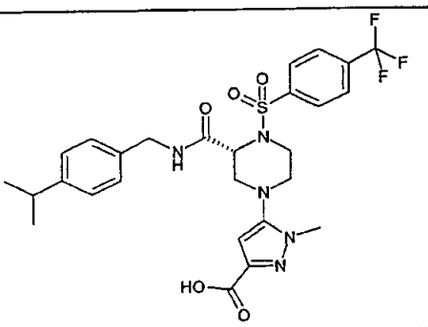
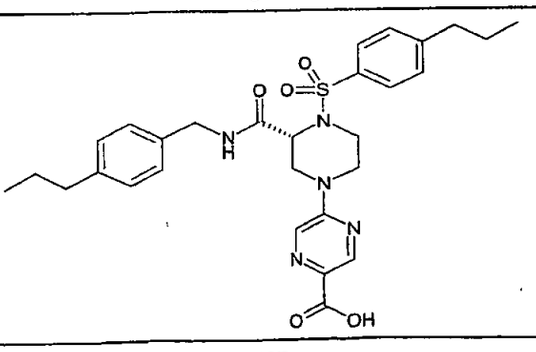
実施例番号	構造式
436	
437	
438	
439	
440	

表89

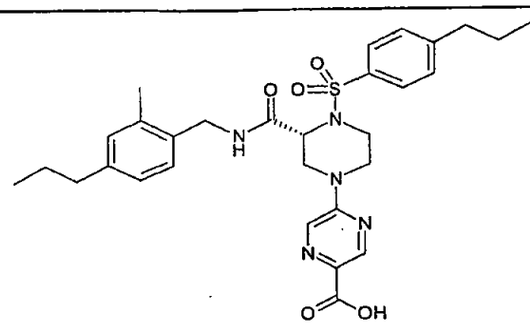
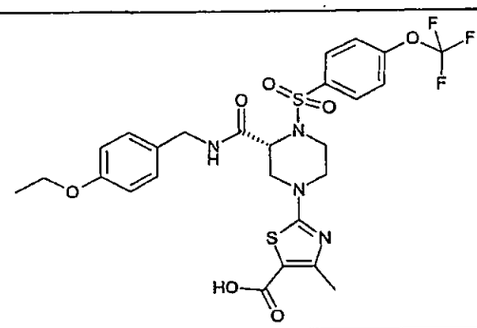
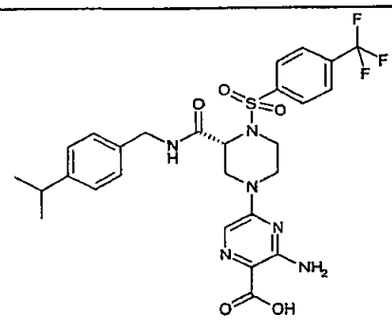
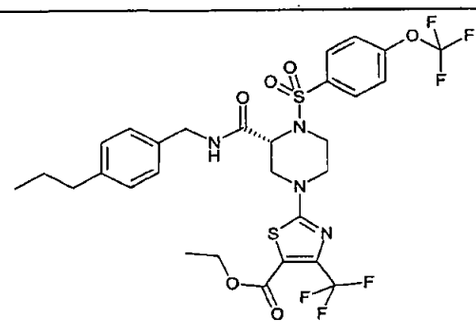
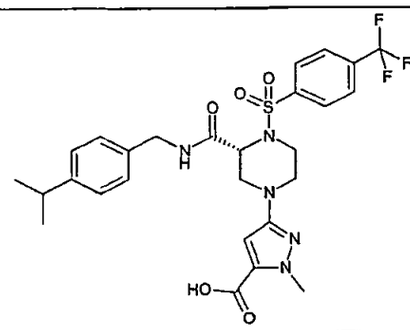
実施例番号	構造式
441	
442	
443	
444	
445	

表90

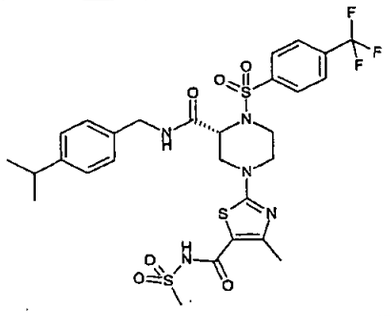
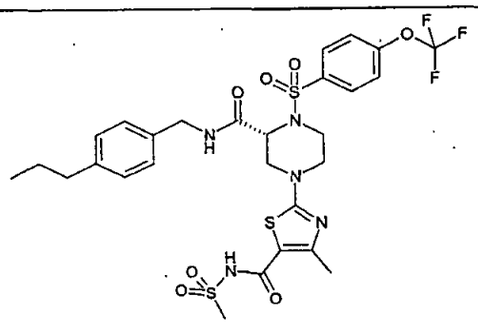
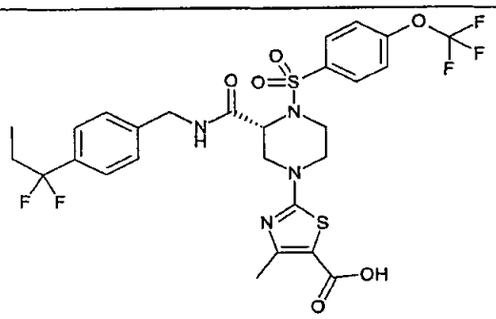
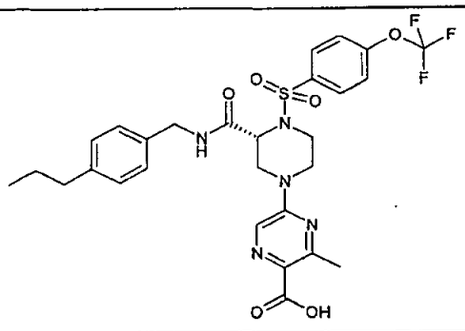
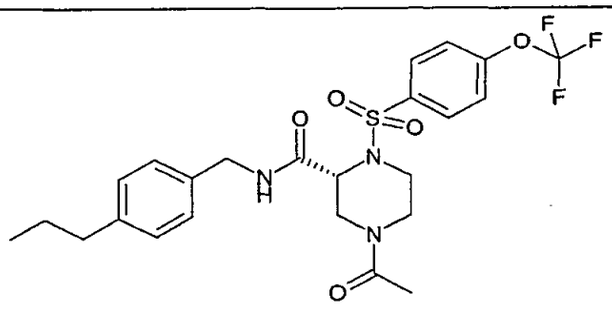
実施例番号	構造式
446	
447	
448	
449	
450	

表91

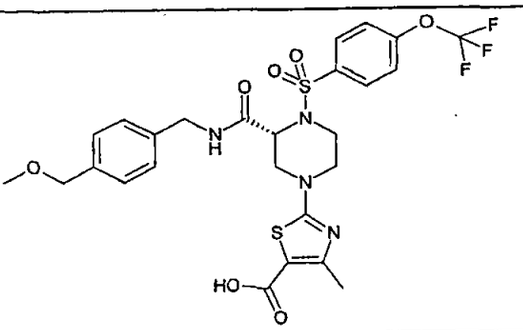
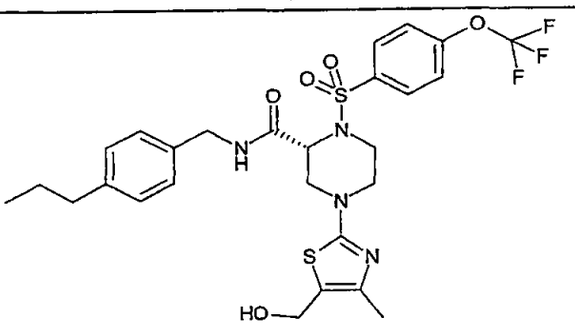
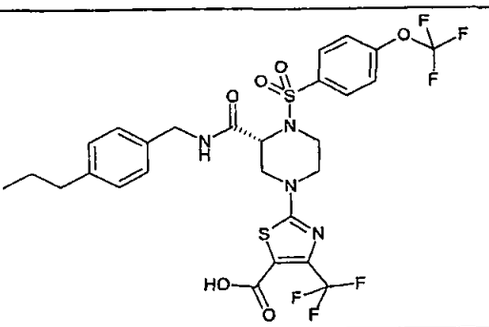
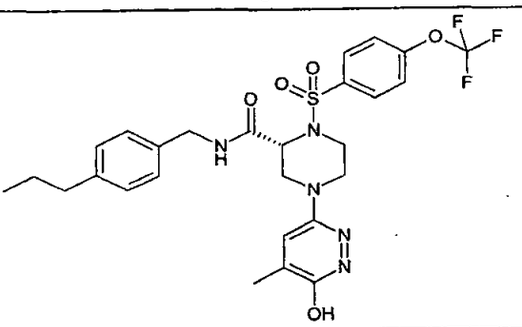
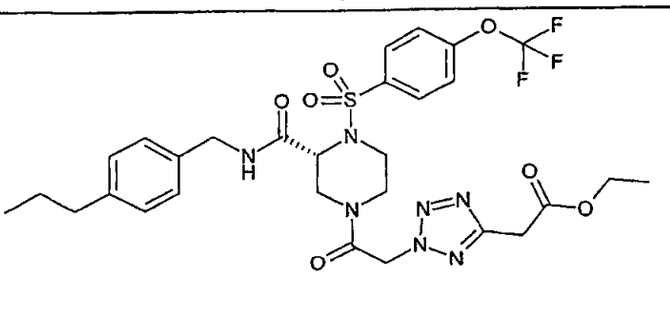
実施例番号	構造式
451	
452	
453	
454	
455	

表92

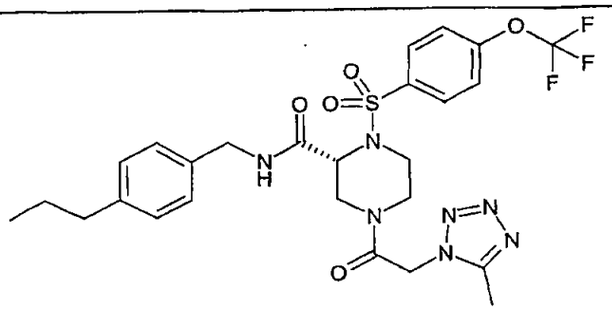
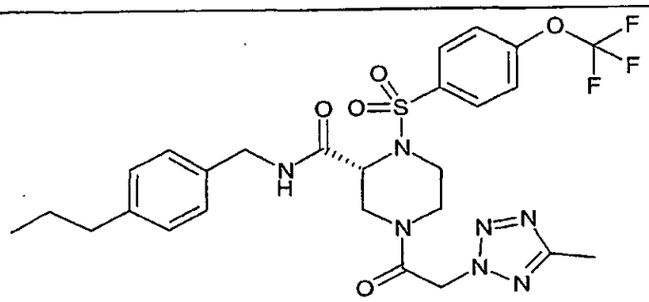
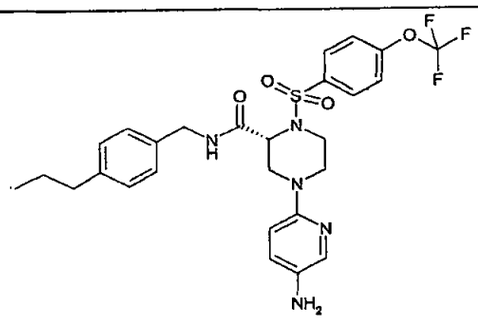
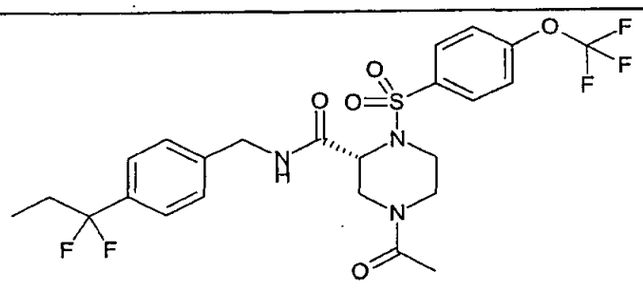
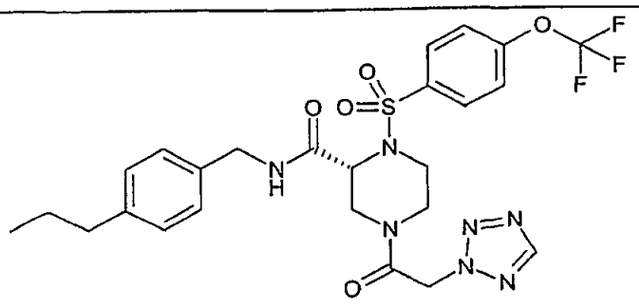
実施例番号	構造式
456	
457	
458	
459	
460	

表93

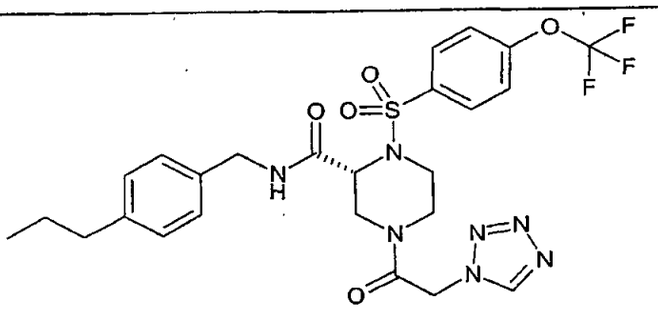
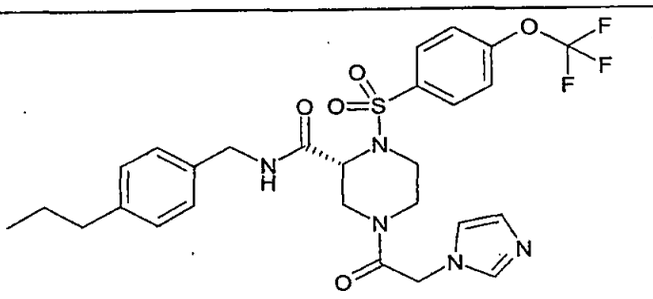
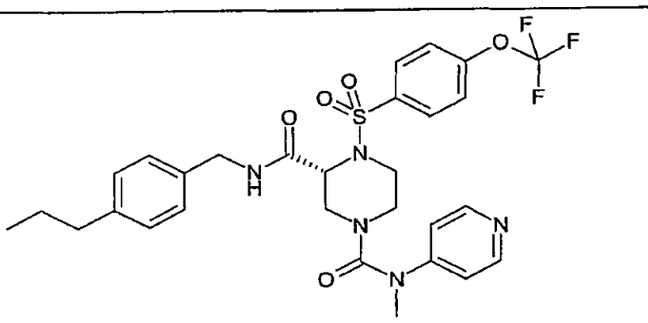
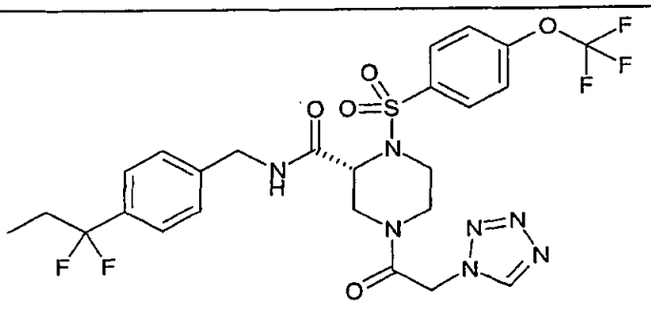
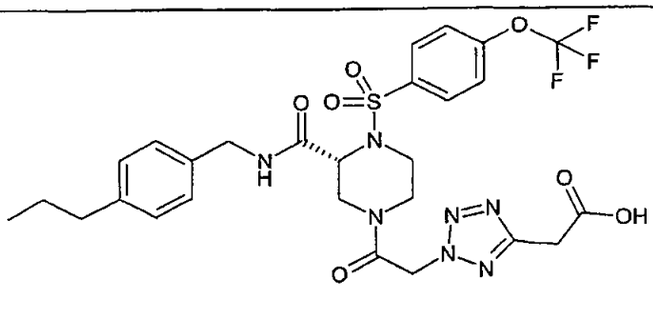
実施例番号	構造式
461	
462	
463	
464	
465	

表94

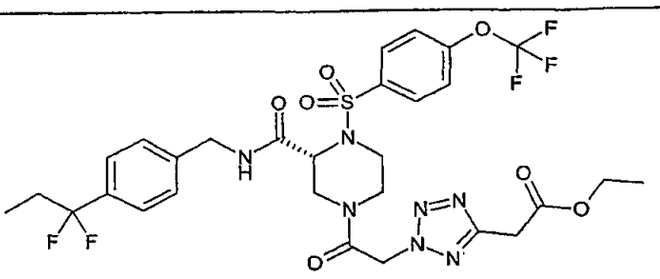
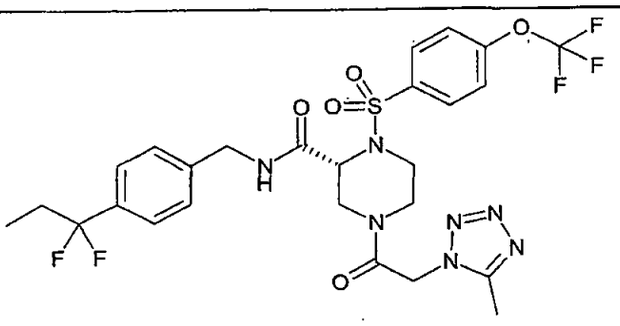
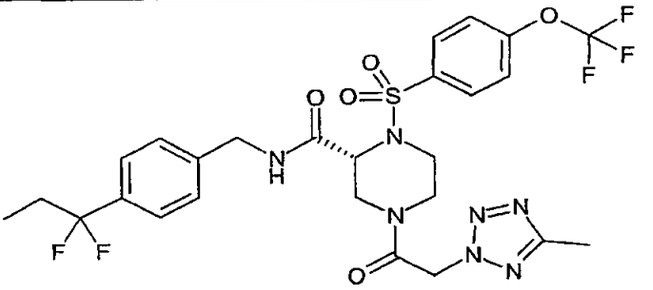
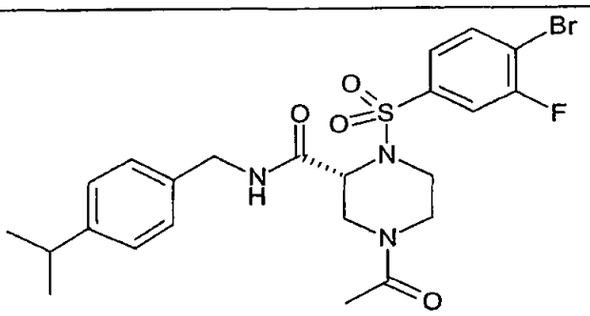
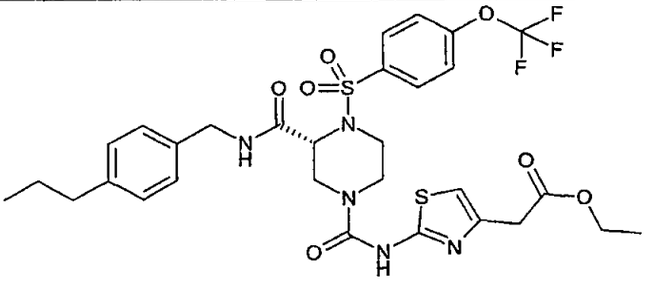
実施例番号	構造式
466	
467	
468	
469	
470	

表95

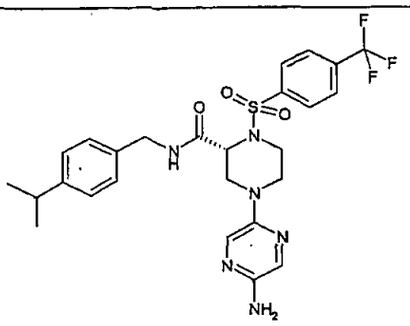
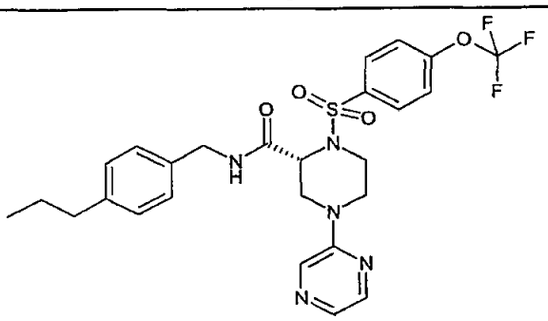
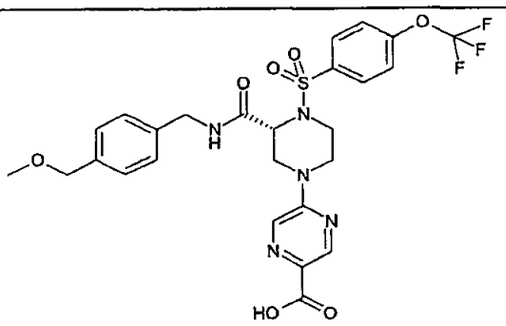
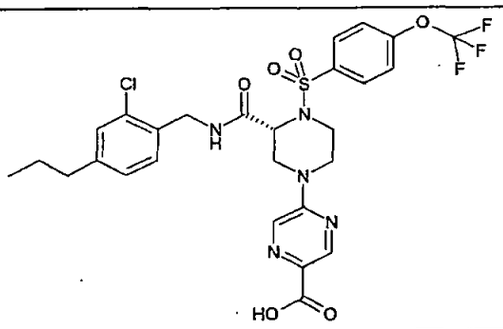
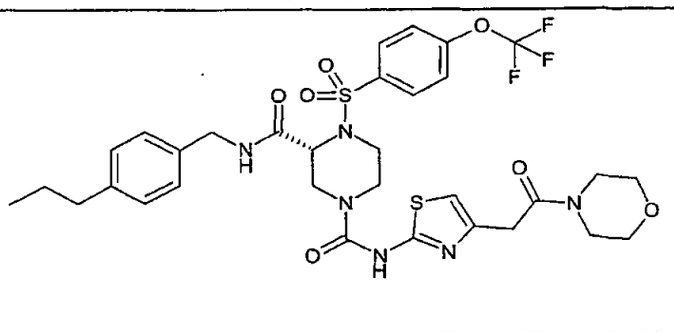
実施例番号	構造式
471	
472	
473	
474	
475	

表96

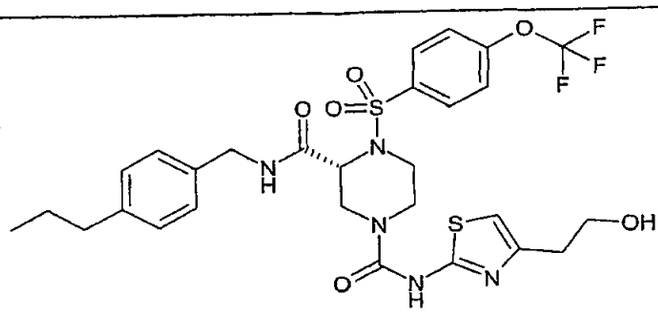
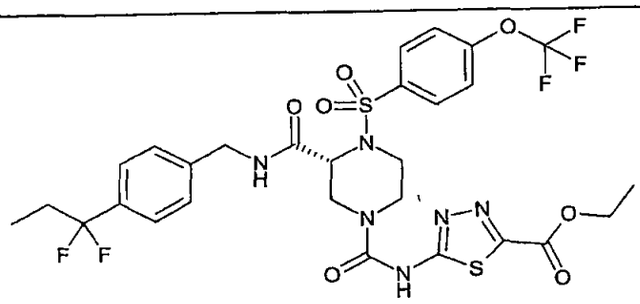
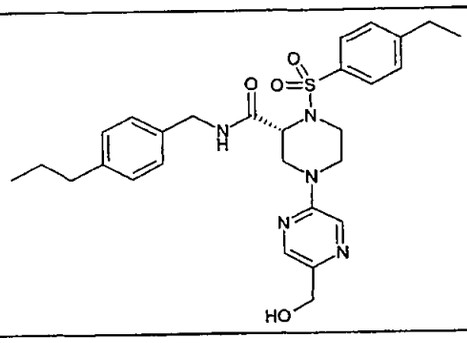
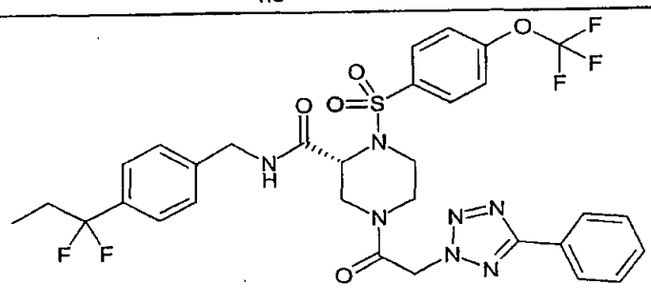
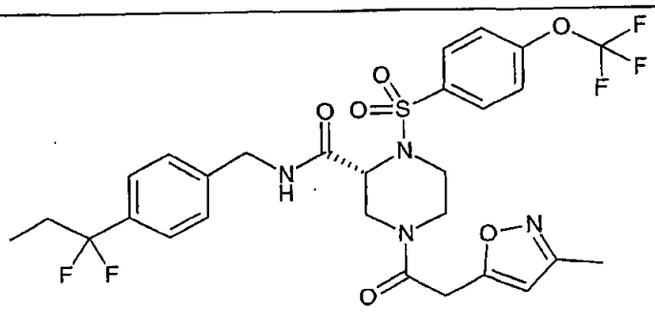
実施例番号	構造式
476	
477	
478	
479	
480	

表97

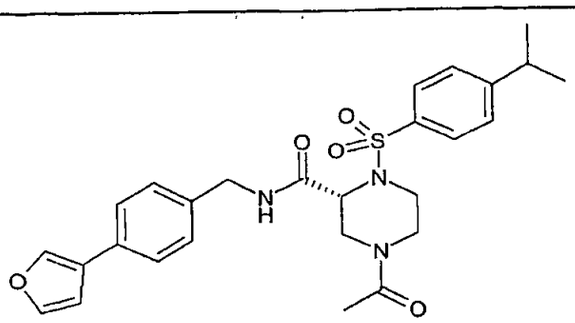
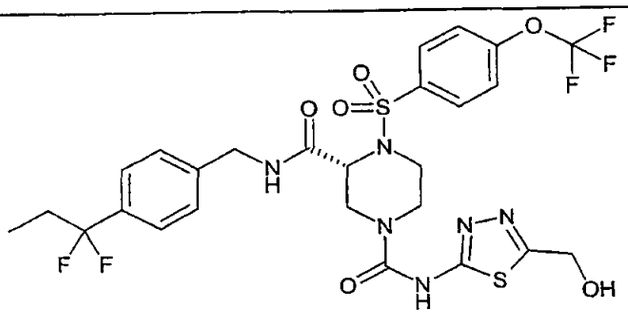
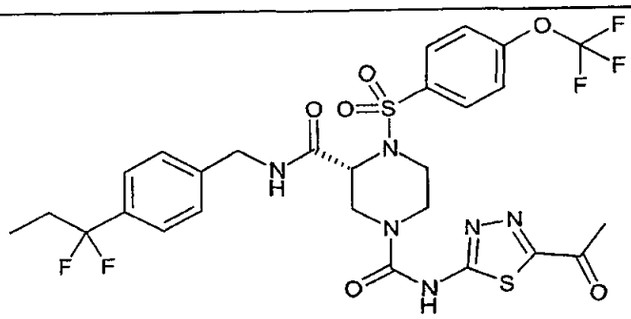
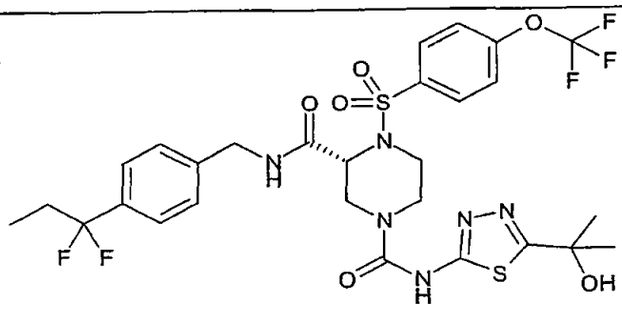
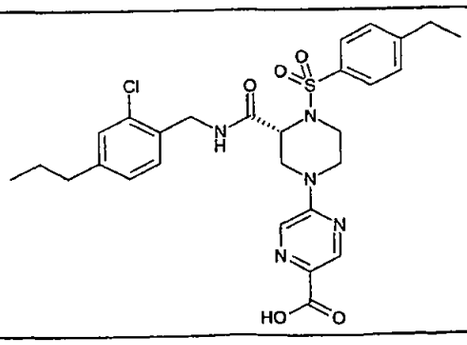
実施例番号	構造式
481	
482	
483	
484	
485	

表98

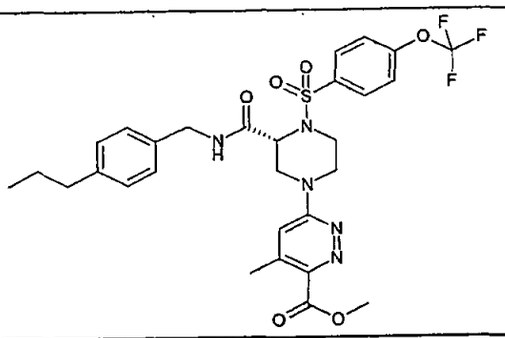
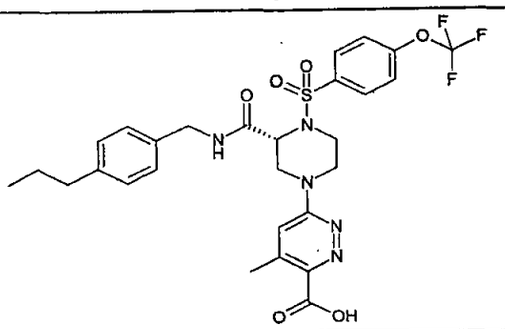
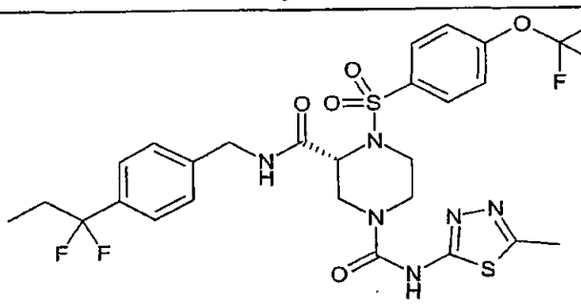
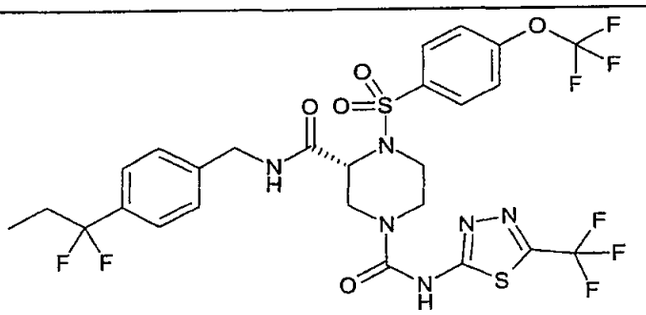
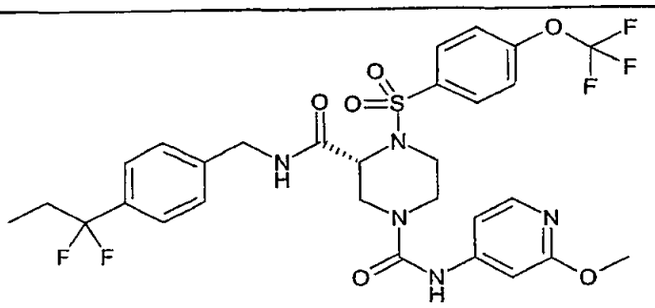
実施例番号	構造式
486	
487	
488	
489	
490	

表99

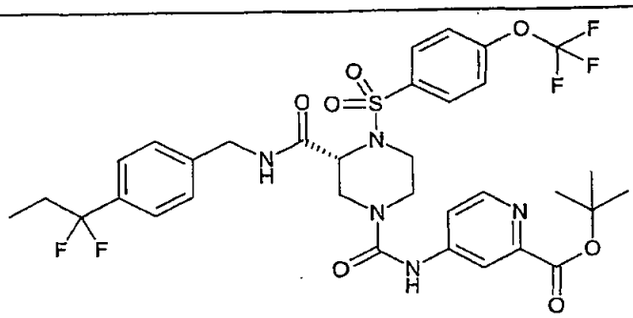
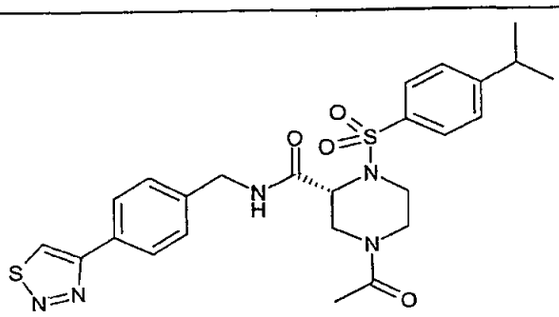
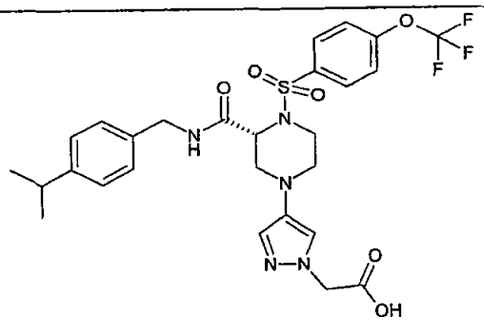
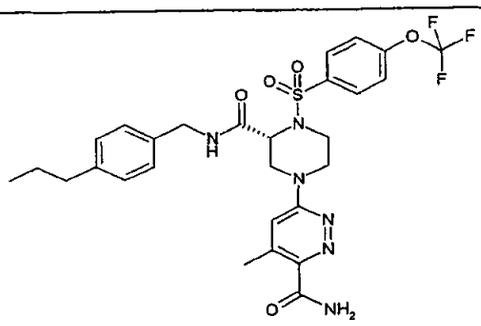
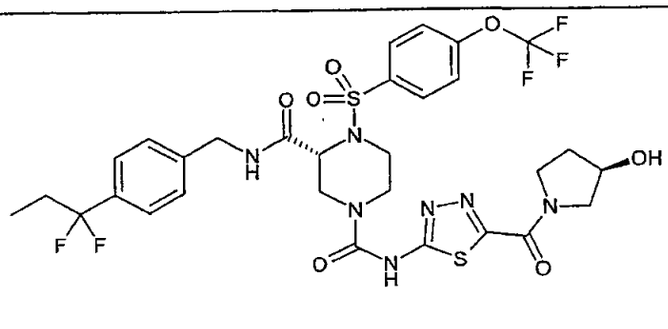
実施例番号	構造式
491	
492	
493	
494	
495	

表100

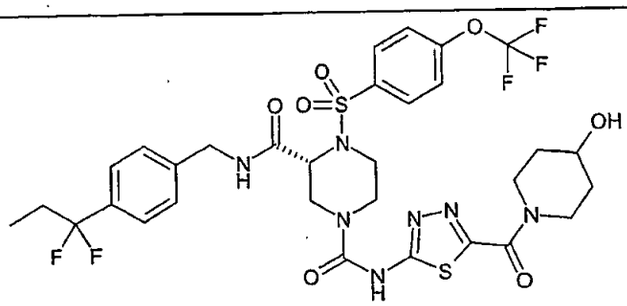
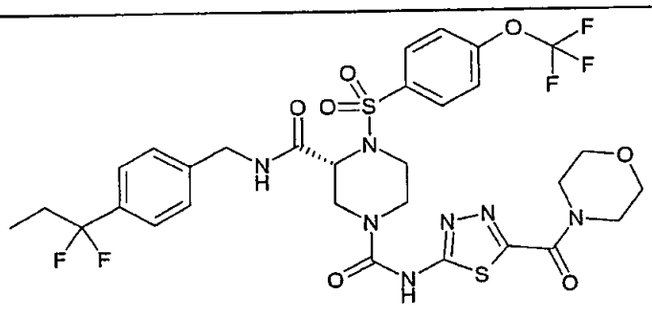
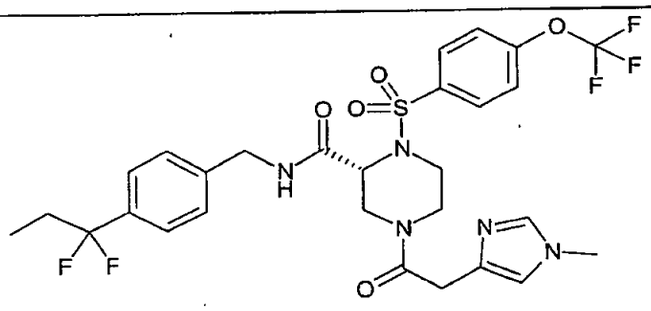
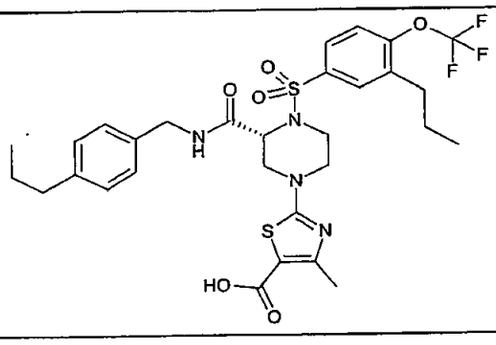
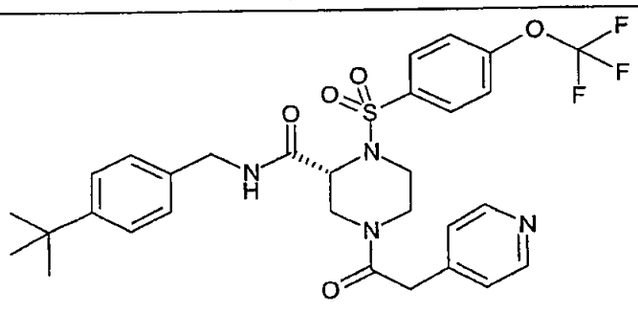
実施例番号	構造式
496	
497	
498	
499	
500	

表101

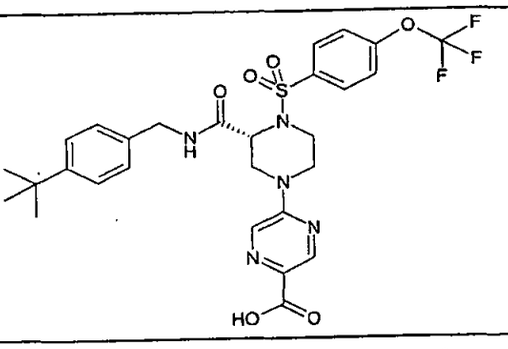
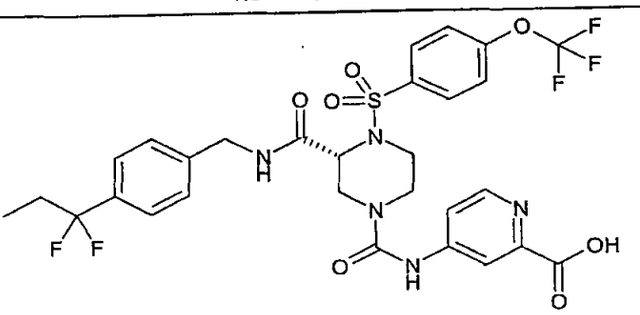
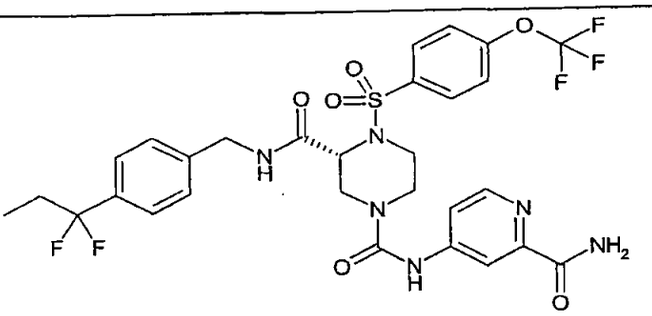
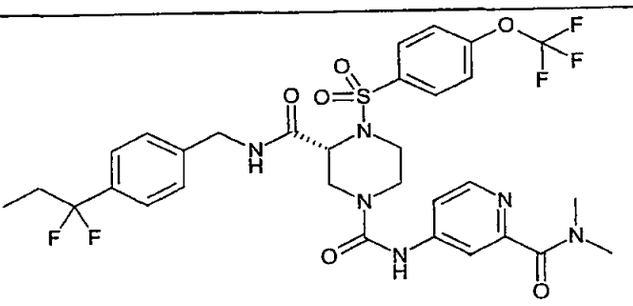
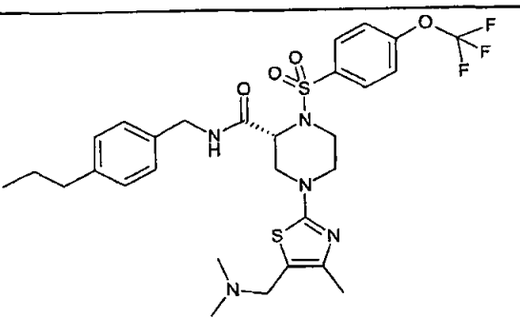
実施例番号	構造式
501	
502	
503	
504	
505	

表102

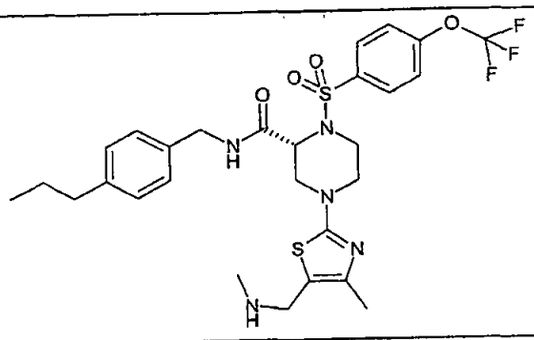
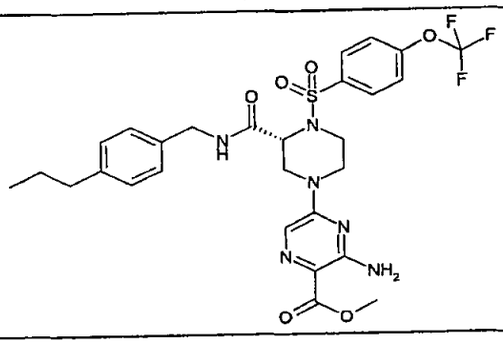
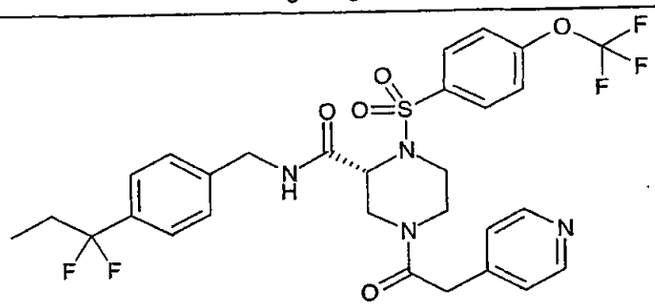
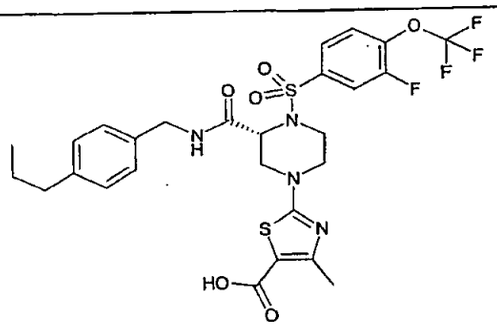
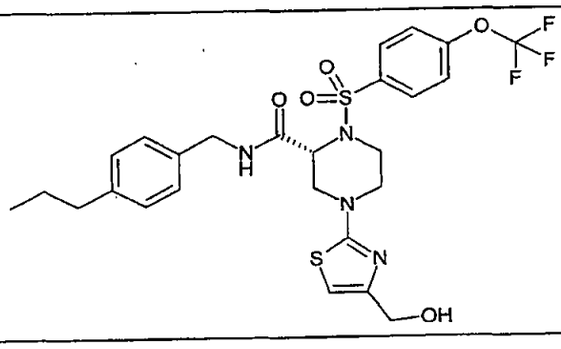
実施例番号	構造式
506	
507	
508	
509	
510	

表103

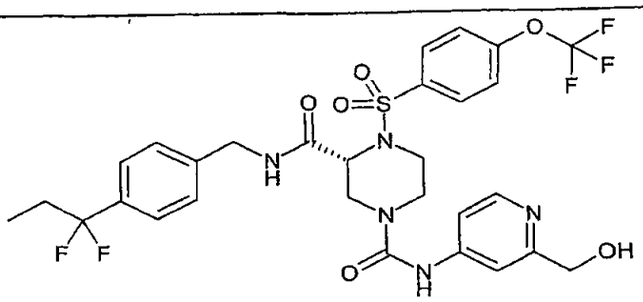
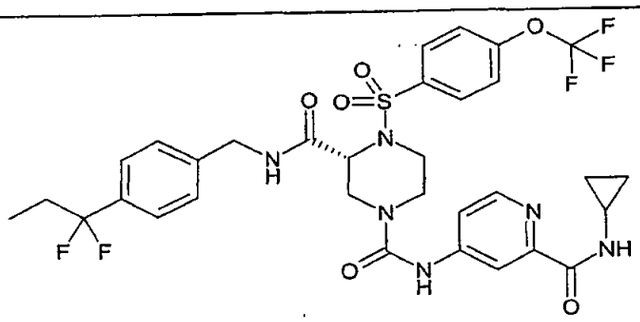
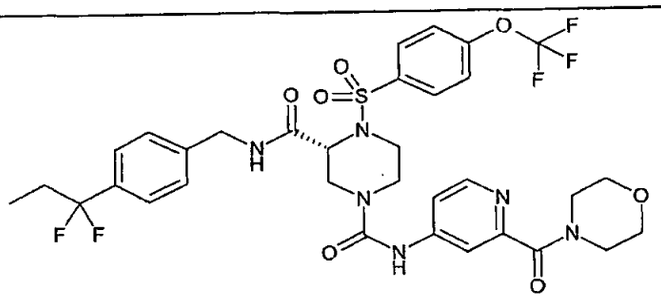
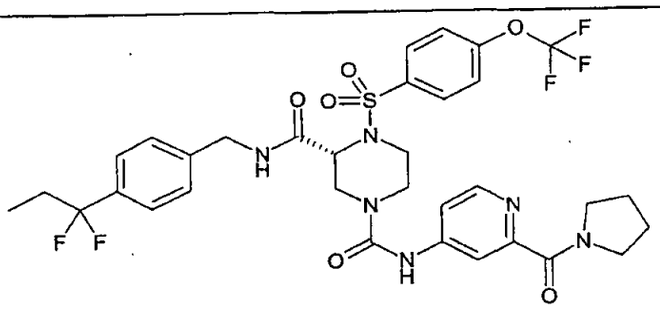
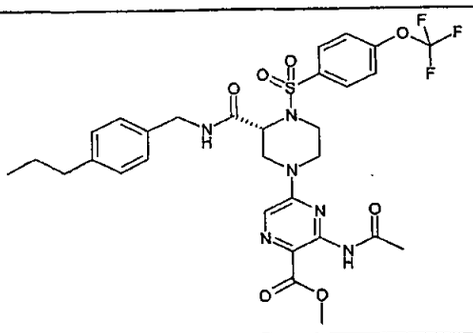
実施例番号	構造式
511	
512	
513	
514	
515	

表104

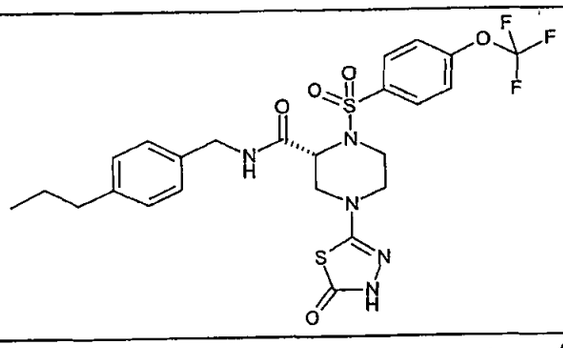
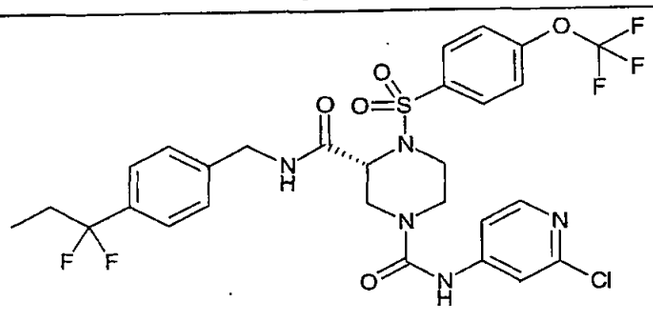
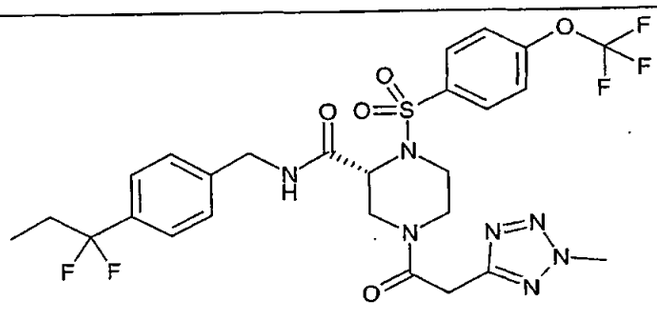
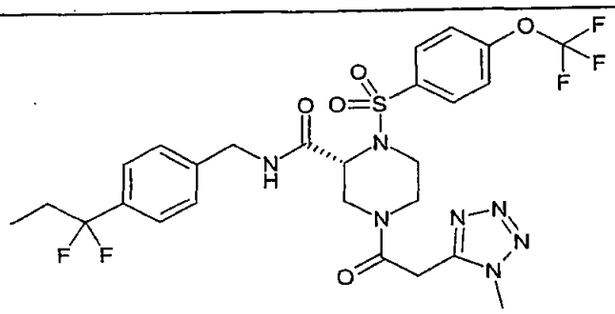
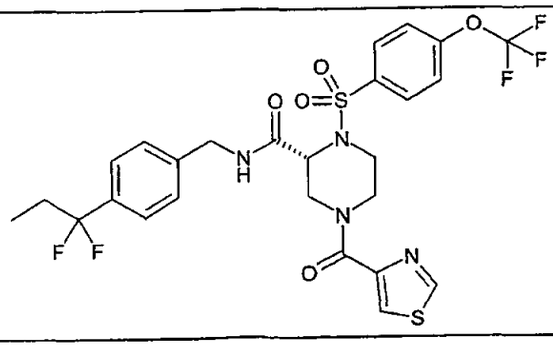
実施例番号	構造式
516	
517	
518	
519	
520	

表105

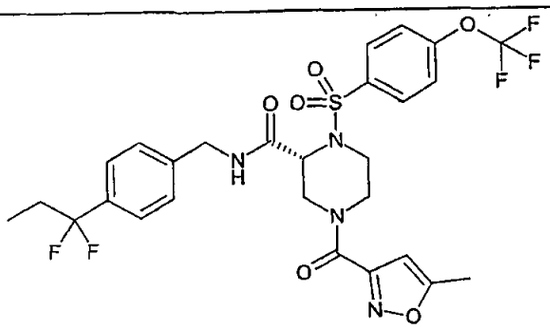
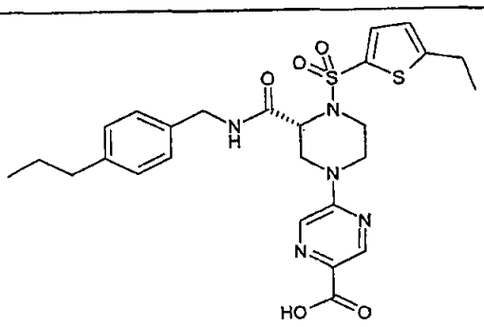
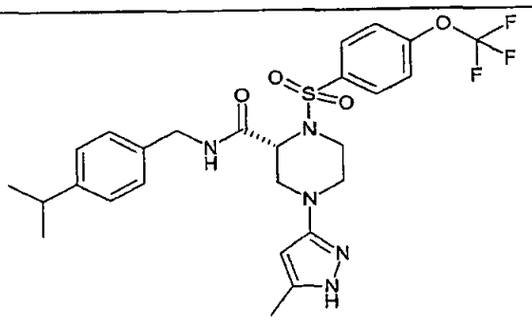
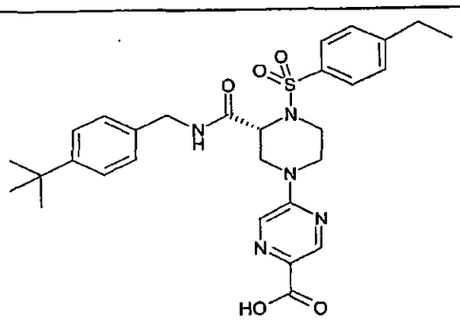
実施例番号	構造式
521	
522	
523	
524	

表106

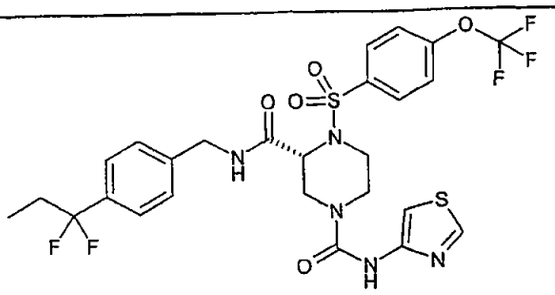
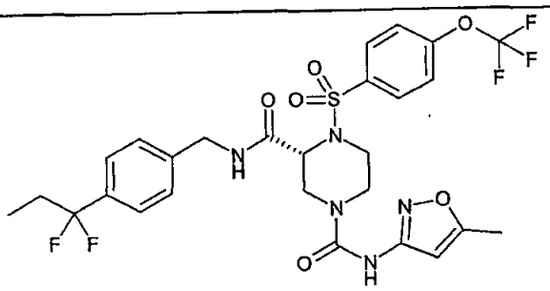
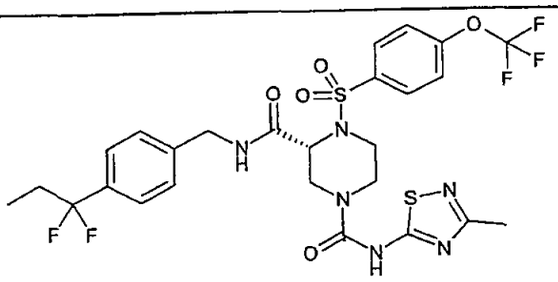
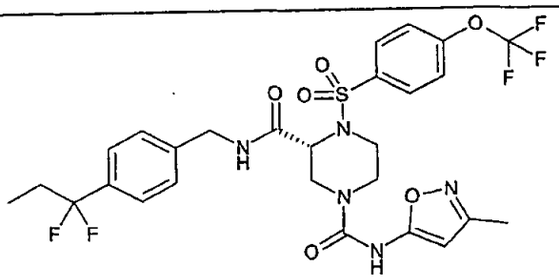
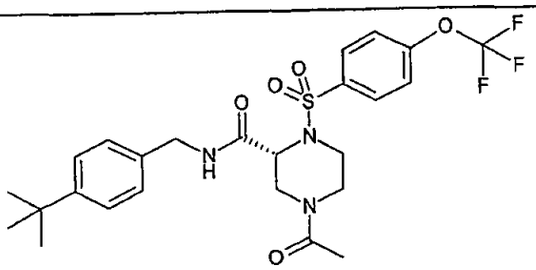
実施例番号	構造式
525	
526	
527	
528	
529	

表107

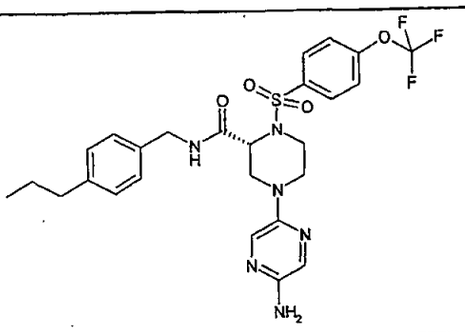
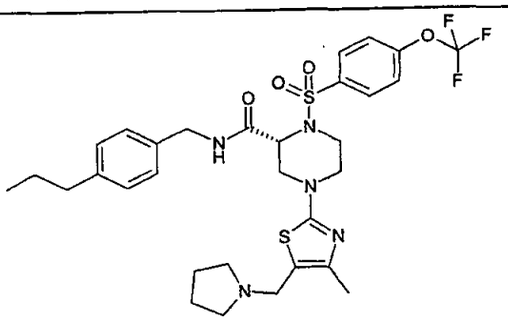
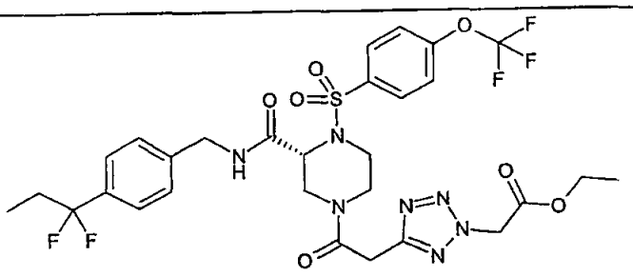
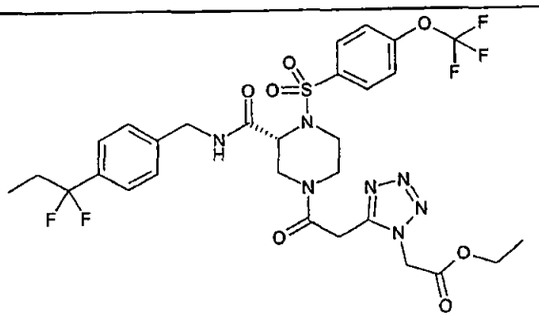
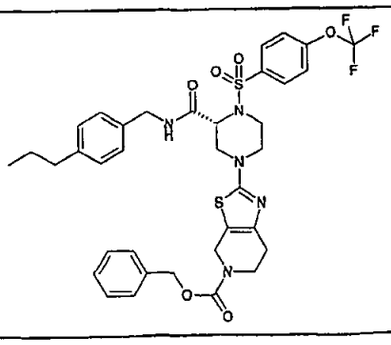
実施例番号	構造式
530	
531	
532	
533	
534	

表108

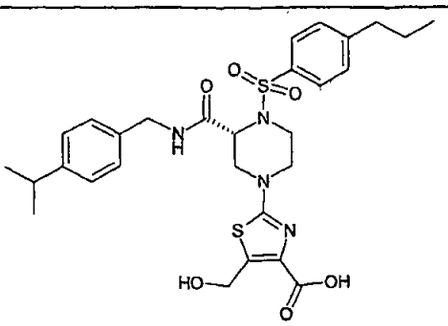
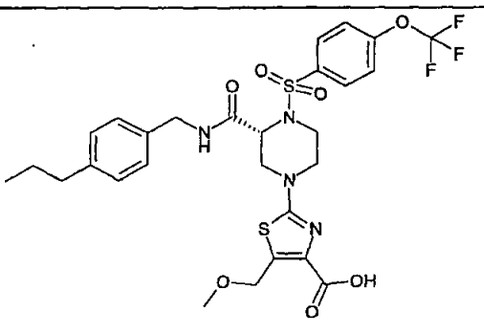
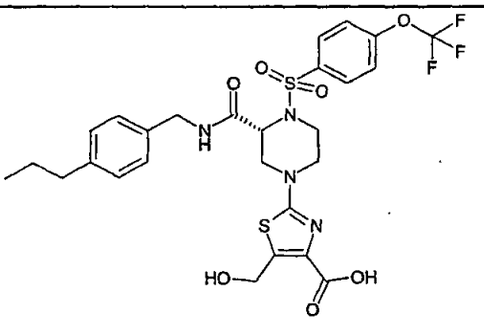
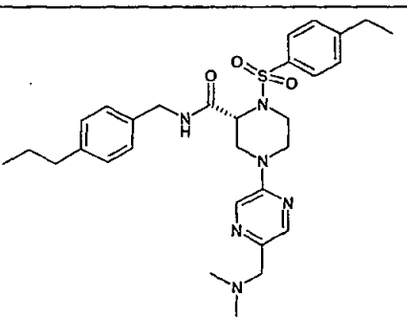
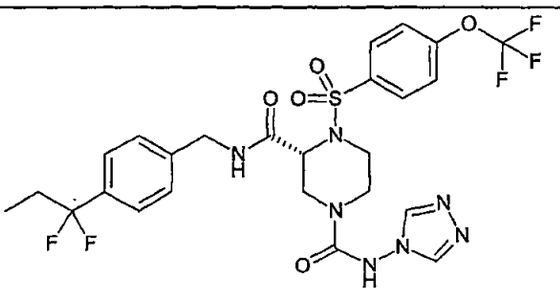
実施例番号	構造式
535	
536	
537	
538	
539	

表109

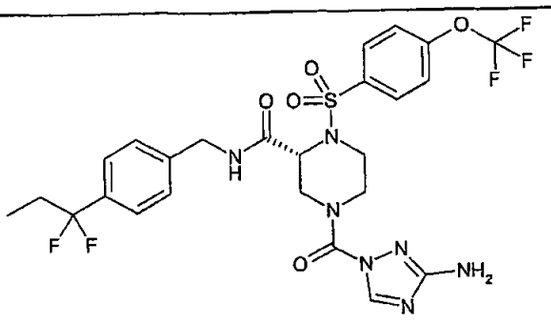
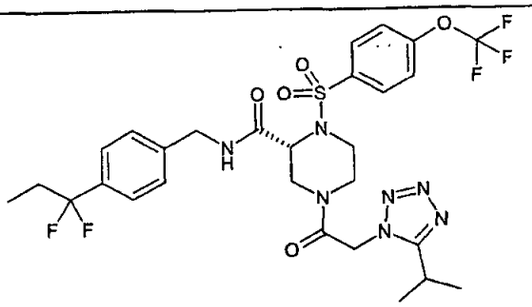
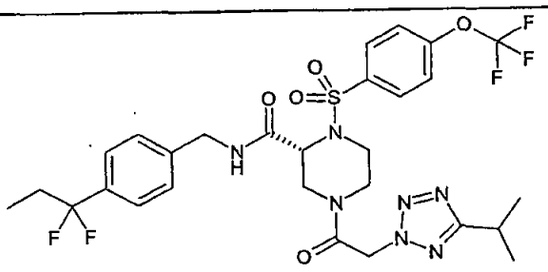
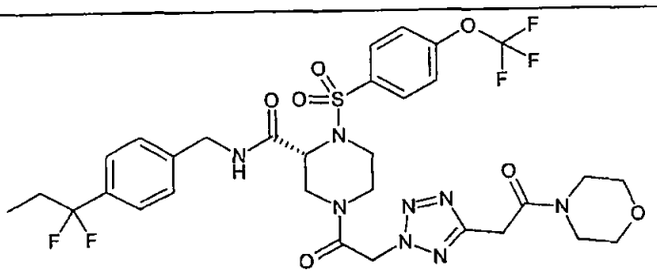
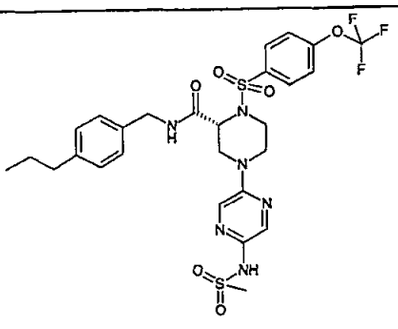
実施例番号	構造式
540	
541	
542	
543	
544	

表110

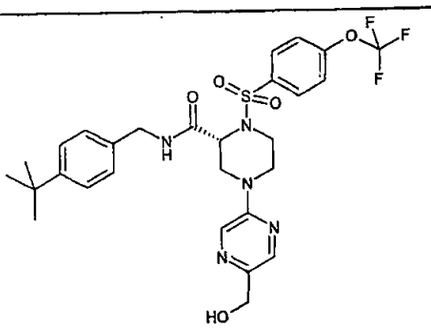
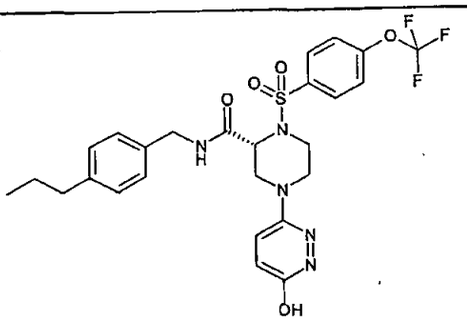
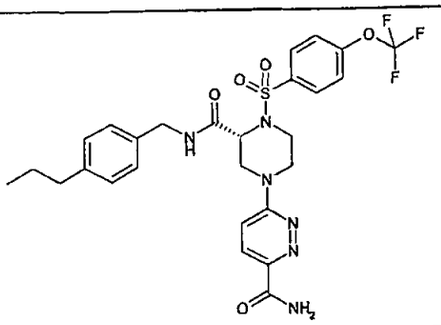
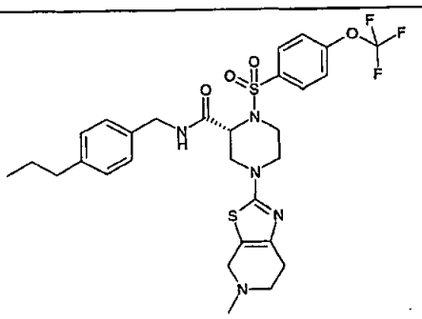
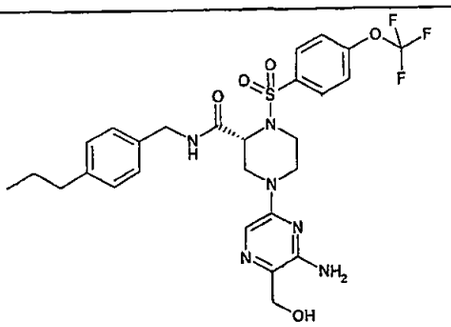
実施例番号	構造式
545	
546	
547	
548	
549	

表111

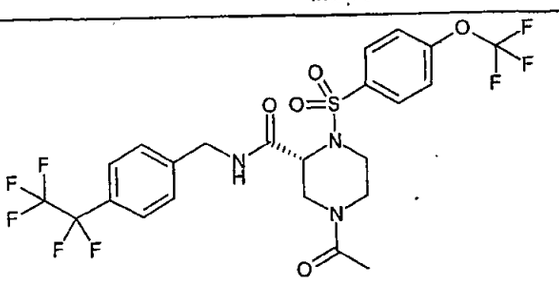
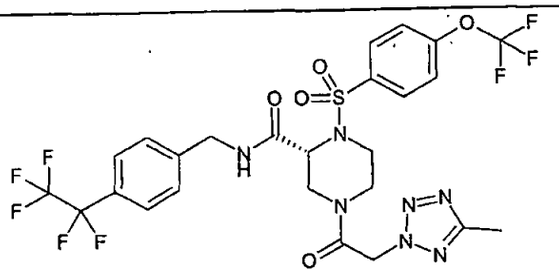
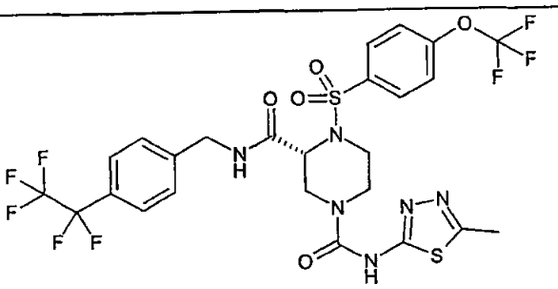
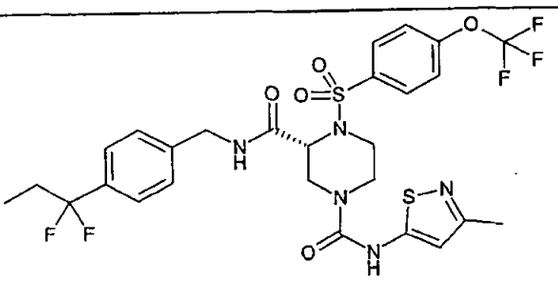
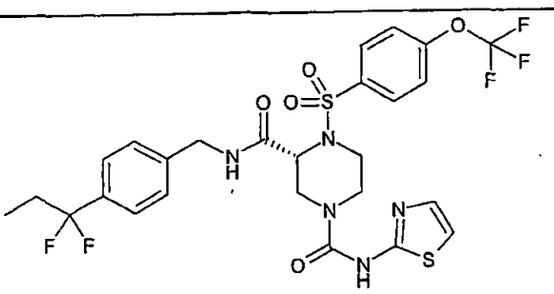
実施例番号	構造式
550	
551	
552	
553	
554	

表112

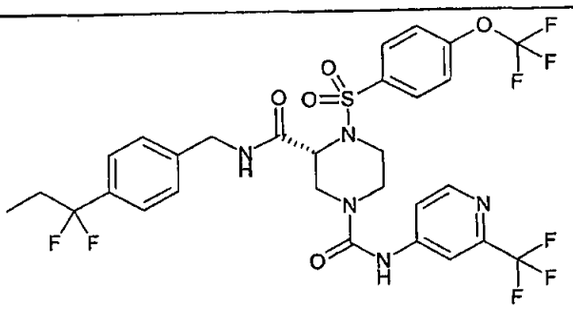
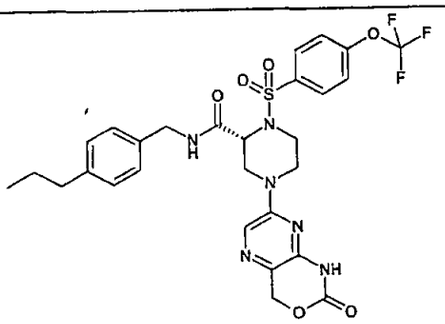
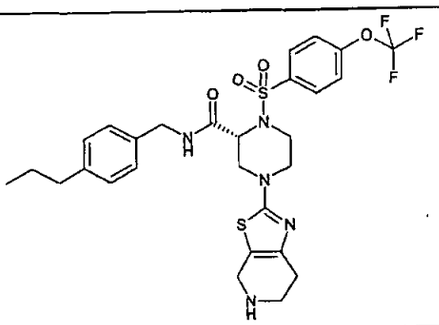
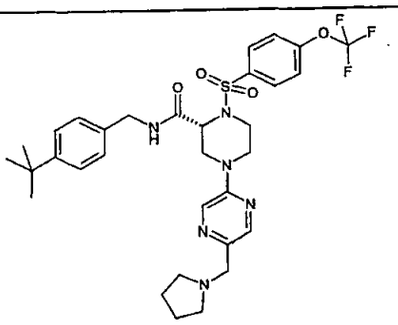
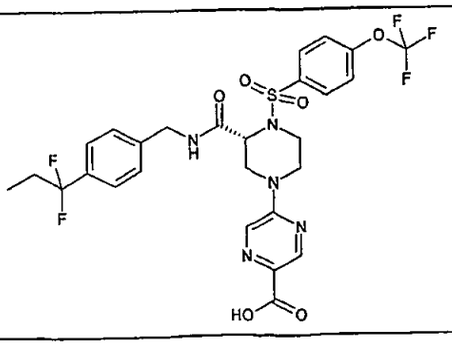
実施例番号	構造式
555	
556	
557	
558	
559	

表113

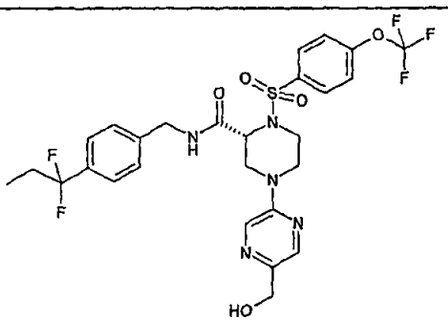
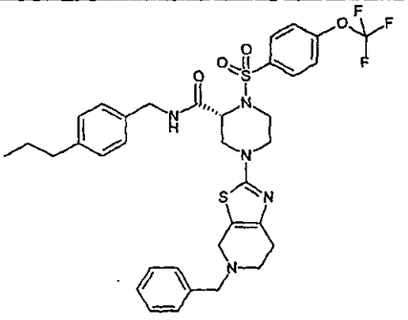
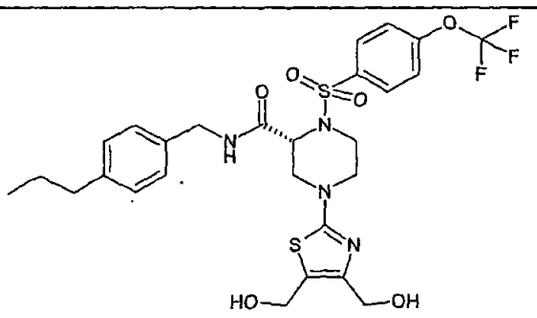
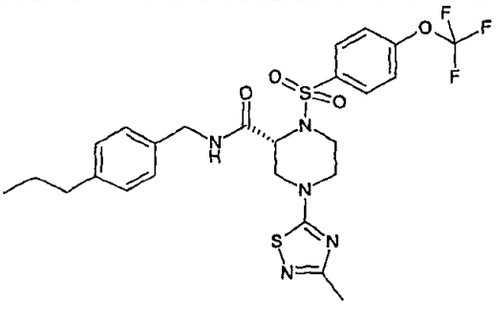
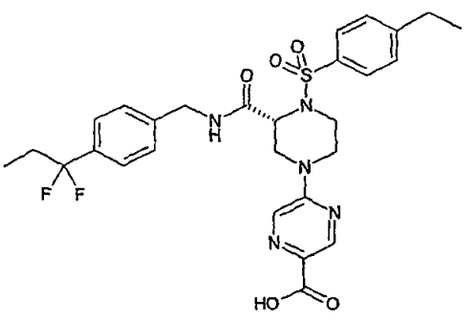
実施例番号	構造式
560	
561	
562	
563	
564	

表114

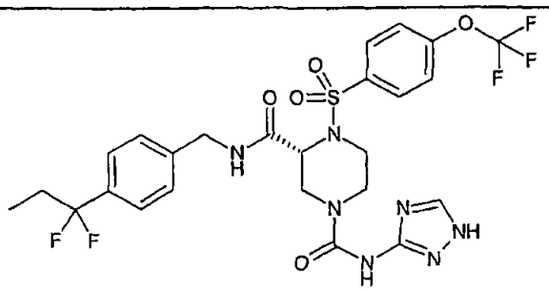
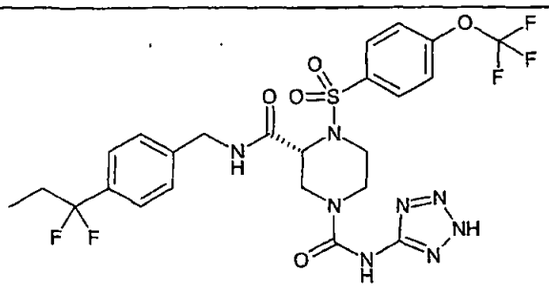
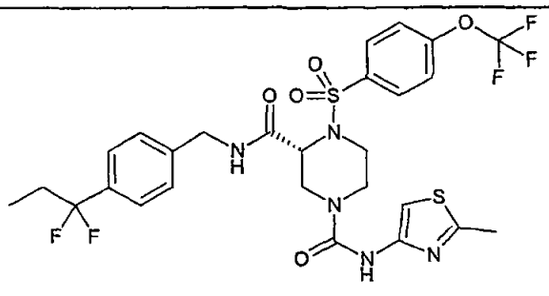
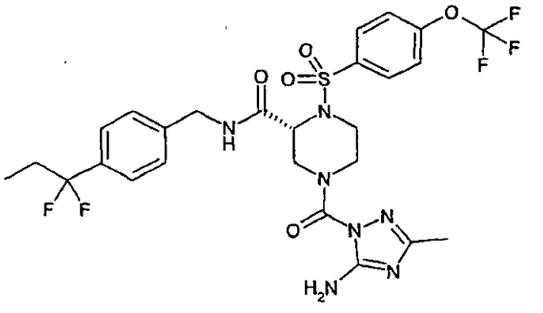
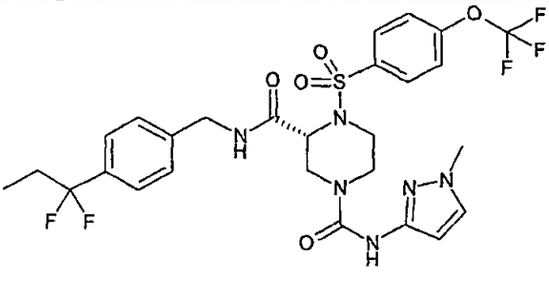
実施例番号	構造式
565	
566	
567	
568	
569	

表115

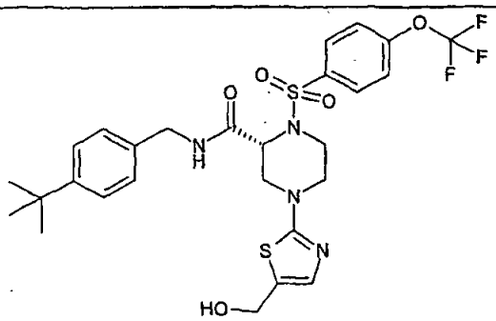
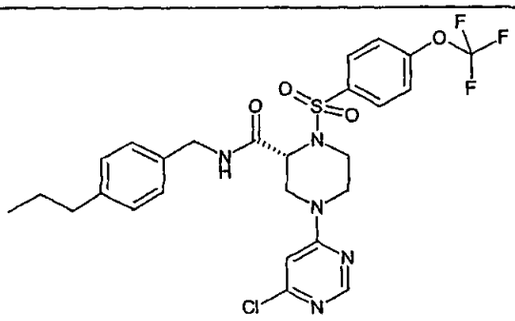
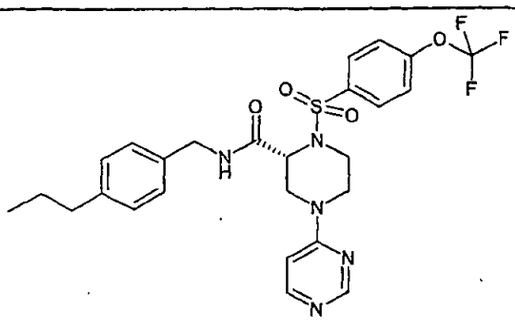
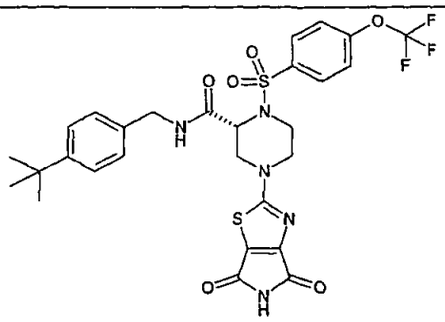
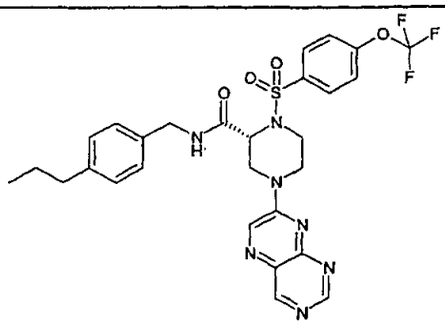
実施例番号	構造式
570	
571	
572	
573	
574	

表116

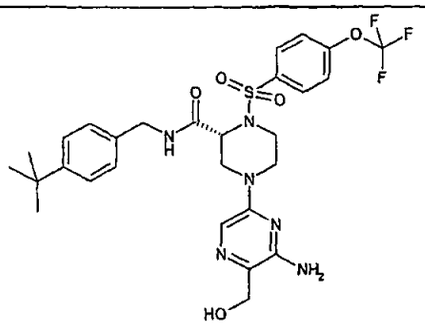
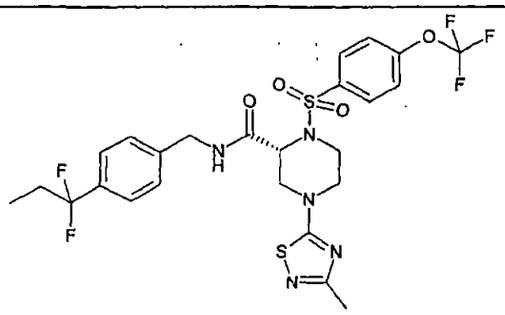
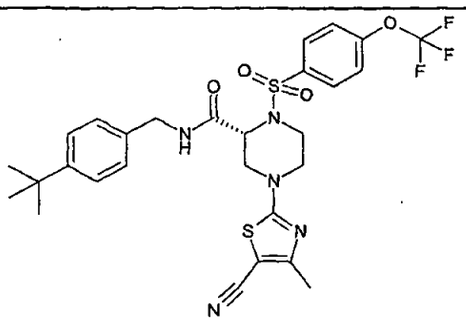
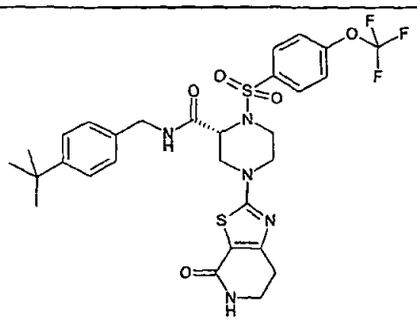
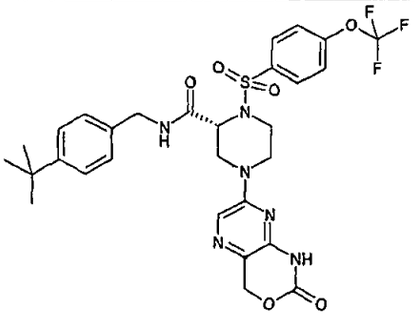
実施例番号	構造式
575	
576	
577	
578	
579	

表117

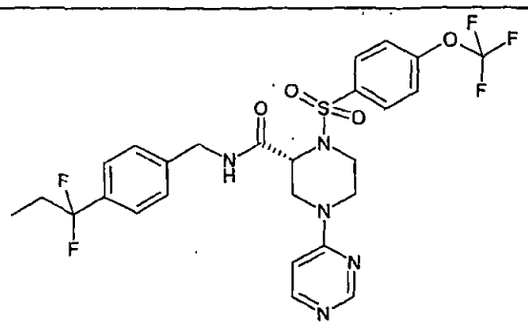
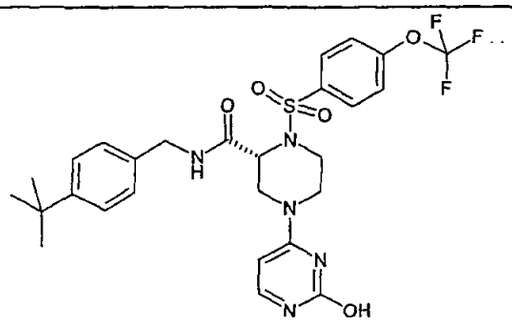
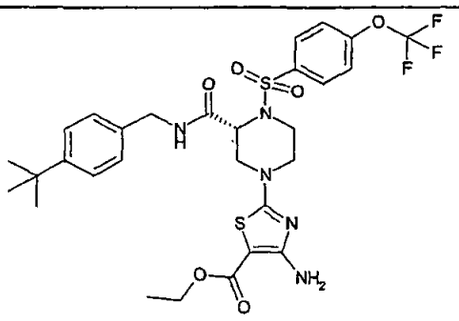
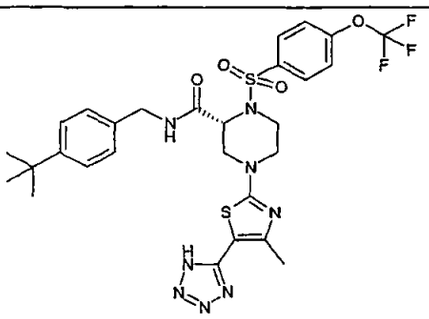
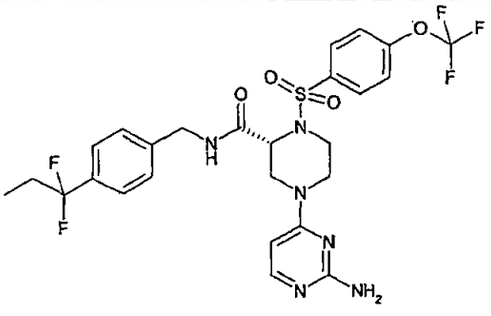
実施例番号	構造式
580	
581	
582	
583	
584	

表118

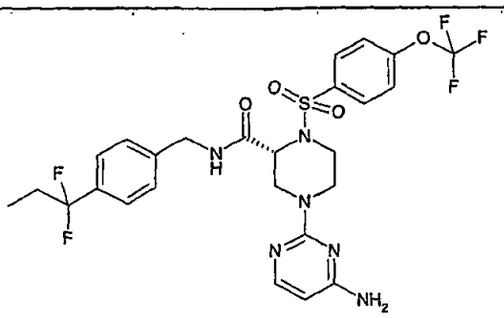
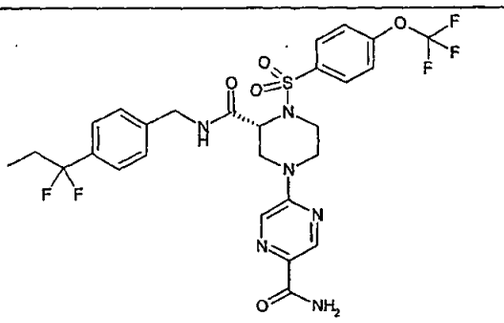
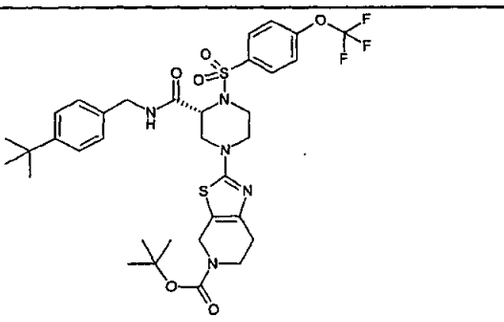
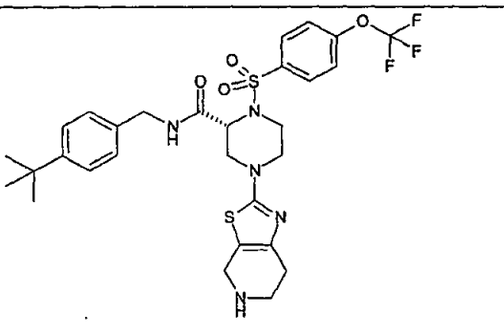
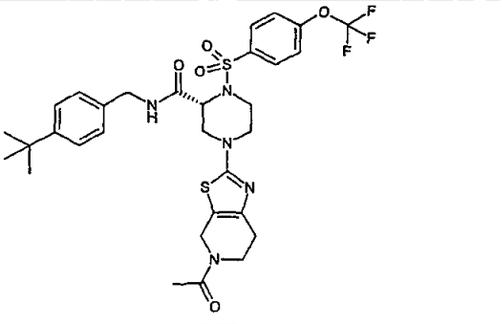
実施例番号	構造式
585	
586	
587	
588	
589	

表119

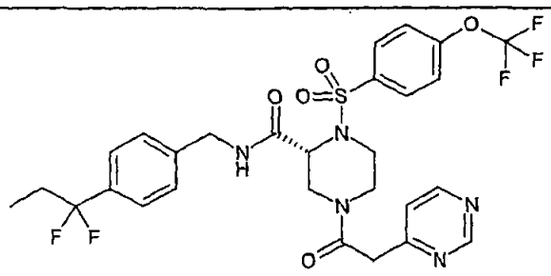
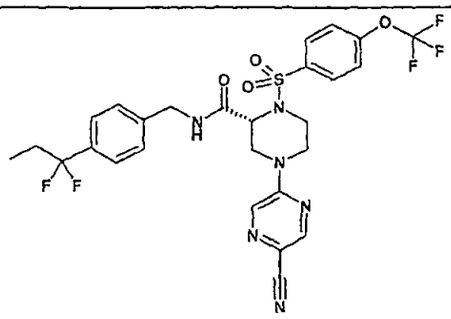
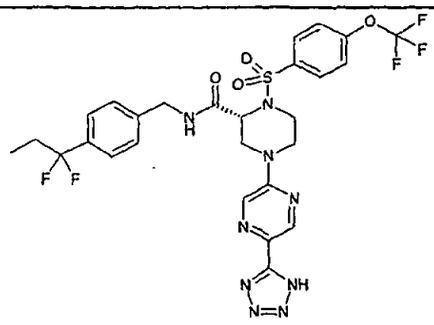
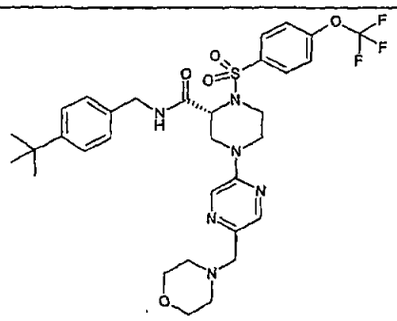
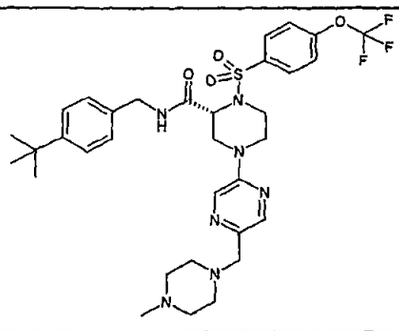
実施例番号	構造式
590	
591	
592	
593	
594	

表120

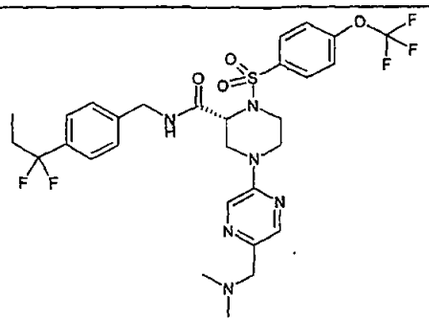
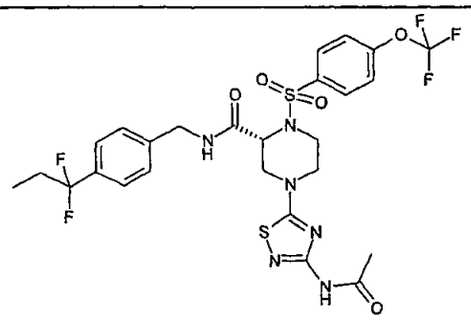
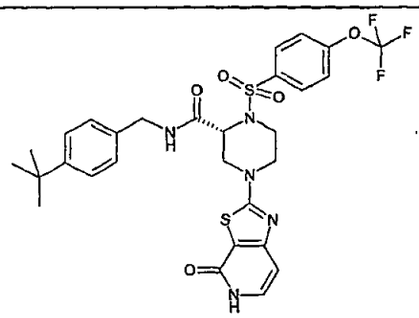
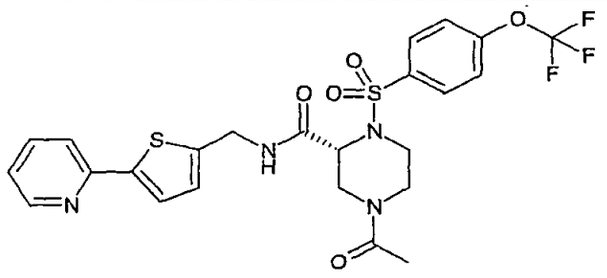
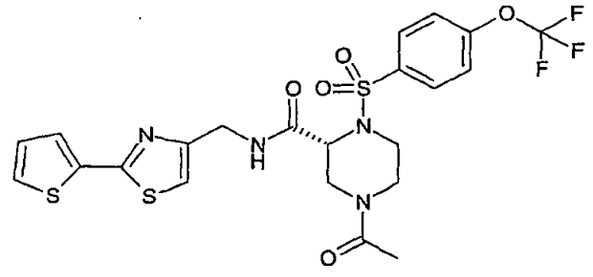
実施例番号	構造式
595	
596	
597	
598	
599	

表121

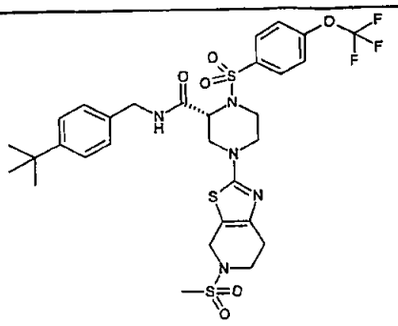
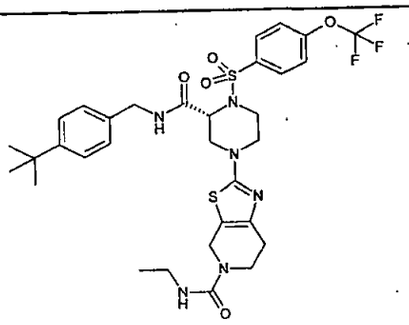
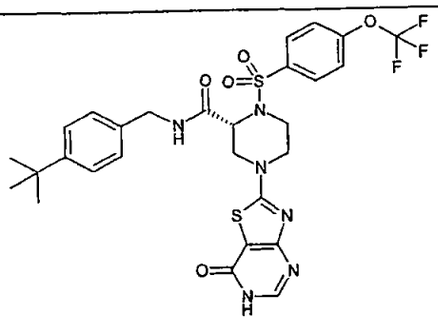
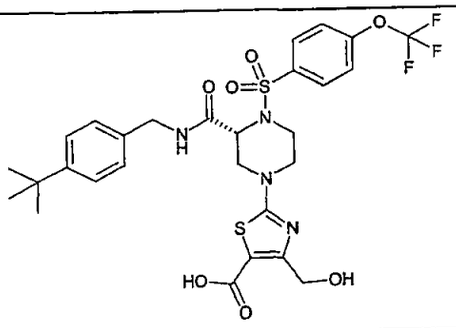
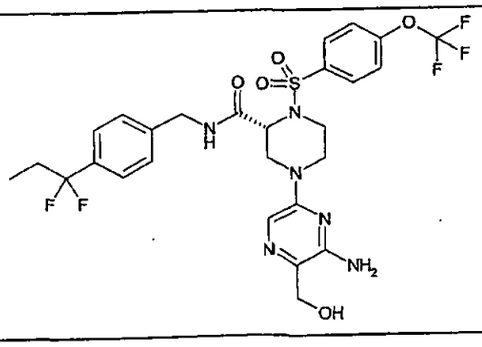
実施例番号	構造式
600	
601	
602	
603	
604	

表122

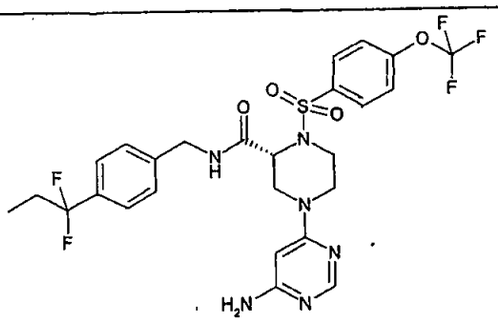
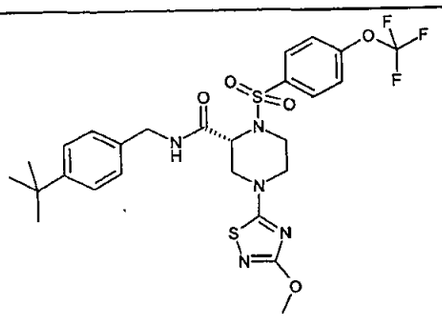
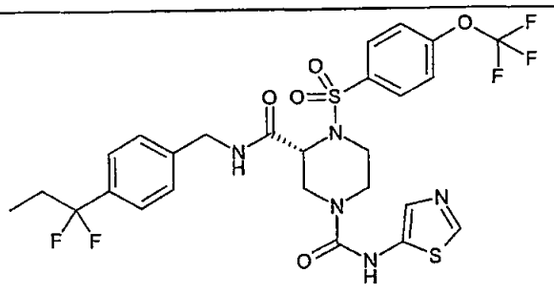
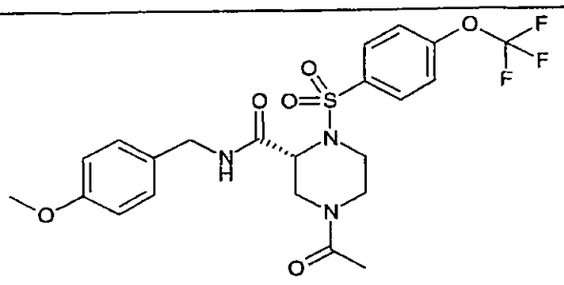
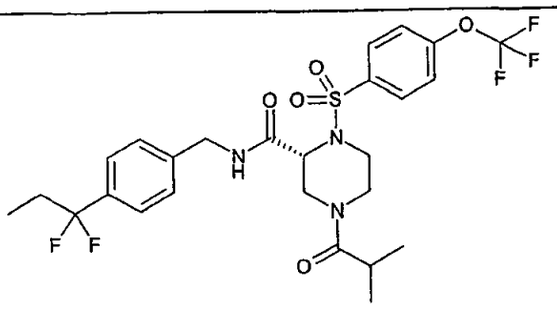
実施例番号	構造式
605	
606	
607	
608	
609	

表123

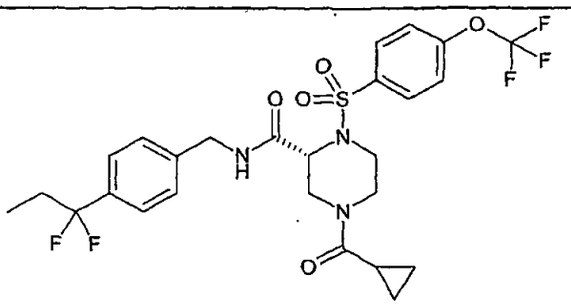
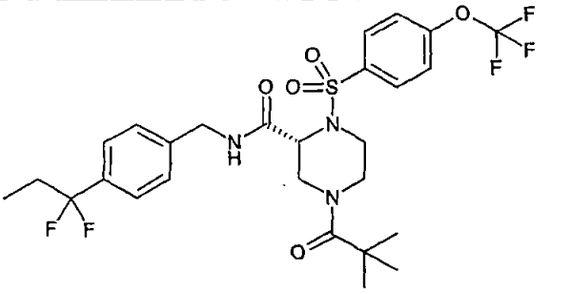
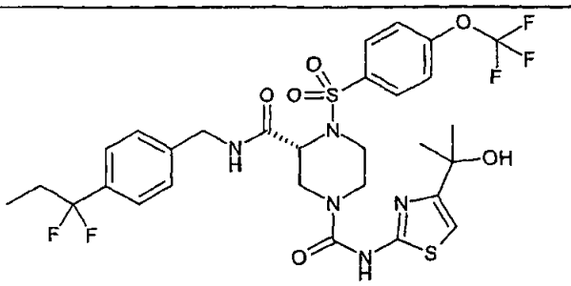
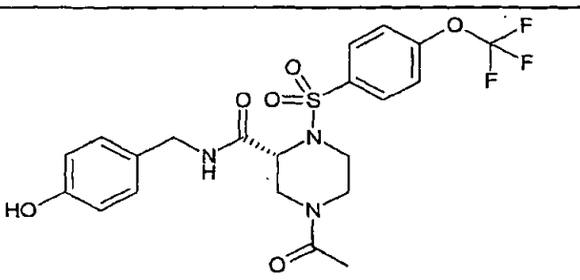
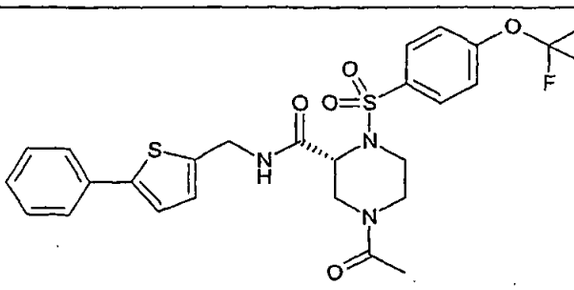
実施例番号	構造式
610	
611	
612	
613	
614	

表124

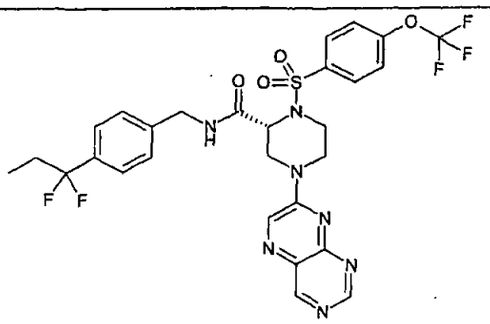
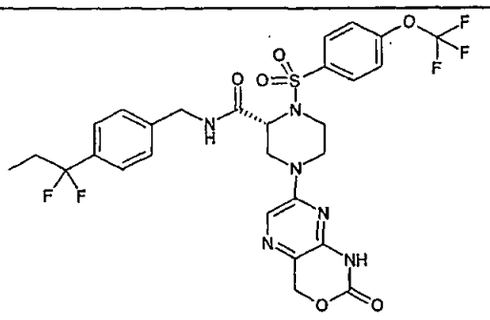
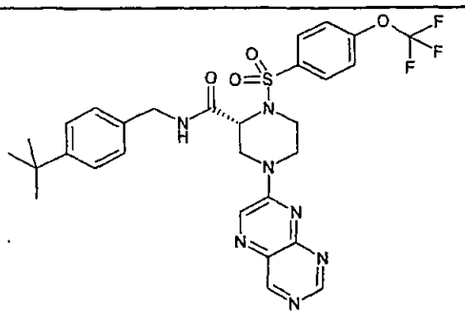
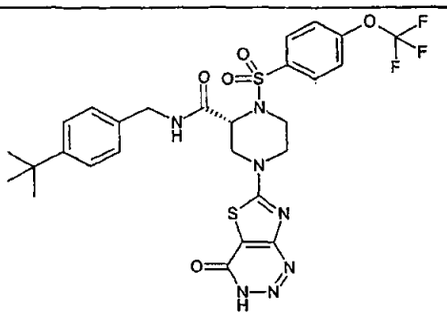
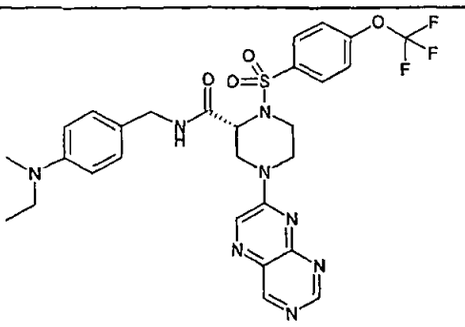
実施例番号	構造式
615	
616	
617	
618	
619	

表125

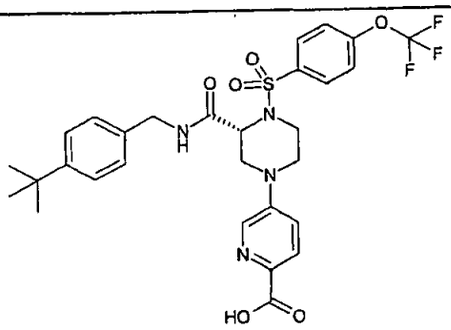
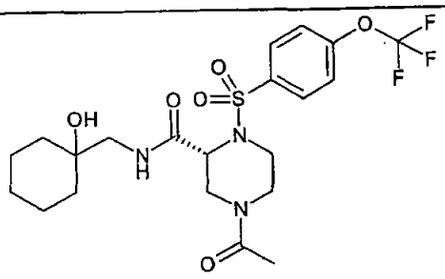
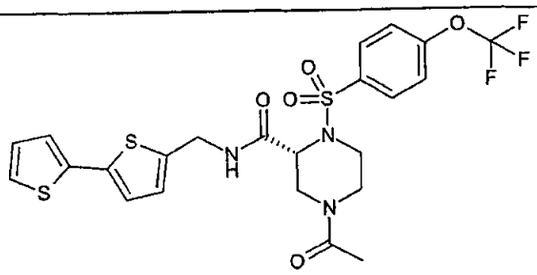
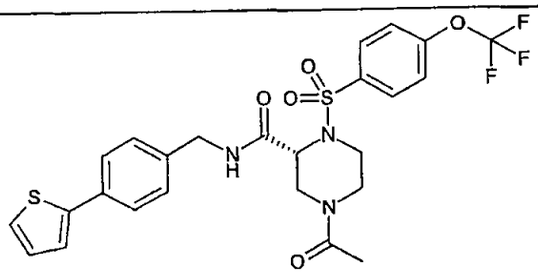
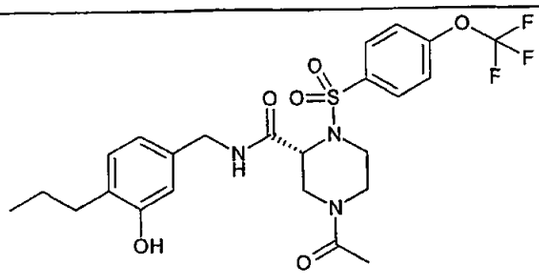
実施例番号	構造式
620	
621	
622	
623	
624	

表126

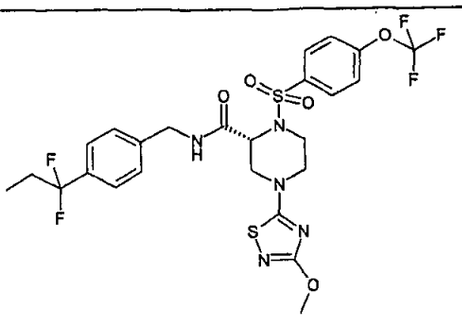
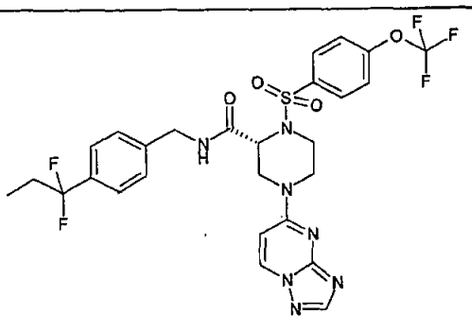
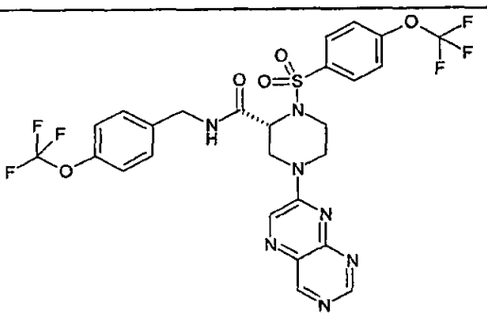
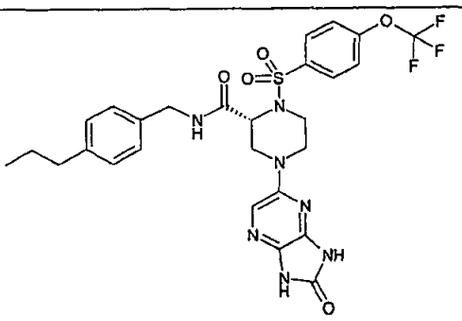
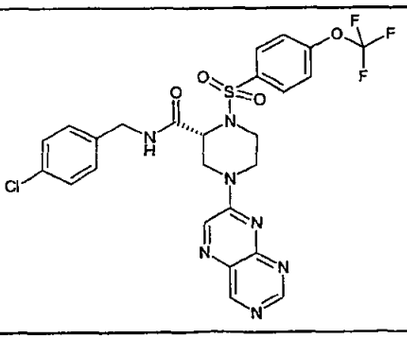
実施例番号	構造式
625	
626	
627	
628	
629	

表127

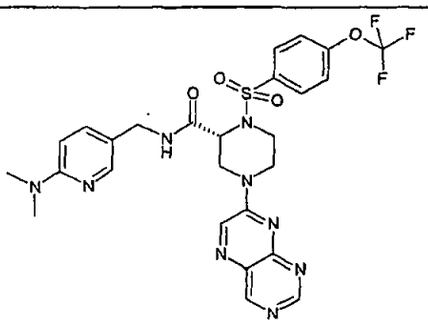
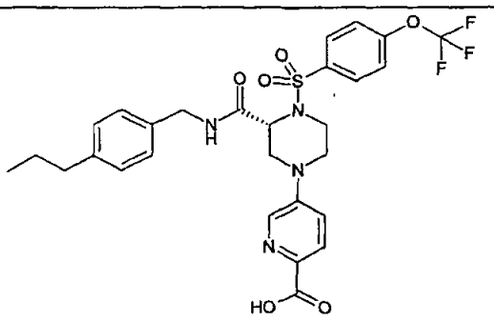
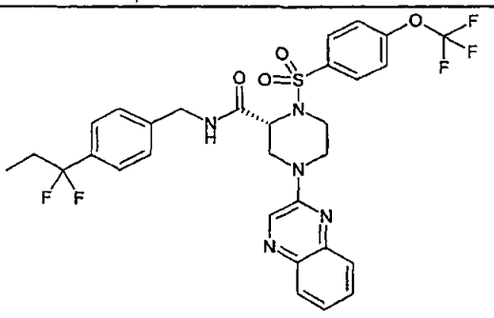
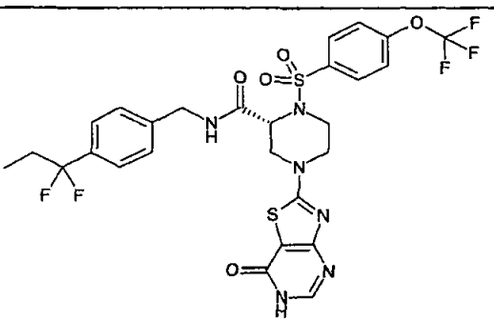
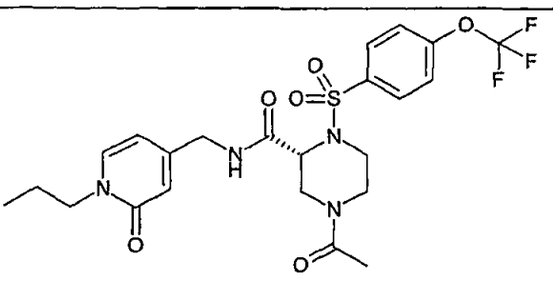
実施例番号	構造式
630	
631	
632	
633	
634	

表128

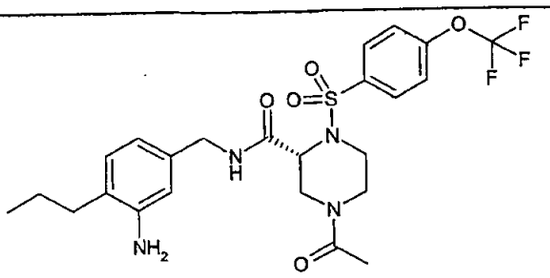
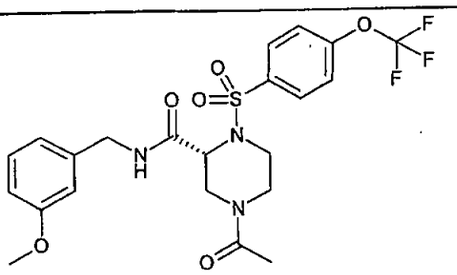
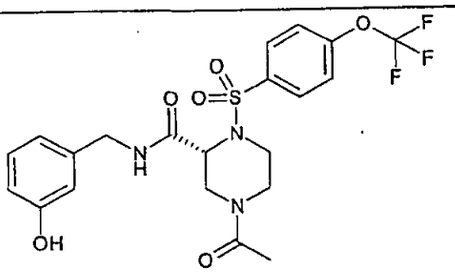
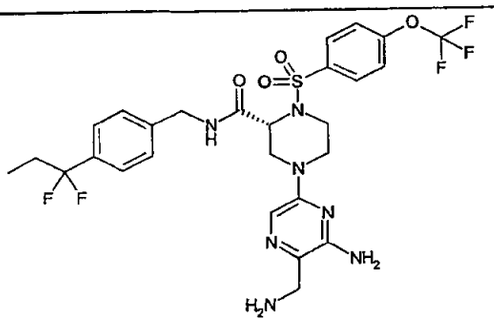
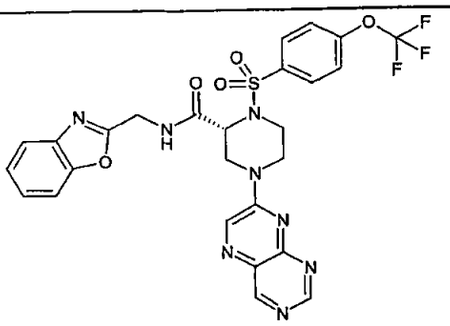
実施例番号	構造式
635	
636	
637	
638	
639	

表129

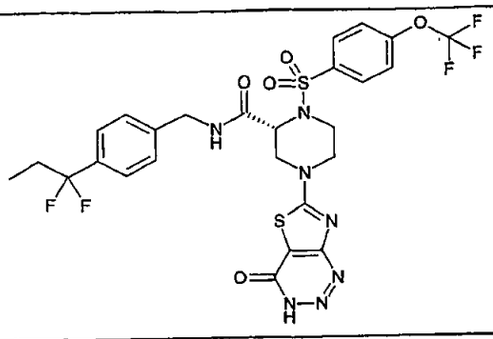
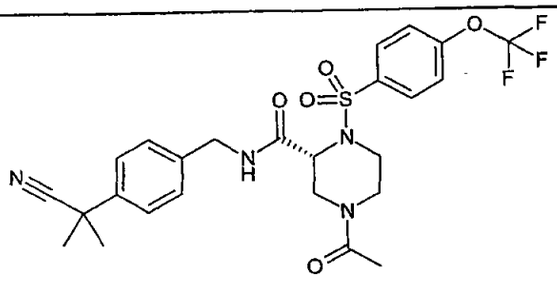
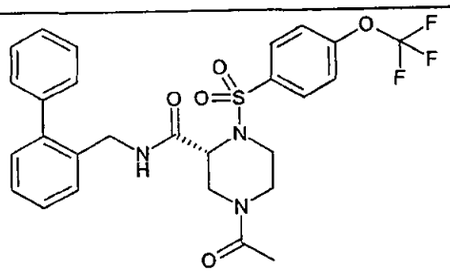
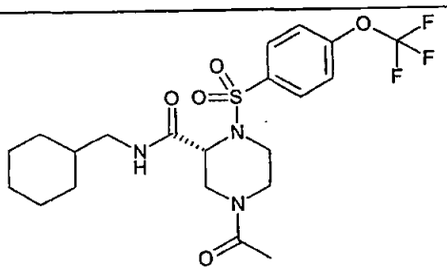
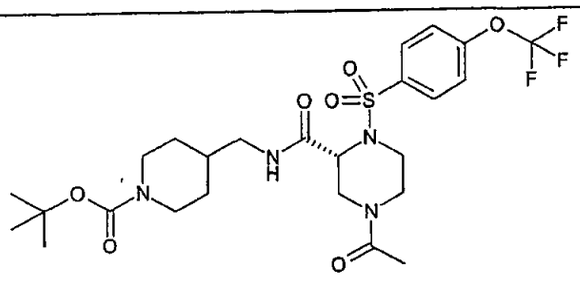
実施例番号	構造式
640	
641	
642	
643	
644	

表130

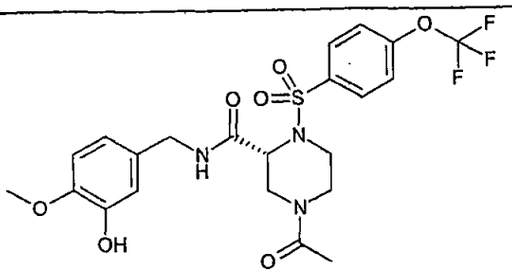
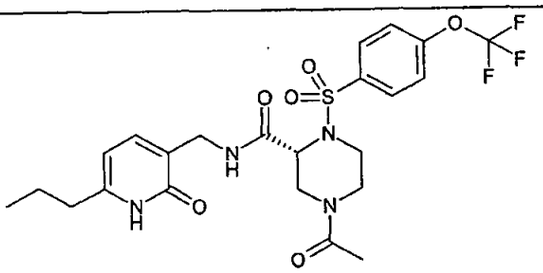
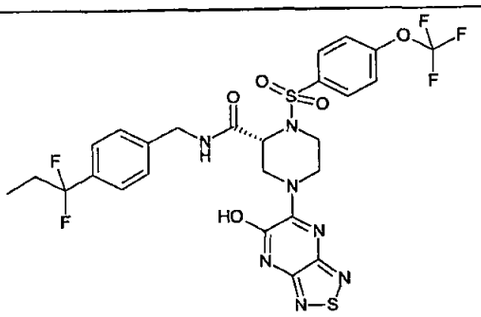
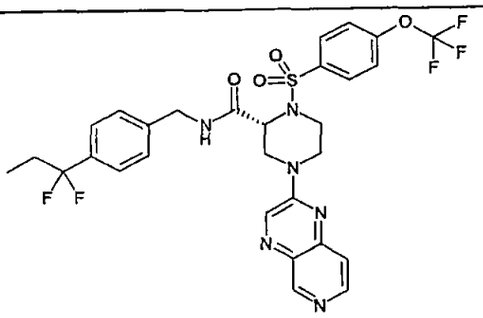
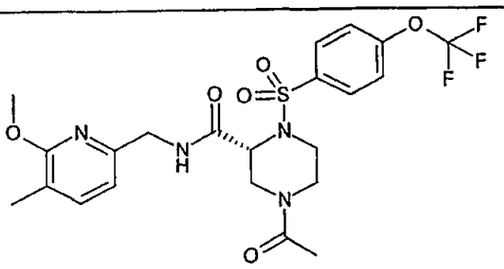
実施例番号	構造式
645	
646	
647	
648	
649	

表131

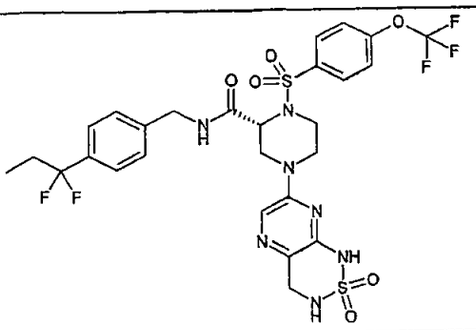
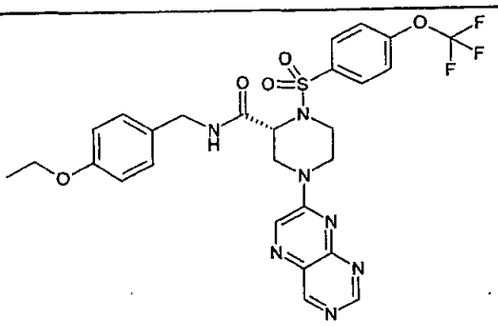
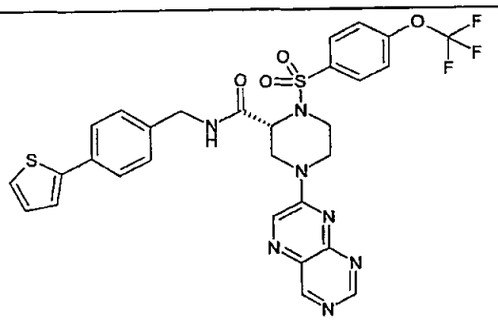
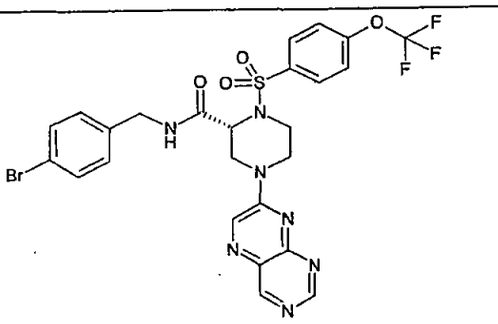
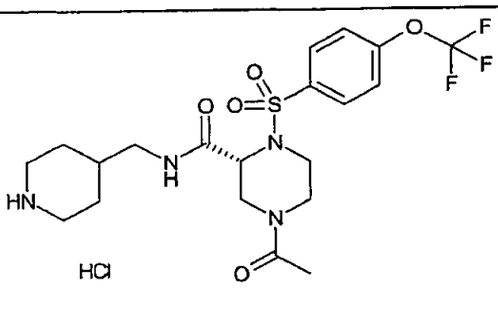
実施例番号	構造式
650	
651	
652	
653	
654	

表132

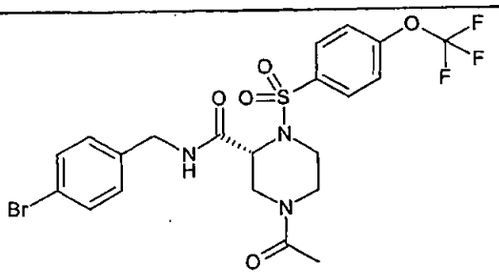
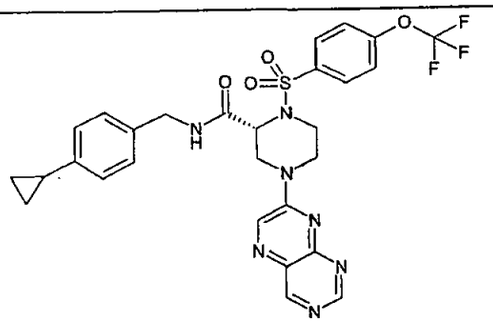
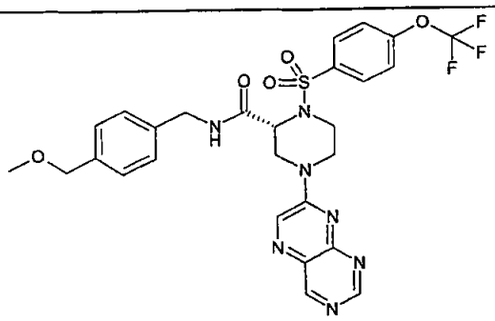
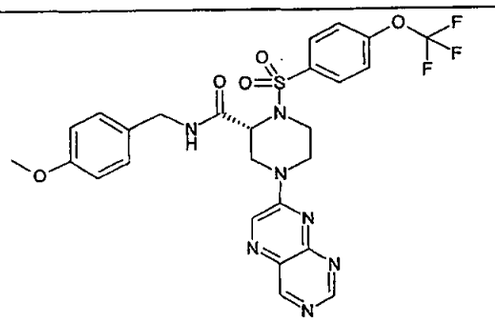
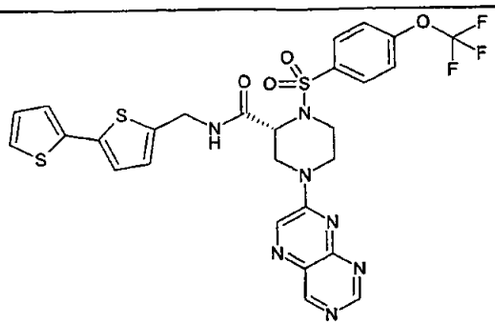
実施例番号	構造式
655	
656	
657	
658	
659	

表133

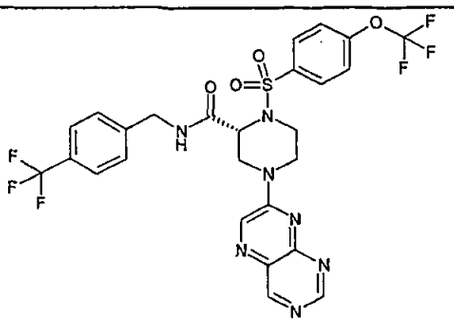
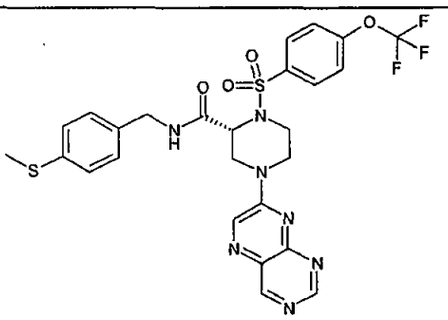
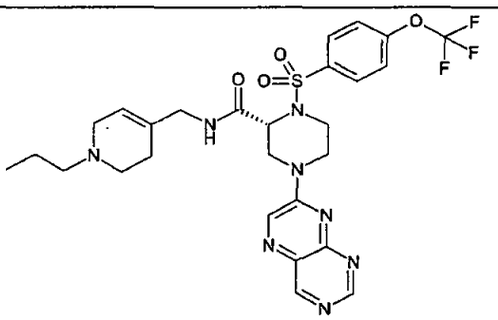
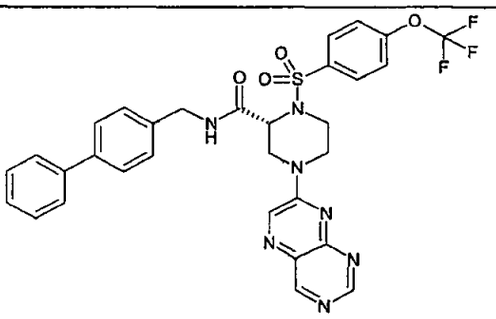
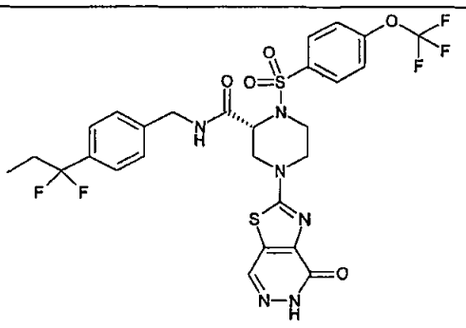
実施例番号	構造式
660	
661	
662	
663	
664	

表134

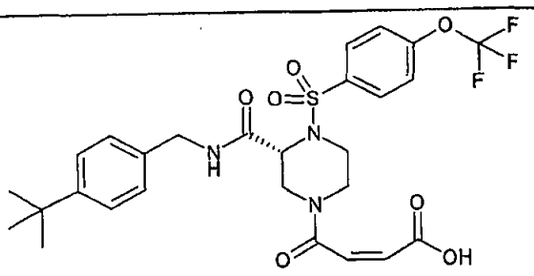
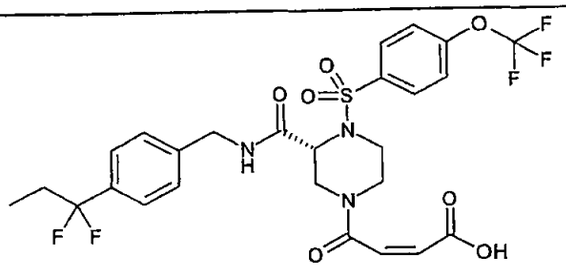
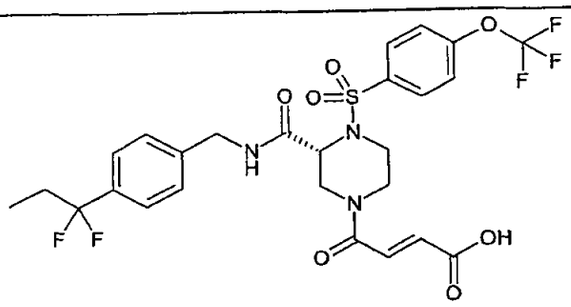
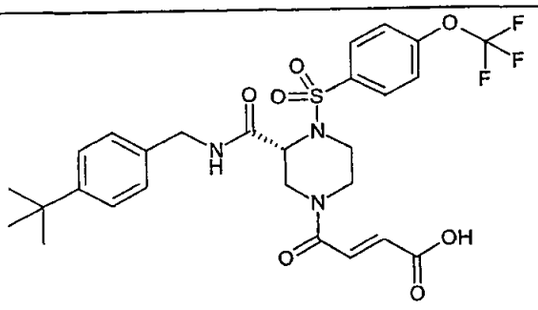
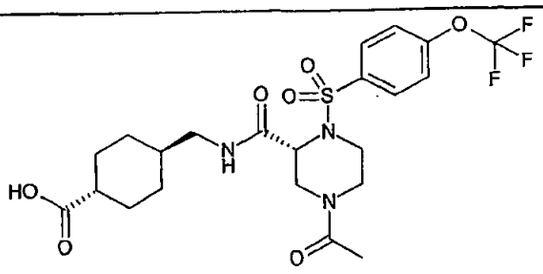
実施例番号	構造式
665	
666	
667	
668	
669	

表135

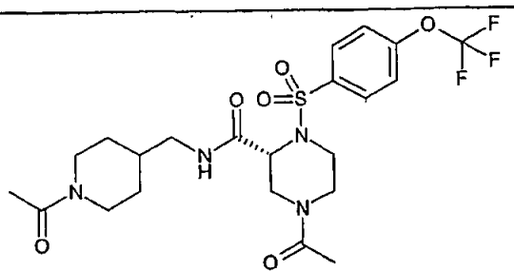
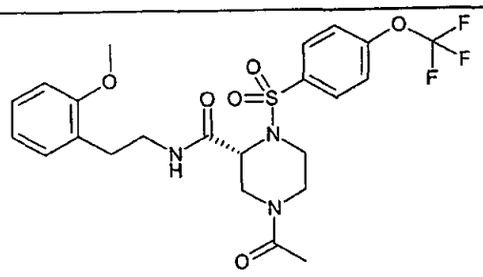
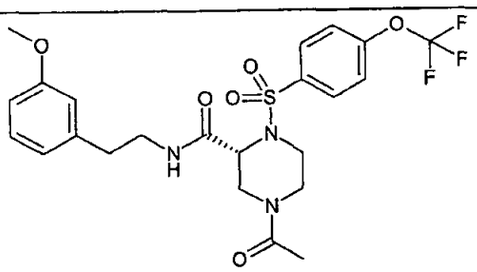
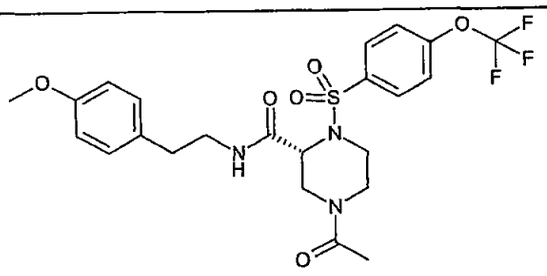
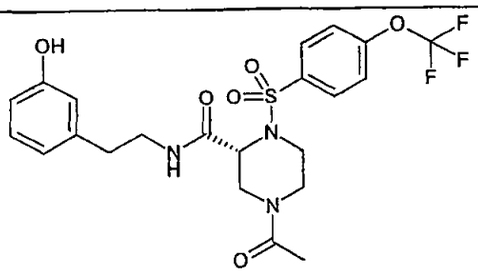
実施例番号	構造式
670	
671	
672	
673	
674	

表136

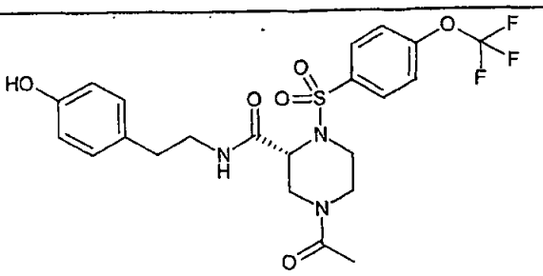
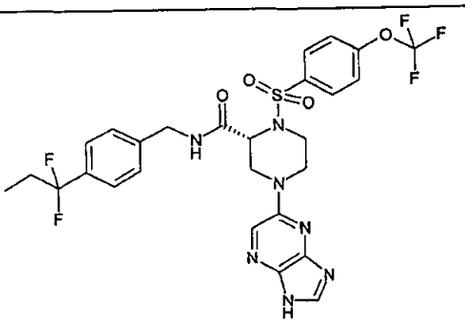
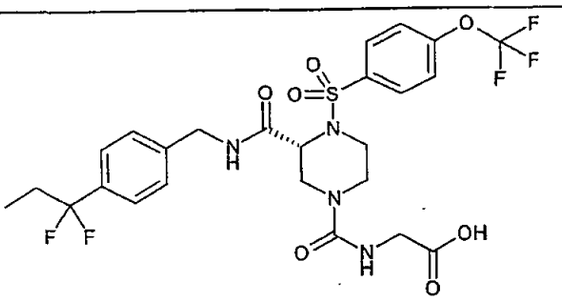
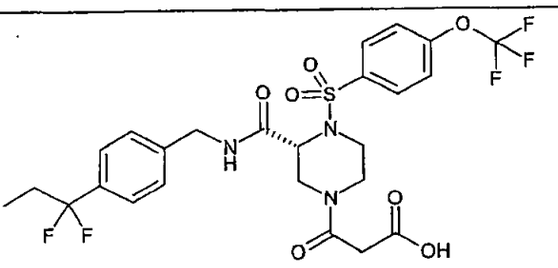
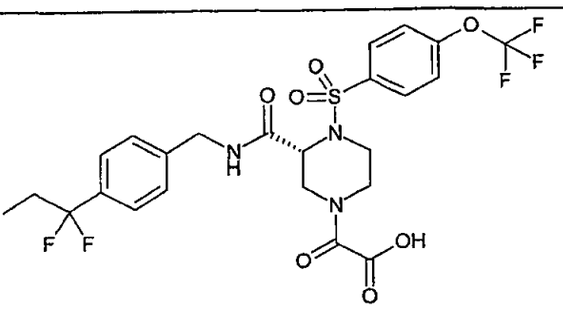
実施例番号	構造式
675	
676	
677	
678	
679	

表137

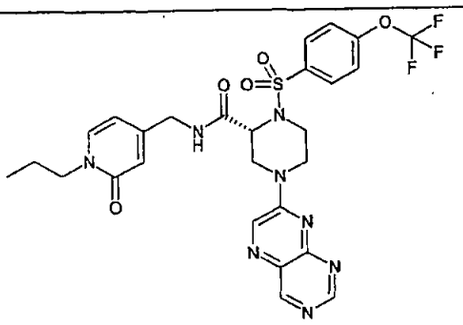
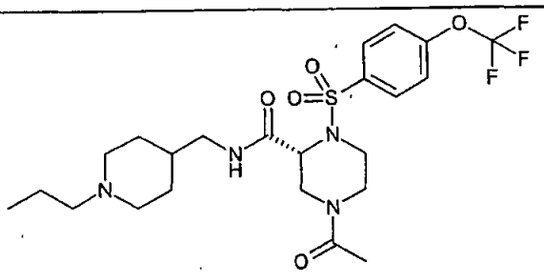
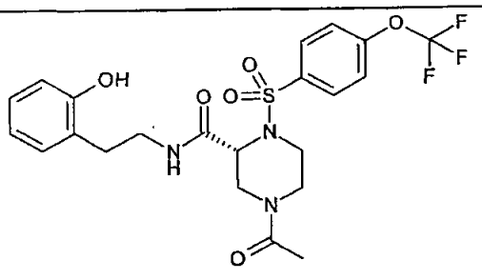
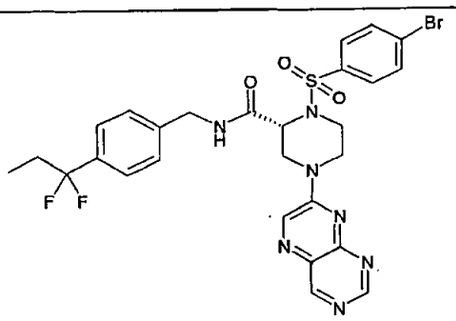
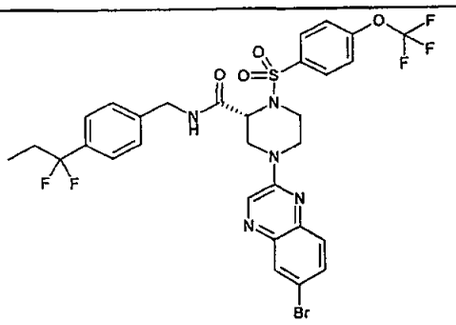
実施例番号	構造式
680	
681	
682	
683	
684	

表138

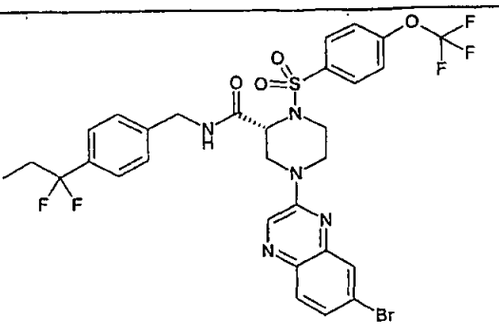
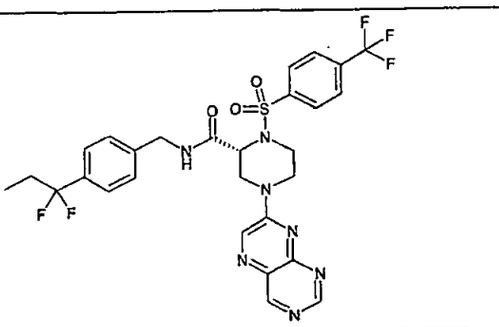
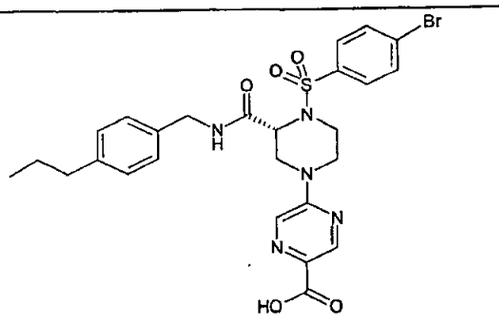
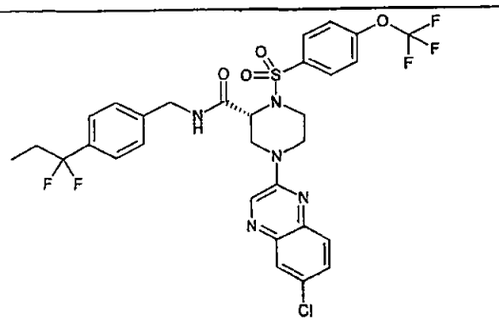
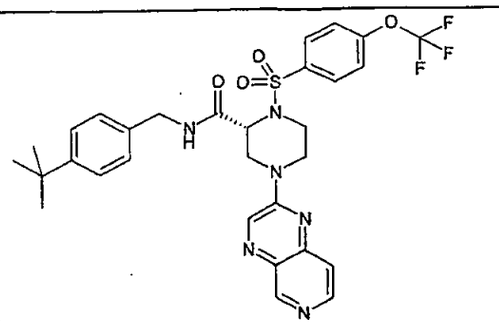
実施例番号	構造式
685	
686	
687	
688	
689	

表139

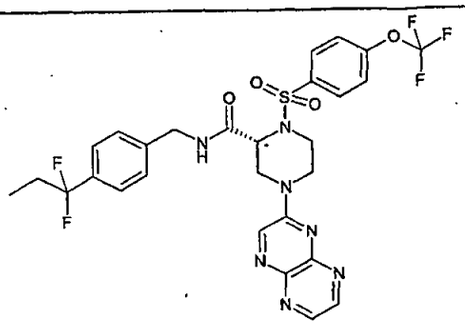
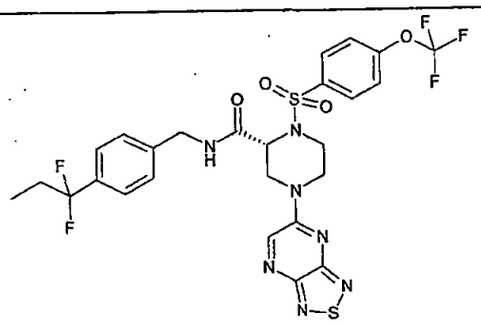
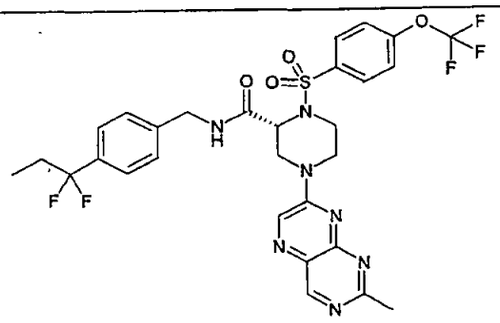
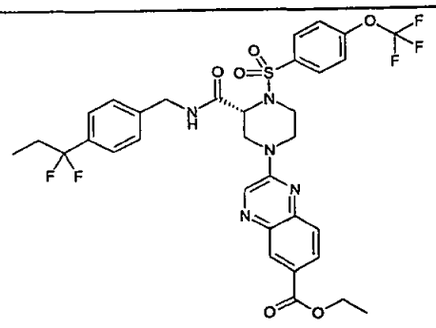
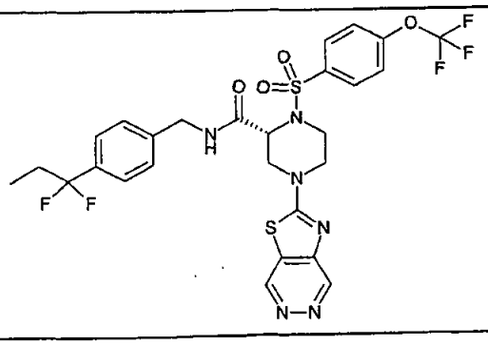
実施例番号	構造式
690	
691	
692	
693	
694	

表140

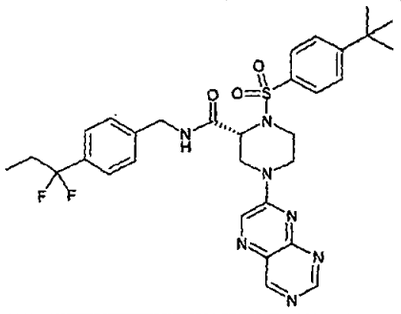
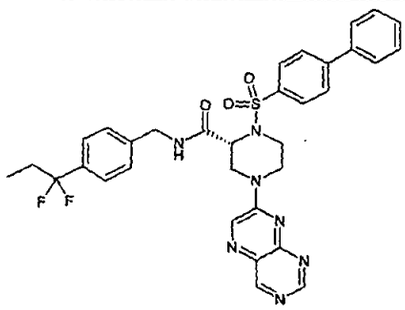
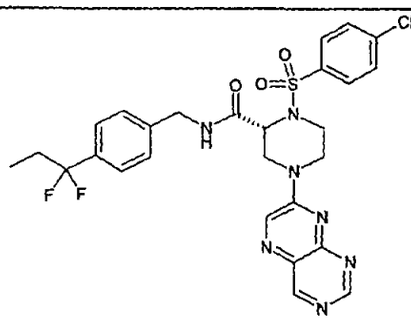
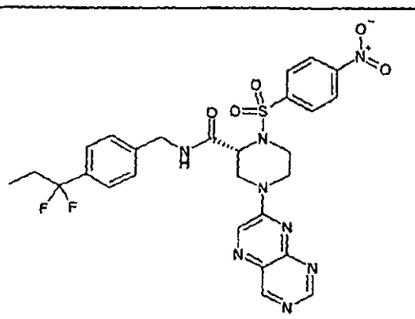
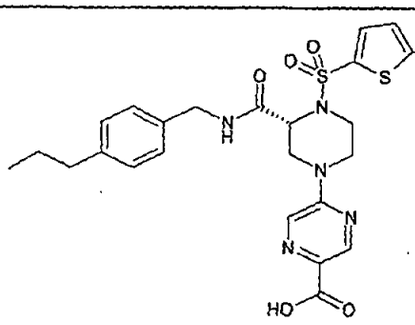
実施例番号	構造式
695	
696	
697	
698	
699	

表141

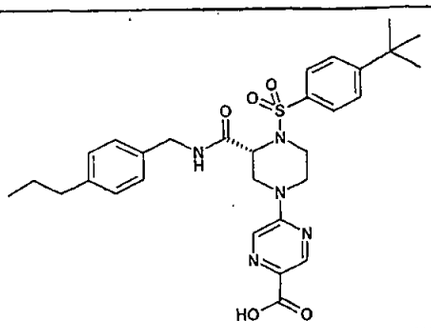
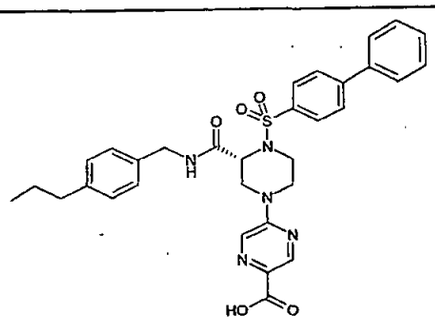
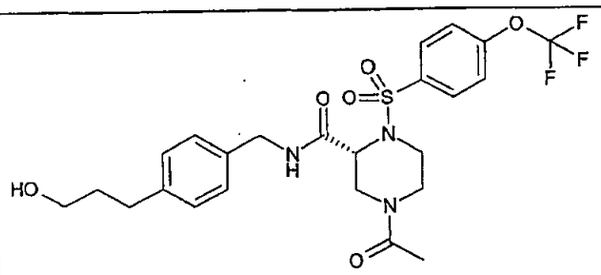
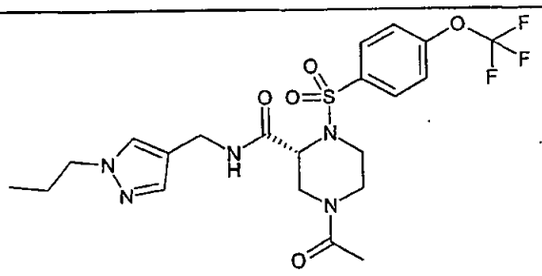
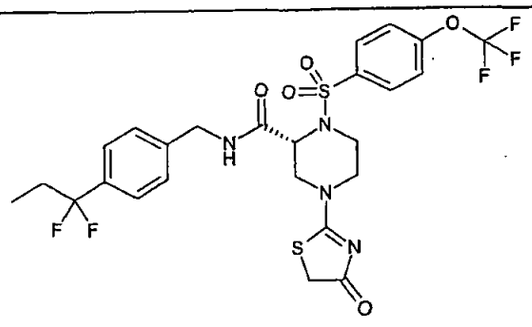
実施例番号	構造式
700	
701	
702	
703	
704	

表142

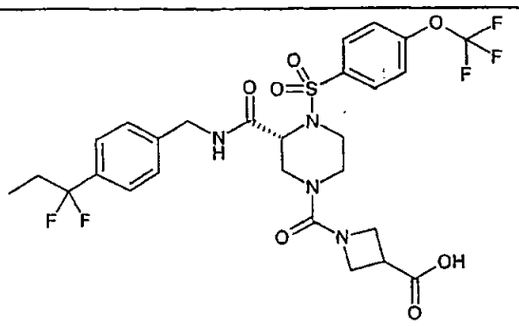
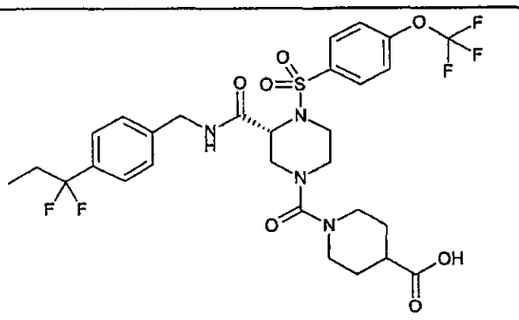
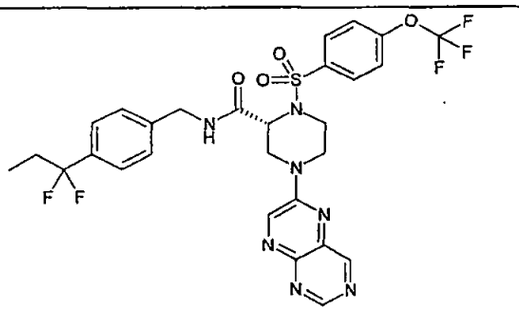
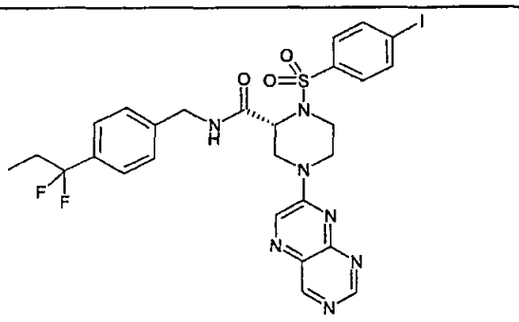
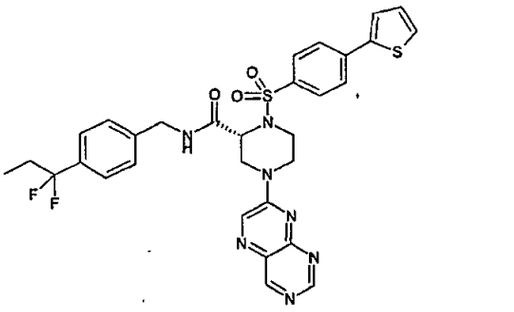
実施例番号	構造式
705	
706	
707	
708	
709	

表143

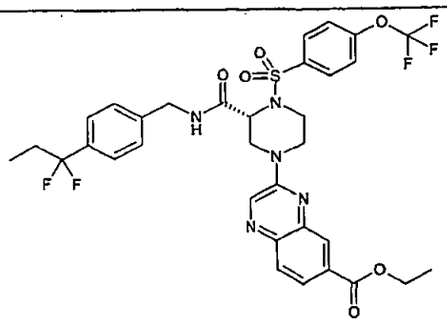
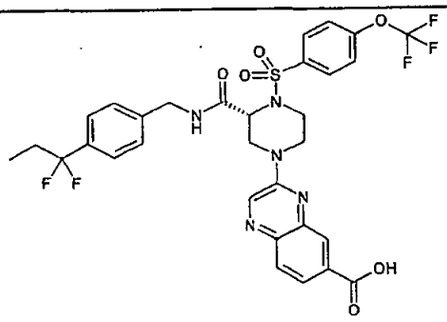
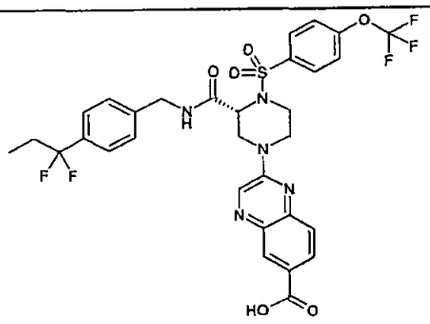
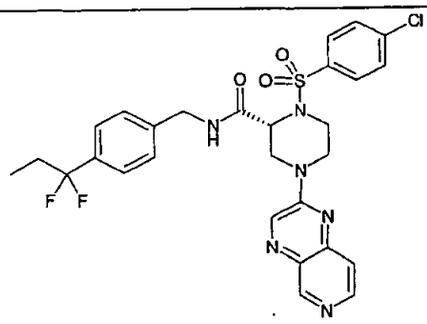
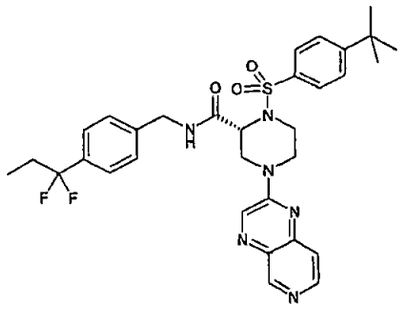
実施例番号	構造式
710	
711	
712	
713	
714	

表144

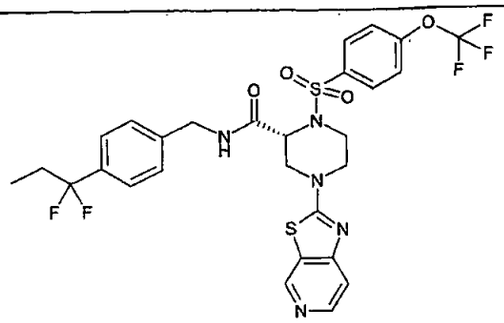
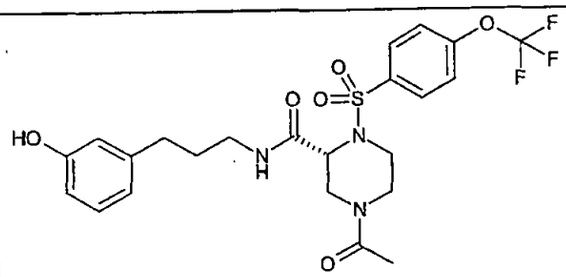
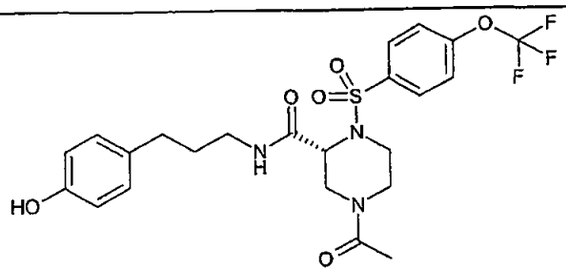
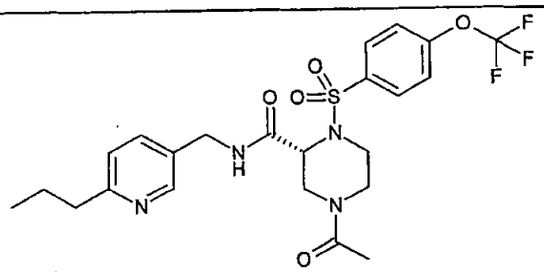
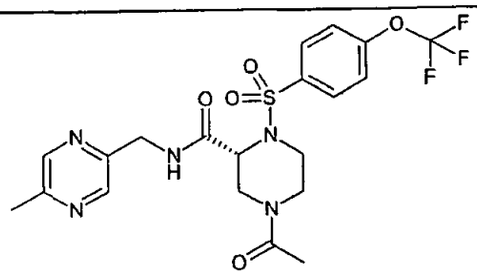
実施例番号	構造式
715	
716	
717	
718	
719	

表145

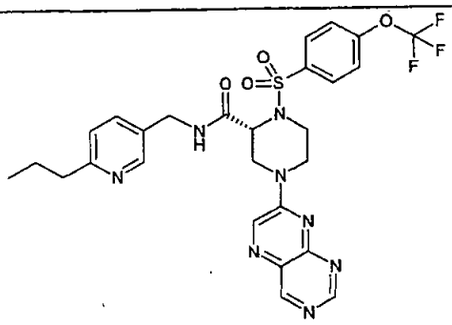
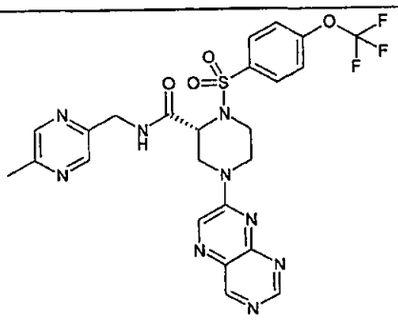
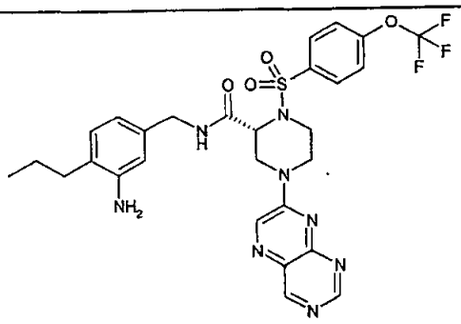
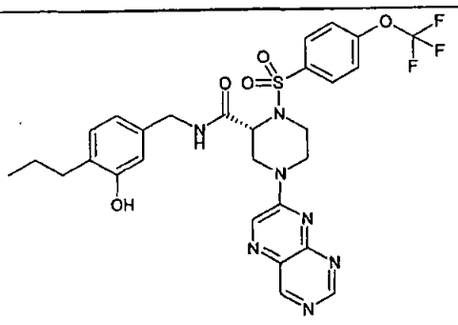
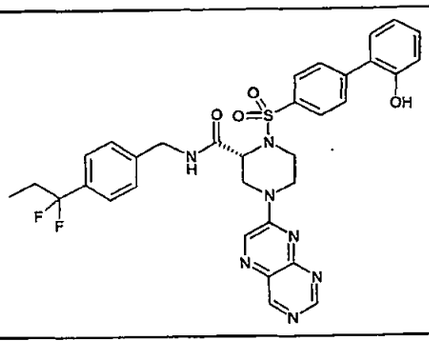
実施例番号	構造式
720	
721	
722	
723	
724	

表146

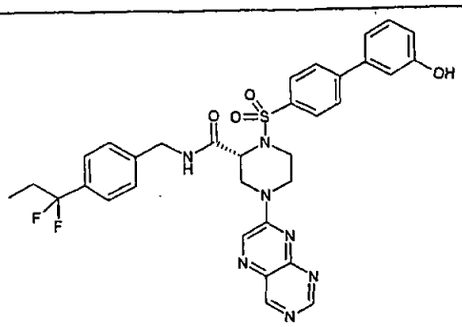
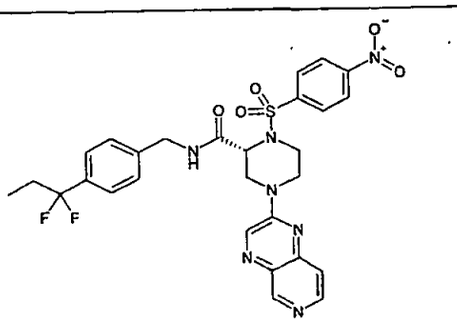
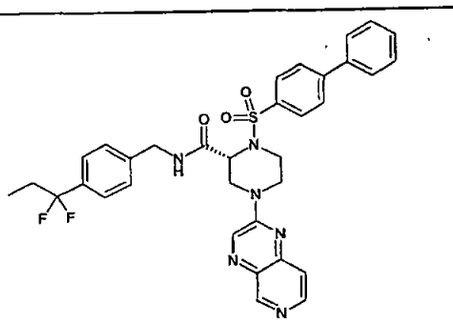
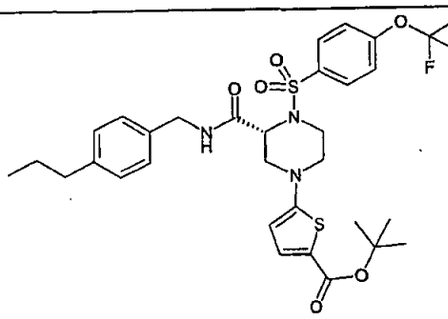
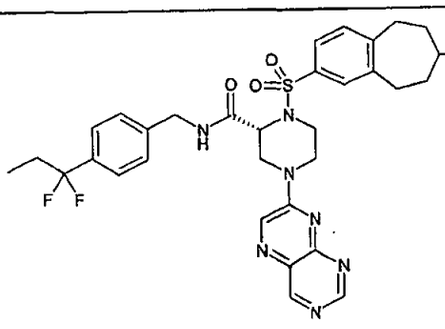
実施例番号	構造式
725	
726	
727	
728	
729	

表147

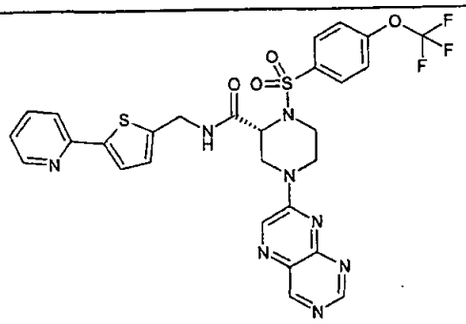
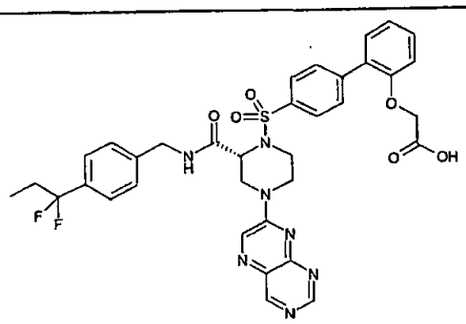
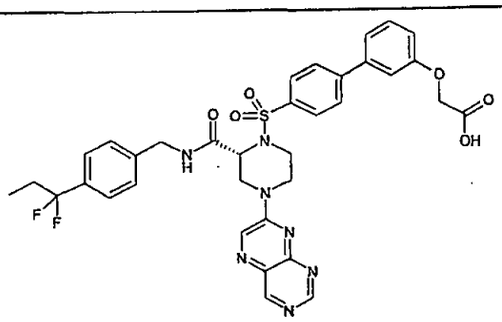
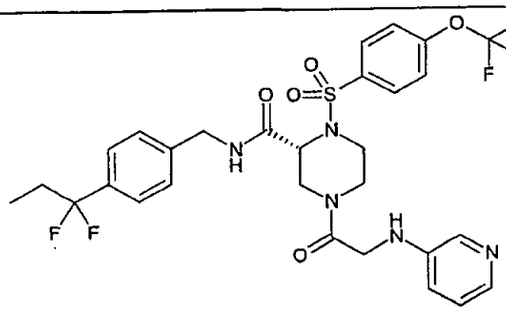
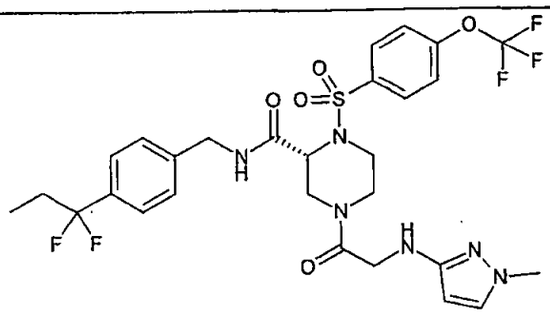
実施例番号	構造式
730	
731	
732	
733	
734	

表148

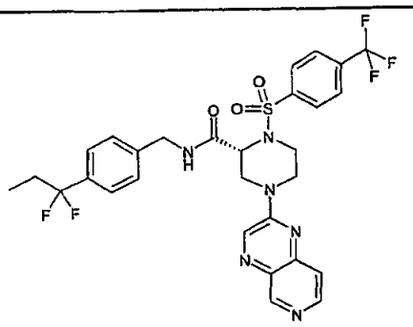
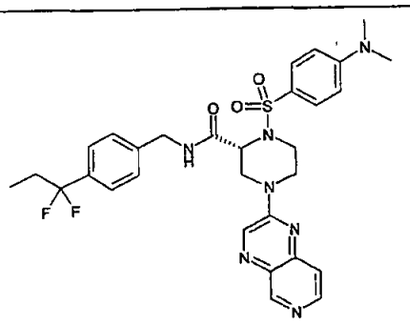
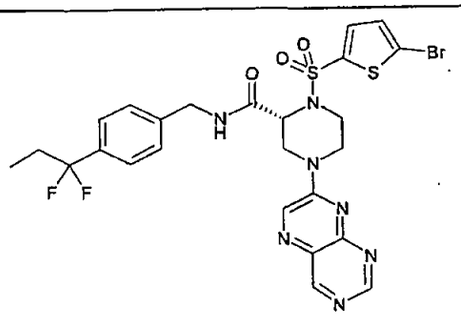
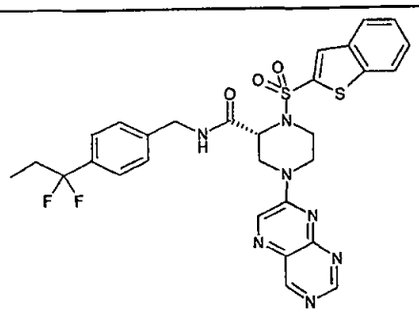
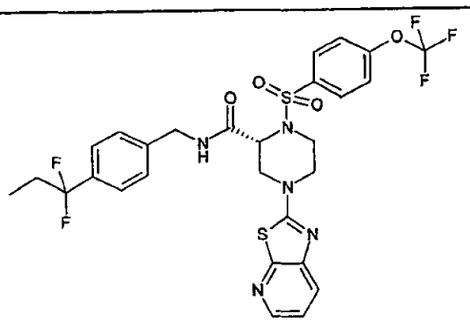
実施例番号	構造式
735	
736	
737	
738	
739	

表149

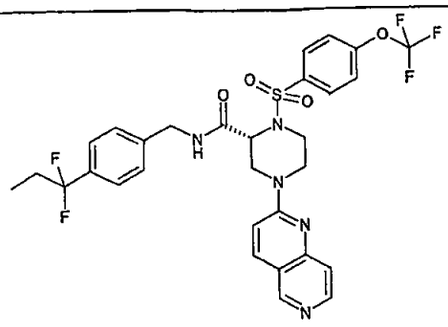
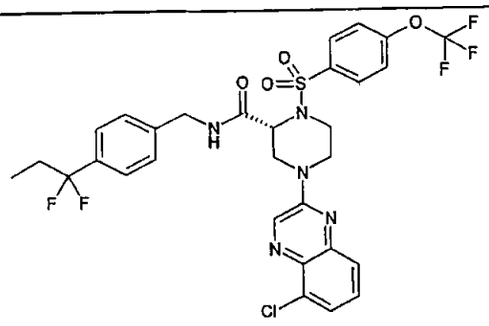
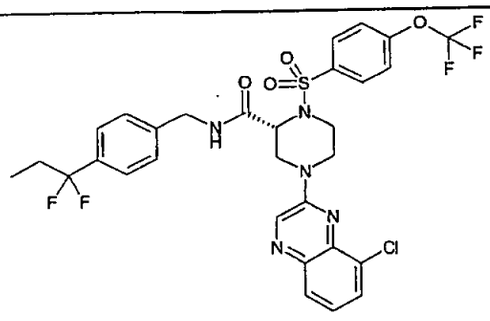
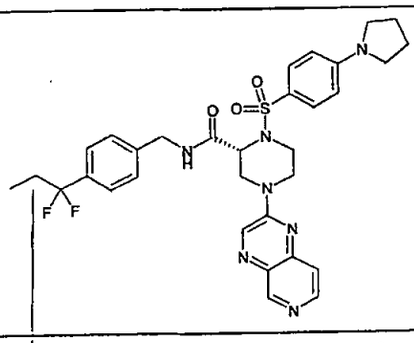
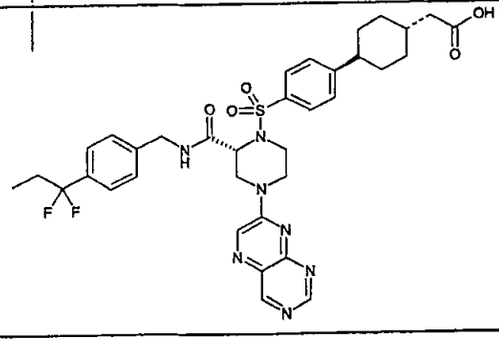
実施例番号	構造式
740	
741	
742	
743	
744	

表150

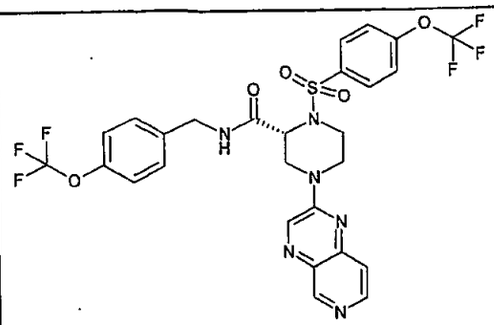
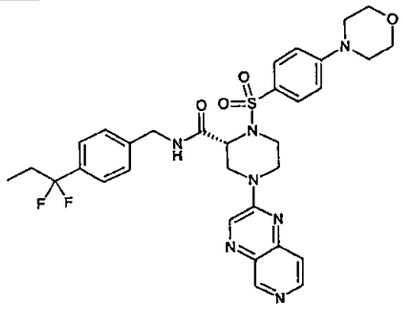
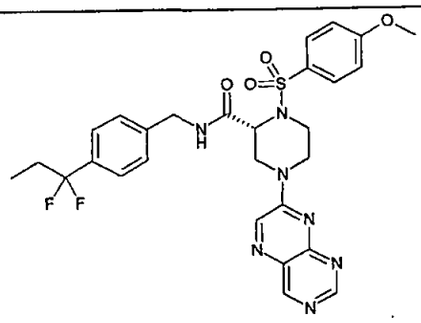
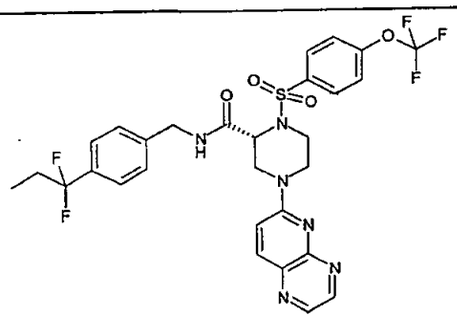
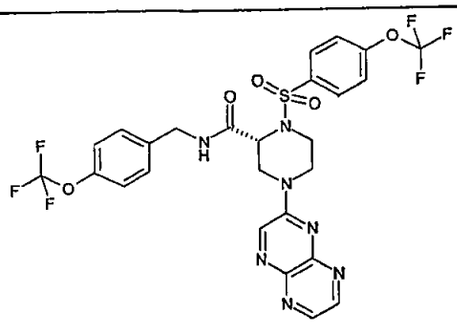
実施例番号	構造式
745	
746	
747	
748	
749	

表151

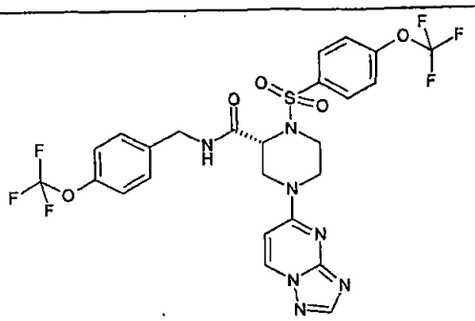
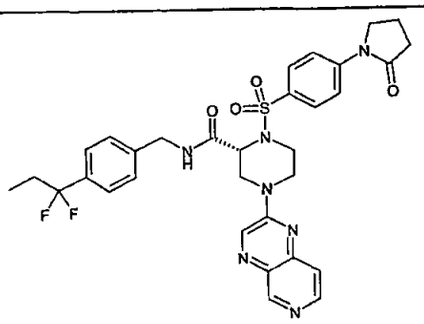
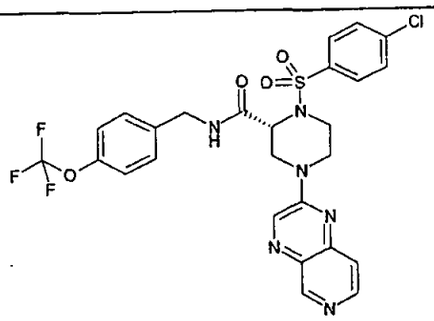
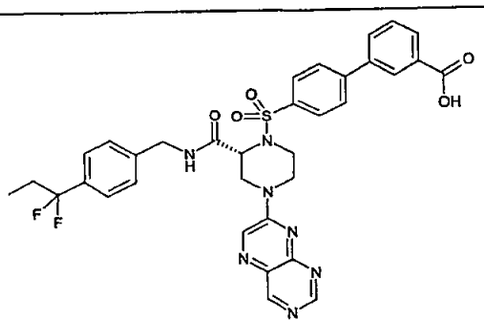
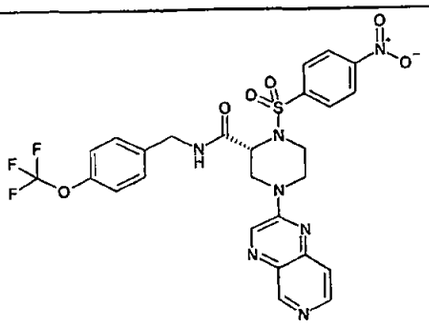
実施例番号	構造式
750	
751	
752	
753	
754	

表152

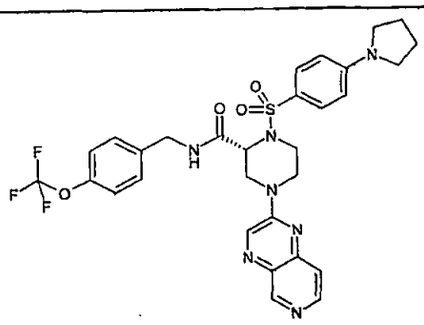
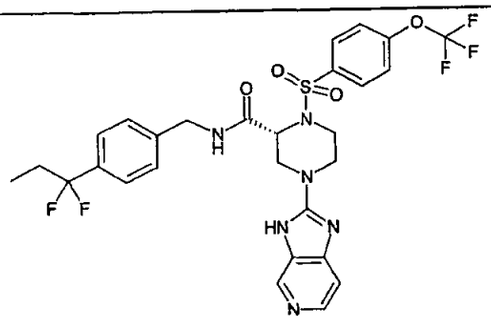
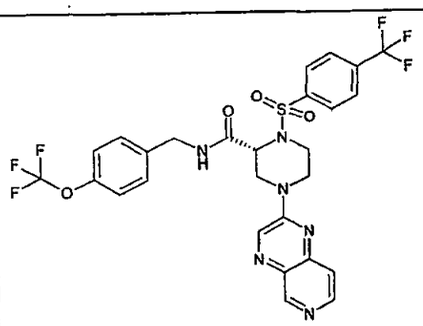
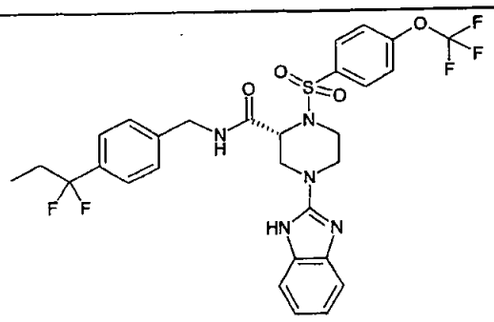
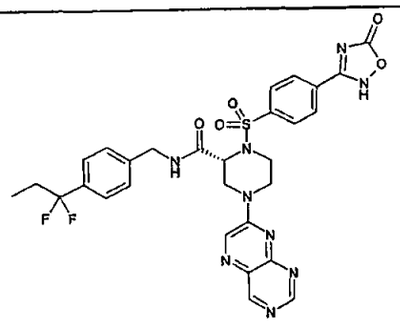
実施例番号	構造式
755	
756	
757	
758	
759	

表153

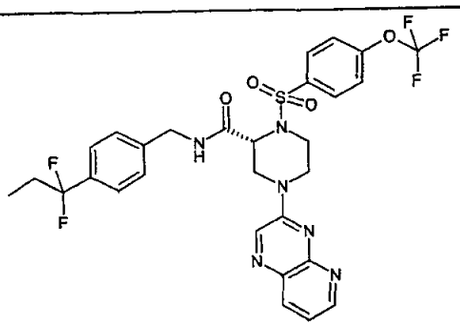
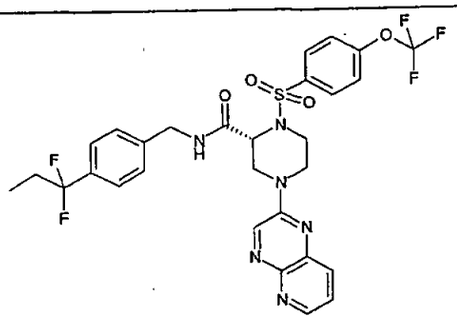
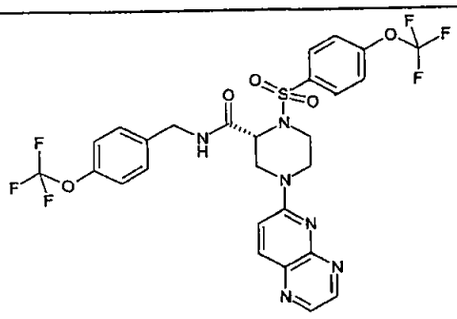
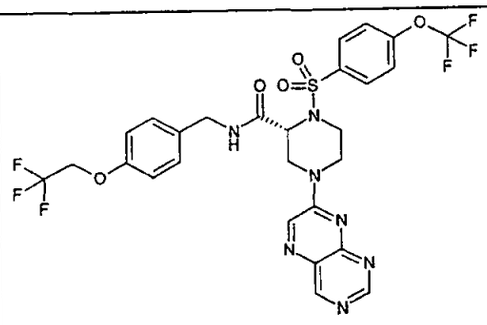
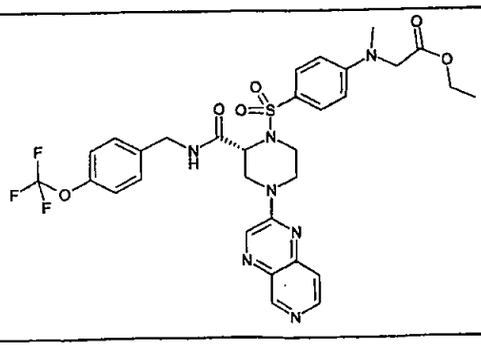
実施例番号	構造式
760	
761	
762	
763	
764	

表154

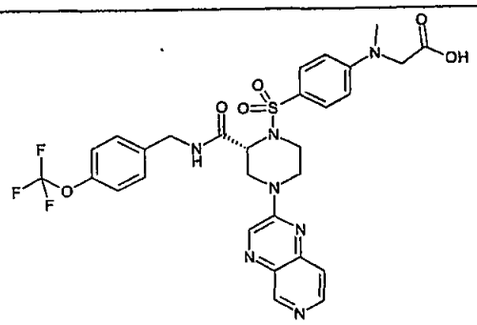
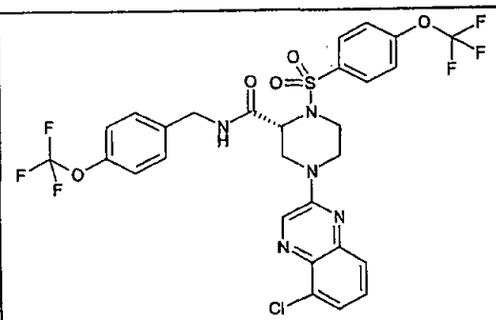
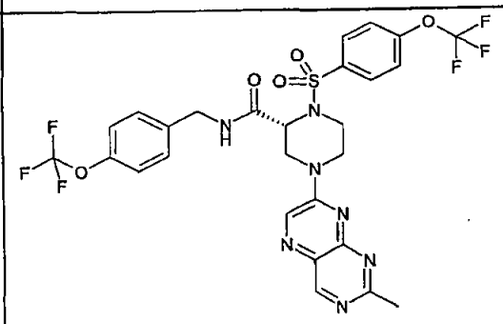
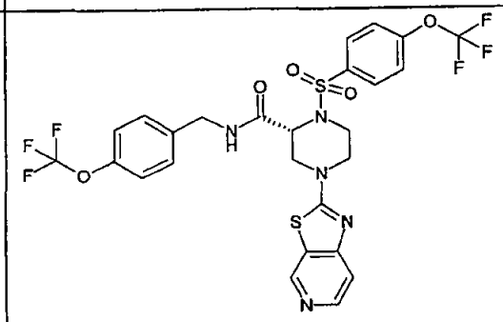
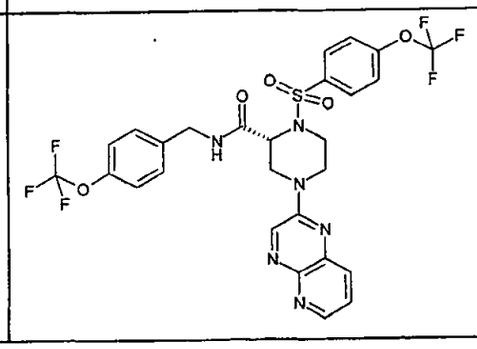
実施例番号	構造式
765	
766	
767	
768	
769	

表155

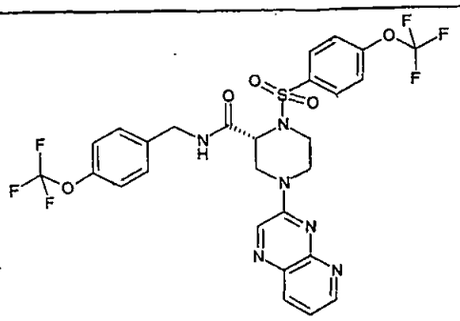
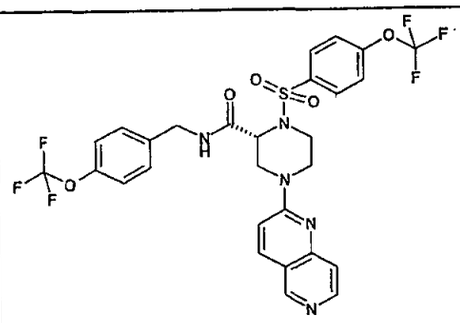
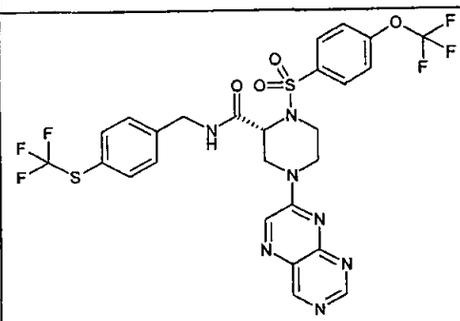
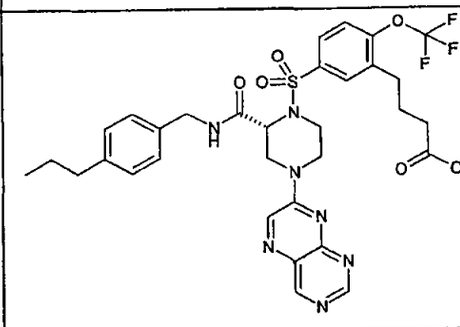
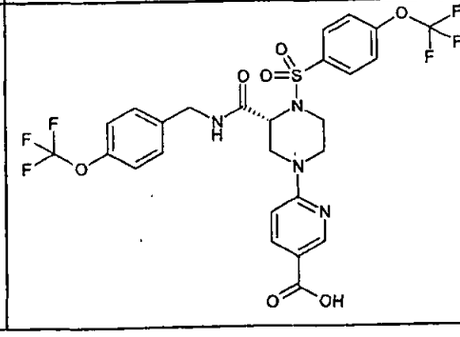
実施例番号	構造式
770	
771	
772	
773	
774	

表156

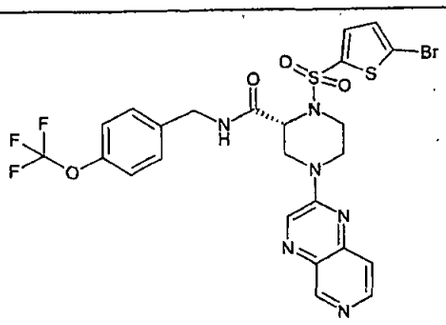
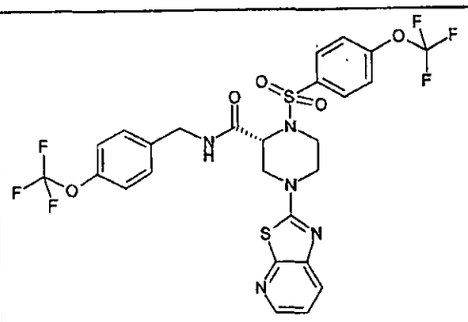
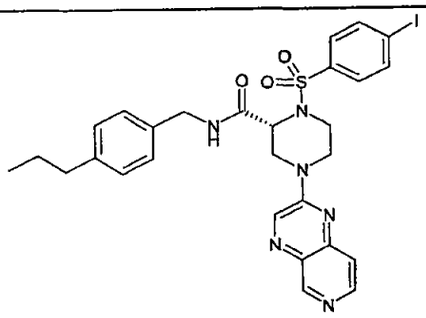
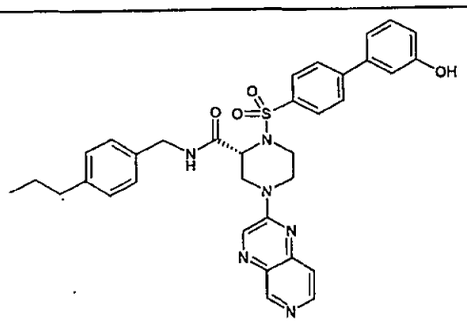
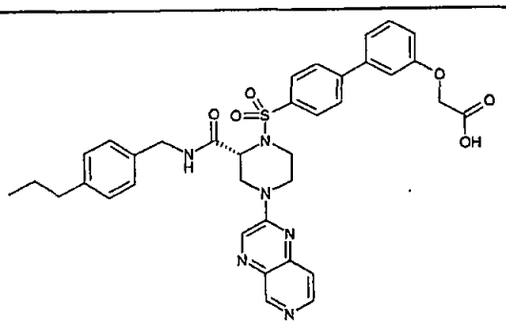
実施例番号	構造式
775	
776	
777	
778	
779	

表157

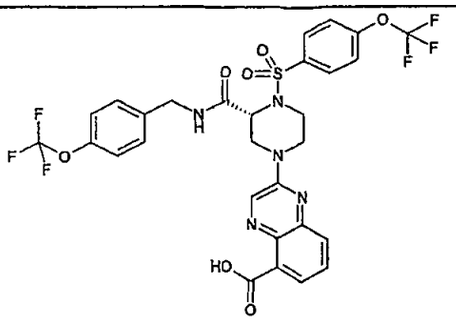
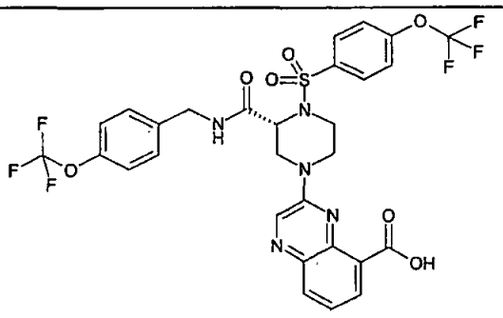
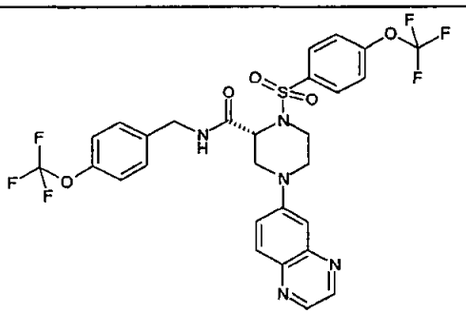
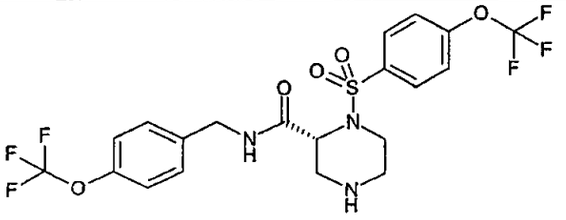
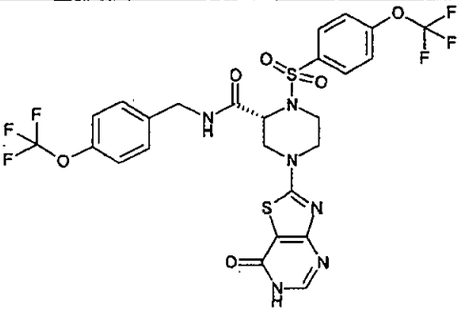
実施例番号	構造式
780	
781	
782	
783	
784	

表158

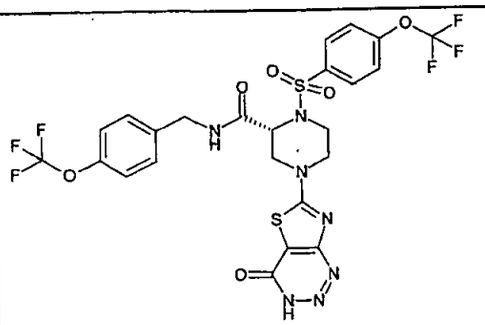
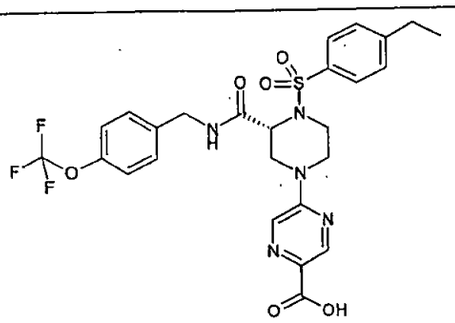
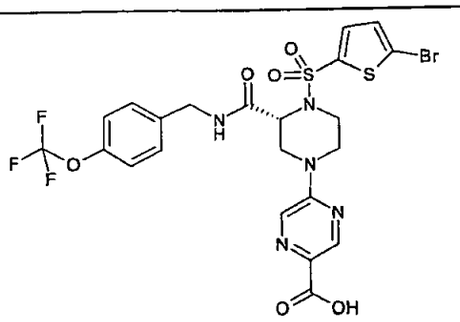
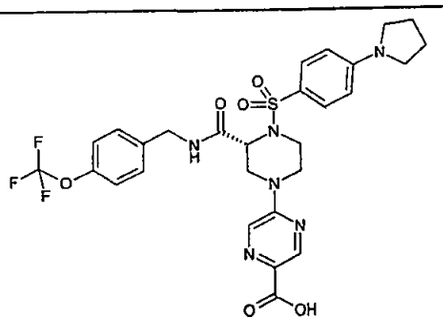
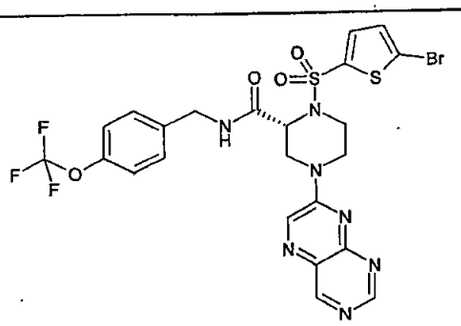
実施例番号	構造式
785	
786	
787	
788	
789	

表159

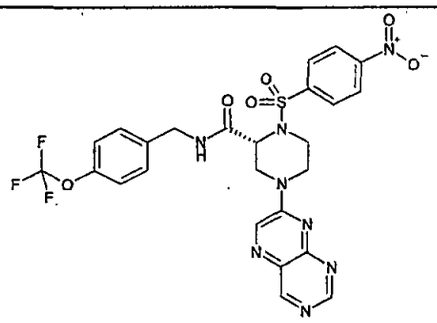
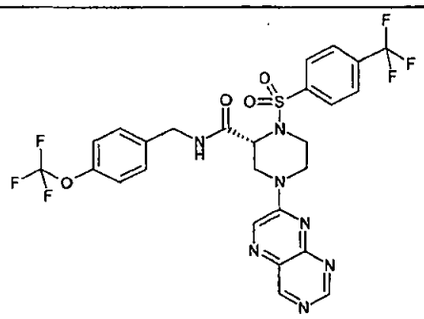
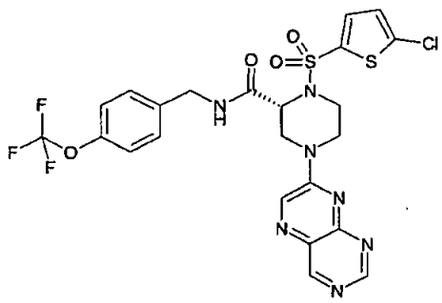
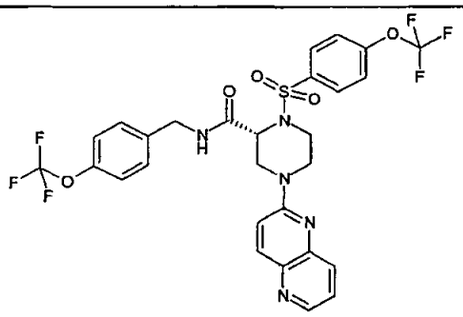
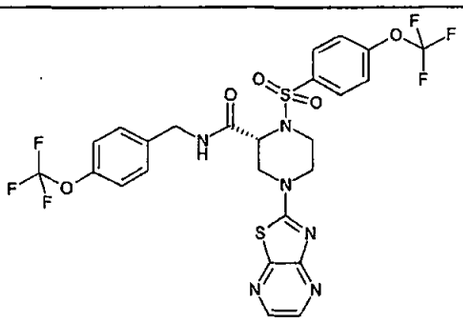
実施例番号	構造式
790	
791	
792	
793	
794	

表160

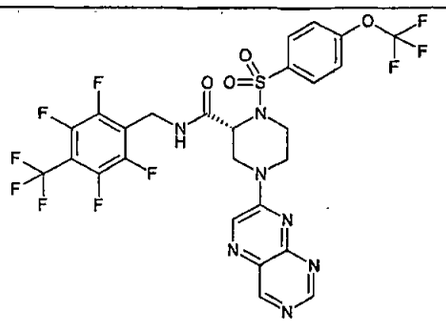
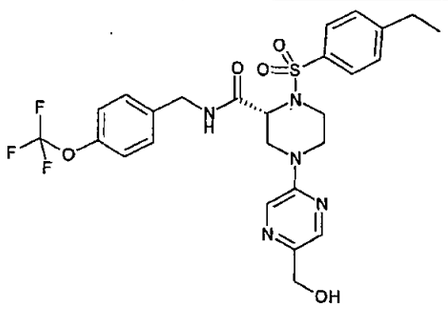
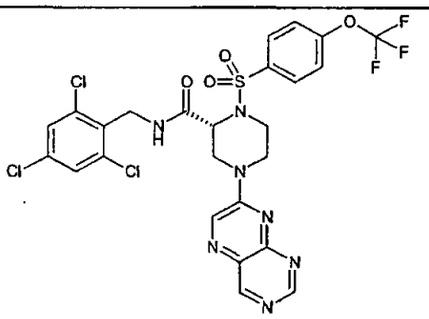
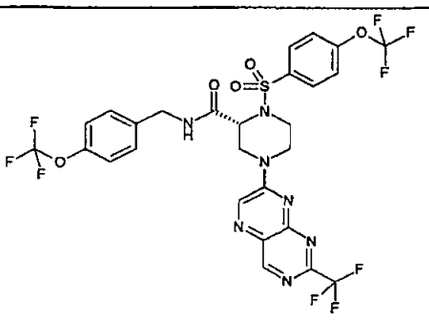
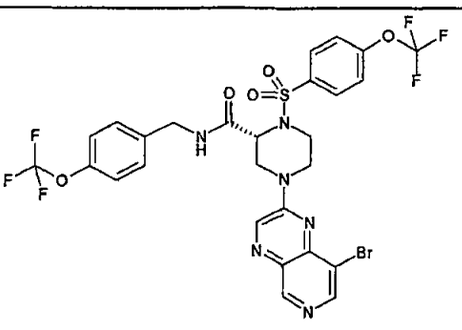
実施例番号	構造式
795	
796	
797	
798	
799	

表161

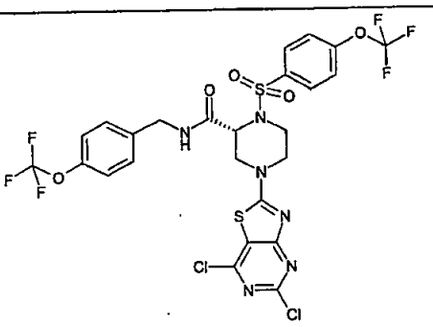
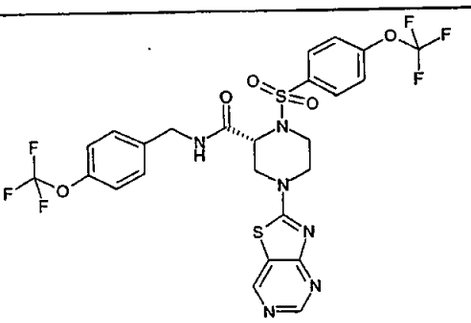
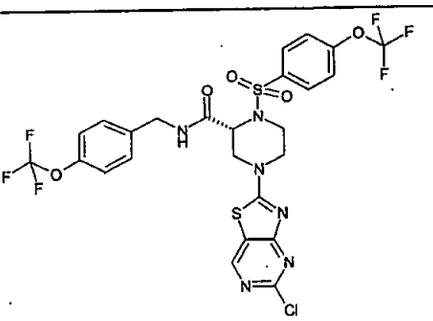
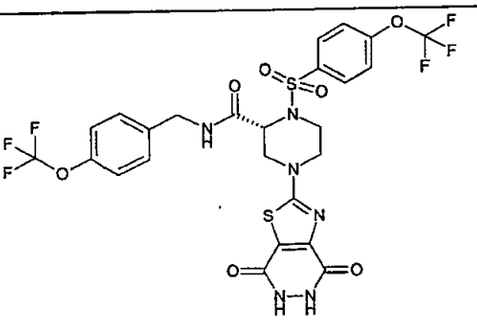
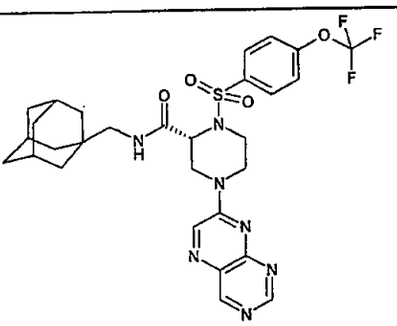
実施例番号	構造式
800	
801	
802	
803	
804	

表162

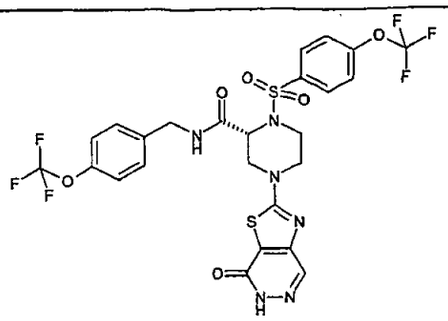
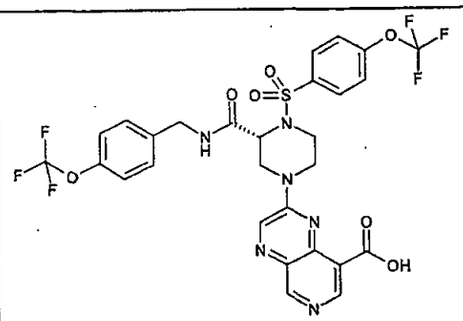
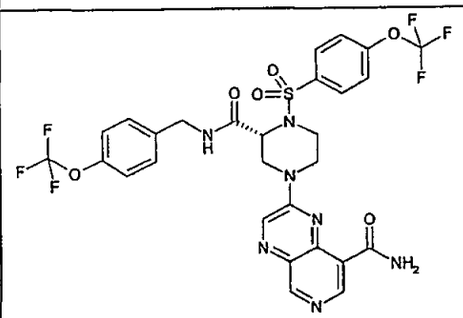
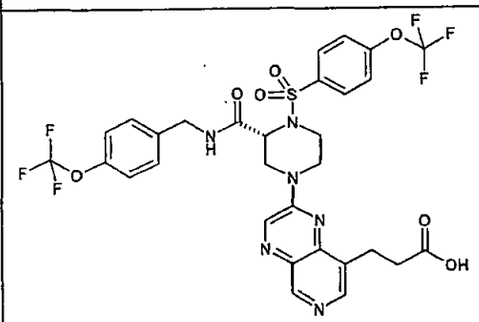
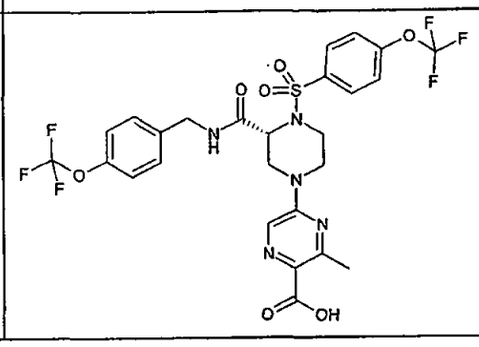
実施例番号	構造式
805	
806	
807	
808	
809	

表163

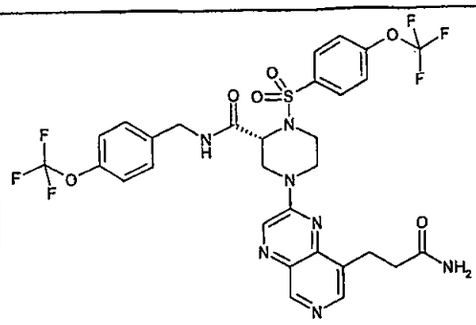
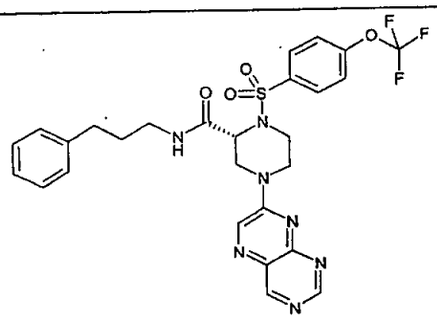
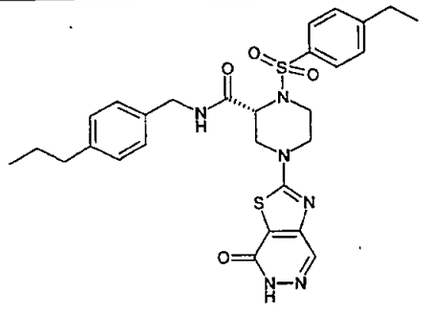
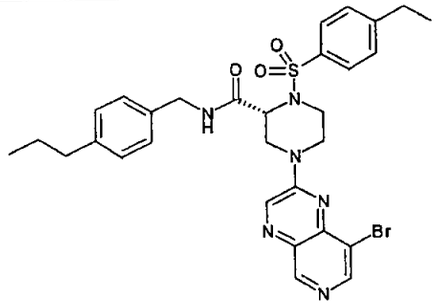
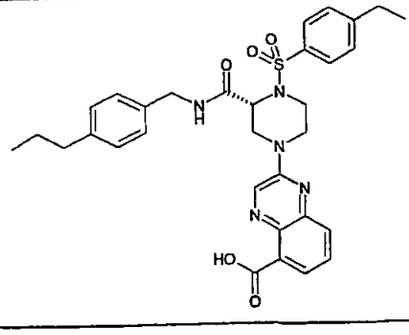
実施例番号	構造式
810	
811	
812	
813	
814	

表164

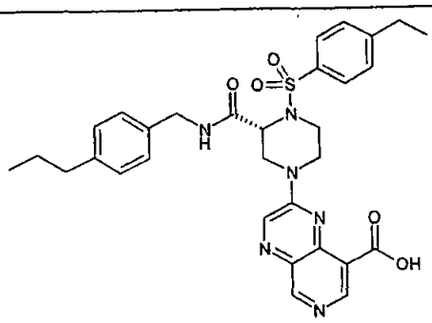
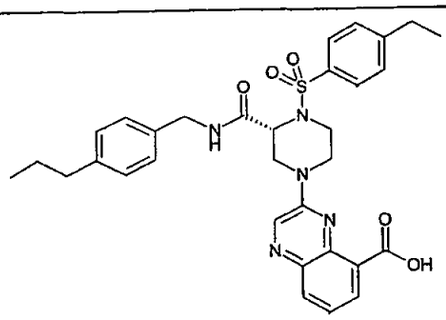
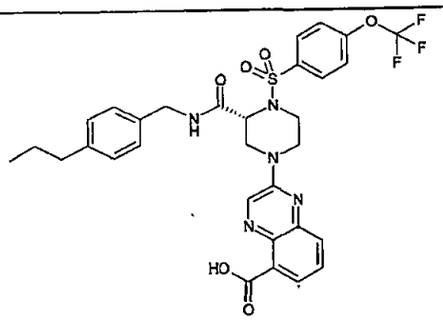
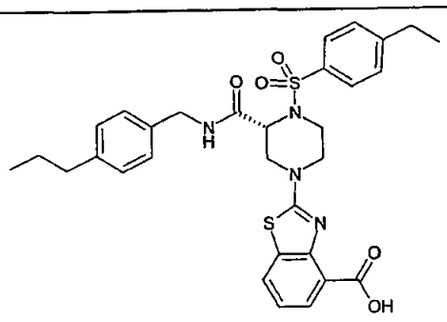
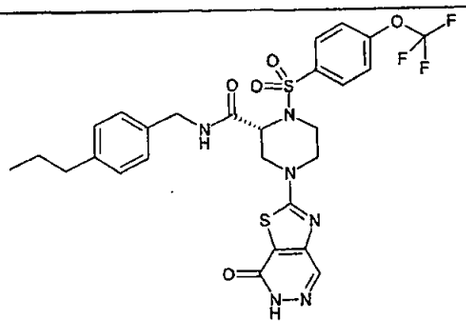
実施例番号	構造式
815	
816	
817	
818	
819	

表165

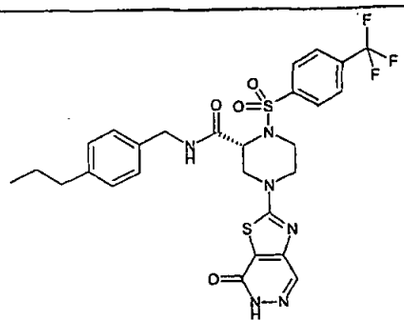
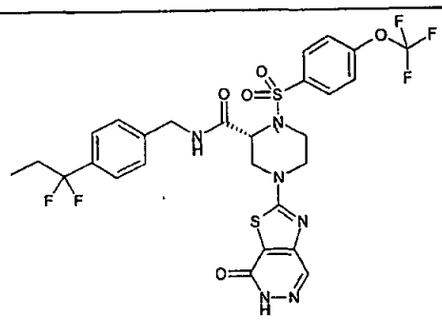
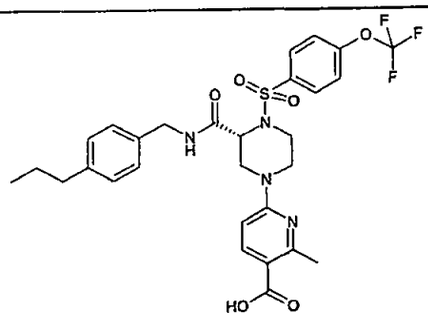
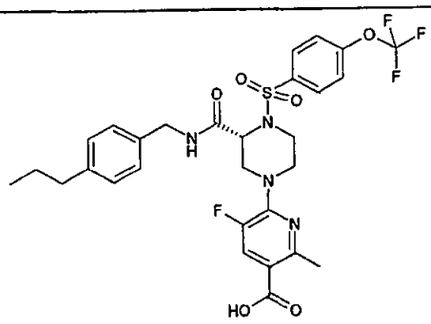
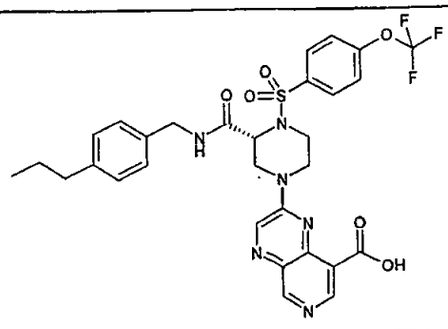
実施例番号	構造式
820	
821	
822	
823	
824	

表166

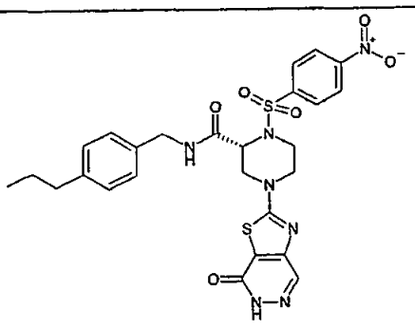
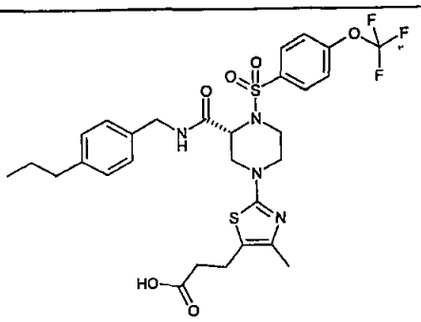
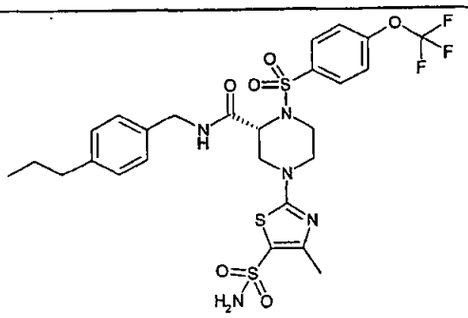
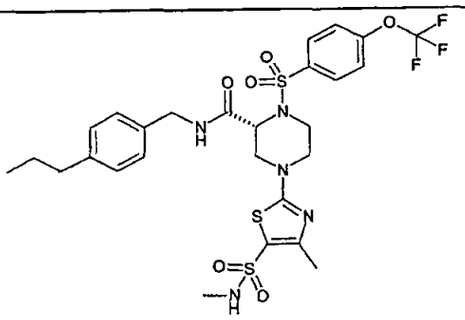
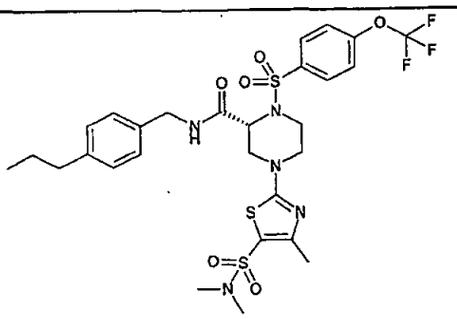
実施例番号	構造式
825	
826	
827	
828	
829	

表167

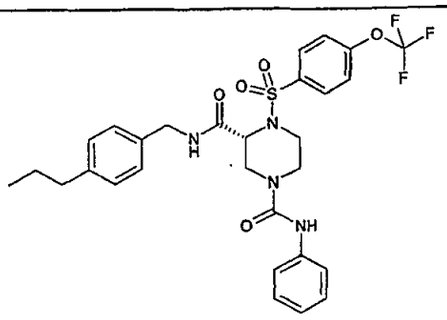
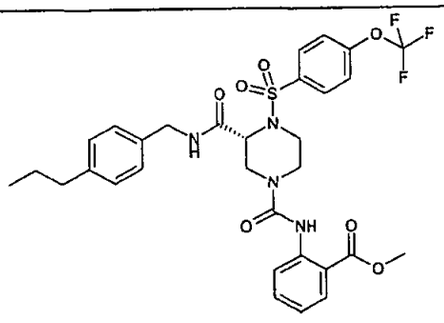
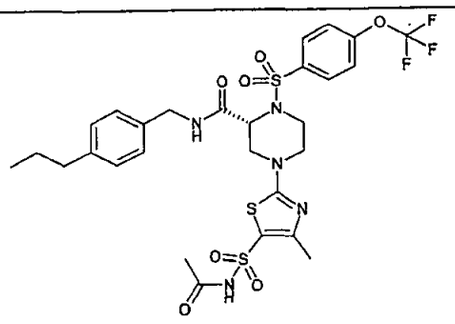
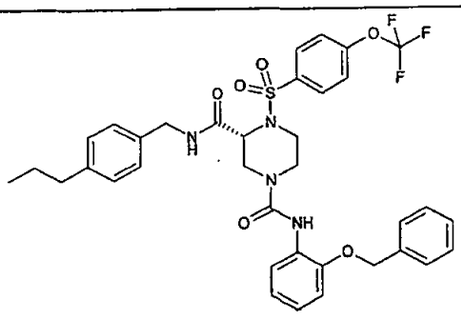
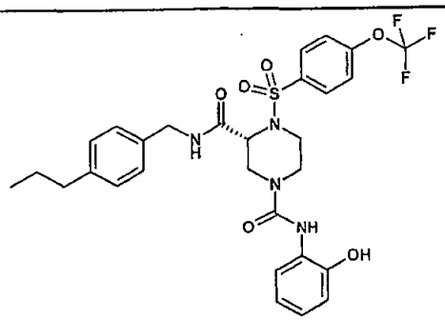
実施例番号	構造式
830	
831	
832	
833	
834	

表168

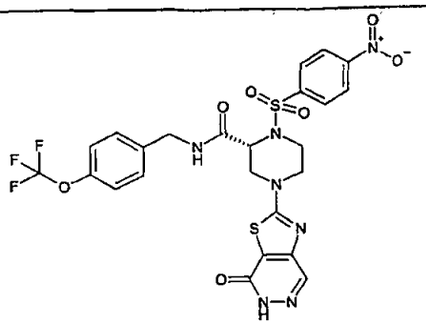
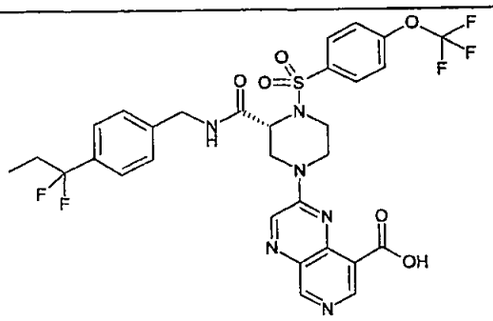
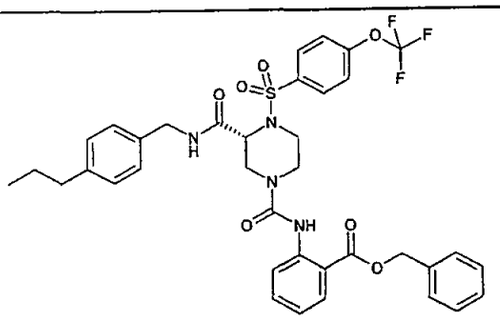
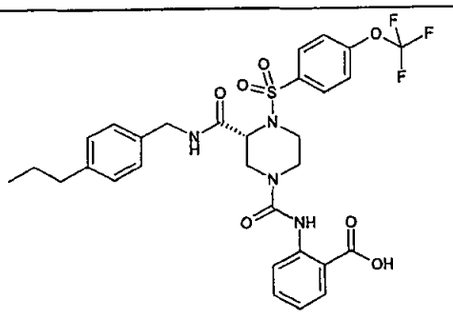
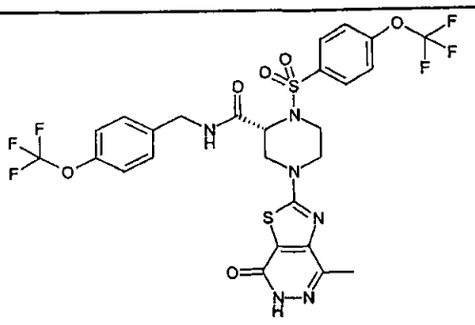
実施例番号	構造式
835	
836	
837	
838	
839	

表169

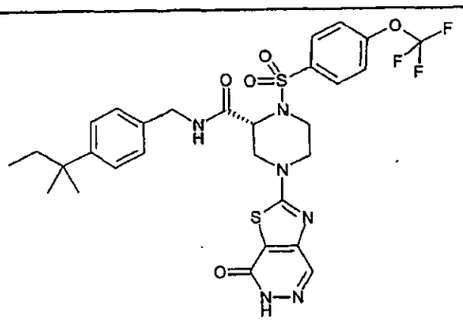
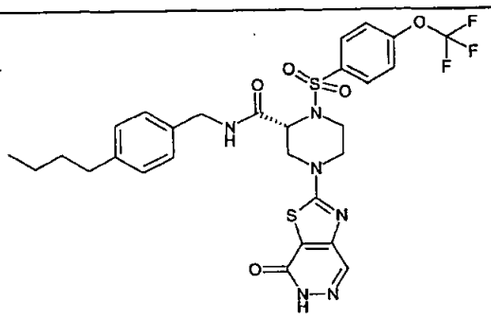
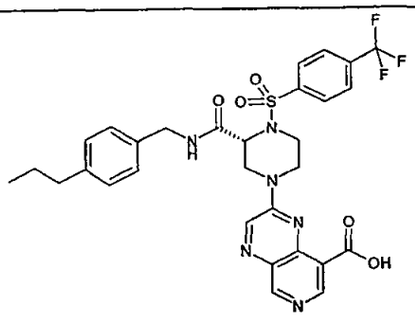
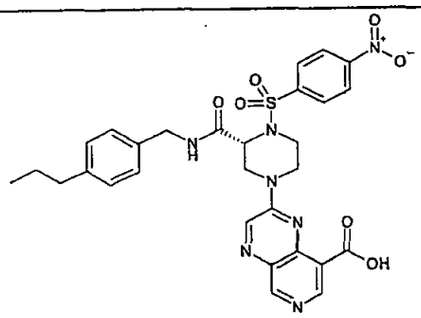
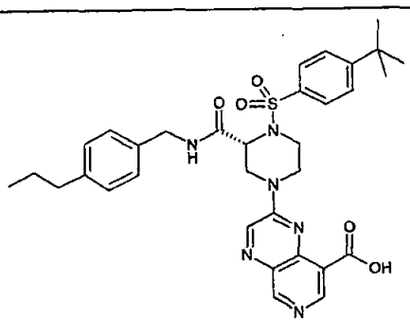
実施例番号	構造式
840	
841	
842	
843	
844	

表170

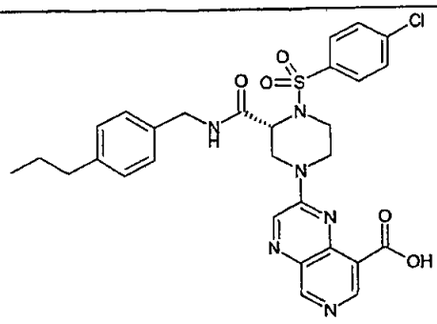
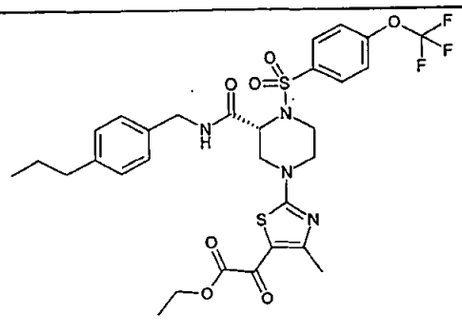
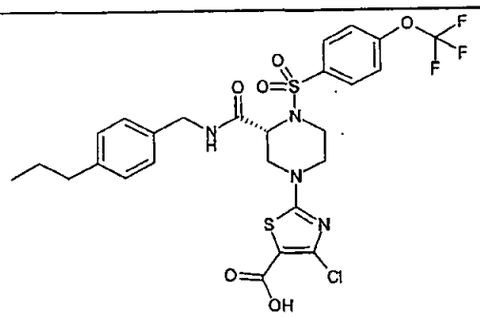
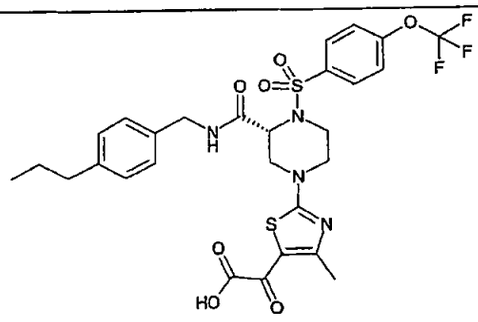
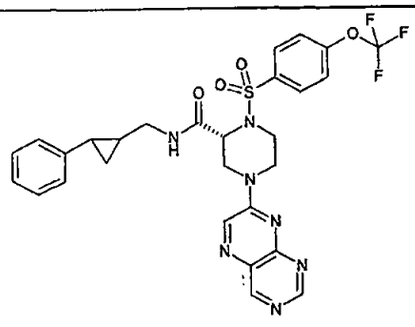
実施例番号	構造式
845	
846	
847	
848	
849	

表171

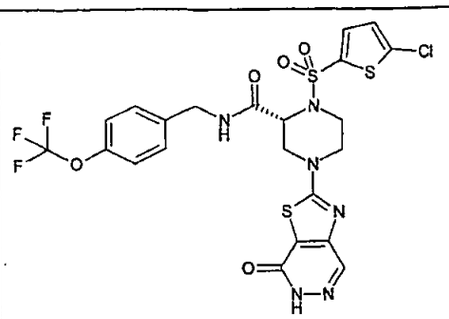
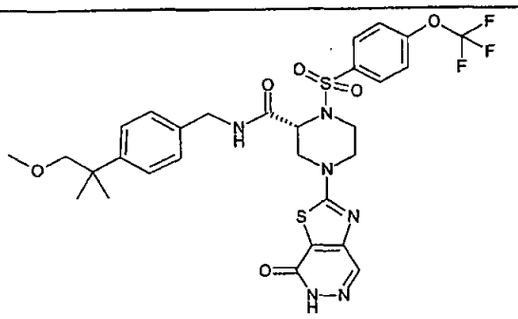
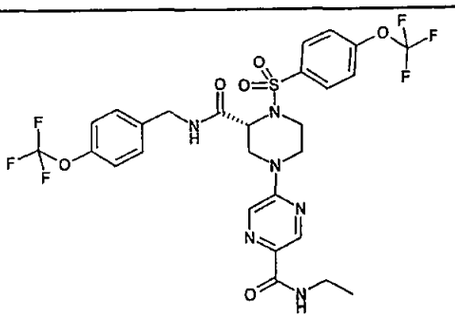
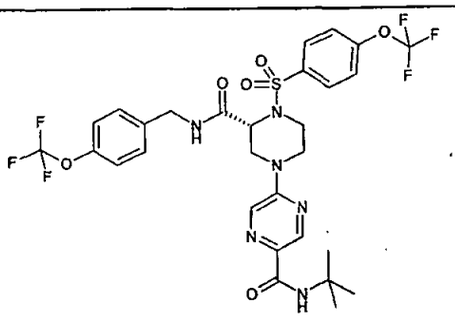
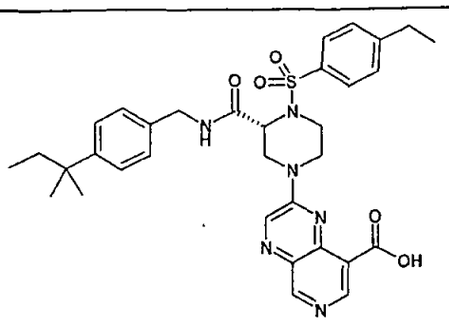
実施例番号	構造式
850	
851	
852	
853	
854	

表172

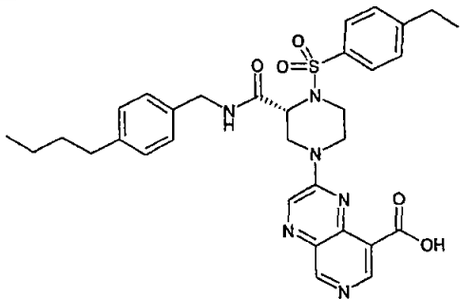
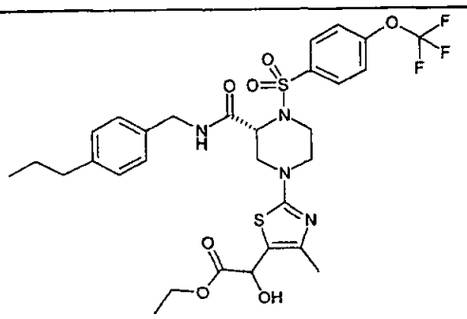
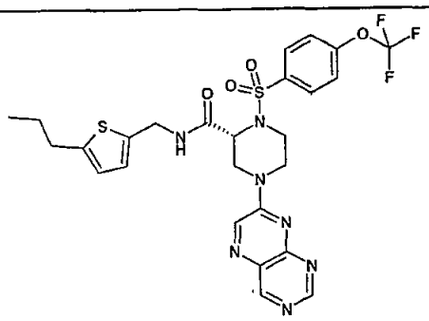
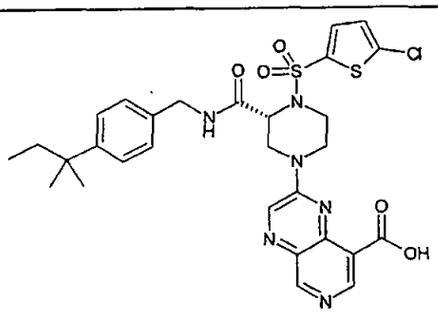
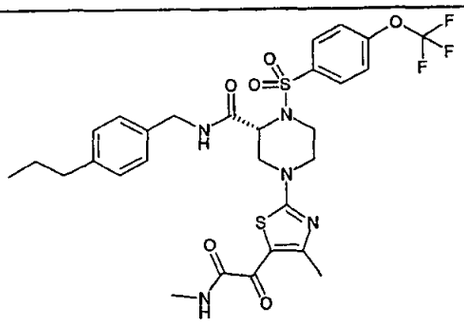
実施例番号	構造式
855	
856	
857	
858	
859	

表173

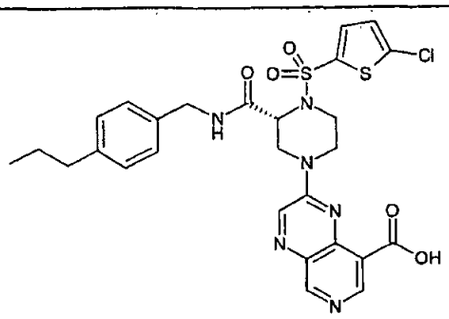
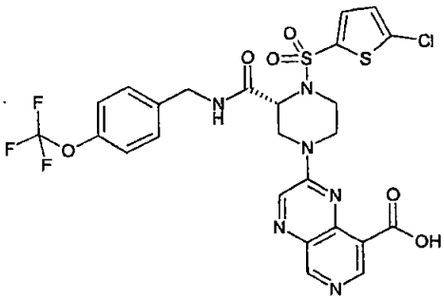
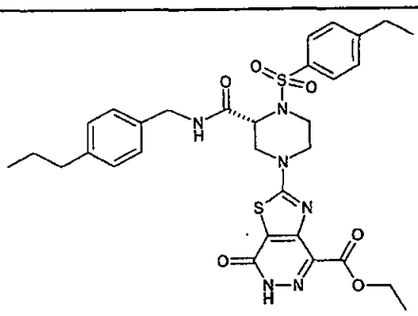
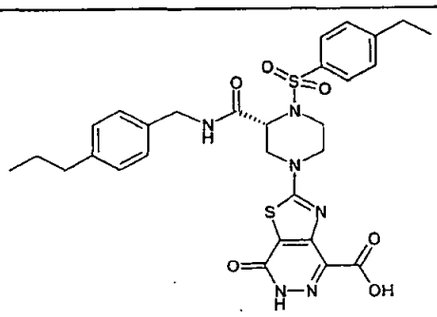
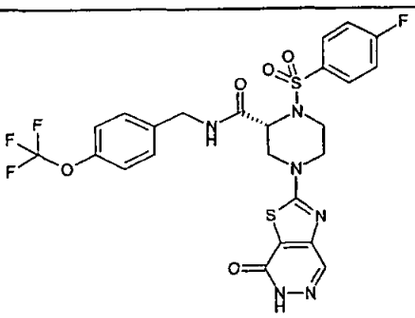
実施例番号	構造式
860	
861	
862	
863	
864	

表174

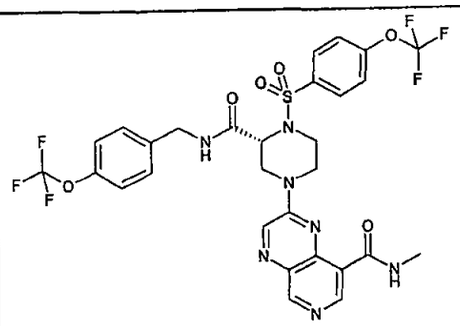
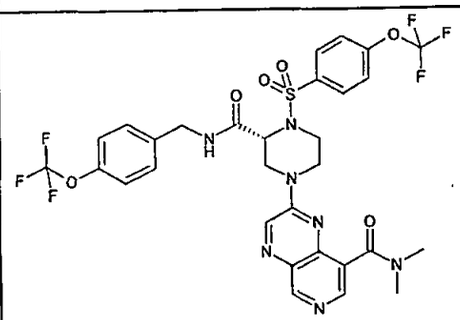
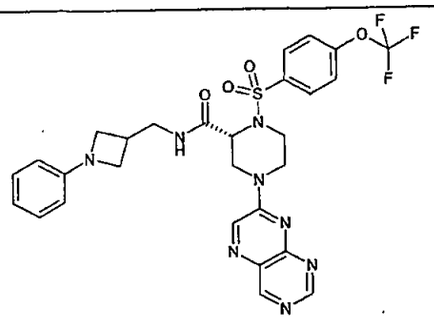
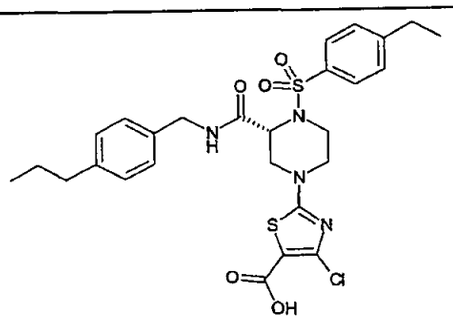
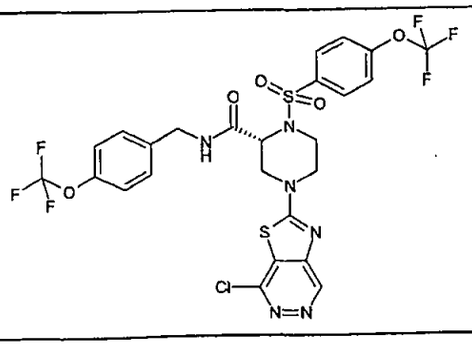
実施例番号	構造式
865	
866	
867	
868	
869	

表175

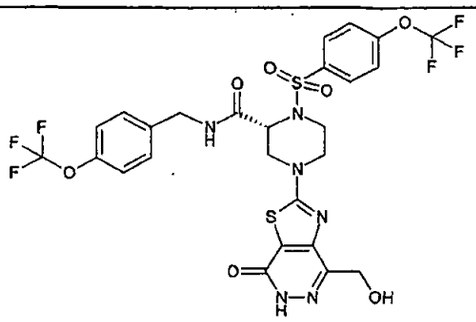
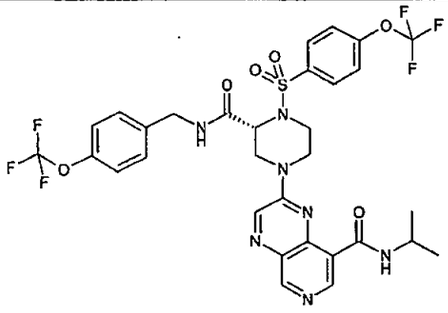
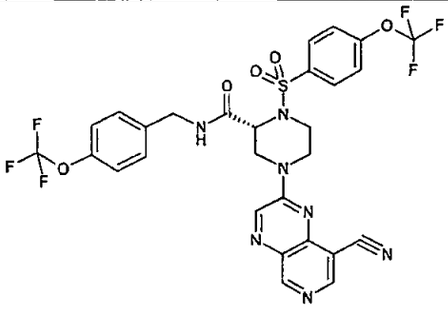
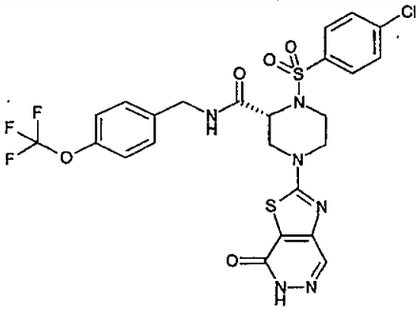
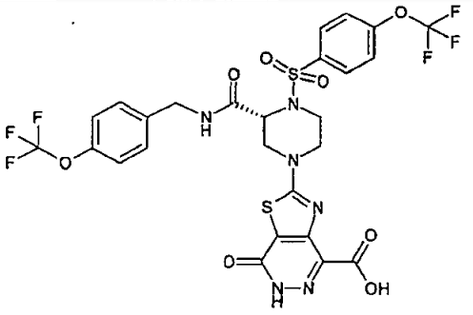
実施例番号	構造式
870	
871	
872	
873	
874	

表176

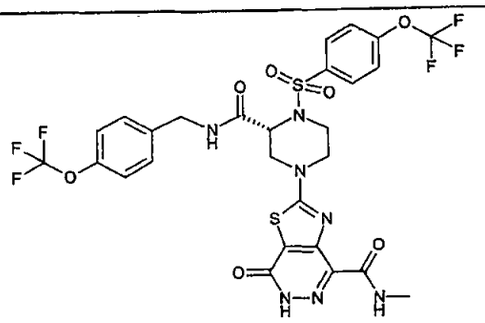
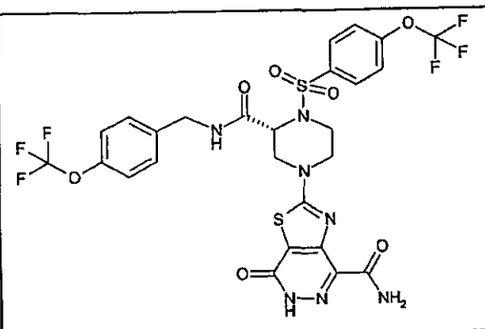
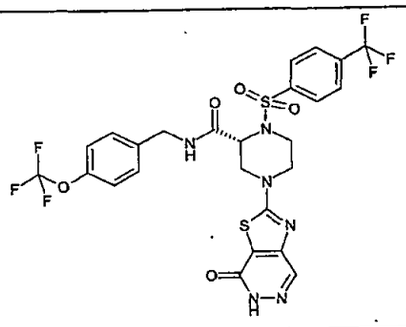
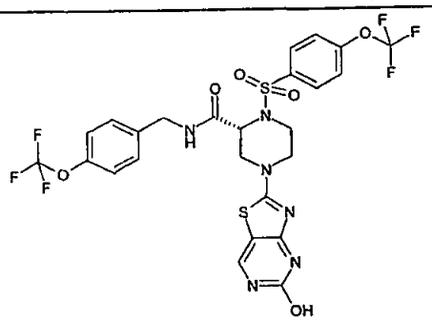
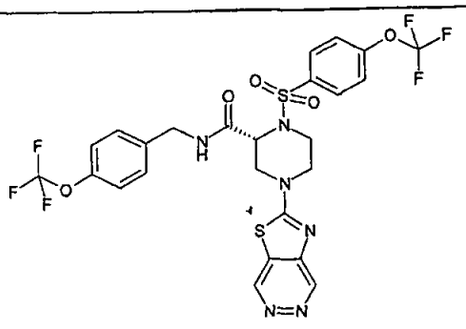
実施例番号	構造式
875	
876	
877	
878	
879	

表177

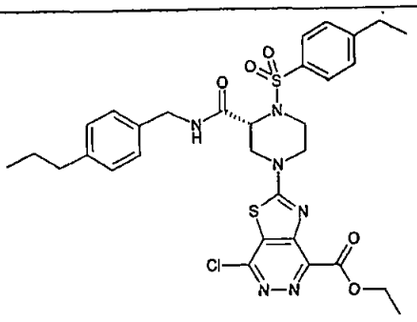
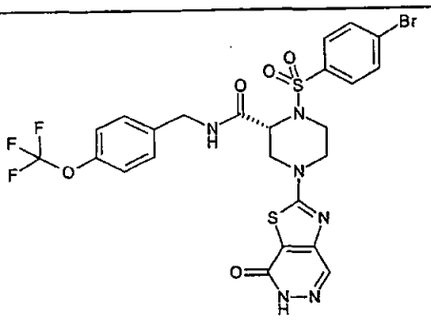
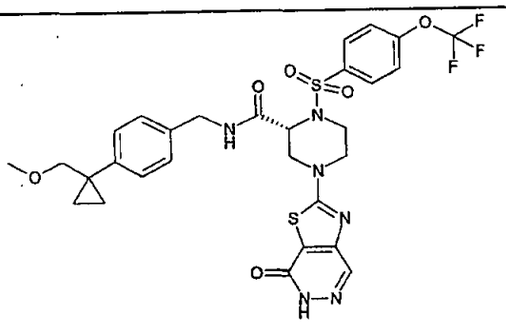
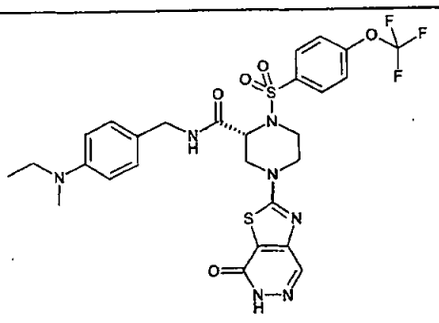
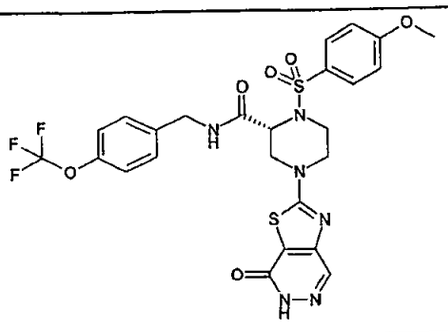
実施例番号	構造式
880	
881	
882	
883	
884	

表178

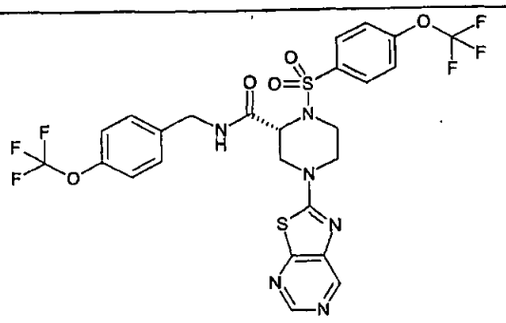
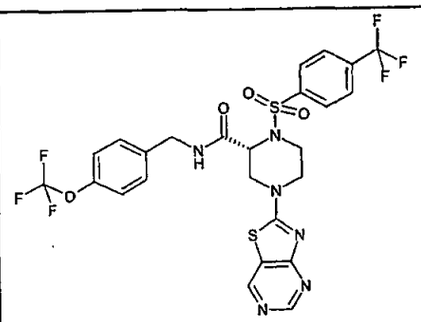
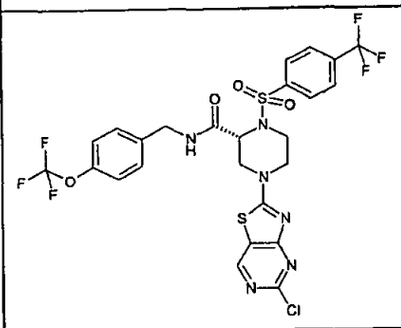
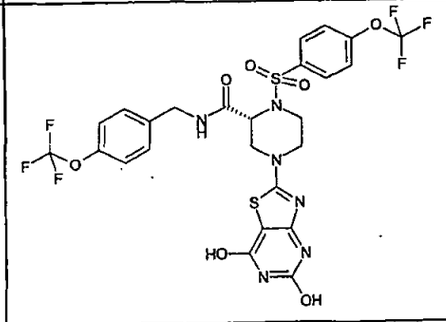
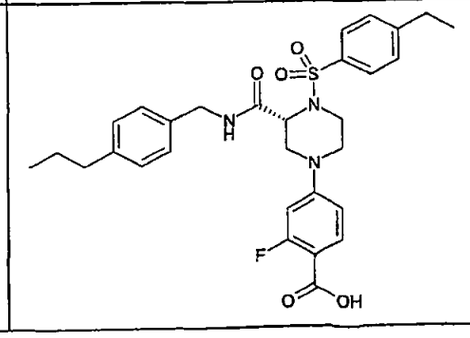
実施例番号	構造式
885	
886	
887	
888	
889	

表179

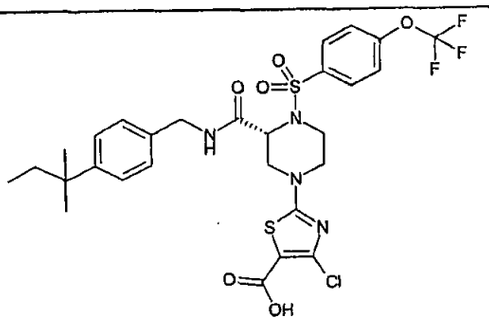
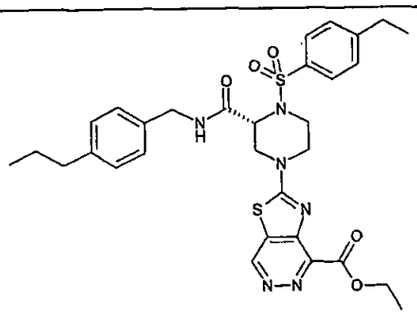
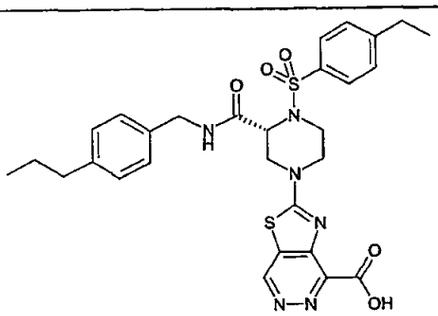
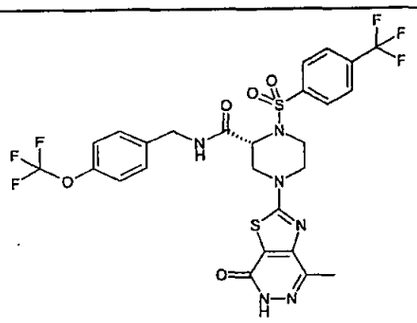
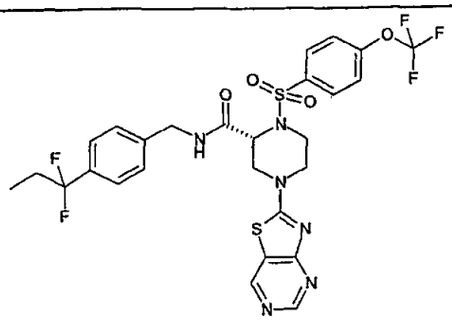
実施例番号	構造式
890	
891	
892	
893	
894	

表180

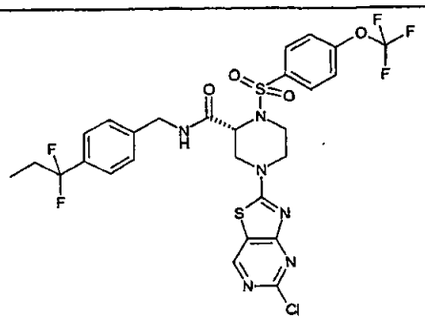
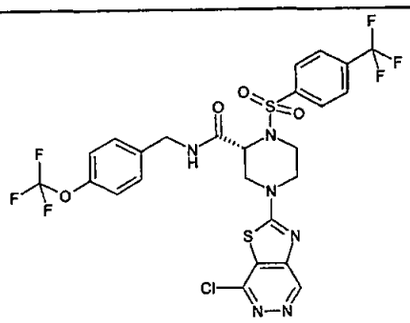
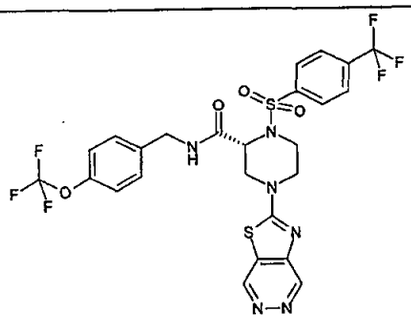
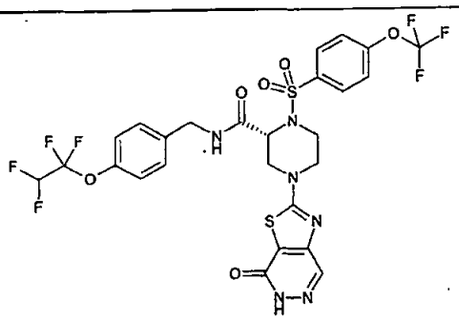
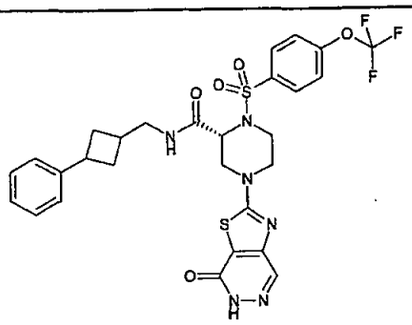
実施例番号	構造式
895	
896	
897	
898	
899	

表181

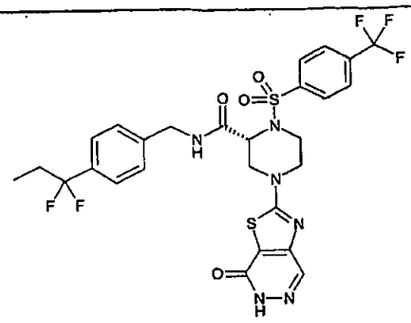
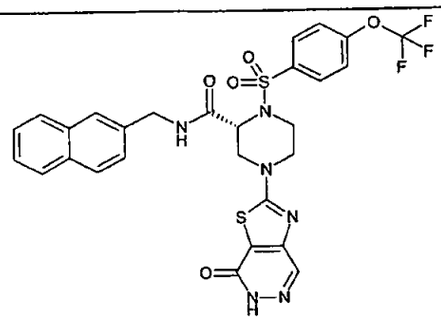
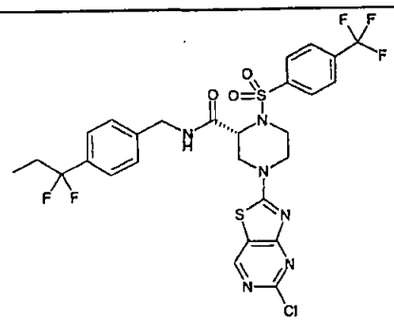
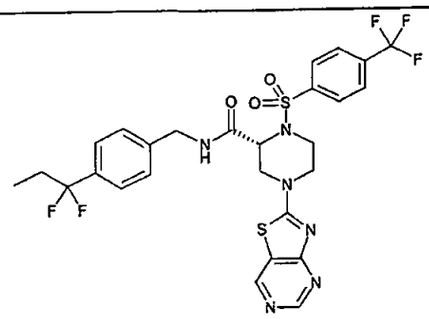
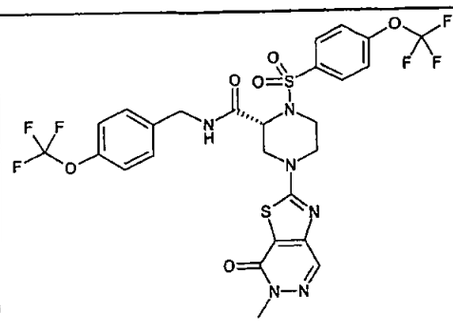
実施例番号	構造式
900	
901	
902	
903	
904	

表182

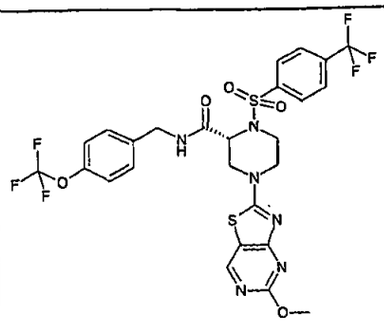
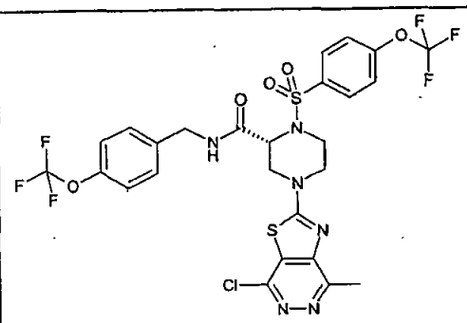
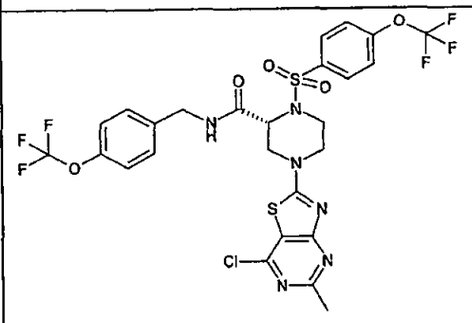
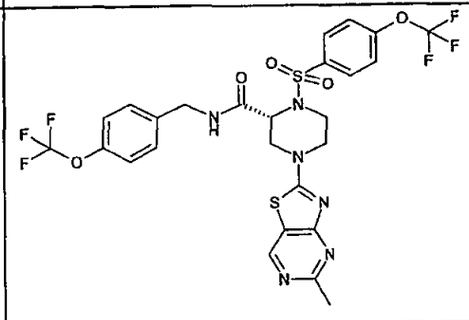
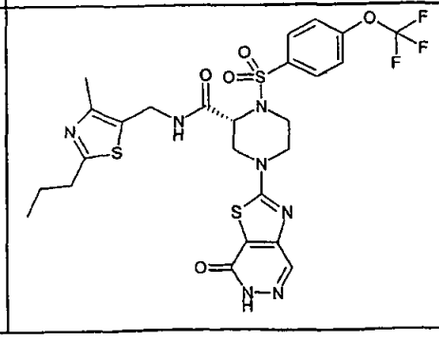
実施例番号	構造式
905	
906	
907	
908	
909	

表183

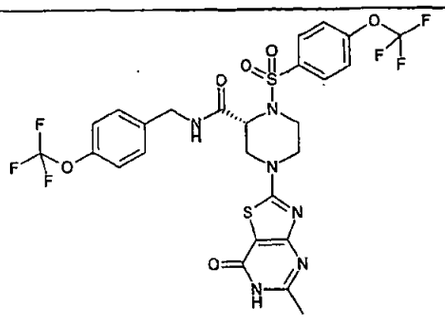
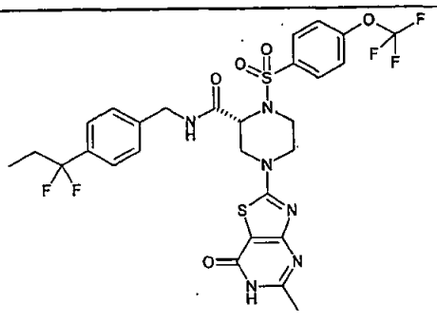
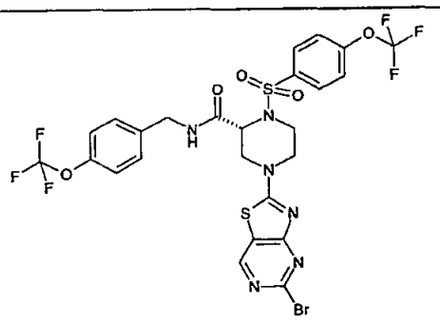
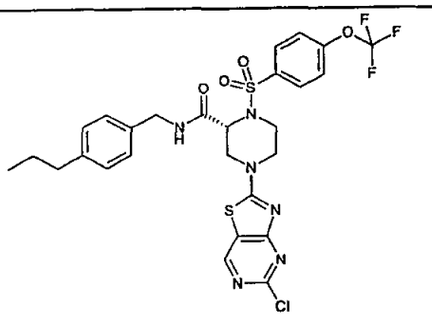
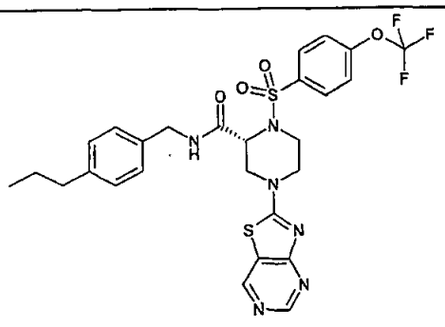
実施例番号	構造式
910	
911	
912	
913	
914	

表184

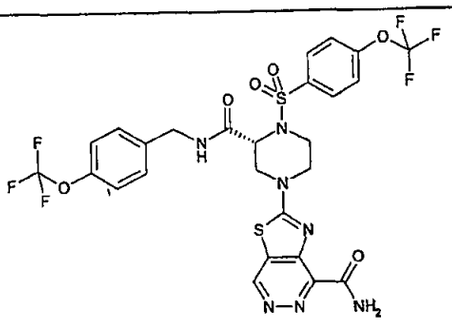
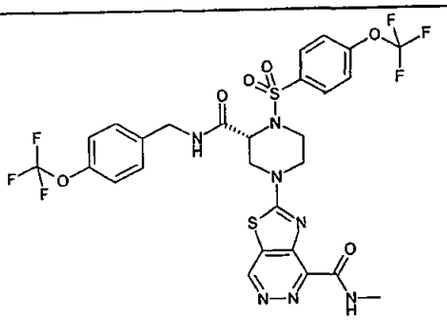
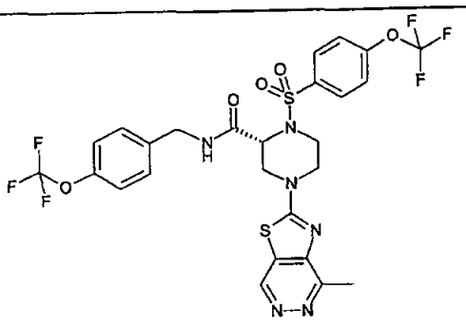
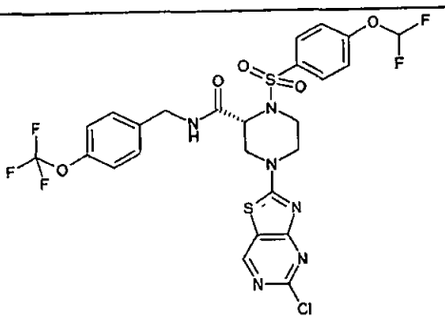
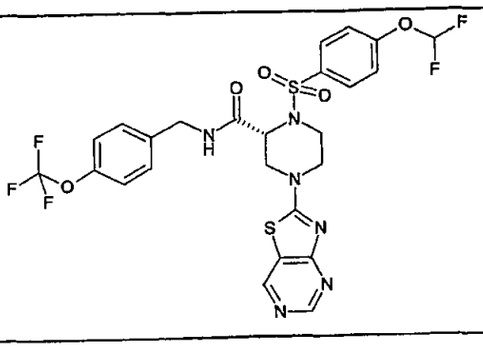
実施例番号	構造式
915	
916	
917	
918	
919	

表185

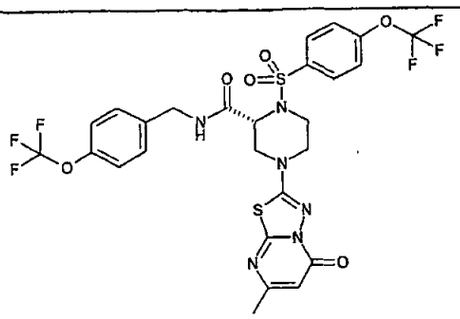
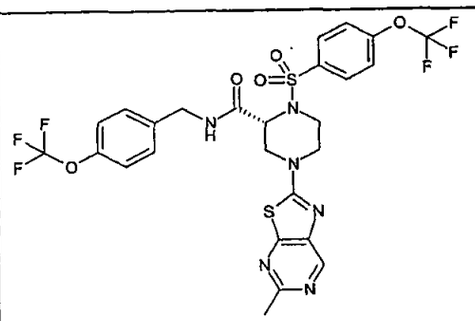
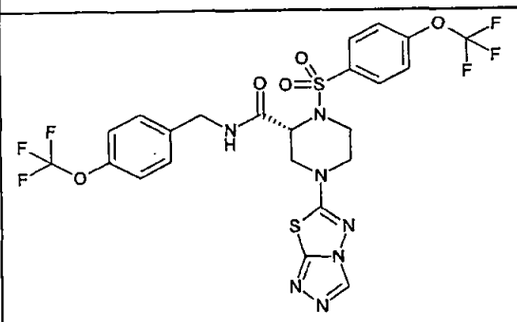
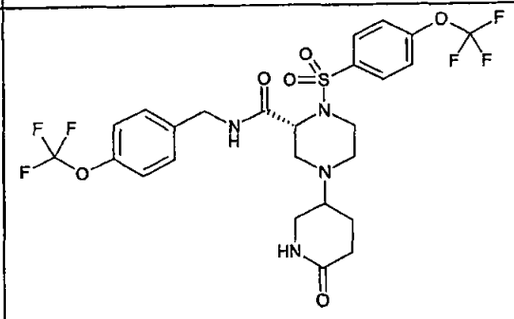
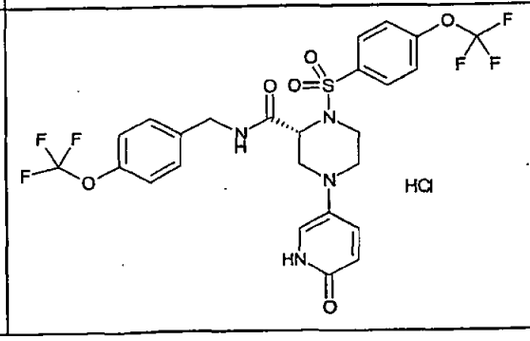
実施例番号	構造式
920	
921	
922	
923	
924	

表186

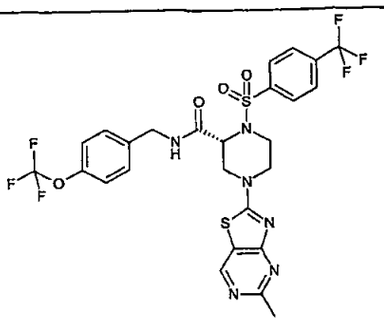
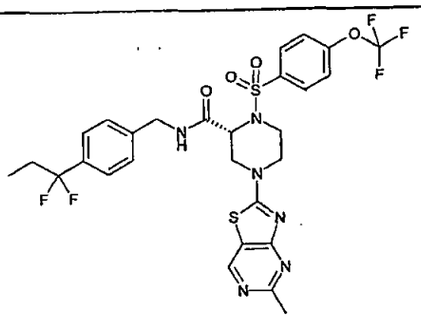
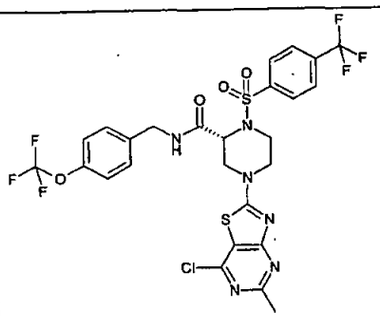
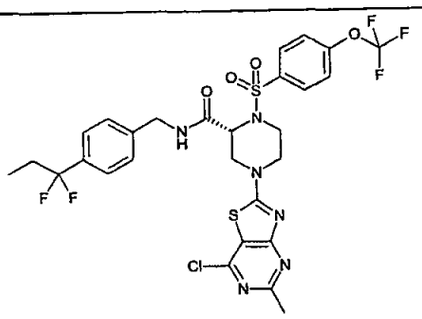
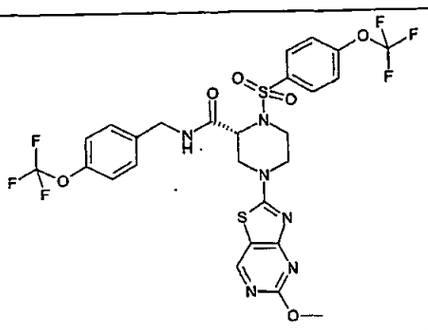
実施例番号	構造式
925	
926	
927	
928	
929	

表187

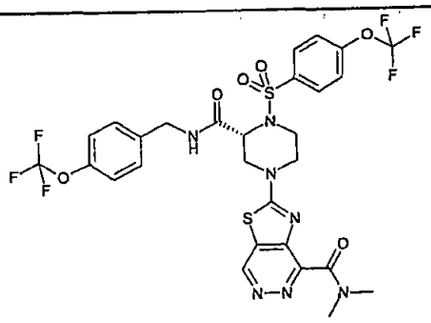
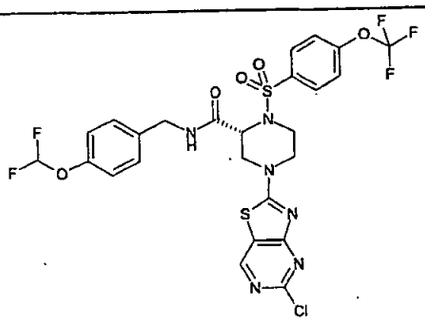
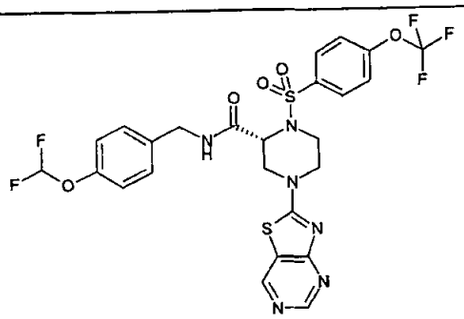
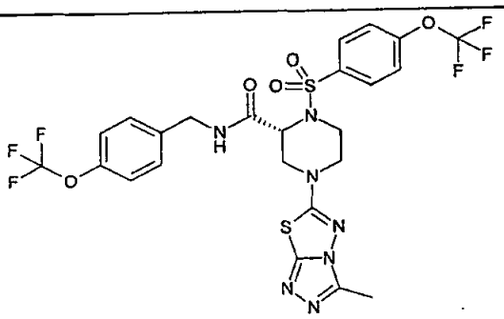
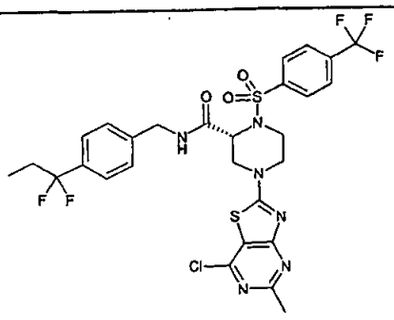
実施例番号	構造式
930	
931	
932	
933	
934	

表188

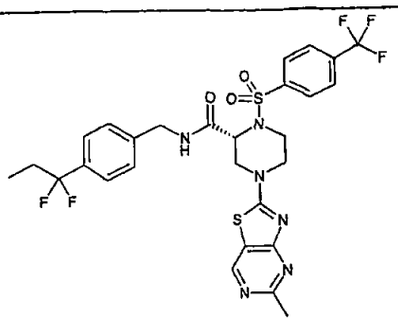
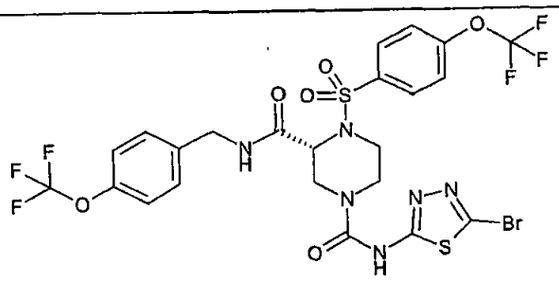
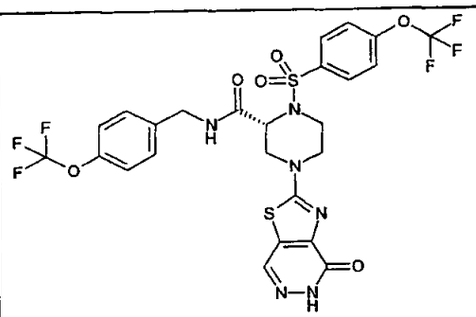
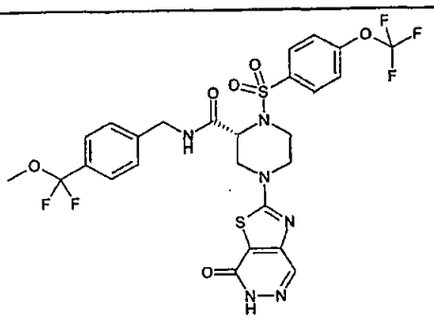
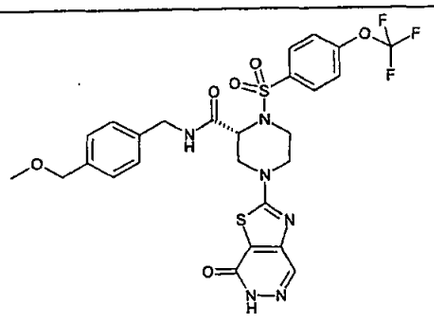
実施例番号	構造式
935	
936	
937	
938	
939	

表189

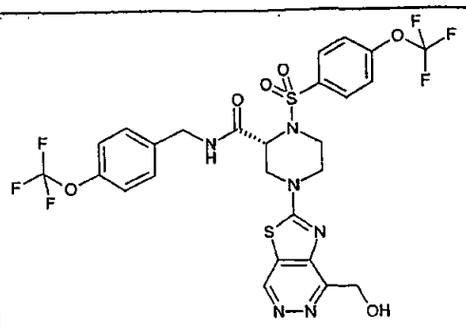
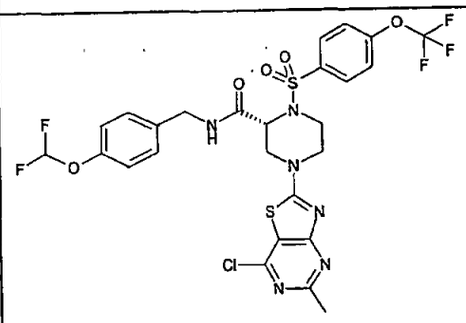
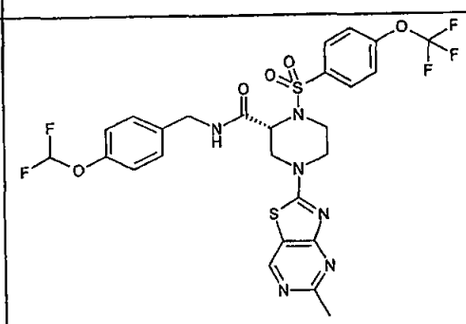
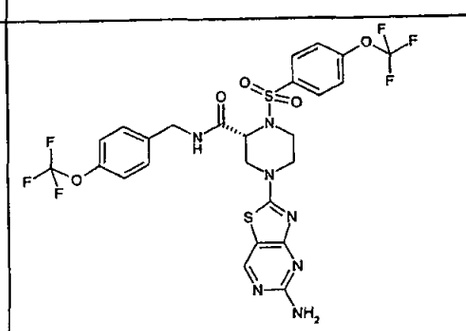
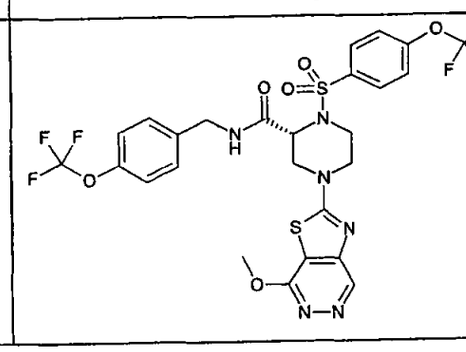
実施例番号	構造式
940	
941	
942	
943	
944	

表190

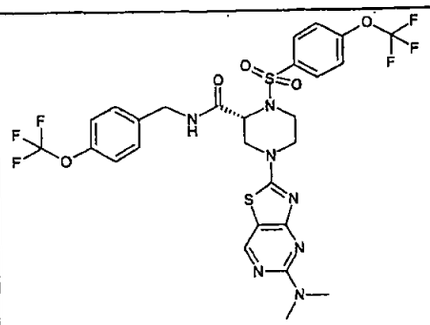
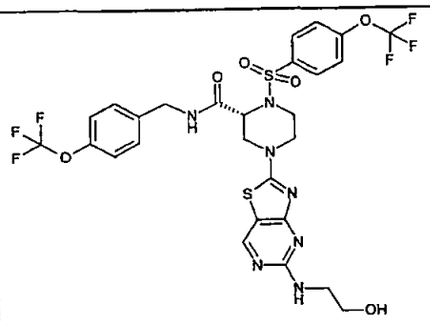
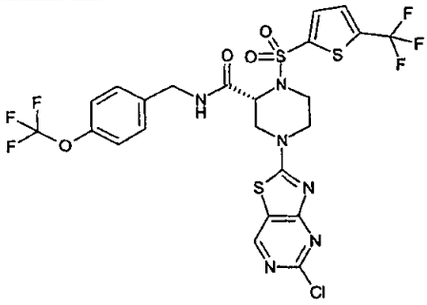
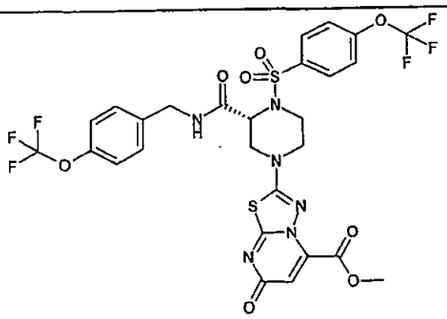
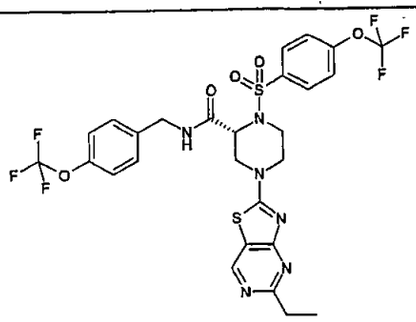
実施例番号	構造式
945	
946	
947	
948	
949	

表191

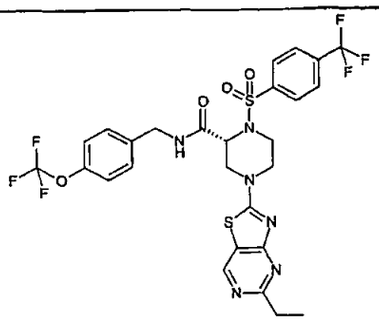
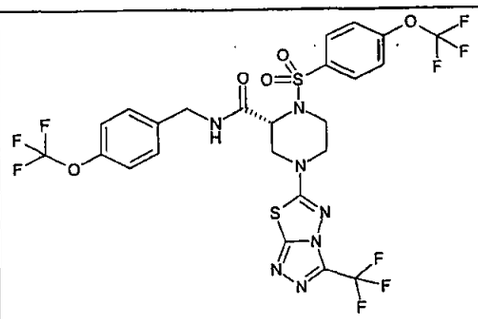
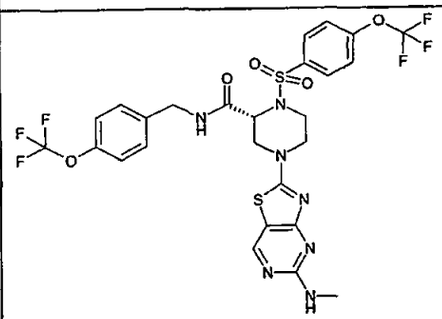
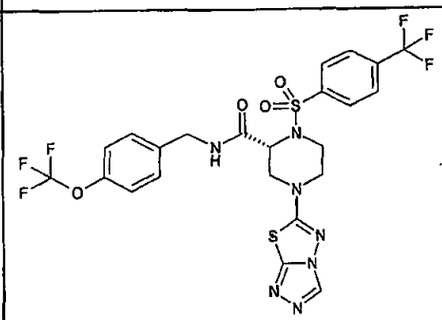
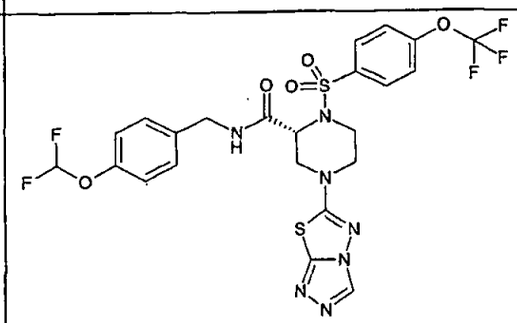
実施例番号	構造式
950	
951	
952	
953	
954	

表192

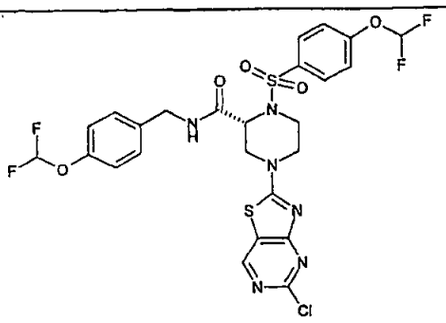
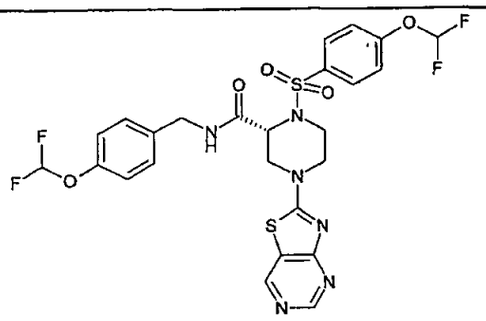
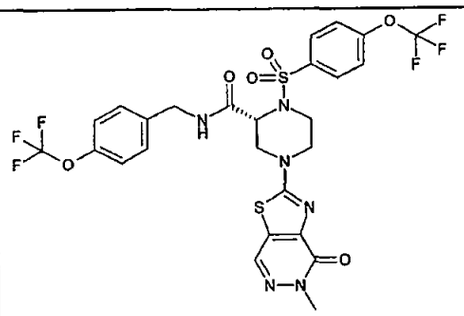
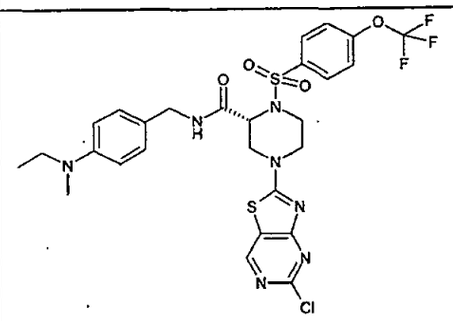
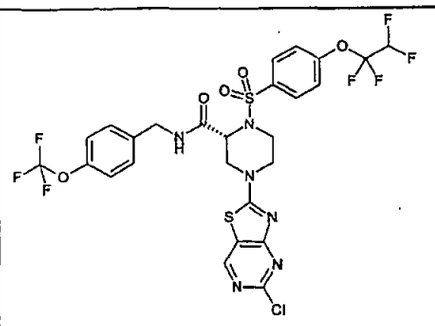
実施例番号	構造式
955	
956	
957	
958	
959	

表193

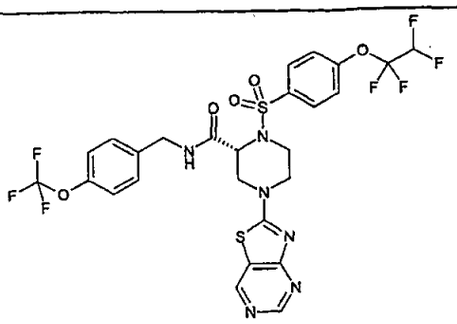
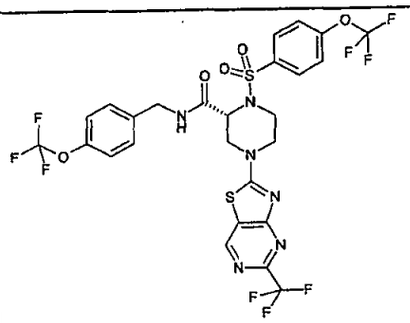
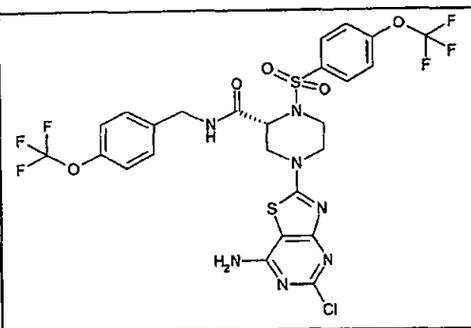
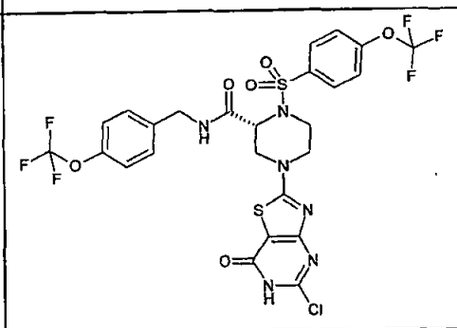
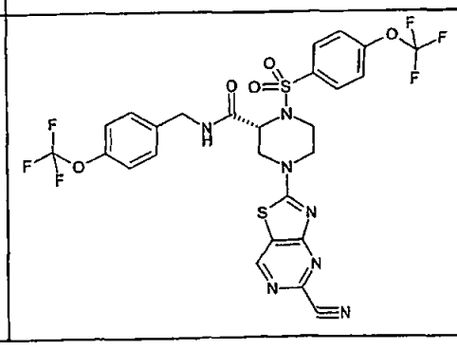
実施例番号	構造式
960	
961	
962	
963	
964	

表194

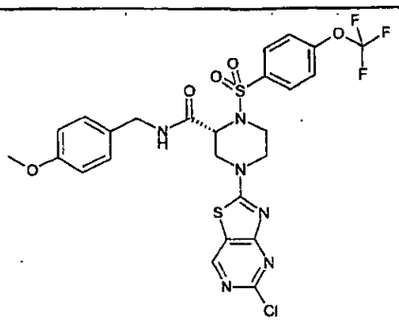
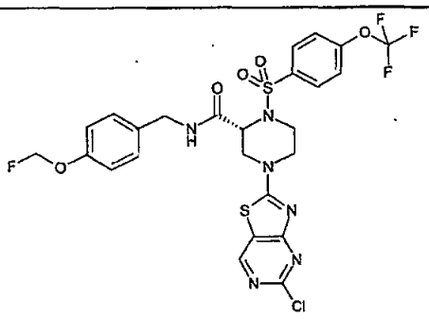
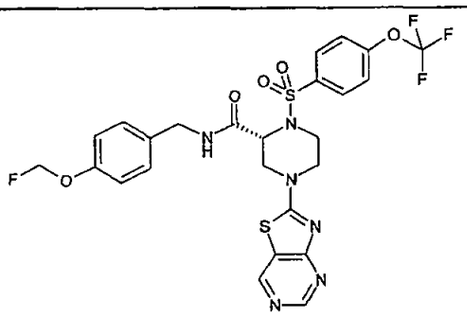
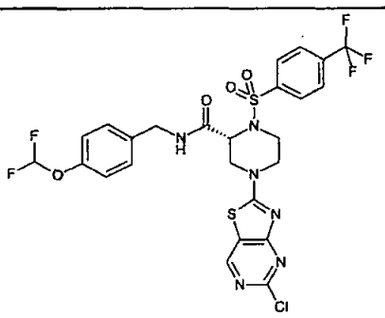
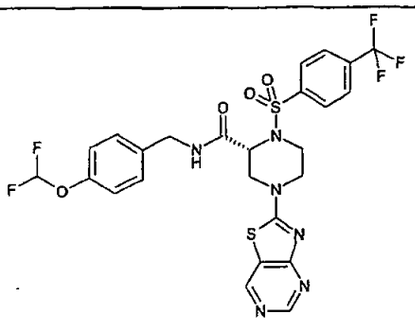
実施例番号	構造式
965	
966	
967	
968	
969	

表195

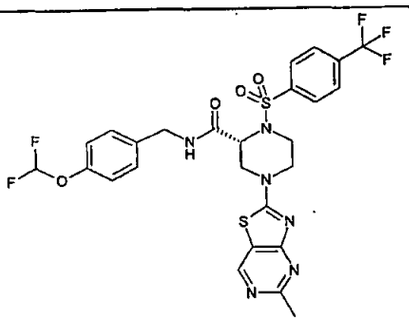
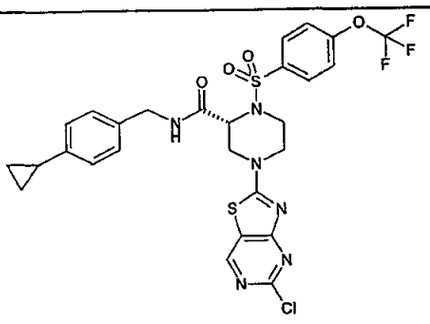
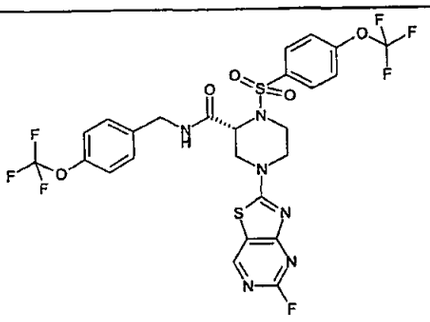
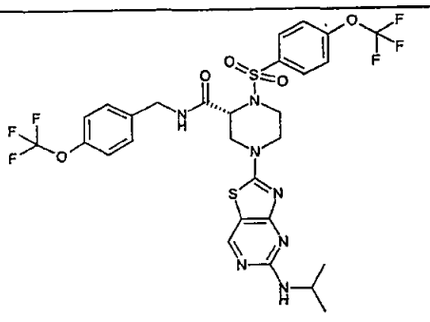
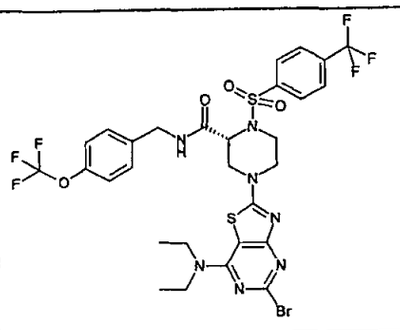
実施例番号	構造式
970	
971	
972	
973	
974	

表196

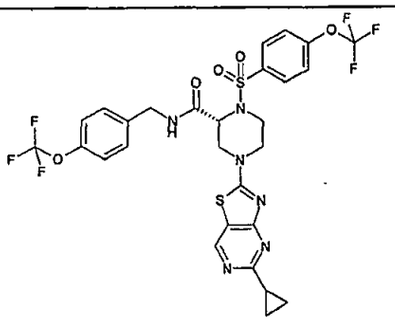
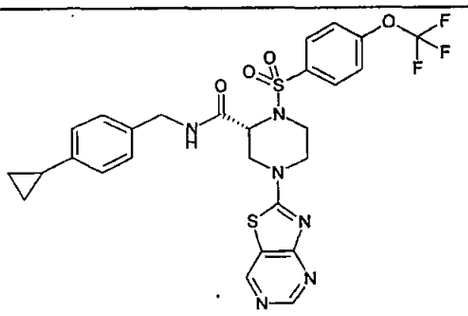
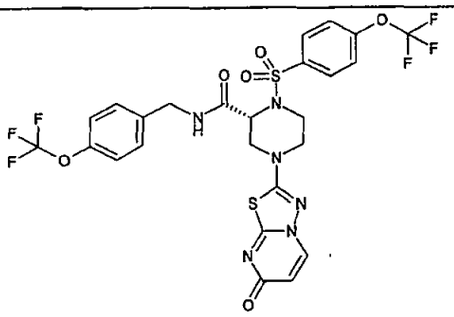
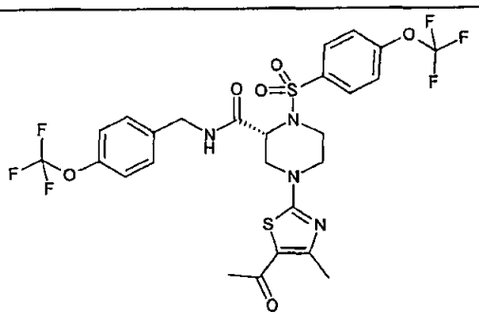
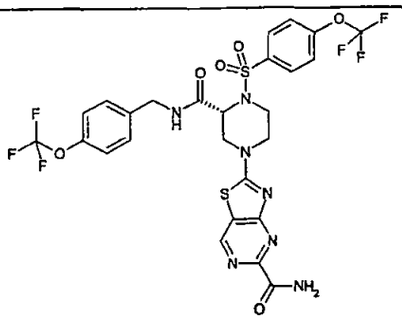
実施例番号	構造式
975	
976	
977	
978	
979	

表197

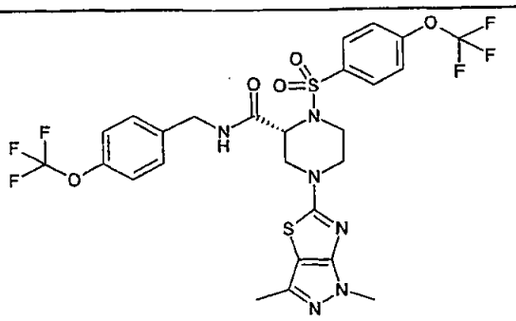
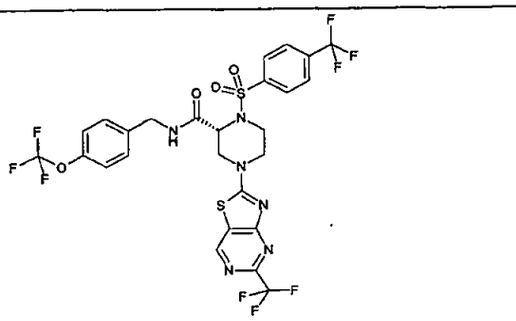
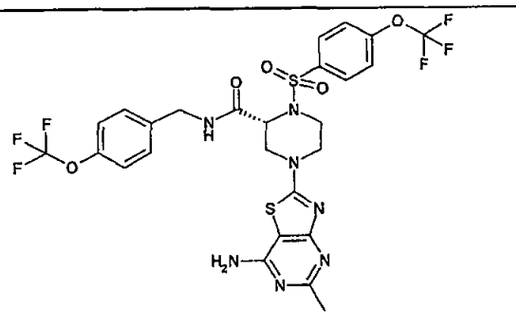
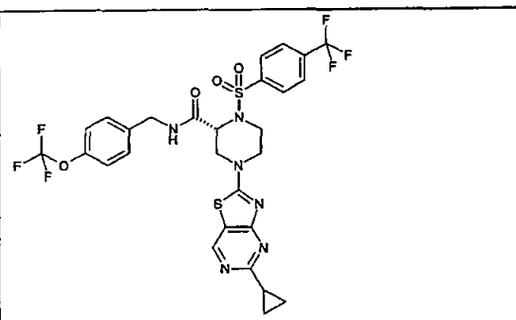
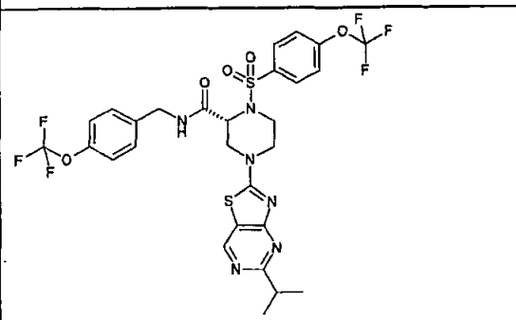
実施例番号	構造式
980	
981	
982	
983	
984	

表198

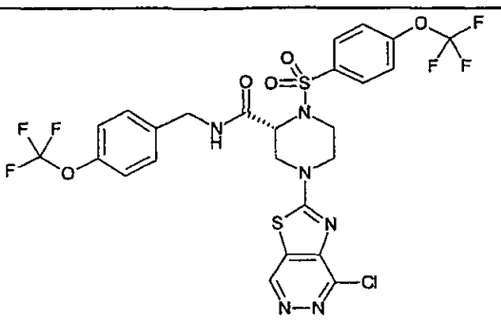
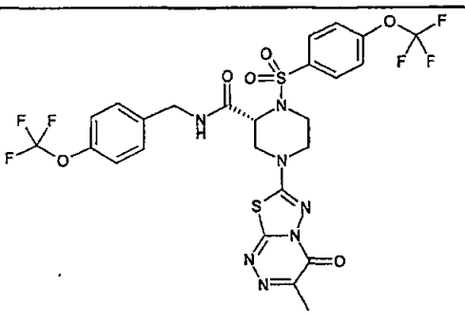
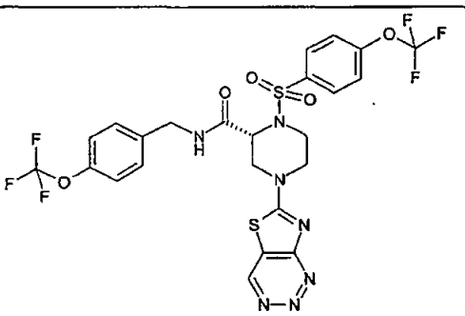
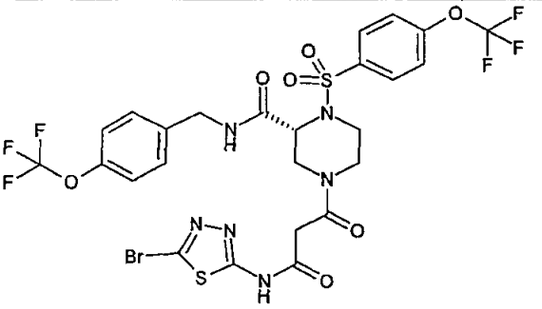
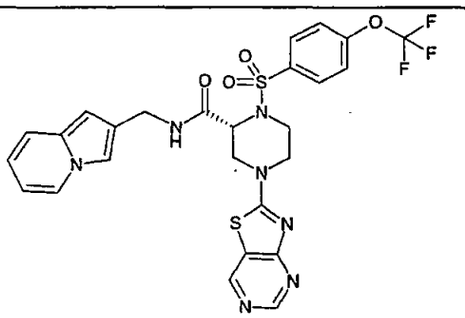
実施例番号	構造式
985	
986	
987	
988	
989	

表199

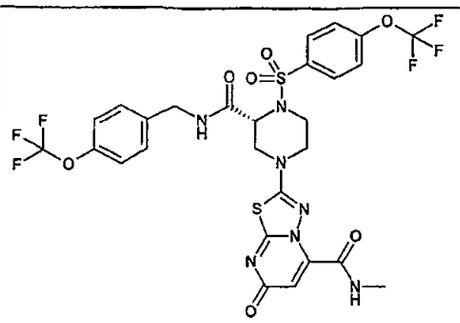
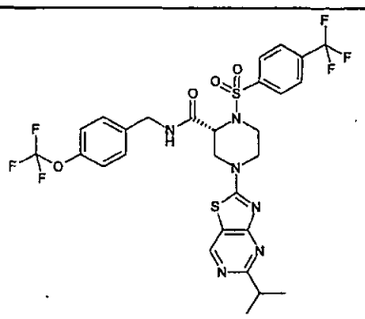
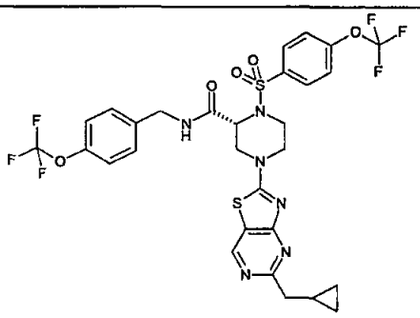
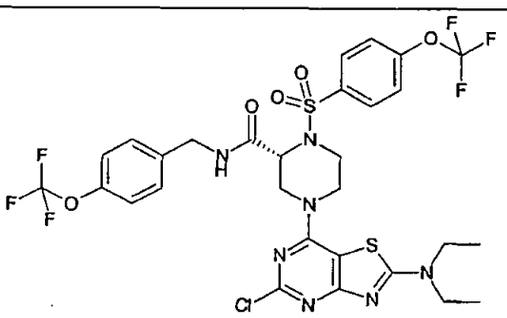
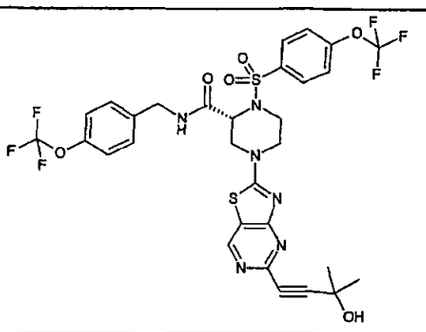
実施例番号	構造式
990	
991	
992	
993	
994	

表200

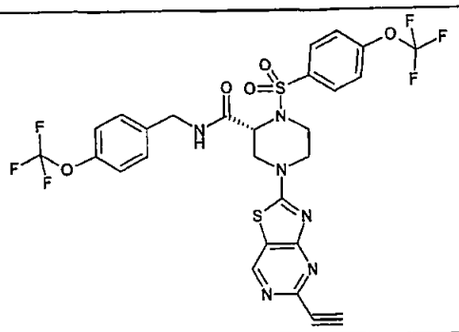
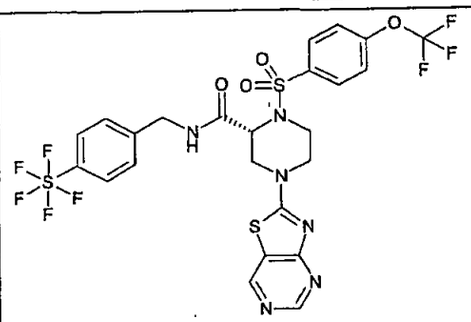
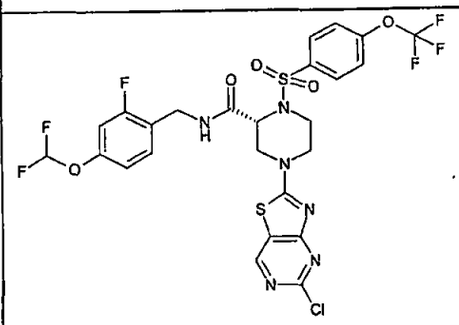
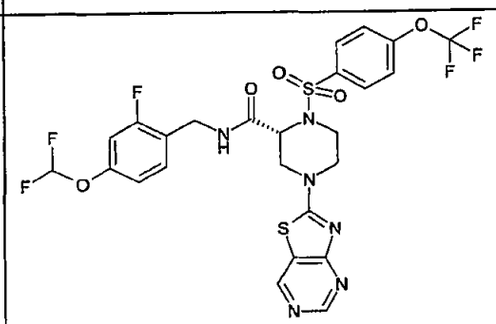
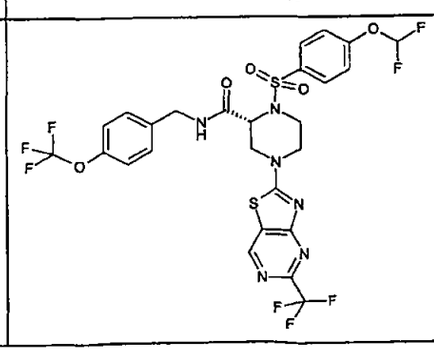
実施例番号	構造式
995	
996	
997	
998	
999	

表201

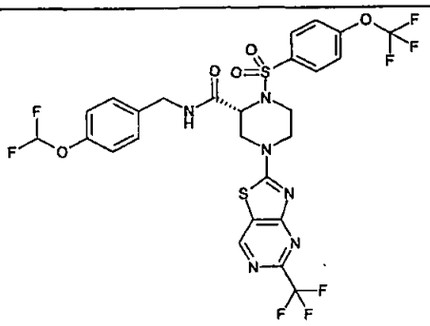
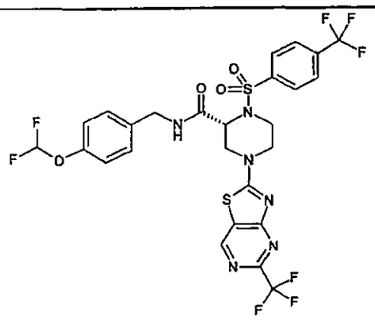
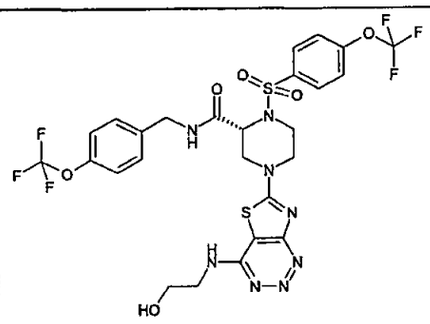
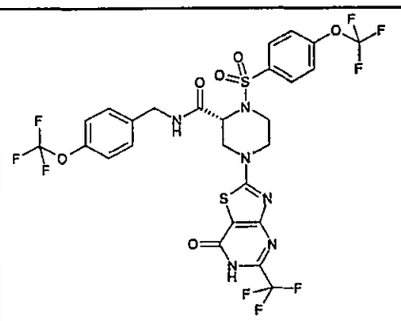
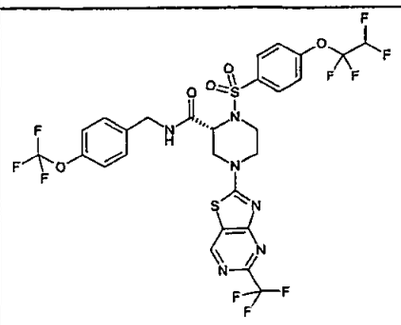
実施例番号	構造式
1000	
1001	
1002	
1003	
1004	

表202

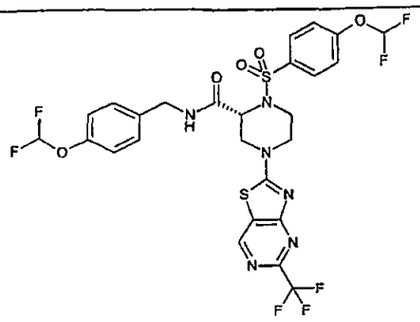
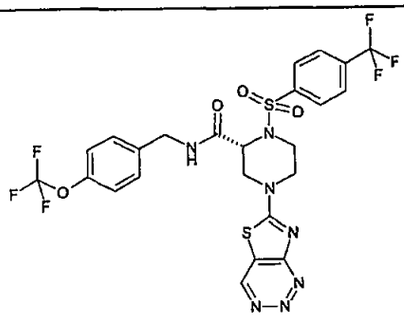
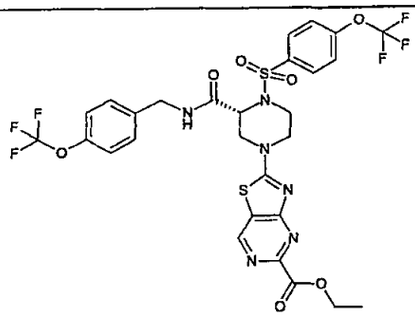
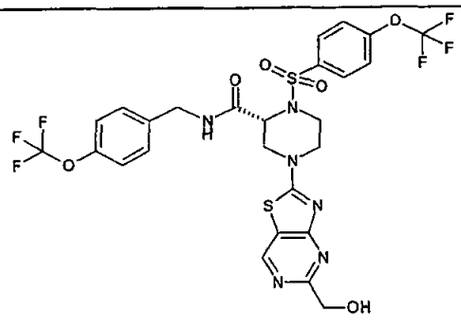
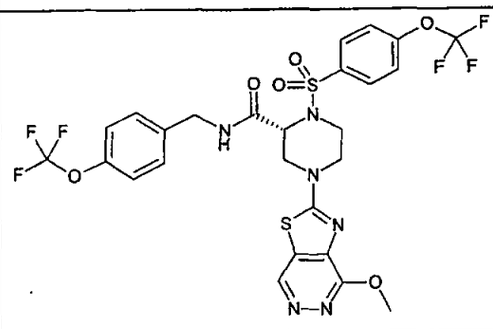
実施例番号	構造式
1005	
1006	
1007	
1008	
1009	

表203

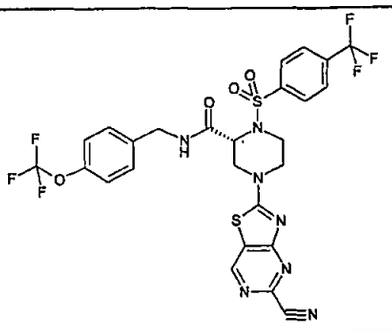
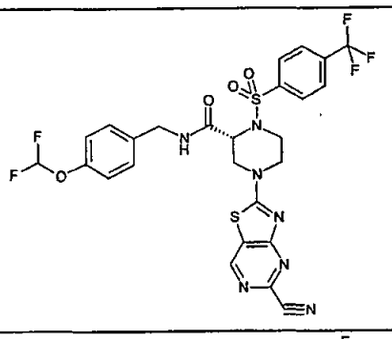
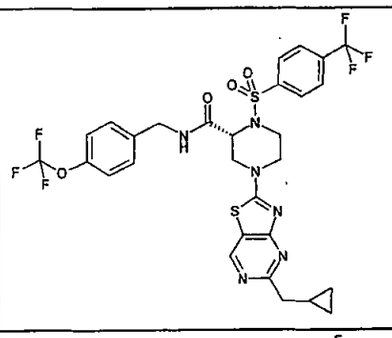
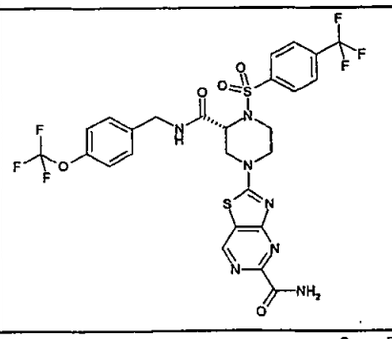
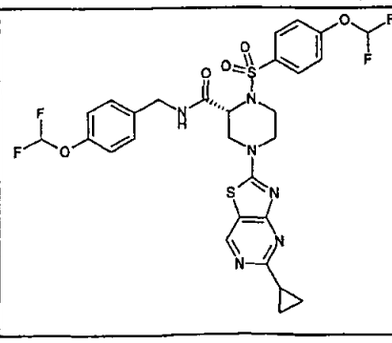
実施例番号	構造式
1010	
1011	
1012	
1013	
1014	

表204

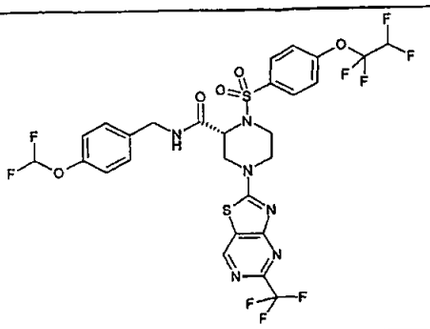
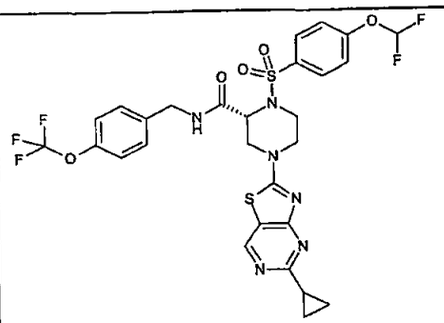
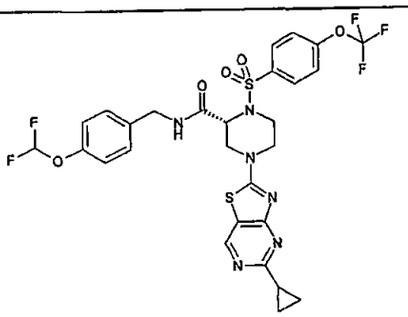
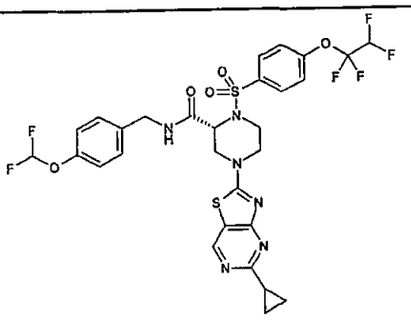
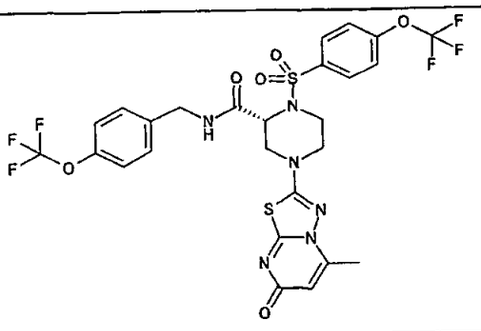
実施例番号	構造式
1015	
1016	
1017	
1018	
1019	

表205

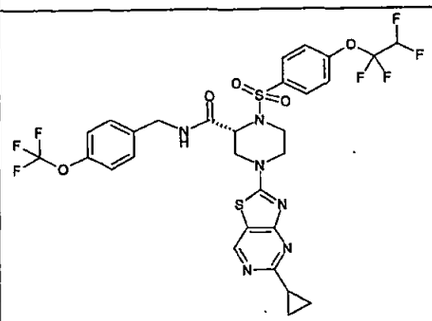
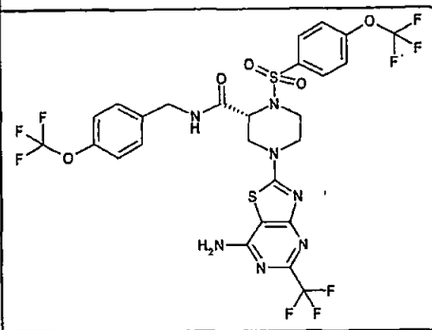
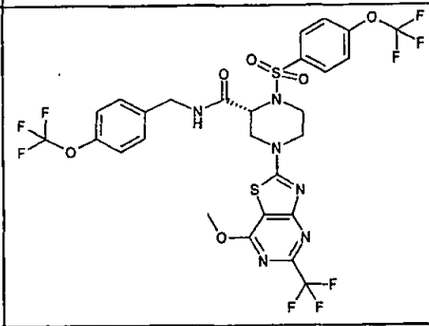
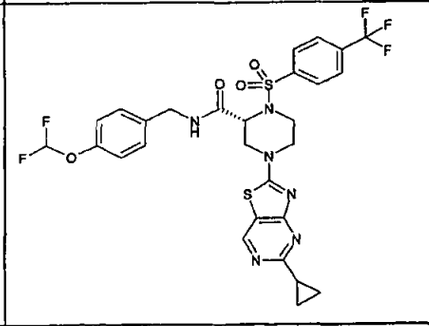
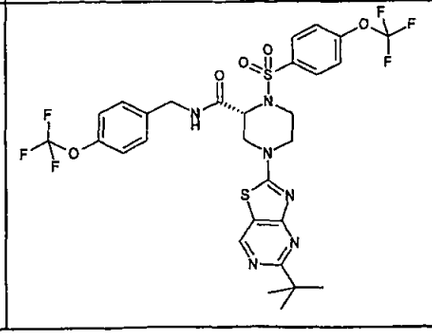
実施例番号	構造式
1020	
1021	
1022	
1023	
1024	

表206

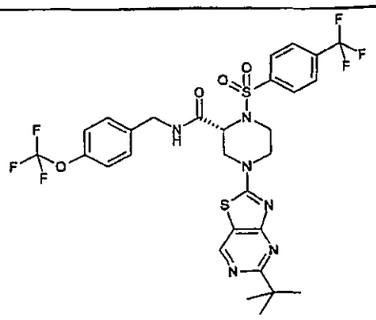
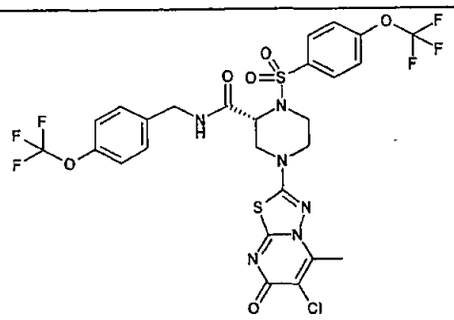
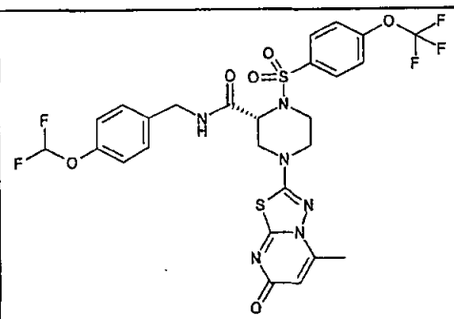
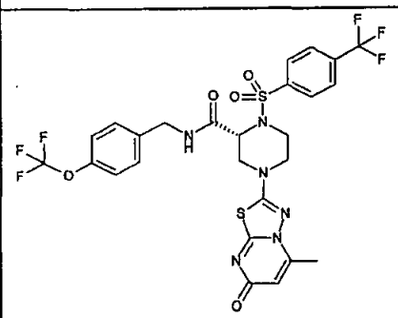
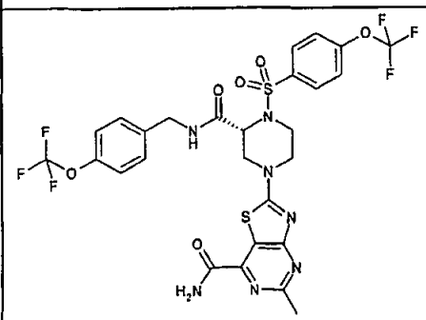
実施例番号	構造式
1025	
1026	
1027	
1028	
1029	

表207

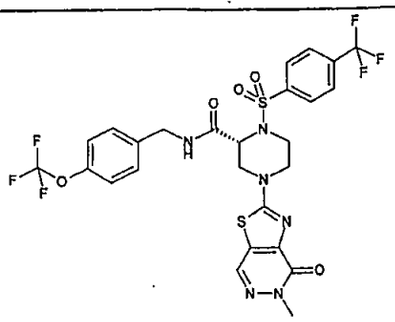
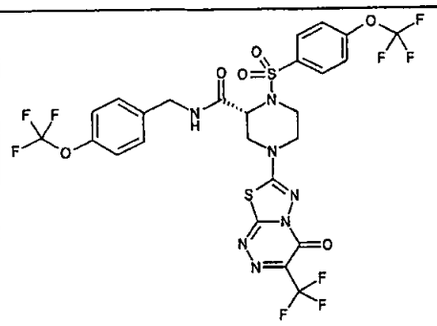
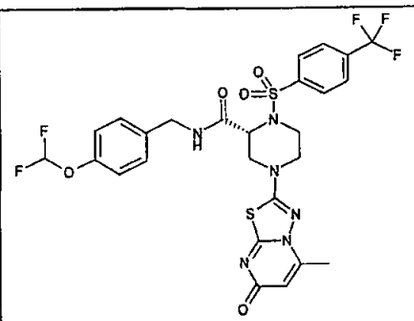
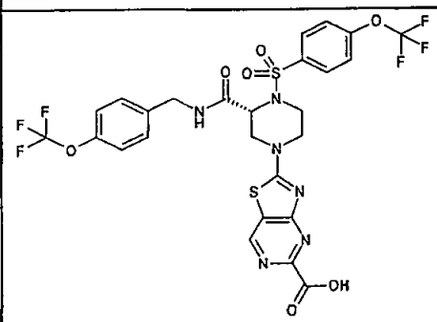
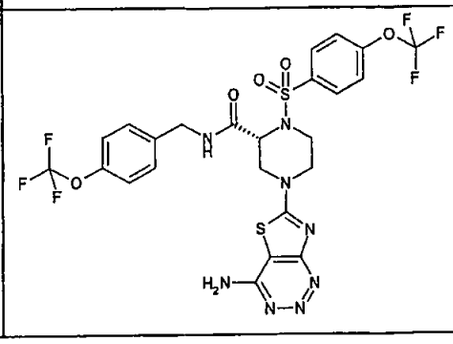
実施例番号	構造式
1030	
1031	
1032	
1033	
1034	

表208

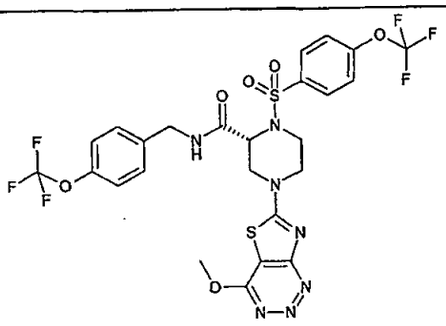
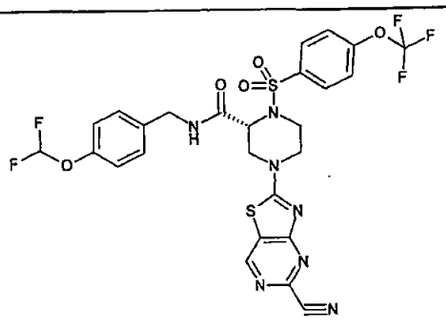
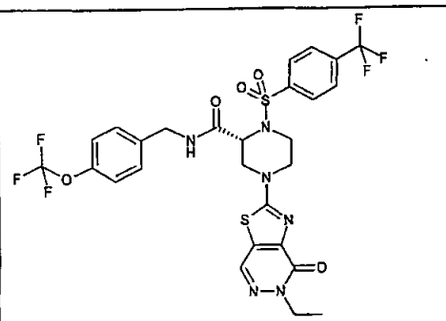
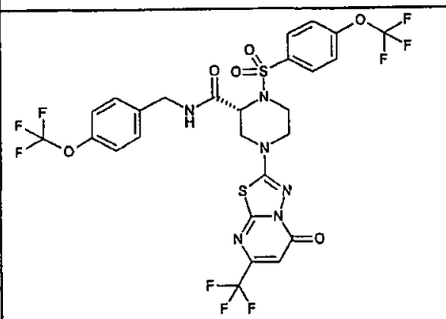
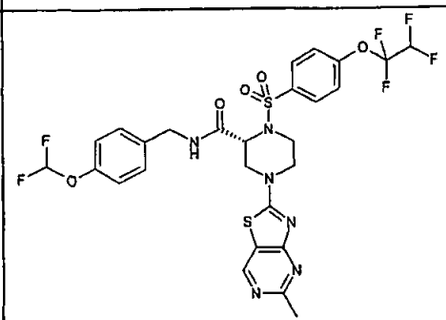
実施例番号	構造式
1035	
1036	
1037	
1038	
1039	

表209

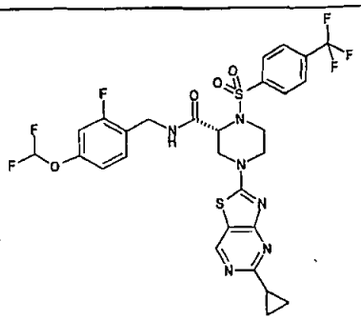
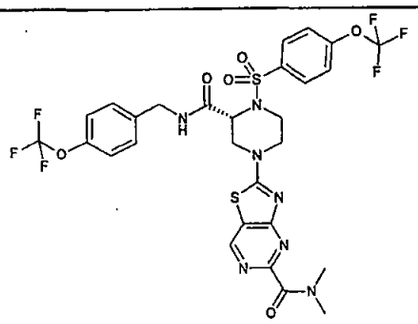
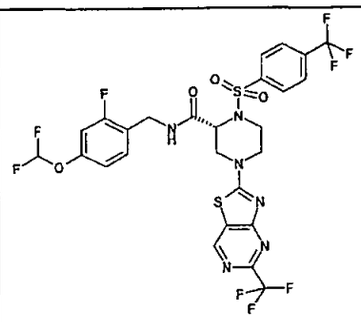
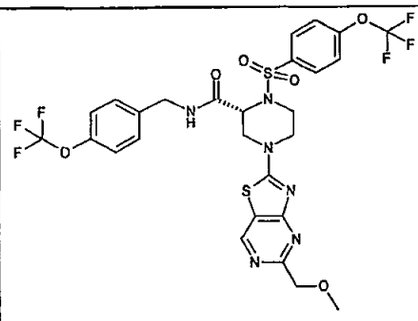
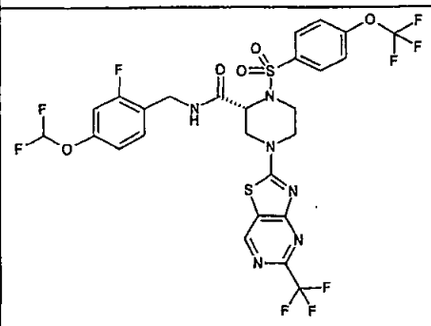
実施例番号	構造式
1040	
1041	
1042	
1043	
1044	

表210

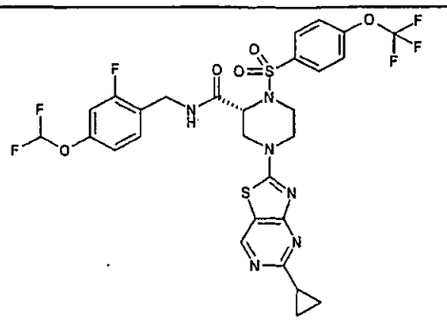
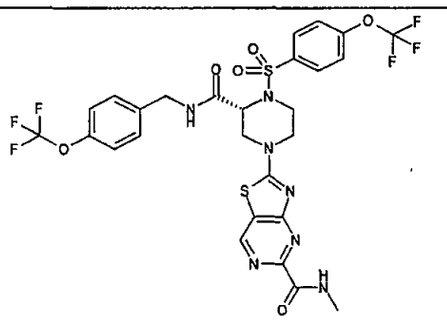
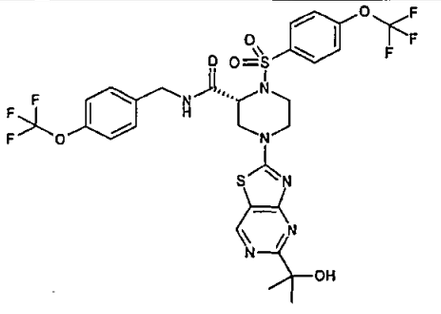
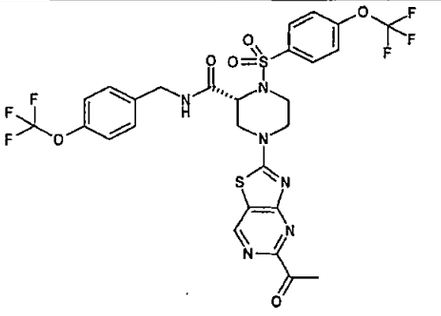
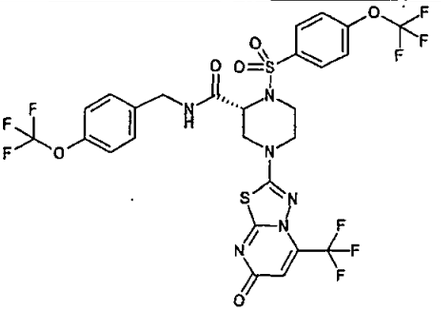
実施例番号	構造式
1045	
1046	
1047	
1048	
1049	

表211

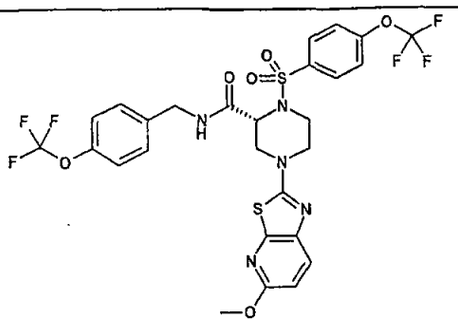
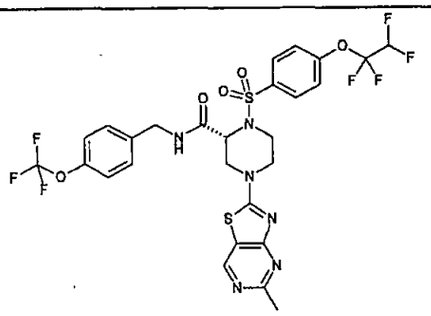
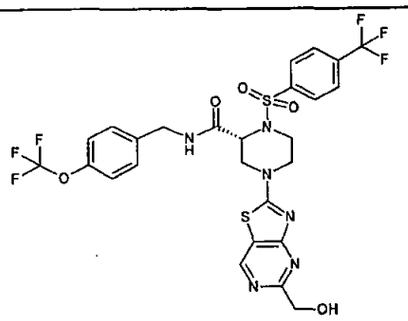
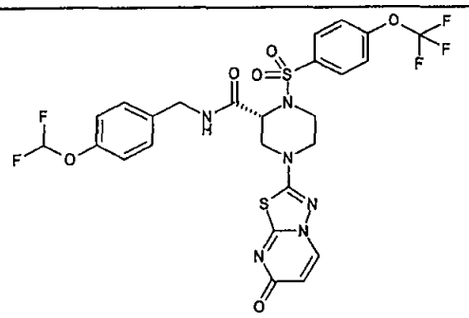
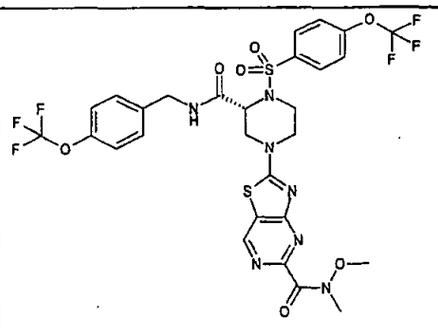
実施例番号	構造式
1050	
1051	
1052	
1053	
1054	

表212

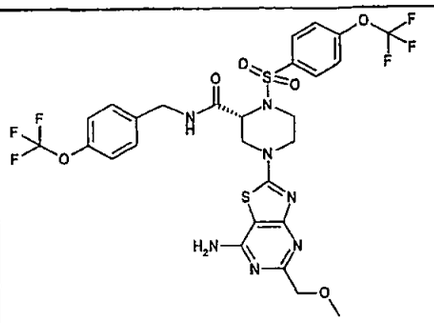
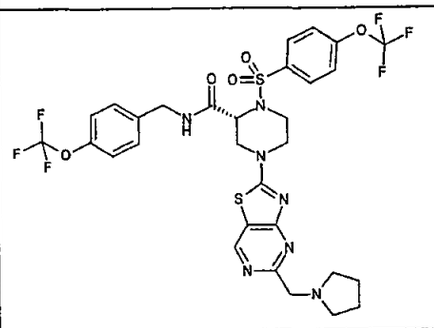
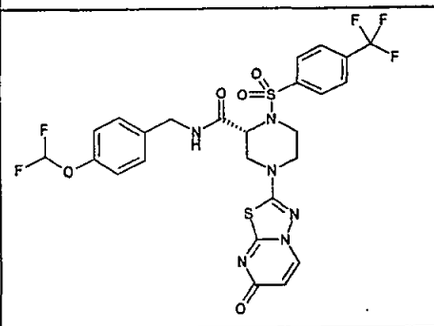
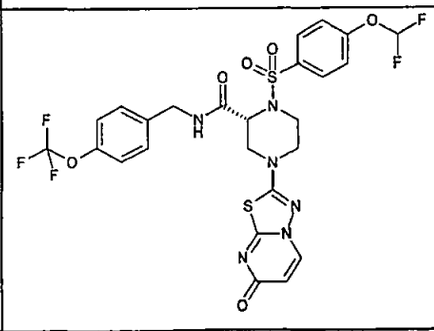
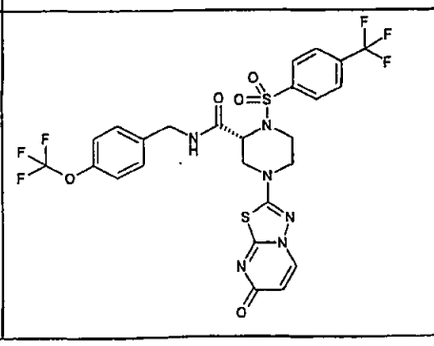
実施例番号	構造式
1055	
1056	
1057	
1058	
1059	

表213

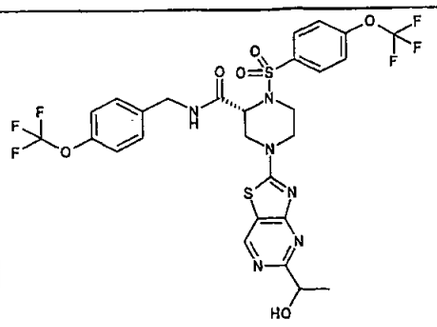
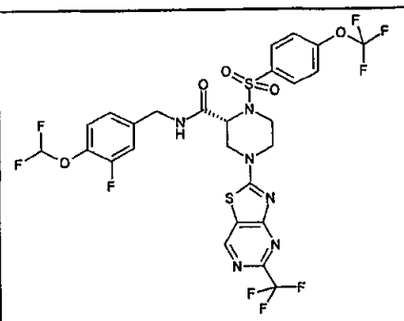
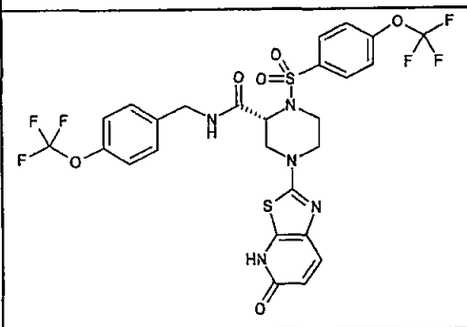
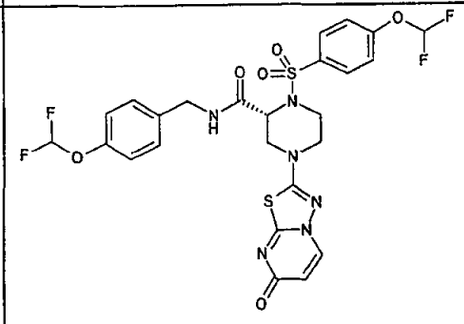
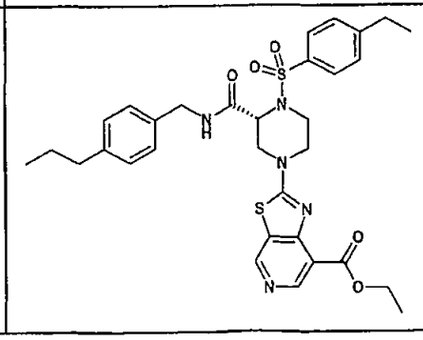
実施例番号	構造式
1060	
1061	
1062	
1063	
1064	

表214

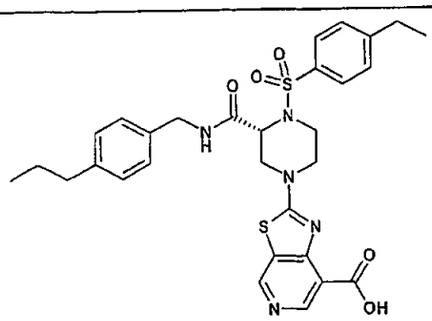
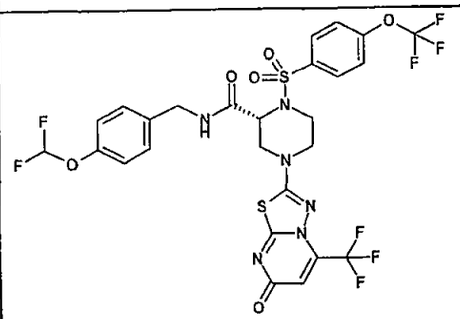
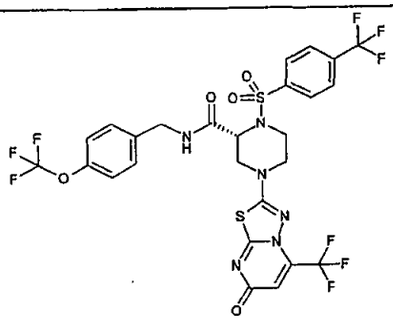
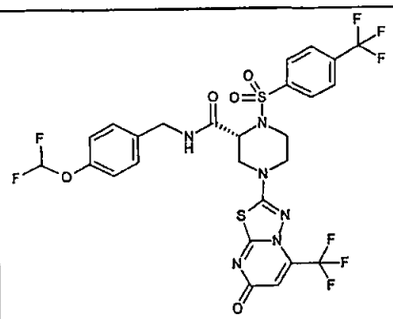
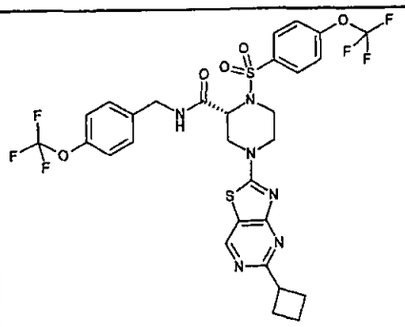
実施例番号	構造式
1065	
1066	
1067	
1068	
1069	

表215

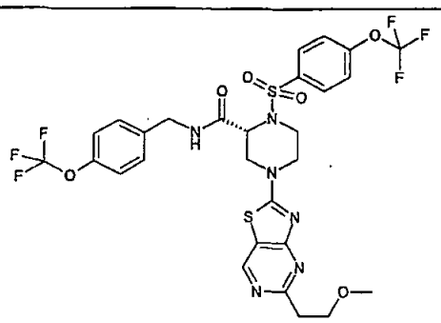
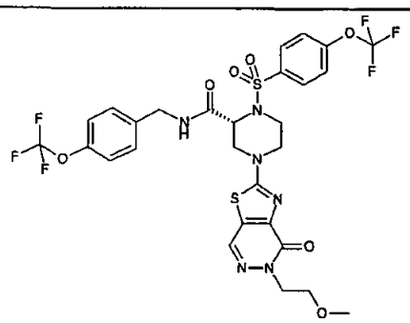
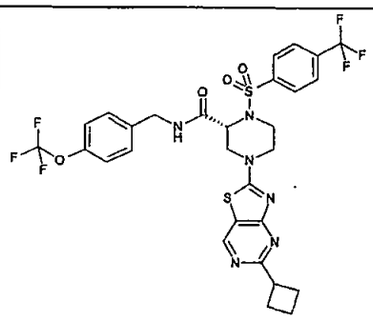
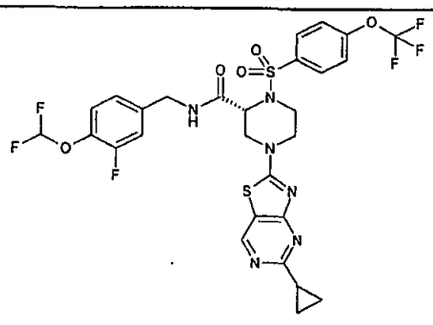
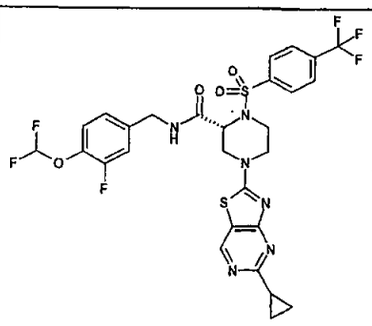
実施例番号	構造式
1070	
1071	
1072	
1073	
1074	

表216

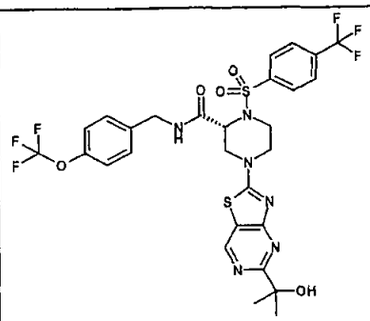
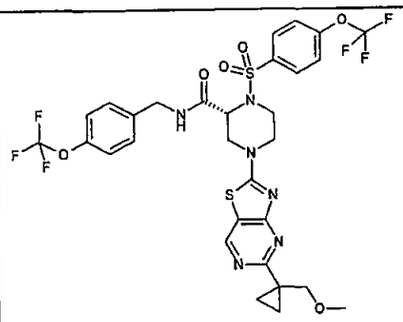
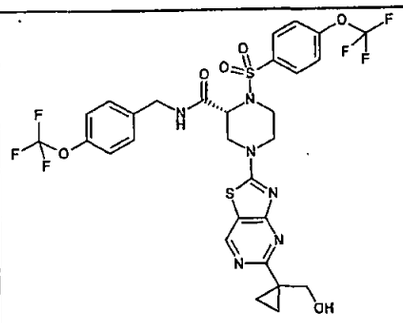
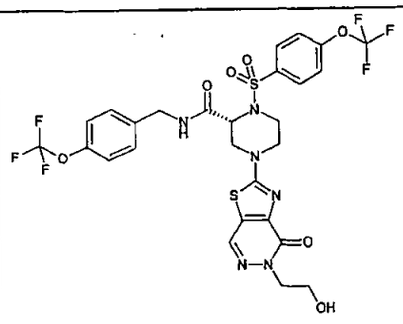
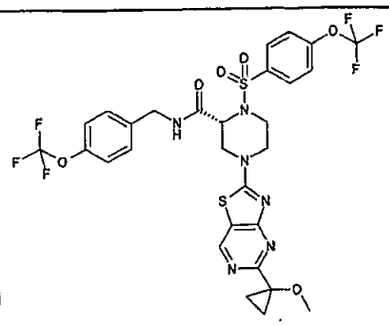
実施例番号	構造式
1075	
1076	
1077	
1078	
1079	

表217

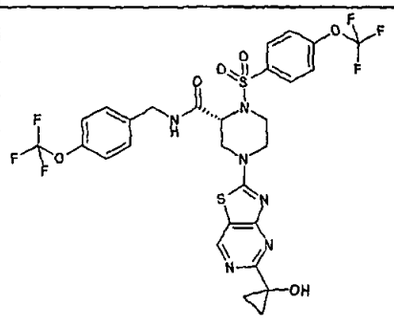
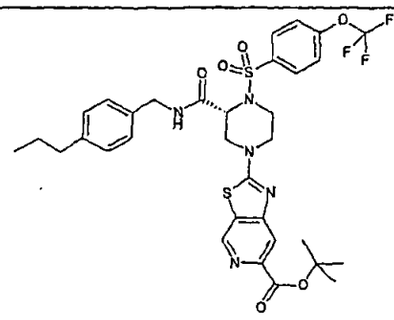
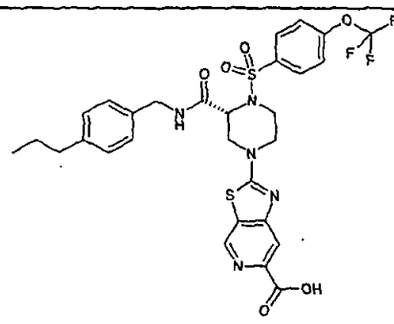
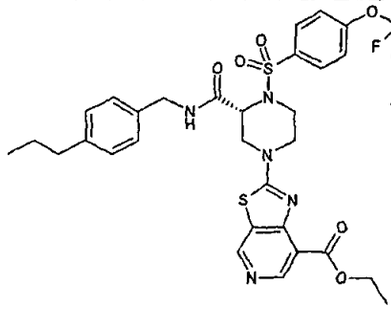
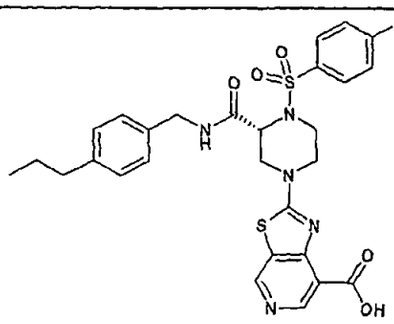
実施例番号	構造式
1080	
1081	
1082	
1083	
1084	

表218

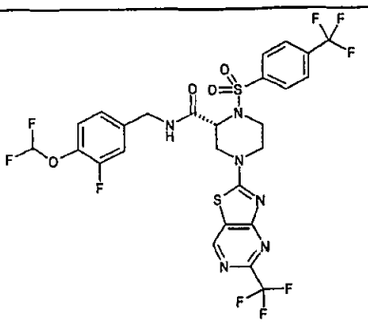
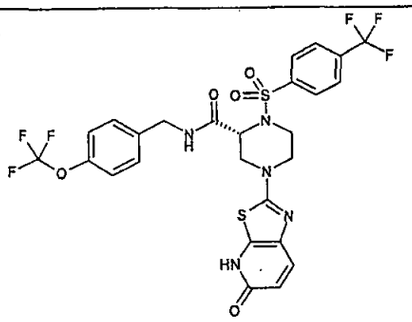
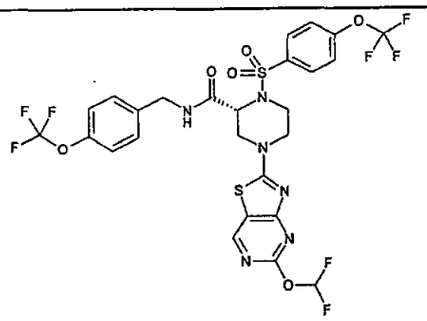
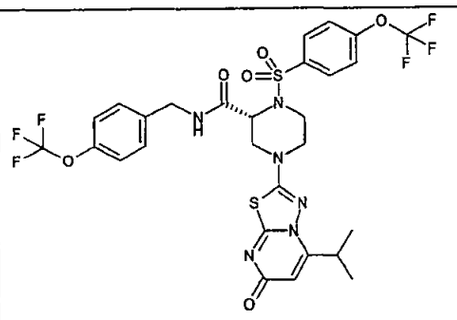
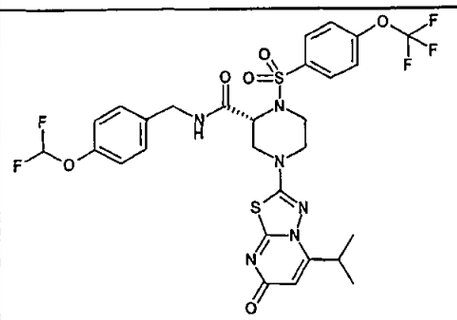
実施例番号	構造式
1085	
1086	
1087	
1088	
1089	

表219

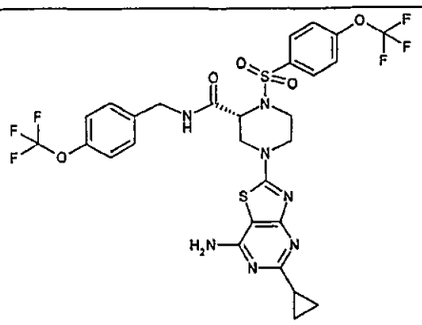
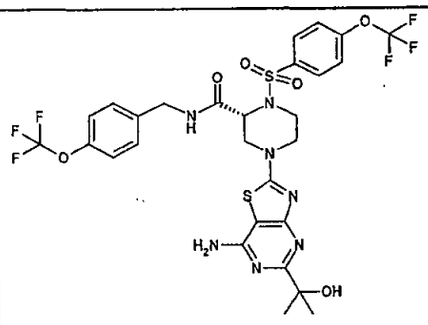
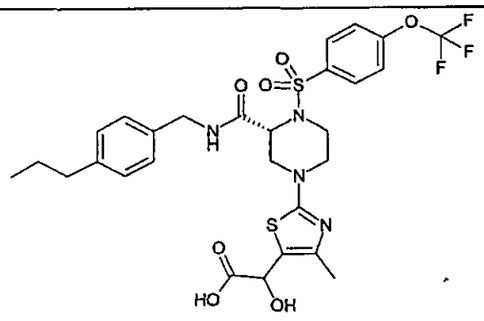
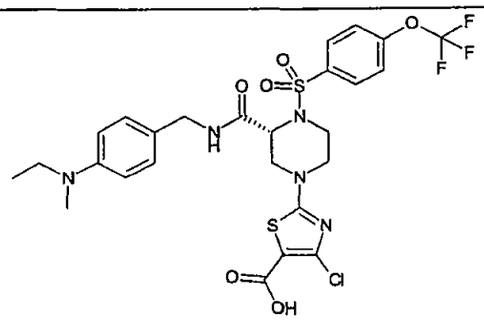
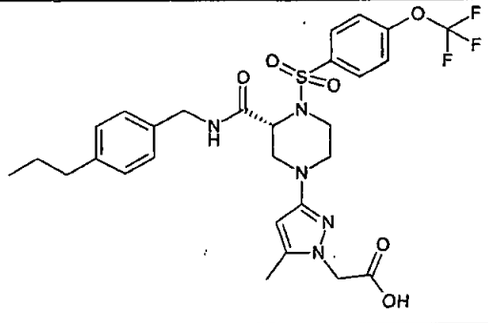
実施例番号	構造式
1090	
1091	
1092	
1093	
1094	

表220

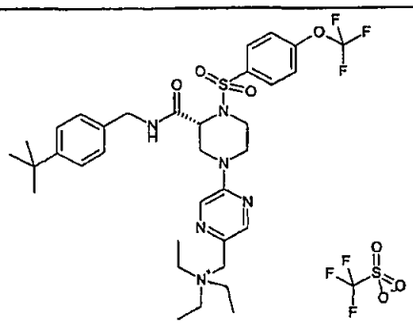
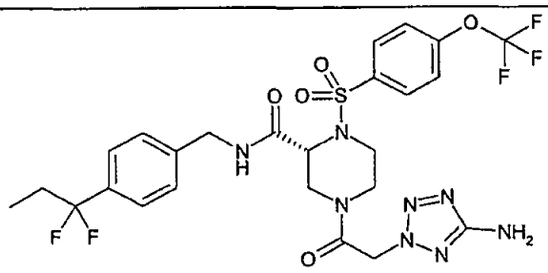
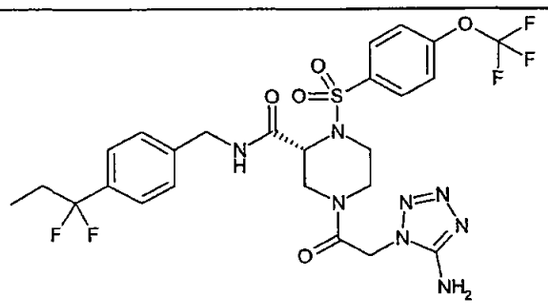
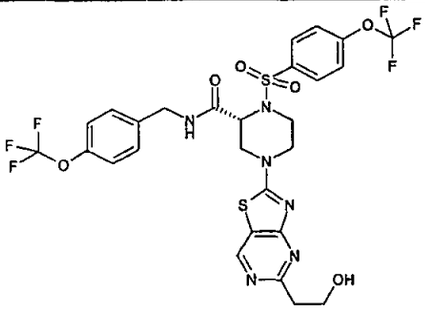
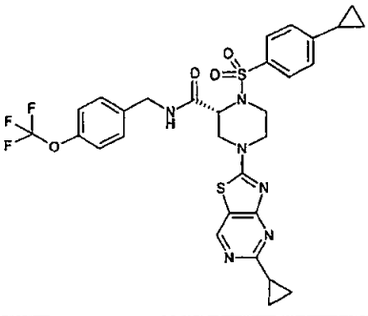
実施例番号	構造式
1095	
1096	
1097	
1098	
1099	

表221

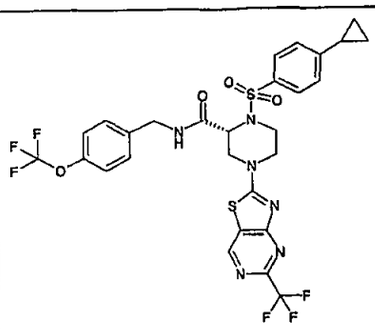
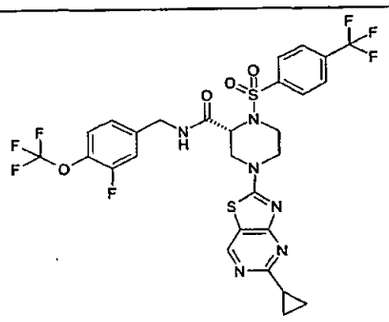
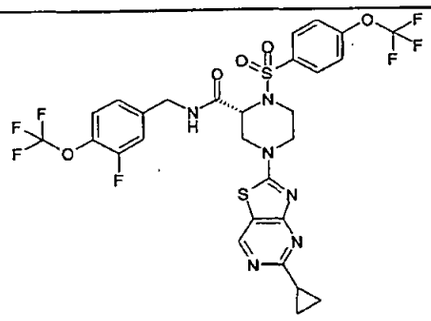
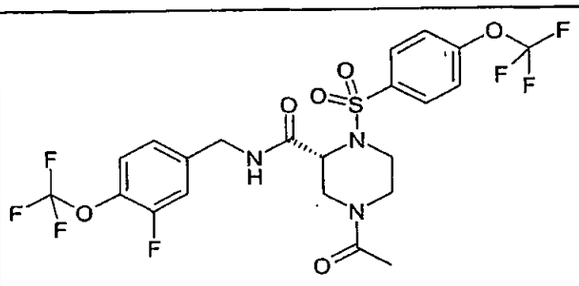
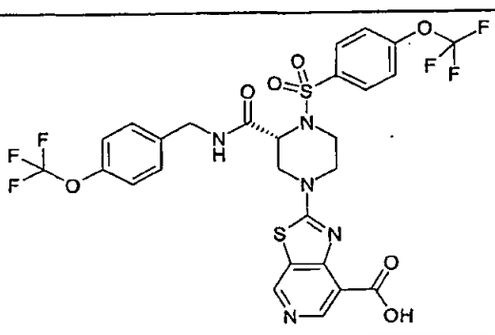
実施例番号	構造式
1100	
1101	
1102	
1103	
1104	

表222

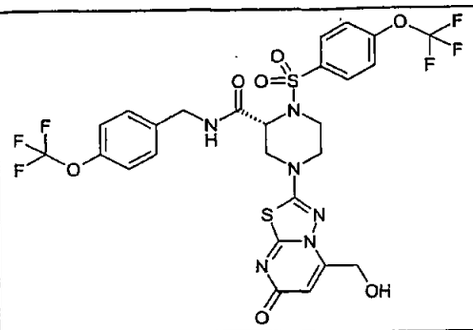
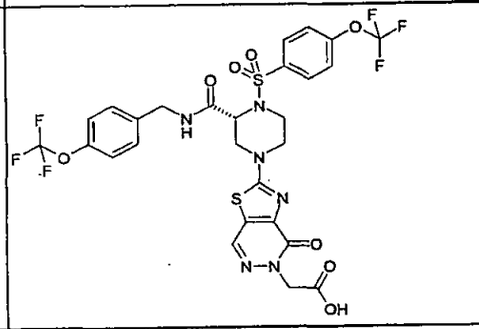
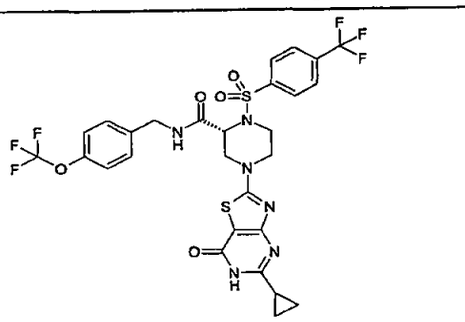
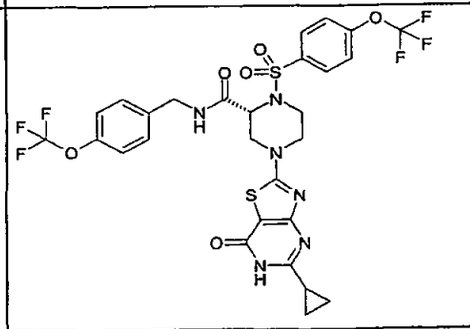
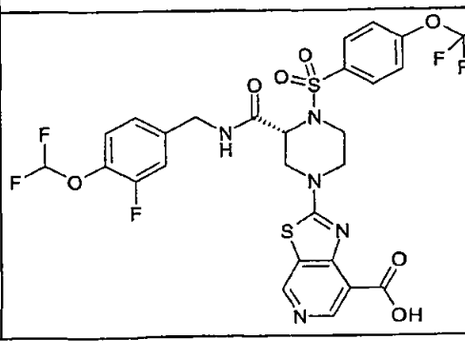
実施例番号	構造式
1105	
1106	
1107	
1108	
1109	

表223

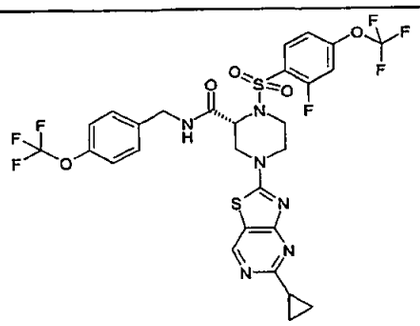
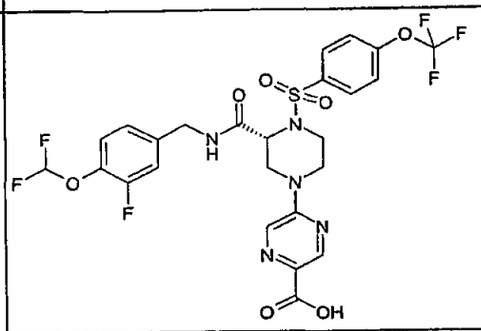
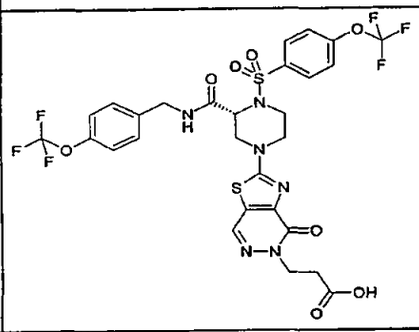
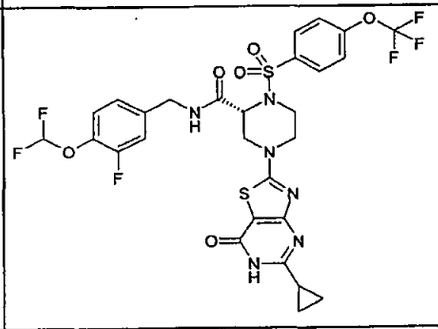
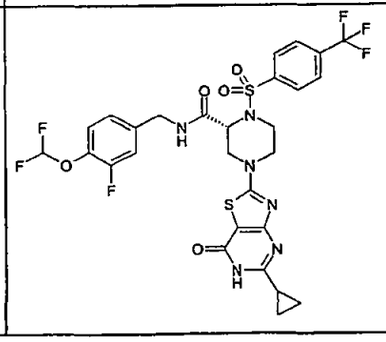
実施例番号	構造式
1110	
1111	
1112	
1113	
1114	

表224

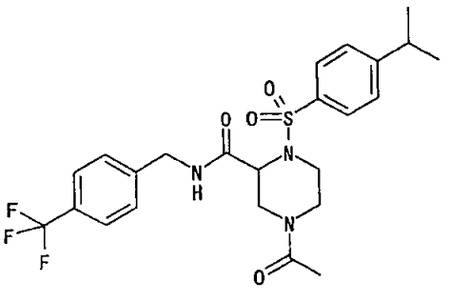
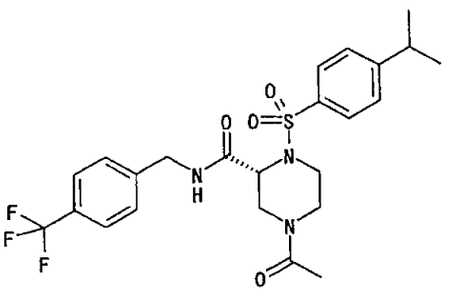
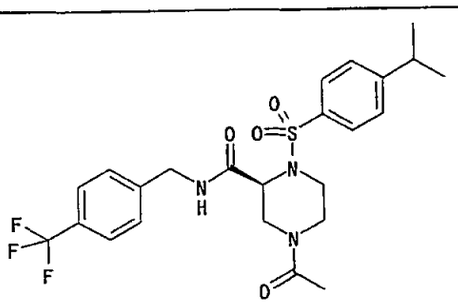
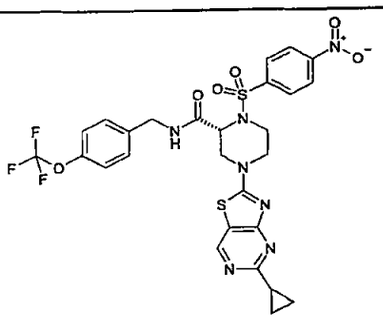
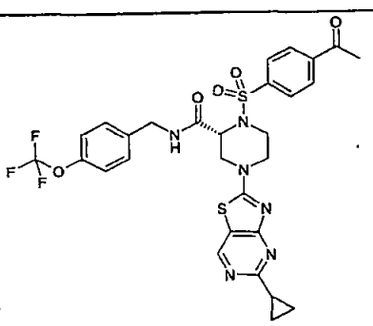
実施例番号	構造式
1115	
1116	
1117	
1118	
1119	

表225

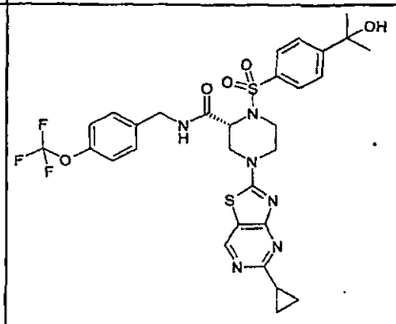
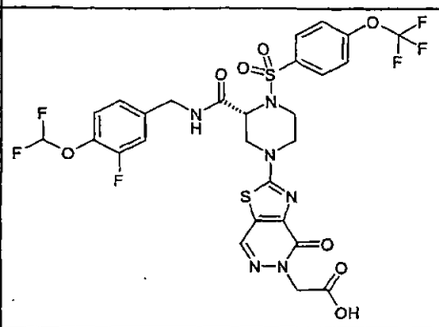
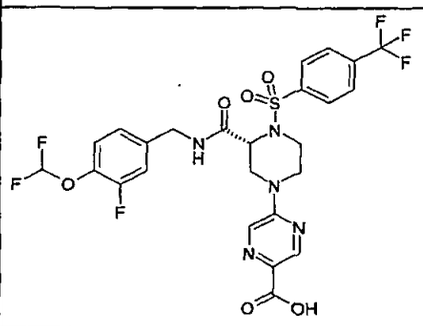
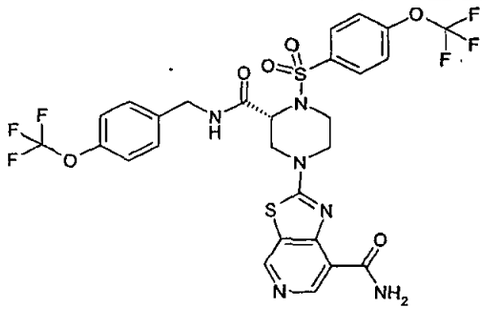
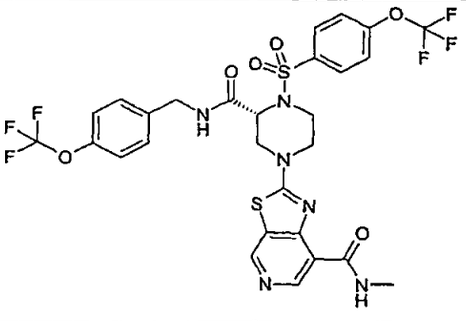
実施例番号	構造式
1120	
1121	
1122	
1123	
1124	

表226

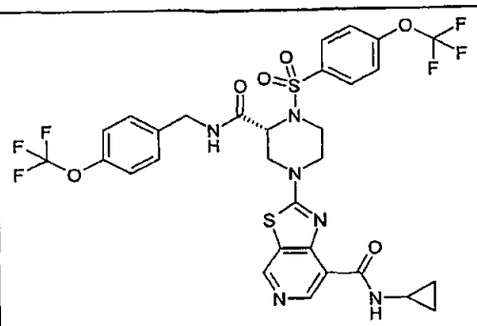
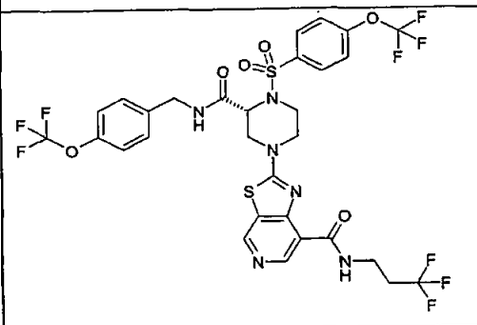
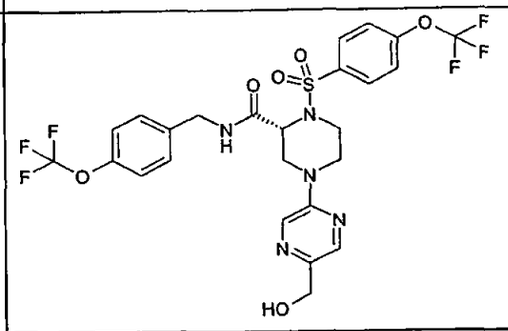
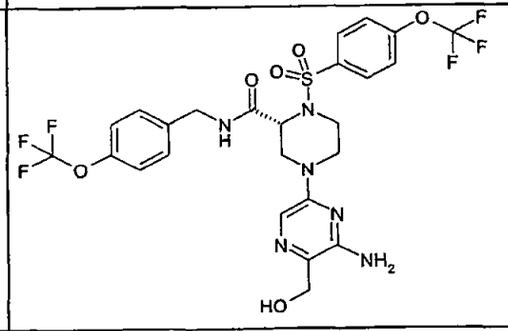
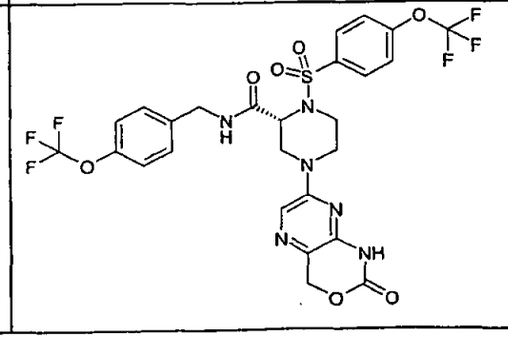
実施例番号	構造式
1125	
1126	
1127	
1128	
1129	

表２２７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
1	470 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.23 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.89-2.96 (3H, br m), 3.42-3.46 (1H, br m), 3.70-3.86 (2H, m), 4.08-4.11 (1H, br m), 4.36 (2H, s), 4.78 (1H, br s), 7.18 (4H, s), 7.67 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.90 (2H, d, J = 7.7 Hz).
2	589 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.26 (6.5H, d, J = 6.7 Hz), 2.36-2.45 (1.0H, m), 2.77 (0.9H, dd, J = 13.7, 3.9 Hz), 2.83-3.03 (1.3H, m), 3.16-3.27 (1.3H, m), 3.45-3.72 (0.8H, m), 3.78-3.97 (3.0H, m), 4.31-4.45 (3.4H, m), 4.52 (0.9H, d, J = 3.2 Hz), 4.61 (1.1H, d, J = 13.4 Hz), 4.94-5.01 (0.1H, m), 7.71-7.77 (0.2H, m), 7.81 (1.7H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2.0H, d, J = 8.1 Hz), 8.51 (1.8H, dd, J = 4.4, 1.6 Hz).
3	590 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.48 (1H, td, J = 13.2, 3.0 Hz), 2.71 (1H, dd, J = 14.3, 3.3 Hz), 2.84-2.95 (1H, m), 3.10 (1H, ddd, J = 15.0, 11.9, 3.1 Hz), 3.95 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.17 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.40-4.63 (4H, m), 6.99 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.24-7.28 (2H, m), 7.84 (2H, d, J = 8.6 Hz), 8.00 (2H, d, J = 7.9 Hz), 8.40 (2H, dd, J = 4.9, 1.5 Hz), 8.54 (1H, s).
4	529 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.67-2.78 (1H, m), 2.86-2.97 (1H, m), 3.12-3.23 (1H, m), 3.95 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.43 (2H, d, J = 5.7 Hz), 4.58-4.69 (2H, m), 5.03 (1H, d, J = 14.6 Hz), 6.36 (2H, s), 6.90 (1H, s), 7.13 (4H, d, J = 8.2 Hz), 7.23 (4H, d, J = 7.9 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.2 Hz).
5	667 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.51 (9H, s), 2.42 (3H, s), 2.91-2.99 (2H, m), 3.11 (1H, dd, J = 13.2, 4.5 Hz), 3.40-3.46 (1H, m), 3.87 (2H, d, J = 10.2 Hz), 4.39 (2H, d, J = 5.7 Hz), 4.48 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.62 (1H, br s), 6.76 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.18 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２２８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
6	611 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 300MHz) δ : 1.27 (6H, t, J = 6.2 Hz), 2.90 (1H, h J = 6.2 Hz), 3.25-3.30 (1H, m), 3.52 (1H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 3.87-3.93 (3H, m), 4.22-4.28 (2H, m), 4.44 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.69-4.70 (1H, m), 7.14 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.18 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.04 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.62-8.64 (1H, br m).
7	610 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.44 (3H, s), 2.85-3.11 (3H, m), 3.42-3.49 (1H, m), 3.90 (2H, d, J = 9.8 Hz), 4.39 (2H, d, J = 5.3 Hz), 4.47 (1H, t, J = 10.4 Hz), 4.62 (1H, br s), 5.34 (2H, br s), 6.77 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz).
8	606 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.83-2.94 (1H, m), 3.01-3.18 (2H, m), 3.42-3.53 (1H, m), 3.84-3.99 (4H, m), 4.19-4.42 (3H, m), 4.62 (1H, t, J = 3.0 Hz), 4.87 (1H, d, J = 12.8 Hz), 6.78 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.04-7.18 (4H, m), 7.78 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.16 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.70 (1H, d, J = 1.1 Hz).
9	592 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 400MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.80-2.91 (1H, m), 3.45 (1H, dd, J = 14.0, 4.3 Hz), 3.72-3.94 (2H, m), 4.17 (2H, s), 4.34 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.66 (1H, br s), 7.02-7.12 (4H, m), 7.79 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.02 (3H, d, J = 8.4 Hz), 8.12 (3H, s), 8.63 (1H, s).
10	654 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.16 (3H, s), 2.45 (1H, ddd, J = 14.4, 11.6, 2.9 Hz), 2.86-2.93 (2H, m), 3.20 (1H, ddd, J = 14.7, 11.5, 3.4 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 15.0, 2.7 Hz), 4.31-4.59 (5H, m), 6.70 (1H, t, J = 7.1 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.37 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.84 (1H, dd, J = 8.8, 2.0 Hz), 8.34 (1H, d, J = 2.4 Hz).

表２２９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
11	614 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.94-2.05 (2H, m), 2.14 (3H, s), 2.38 (2H, t, J = 6.8 Hz), 2.49 (1H, td, J = 12.3, 3.6 Hz), 2.80 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.85-2.95 (2H, m), 3.21 (1H, ddd, J = 14.4, 11.4, 3.3 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.7, 3.2 Hz), 4.30 (1H, dt, J = 12.2, 2.6 Hz), 4.42 (2H, d, J = 5.7 Hz), 4.45-4.58 (2H, m), 6.85 (1H, t, J = 4.9 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.73 (1H, dd, J = 8.7, 2.6 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.9 Hz), 11.10 (1H, br s).
12	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.95 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.59-1.69 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.36-2.43 (1H, m), 2.54 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.6, 3.6 Hz), 2.93-3.17 (2H, m), 3.81 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.34-4.56 (4H, m), 6.72 (1H, t, J = 4.7 Hz), 6.96-7.08 (3H, m), 7.38 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.2 Hz).
13	628 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ : 1.20 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.37 (3H, s), 2.91-3.03 (1H, m), 3.10-3.20 (1H, m), 3.38-3.46 (1H, m), 3.67-3.78 (2H, m), 3.79-3.87 (1H, m), 4.03-4.19 (2H, m), 4.23-4.31 (1H, m), 4.53-4.58 (1H, m), 7.13 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 8.1, 2.3 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.8 Hz), 8.31 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.72 (1H, br t, J = 5.8 Hz), 12.52 (1H, br s).
14	645 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 400MHz) δ : 0.90 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.59 (2H, td, J = 15.0, 7.6 Hz), 2.42 (3H, s), 2.53 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.17-3.29 (1H, m), 3.51 (1H, dd, J = 13.8, 4.5 Hz), 3.85-4.03 (3H, m), 4.09 (1H, dd, J = 14.7, 5.4 Hz), 4.22 (1H, dd, J = 15.1, 6.3 Hz), 4.48 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.66 (1H, s), 7.01-7.09 (4H, m), 7.20-7.28 (2H, m), 7.95 (1H, t, J = 8.4 Hz), 8.47-8.53 (1H, br m).

表２３０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
15	470 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.68 (1H, t, J = 10.0 Hz), 2.87-3.05 (2H, m), 3.17 (1H, d, J = 12.8 Hz), 3.50-3.63 (2H, m), 3.85 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.30 (2H, d, J = 4.5 Hz), 4.73 (1H, d, J = 3.8 Hz), 7.45 (2H, d, J = 6.4 Hz), 7.48 (2H, d, J = 5.7 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.42 (1H, br s), 8.92 (1H, t, J = 5.7 Hz), 9.55 (1H, br s).
16	484 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 7.2 Hz), 1.60 (1H, t, J = 9.2 Hz), 1.80 (1H, dd, J = 11.7, 4.1 Hz), 2.02 (3H, s), 2.54-2.60 (1H, m), 2.93-3.02 (1H, m), 3.10 (1H, d, J = 11.7 Hz), 3.49 (1H, d, J = 15.1 Hz), 3.63 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.25-4.44 (3H, m), 7.39-7.46 (4H, m), 7.68 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.50 (1H, t, J = 5.5 Hz).
17	548 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 1.20 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.62 (1H, dd, J = 13.0, 9.2 Hz), 2.80 (3H, s), 2.87 (1H, dd, J = 12.2, 3.6 Hz), 2.92-3.03 (1H, m), 3.48 (1H, d, J = 10.9 Hz), 3.61 (1H, t, J = 12.1 Hz), 3.75 (1H, d, J = 12.4 Hz), 3.95 (1H, d, J = 12.4 Hz), 4.32 (2H, ddd, J = 30.7, 16.0, 5.8 Hz), 4.61 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.41 (2H, d, J = 6.4 Hz), 7.44 (2H, d, J = 6.0 Hz), 7.65 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.71 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.69 (1H, t, J = 6.0 Hz).
18	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.13 (3H, s), 2.36-2.47 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.95-3.05 (1H, m), 3.12-3.22 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.44-4.59 (4H, m), 7.14 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.6 Hz).

表２３１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
19	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.29 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.90 (0.4H, s), 2.13 (2.7H, s), 2.35-2.48 (1.0H, m), 2.81 (1.0H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.93-3.07 (1.3H, m), 3.11-3.25 (1.2H, m), 3.83 (1.1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1.0H, d, J = 13.2 Hz), 4.43-4.61 (4.1H, m), 7.09-7.18 (1.0H, m), 7.34 (4.1H, d, J = 8.3 Hz), 7.41 (4.1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (1.9H, d, J = 8.3 Hz).
20	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.5, 11.2, 3.1 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.3, 3.9 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.5, 11.2, 2.8 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.4, 2.5 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.2, 3.0 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 7.01 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.55 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.6 Hz).
21	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.20 (3H, s), 2.60 (1H, td, J = 12.8, 3.4 Hz), 3.12 (1H, ddd, J = 14.4, 12.0, 2.4 Hz), 3.25 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.1, 1.9 Hz), 4.40 (1H, dd, J = 15.1, 5.4 Hz), 4.49-4.67 (4H, m), 7.04 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.28 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.1 Hz), 7.54 (1H, dd, J = 8.0, 1.2 Hz), 7.57 (2H, t, J = 8.3 Hz), 8.14 (1H, dd, J = 8.0, 1.7 Hz).
22	548, 550 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.1, 11.4, 2.9 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.5, 4.2 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.6, 11.4, 3.2 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.7, 2.8 Hz), 4.33 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 7.00 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.62 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.71-7.73 (4H, m).
23	554, 556 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.17 (3H, s), 2.62 (1H, ddd, J = 13.8, 11.1, 2.6 Hz), 3.02 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 3.23 (1H, ddd, J = 14.4, 11.1, 3.1 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.0, 3.4 Hz), 4.33 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.44-4.61 (4H, m), 6.97 (1H, t, J = 6.3 Hz), 7.13 (1H, d, J = 3.7 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.42 (1H, d, J = 4.0 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz).

表２３２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
24	470 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 2.13 (3H, s), 2.38 (1H, ddd, J = 14.5, 10.9, 3.0 Hz), 2.79 (1H, dd, J = 13.9, 4.1 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 13.9, 11.3, 2.8 Hz), 3.86 (1H, dt, J = 13.6, 2.8 Hz), 4.30 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.44-4.59 (4H, m), 7.05 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.54-7.68 (5H, m), 7.87 (2H, d, J = 7.5 Hz).
25	596 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.15 (3H, s), 2.43 (1H, ddd, J = 13.9, 11.4, 2.8 Hz), 2.86 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 14.7, 11.5, 3.3 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 12.9, 2.4 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 13.7, 2.6 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 7.03 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.07 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.12 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.6 Hz).
26	580 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.14 (3H, s), 2.45 (1H, ddd, J = 13.7, 11.2, 2.7 Hz), 2.86 (1H, dd, J = 14.0, 4.5 Hz), 3.21 (1H, ddd, J = 14.7, 11.7, 2.9 Hz), 3.88 (1H, dt, J = 14.2, 3.0 Hz), 4.32 (1H, dt, J = 13.8, 2.7 Hz), 4.46-4.61 (4H, m), 7.09 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.48 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.54 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.92 (2H, d, J = 8.4 Hz).
27	615 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.19 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.47 (1H, td, J = 12.7, 3.3 Hz), 2.57 (3H, s), 2.59-2.62 (1H, m), 3.04-3.13 (1H, m), 3.59 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.42-4.58 (4H, m), 4.66 (1H, d, J = 13.5 Hz), 6.90 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.25 (2H, d, J = 3.7 Hz), 7.31 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.60 (2H, d, J = 9.5 Hz), 7.62 (2H, d, J = 9.0 Hz).

表２３３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
28	586 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.15 (3H, s), 2.66 (1H, ddd, J = 13.9, 10.9, 3.1 Hz), 3.05 (1H, dd, J = 14.1, 4.4 Hz), 3.26 (1H, ddd, J = 14.3, 10.4, 3.0 Hz), 3.90 (1H, dt, J = 14.5, 3.3 Hz), 4.32 (1H, dt, J = 13.5, 3.2 Hz), 4.45-4.61 (4H, m), 7.05 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.27 (1H, d, J = 4.0 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.51 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.59 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 3.5 Hz).
29	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 14.8, 11.4, 3.4 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 13.6, 3.4 Hz), 3.20 (1H, ddd, J = 15.1, 11.2, 3.2 Hz), 3.85 (1H, dt, J = 14.1, 2.5 Hz), 4.34 (1H, dt, J = 14.3, 3.3 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 6.97 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.52 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.58-7.65 (3H, m), 7.74 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.85 (1H, t, J = 2.0 Hz).
30	526 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.35 (9H, s), 2.14 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 13.9, 10.7, 2.4 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.3, 4.5 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 13.8, 11.3, 2.8 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.5, 2.9 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.4, 3.0 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 7.14 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.57 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.78 (2H, d, J = 7.7 Hz).
31	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.35 (1H, ddd, J = 13.8, 10.9, 3.0 Hz), 2.67 (3H, s), 2.78 (1H, dd, J = 14.1, 4.6 Hz), 3.20 (1H, ddd, J = 14.8, 12.1, 3.3 Hz), 3.86 (1H, dt, J = 14.6, 2.5 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.5, 2.9 Hz), 4.45-4.60 (4H, m), 7.03 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.97 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.12 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２３４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
32	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.70-2.81 (1H, m), 2.96-3.03 (1H, m), 3.31 (1H, ddd, J = 14.7, 11.1, 4.1 Hz), 3.65 (3H, s), 3.68-3.82 (2H, m), 4.42-4.62 (5H, m), 7.04 (1H, t, J = 6.6 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.39 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
33	478 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.12 (3H, s), 2.36-2.47 (1H, m), 2.85 (1H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.98-3.04 (1H, m), 3.15 (1H, t, J = 18.4 Hz), 3.84 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.30 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.45-4.62 (4H, m), 7.05 (1H, t, J = 10.0 Hz), 7.22-7.33 (3H, m), 7.38-7.42 (3H, m), 7.78 (2H, d, J = 8.6 Hz).
34	478 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.12 (3H, s), 2.38-2.46 (1H, m), 2.85 (1H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.98-3.04 (1H, m), 3.11-3.18 (1H, m), 3.84 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.30 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.48-4.59 (4H, m), 7.04 (1H, br s), 7.22-7.33 (3H, m), 7.37-7.40 (3H, m), 7.78 (2H, d, J = 10.7 Hz).
35	478 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.15 (3H, s), 2.36-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.97-3.05 (1H, m), 3.11-3.19 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.37-4.53 (4H, m), 7.03 (1H, br s), 7.17 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.33 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz).
36	520 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.18 (3H, s), 2.36-2.47 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.6, 4.3 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.17-3.21 (1H, m), 3.85 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.31 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.44-4.58 (4H, m), 7.02 (1H, t, J = 4.9 Hz), 7.29-7.47 (7H, m), 7.59-7.61 (4H, m), 7.78 (2H, d, J = 6.6 Hz).

表２３５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
37	487 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.17 (3H, s), 2.36-2.45 (1H, m), 2.78-2.86 (1H, m), 2.96 (6H, s), 2.98-3.05 (1H, m), 3.07-3.17 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.25-4.43 (3H, m), 4.46-4.55 (2H, m), 6.78 (3H, br s), 7.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.6 Hz).
38	523 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.10 (3H, s), 2.37-2.46 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.4, 4.2 Hz), 2.97-3.06 (1H, m), 3.15-3.24 (1H, m), 3.76-3.85 (1H, m), 4.18-4.25 (1H, m), 4.41-4.58 (4H, m), 5.03 (2H, s), 7.38 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.44 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.3 Hz).
39	527 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.15 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 13.7, 10.9, 3.1 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 14.3, 4.8 Hz), 3.14-3.28 (1H, m), 3.83 (1H, dt, J = 14.3, 2.8 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 13.6, 3.0 Hz), 4.45-4.61 (4H, m), 7.10 (1H, t, J = 5.6 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.51 (1H, br s), 7.61 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz).
40	515 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.99 (1.2H, s), 2.15 (1.8H, s), 2.38 (0.6H, ddd, J = 14.1, 11.2, 3.0 Hz), 2.83 (0.6H, dd, J = 13.9, 4.9 Hz), 3.03-3.42 (1.8H, m), 3.73-3.92 (1H, m), 4.28-4.64 (5H, m), 6.97 (0.6H, t, J = 5.7 Hz), 7.04 (0.4H, t, J = 5.3 Hz), 7.34 (0.8H, d, J = 7.2 Hz), 7.36 (1.2H, d, J = 8.1 Hz), 7.59 (0.8H, d, J = 7.7 Hz), 7.63 (1.2H, d, J = 9.0 Hz), 8.06 (0.8H, d, J = 8.6 Hz), 8.08 (1.2H, d, J = 9.7 Hz), 8.34 (0.8H, d, J = 9.3 Hz), 8.43 (1.2H, d, J = 9.7 Hz).

表２３６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
41	538 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.16 (3H, s), 2.45 (1H, ddd, J = 14.0, 11.1, 3.1 Hz), 2.89 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.22 (1H, ddd, J = 14.4, 11.1, 3.5 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.1, 2.8 Hz), 4.34-4.64 (5H, m), 6.98 (1H, t, J = 5.6 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.58-7.71 (4H, m), 7.96 (1H, d, J = 2.6 Hz).
42	546 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.44 (1H, ddd, J = 13.9, 10.8, 2.8 Hz), 2.86 (1H, dd, J = 12.5, 4.2 Hz), 3.21 (1H, ddd, J = 14.6, 11.5, 3.4 Hz), 3.91 (1H, dt, J = 14.7, 3.1 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.5, 3.1 Hz), 4.45-4.61 (4H, m), 7.09 (1H, t, J = 6.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.44-7.54 (3H, m), 7.59 (2H, d, J = 2.6 Hz), 7.61 (2H, d, J = 3.7 Hz), 7.65 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.84 (1H, dt, J = 8.0, 1.0 Hz), 7.89 (1H, dt, J = 7.5, 1.2 Hz), 8.08 (1H, t, J = 1.5 Hz).
43	611 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.17 (3H, s), 2.62 (1H, ddd, J = 14.6, 11.1, 3.3 Hz), 3.05 (1H, dd, J = 13.6, 4.8 Hz), 3.29 (1H, ddd, J = 15.4, 10.6, 3.5 Hz), 3.92 (1H, dt, J = 14.0, 3.0 Hz), 4.36 (1H, dt, J = 13.8, 3.1 Hz), 4.46-4.65 (4H, m), 6.97-7.00 (1H, m), 7.00 (1H, s), 7.36 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.51 (1H, d, J = 3.7 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.69 (1H, d, J = 4.4 Hz).
44	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 13.9, 10.8, 3.0 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 14.1, 4.6 Hz), 3.16 (1H, ddd, J = 14.6, 11.5, 3.0 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 13.8, 2.9 Hz), 3.89 (3H, s), 4.28 (1H, dt, J = 13.3, 3.0 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 7.02 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.33 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2H, d, J = 9.0 Hz).
45	538 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.38 (1H, ddd, J = 14.3, 11.4, 3.1 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.2, 3.7 Hz), 3.22 (1H, ddd, J = 14.4, 11.5, 3.1 Hz), 3.85 (1H, dt, J = 14.3, 2.8 Hz), 4.36 (1H, dt, J = 14.1, 2.5 Hz), 4.43-4.61 (4H, m), 6.98 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.62 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.85 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz).

表２３７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
46	495 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.98 (0.9H, s), 2.14 (2.1H, s), 2.36 (0.7H, ddd, J = 14.1, 11.0, 3.2 Hz), 2.80 (0.7H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 3.04 (0.3H, dd, J = 14.8, 3.7 Hz), 3.16 (0.3H, td, J = 11.8, 2.9 Hz), 3.23 (0.7H, ddd, J = 14.0, 11.4, 2.9 Hz), 3.35 (0.3H, ddd, J = 14.3, 11.3, 3.5 Hz), 3.70-3.78 (0.3H, m), 3.84 (0.7H, dt, J = 13.7, 2.7 Hz), 4.32-4.61 (5H, m), 6.95 (0.7H, t, J = 5.7 Hz), 7.01 (0.3H, t, J = 5.4 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.58 (0.6H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1.4H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (0.6H, d, J = 8.4 Hz), 7.88 (1.4H, d, J = 8.6 Hz), 7.99 (2H, d, J = 7.1 Hz).
47	616 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.15 (3H, s), 2.56 (1H, ddd, J = 14.1, 11.0, 3.1 Hz), 2.96 (1H, dd, J = 13.5, 4.0 Hz), 3.27 (1H, ddd, J = 14.3, 11.4, 3.5 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.3, 3.0 Hz), 4.35 (1H, dt, J = 13.2, 3.4 Hz), 4.40-4.63 (4H, m), 6.88 (1H, t, J = 6.7 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53-7.71 (7H, m), 8.00 (2H, d, J = 7.3 Hz).
48	512(M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 2.14 (3H, s), 2.48 (1H, ddd, J = 13.9, 10.8, 3.1 Hz), 2.87 (1H, dd, J = 13.2, 4.0 Hz), 3.16 (1H, ddd, J = 14.7, 11.5, 3.4 Hz), 3.27 (2H, t, J = 8.9 Hz), 3.80 (1H, dt, J = 14.0, 3.0 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.9, 3.1 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 4.72 (2H, t, J = 8.8 Hz), 6.88 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.13 (1H, t, J = 5.1 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.64 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.66 (1H, s).
49	444 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.35-2.45 (1H, m), 2.77-2.85 (1H, m), 2.92-3.05 (1H, m), 3.09-3.19 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.40-4.54 (4H, m), 6.95 (1H, t, J = 5.6 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.28-7.40 (5H, m), 7.75 (2H, d, J = 7.7 Hz).

表２３８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
50	474 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.13 (3H, s), 2.29-2.38 (1H, m), 2.73-2.81 (1H, m), 2.94-3.05 (1H, m), 3.06-3.17 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.4 Hz), 3.88 (3H, s), 4.26 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.37-4.52 (4H, m), 6.89-6.95 (2H, m), 7.21 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.28-7.33 (1H, m), 7.39 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).
51	474 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.16 (3H, s), 2.37-2.46 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.11-3.20 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.84-3.88 (1H, m), 4.29 (1H, d, J = 13.4 Hz), 4.44 (2H, d, J = 5.8 Hz), 4.49-4.54 (2H, m), 6.77-6.87 (3H, m), 6.97 (1H, br s), 7.27 (1H, s), 7.41 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz).
52	474 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.16 (3H, s), 2.35-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.2, 3.9 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.08-3.18 (1H, m), 3.79-3.86 (1H, m), 3.82 (3H, s), 4.29 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.33-4.54 (4H, m), 6.85-6.91 (3H, m), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).
53	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.15 (3H, s), 2.36-2.47 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.94-3.07 (1H, m), 3.12-3.22 (1H, m), 3.84 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.29 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.40-4.55 (4H, m), 7.08 (1H, br s), 7.21 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.21 (2H, s), 7.27 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.3 Hz).
54	523, 525 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.15 (3H, s), 2.36-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.97-3.06 (1H, m), 3.11-3.19 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.28 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.36-4.52 (4H, m), 7.03 (1H, br s), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.48 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.6 Hz).

表２３９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
55	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.50-2.59 (1H, m), 2.75 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 2.95-3.05 (1H, m), 3.14-3.28 (2H, m), 3.88 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.06 (1H, d, J = 15.2 Hz), 4.18 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.26 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.41-4.60 (4H, m), 7.11 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
56	556 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.38 (3H, s), 1.42 (3H, s), 2.75-2.90 (2H, m), 2.94-3.07 (1H, m), 3.28-3.38 (1H, m), 3.77 (1H, dt, J = 13.9, 3.6 Hz), 4.10-4.38 (2H, m), 4.45 (1H, s), 4.51 (2H, d, J = 5.3 Hz), 5.34 (1H, d, J = 13.2 Hz), 7.36 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz).
57	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.47 (1H, t, J = 11.0 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.0 Hz), 2.95-3.05 (1H, m), 3.14-3.29 (1H, m), 3.37 (3H, s), 3.84 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.15 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.22-4.31 (2H, m), 4.40-4.59 (4H, m), 7.16 (1H, br s), 7.34 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.6 Hz).
58	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.38-2.50 (2H, m), 2.77 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.87 (1H, dq, J = 16.9, 3.0 Hz), 2.94-3.08 (2H, m), 3.12-3.23 (1H, m), 3.69-3.93 (3H, m), 4.29 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.43-4.59 (4H, m), 7.16 (1H, br s), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
59	541 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.51-2.61 (1H, m), 2.64 (1H, dd, J = 13.2, 4.4 Hz), 2.79 (6H, s), 2.93-3.05 (1H, m), 3.29-3.38 (2H, m), 3.80 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.15 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.44-4.51 (2H, m), 4.60 (1H, dd, J = 15.4, 6.0 Hz), 7.34 (1H, br s), 7.36-7.41 (4H, m), 7.59 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２４０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
60	498 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (3H, t, J = 7.6 Hz), 2.13 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.3, 11.1, 3.3 Hz), 2.75 (2H, q, J = 7.6 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.5, 4.2 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.8, 11.2, 3.0 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.6, 2.6 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.6, 2.6 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 7.12 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.2 Hz).
61	596 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.0, 11.1, 3.1 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 14.0, 3.9 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 14.9, 11.4, 3.3 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 13.7, 2.9 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.9, 3.1 Hz), 4.44-4.59 (4H, m), 7.03 (1H, t, J = 5.1 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.62 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.6 Hz).
62	576 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.16 (3H, s), 2.65 (1H, ddd, J = 14.1, 11.3, 2.9 Hz), 3.08 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 3.25 (1H, ddd, J = 14.5, 11.0, 3.4 Hz), 3.87 (1H, dt, J = 14.3, 2.9 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 14.0, 3.1 Hz), 4.45-4.61 (4H, m), 6.94 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.02 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.52 (1H, d, J = 4.0 Hz), 7.59 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.64 (1H, s), 7.86 (1H, s).
63	498 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.45 (1H, td, J = 13.5, 4.0 Hz), 2.86 (1H, dd, J = 13.3, 4.3 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.10 (1H, ddd, J = 14.8, 11.7, 3.3 Hz), 3.88 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.14 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.45-4.53 (3H, m), 7.05 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.02 (1H, s).

表２４１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
64	484 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 13.9, 11.3, 2.7 Hz), 2.46 (3H, s), 2.80 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 3.16 (1H, ddd, J = 14.6, 11.5, 3.4 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.8, 2.8 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.8, 2.8 Hz), 4.44-4.59 (4H, m), 7.09 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.36 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.2 Hz).
65	554 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 13.7, 11.0, 3.1 Hz), 2.84 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 3.21 (1H, ddd, J = 14.6, 11.5, 2.9 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 13.9, 2.7 Hz), 4.34 (1H, dt, J = 14.2, 3.0 Hz), 4.43-4.60 (4H, m), 7.03 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz).
66	563 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 1.76 (1.5H, s), 1.91 (1.5H, s), 2.52-2.61 (0.5H, m), 2.93 (0.5H, dd, J = 13.4, 5.1 Hz), 3.08-3.23 (1H, m), 3.40 (0.5H, td, J = 12.5, 4.4 Hz), 3.53-3.85 (2H, m), 3.98-4.32 (3H, m), 4.42-4.64 (1.5H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.39-7.44 (2H, m), 7.53-7.73 (4H, m), 7.77 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.85 (1H, d, J = 7.9 Hz), 8.49-8.55 (2H, m), 8.71 (0.5H, t, J = 5.8 Hz), 8.81 (0.5H, t, J = 5.5 Hz).
67	462 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ 1.28(6H, d, J=6.9Hz), 2.12(3H, s), 2.30-2.50(1H, m), 2.90-3.05(1H, m), 3.05-3.20(1H, m), 3.83(1H, d, J=14.1Hz), 4.28(1H, d, J=13.8Hz), 4.40-4.60(4H, m), 6.95(1H, brs), 7.00-7.15(2H, m), 7.20-7.30(2H, m), 7.40(2H, d, J=8.4Hz), 7.76(2H, d, J=8.3Hz).
68	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.2 Hz), 1.32 (9H, s), 2.15 (3H, s), 2.32-2.47 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.93-3.06 (1H, m), 3.09-3.23 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.35-4.56 (4H, m), 6.89 (1H, br s), 7.15 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.33-7.44 (4H, m), 7.76 (2H, d, J = 7.9 Hz).

表２４２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
69	583, 585 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.00 (1.5H, s), 2.15 (1.5H, s), 2.49 (0.5H, t, J = 11.8 Hz), 2.96 (0.5H, t, J = 6.7 Hz), 3.03-3.17 (1H, m), 3.28 (0.5H, t, J = 11.1 Hz), 3.39 (0.5H, t, J = 10.5 Hz), 3.73-3.87 (1.5H, m), 4.27-4.62 (3.5H, m), 4.69-4.73 (0.5H, m), 4.95-5.03 (0.5H, m), 6.90 (0.5H, t, J = 6.1 Hz), 7.01 (0.5H, t, J = 6.5 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.62 (1H, d, J = 7.7 Hz), 8.34 (1H, d, J = 9.7 Hz), 8.74 (1H, d, J = 13.9 Hz).
70	556 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.52 (1H, t, J = 10.9 Hz), 2.96 (1H, d, J = 13.2 Hz), 3.20 (1H, t, J = 12.1 Hz), 3.67-3.87 (9H, m), 4.30 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.45-4.62 (4H, m), 6.63 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.18 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.79 (1H, d, J = 9.5 Hz), 8.58 (1H, s).
71	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.43 (1H, ddd, J = 14.2, 11.3, 2.9 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.4, 11.4, 2.9 Hz), 3.86 (3H, s), 3.86-3.90 (1H, m), 4.31 (1H, dt, J = 13.2, 2.7 Hz), 4.43-4.59 (4H, m), 7.03 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.16 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.31-7.37 (3H, m), 7.40-7.50 (2H, m), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz).
72	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.96 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.68 (2H, dd, J = 15.0, 7.5 Hz), 2.13 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 13.9, 11.0, 2.7 Hz), 2.68 (2H, t, J = 7.7 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.7, 11.2, 3.4 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.1, 3.0 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.3, 2.3 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 7.10 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.34 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.36 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２４３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
73	546 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.47 (1H, ddd, J = 14.1, 11.0, 3.0 Hz), 2.87 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 3.21 (1H, ddd, J = 14.6, 11.0, 3.3 Hz), 3.89 (1H, dt, J = 14.4, 3.0 Hz), 4.32 (1H, dt, J = 13.8, 3.5 Hz), 4.46-4.61 (4H, m), 7.10 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.44-7.53 (3H, m), 7.59 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.61 (2H, d, J = 6.6 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz).
74	526 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.63 (1H, ddd, J = 14.3, 11.0, 3.3 Hz), 3.04 (1H, dd, J = 13.8, 4.1 Hz), 3.24 (1H, ddd, J = 14.3, 11.2, 3.4 Hz), 3.95 (1H, dt, J = 14.6, 2.9 Hz), 4.35 (1H, dt, J = 13.4, 2.9 Hz), 4.44-4.61 (4H, m), 7.01 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.30 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.50-7.60 (4H, m), 7.87 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.92 (1H, d, J = 7.1 Hz), 7.94 (1H, s).
75	518 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.35 (6H, d, J = 6.6 Hz), 2.16 (3H, s), 2.61 (1H, ddd, J = 14.3, 10.4, 3.0 Hz), 2.99 (1H, dd, J = 12.8, 3.5 Hz), 3.17-3.27 (2H, m), 3.84 (1H, dt, J = 14.8, 3.0 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.5, 3.1 Hz), 4.47-4.59 (4H, m), 6.85 (1H, d, J = 3.1 Hz), 7.10 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.50 (1H, s), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz).
76	502 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.14 (3H, s), 2.33-2.47 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 2.92-3.06 (1H, m), 3.09-3.23 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.3 Hz), 3.92 (3H, s), 4.28 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.43-4.59 (4H, m), 7.08 (1H, br s), 7.28 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.02 (2H, d, J = 8.3 Hz).
77	489 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.12 (3H, s), 2.36-2.49 (1H, m), 2.76-2.86 (1H, m), 2.94-3.09 (1H, m), 3.13-3.27 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.27 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.42-4.58 (2H, m), 4.63 (1H, dd, J = 15.8, 6.4 Hz), 7.29 (1H, br s), 7.40-7.43 (4H, m), 7.78 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.21 (2H, d, J = 8.7 Hz).

表２４４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
78	462 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.15 (3H, s), 2.37-2.45 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.97-3.05 (1H, m), 3.12-3.21 (1H, m), 3.85 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.30 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.38-4.54 (4H, m), 6.91-7.08 (4H, m), 7.32 (1H, td, J = 7.9, 6.0 Hz), 7.42 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.6 Hz).
79	497 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.16 (3H, s), 2.21-2.31 (1H, m), 2.56-2.66 (1H, m), 2.75 (1H, dd, J = 13.4, 4.2 Hz), 2.92-3.09 (3H, m), 3.48-3.60 (2H, m), 3.67-3.78 (1H, m), 4.12 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.39 (1H, d, J = 3.7 Hz), 4.47 (1H, d, J = 13.4 Hz), 6.53-6.59 (1H, m), 6.98-7.00 (1H, m), 7.13-7.18 (1H, m), 7.21-7.26 (1H, m), 7.33 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.65 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.19 (1H, br s).
80	529 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.33-2.42 (1H, m), 2.79 (1H, dd, J = 13.2, 4.0 Hz), 2.95-3.05 (1H, m), 3.08-3.16 (1H, m), 3.14-3.18 (4H, m), 3.80 (1H, d, J = 14.6 Hz), 3.84-3.89 (4H, m), 4.23-4.53 (5H, m), 6.83-6.88 (1H, m), 6.88 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
81	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.34-2.44 (1H, m), 2.47 (3H, s), 2.71-2.77 (4H, m), 2.77-2.84 (1H, m), 2.94-3.04 (1H, m), 3.07-3.17 (1H, m), 3.27-3.33 (4H, m), 3.79 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.22-4.34 (2H, m), 4.38-4.52 (3H, m), 6.70 (1H, s), 6.88 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
82	629 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.42 (9H, s), 2.65-2.91 (2H, m), 2.95 (6H, s), 3.28 (1H, ddd, J = 13.8, 10.9, 3.2 Hz), 3.62-3.87 (2H, m), 4.23 (1H, dd, J = 14.9, 5.1 Hz), 4.33-4.42 (2H, m), 4.52-4.60 (1H, m), 6.48 (1H, t, J = 5.5 Hz), 6.71 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.09 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.85 (2H, d, J = 8.7 Hz).

表２４５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
83	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.39 (6H, d, J = 6.0 Hz), 2.14 (3H, s), 2.44 (1H, ddd, J = 14.1, 11.3, 3.0 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 13.9, 4.6 Hz), 3.16 (1H, ddd, J = 14.4, 11.6, 3.1 Hz), 3.80 (1H, dt, J = 14.4, 2.9 Hz), 4.27 (1H, dt, J = 13.7, 3.0 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 4.60-4.67 (1H, m), 6.98 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.14 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.33 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.8 Hz).
84	529 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 2.72 (1H, t, J = 10.0 Hz), 2.99-3.03 (1H, m), 3.02 (6H, s), 3.19 (1H, d, J = 11.7 Hz), 3.53-3.66 (2H, m), 3.86 (1H, d, J = 12.1 Hz), 4.19 (2H, d, J = 5.3 Hz), 4.71 (1H, d, J = 4.1 Hz), 7.21-7.32 (4H, m), 7.60 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.97 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.46 (1H, br s), 8.78 (1H, br s), 9.68 (1H, br s).
85	571 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.16 (3H, s), 2.41 (1H, ddd, J = 14.1, 11.1, 3.0 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 3.00 (6H, s), 3.12 (1H, ddd, J = 14.4, 11.4, 3.3 Hz), 3.79 (1H, dt, J = 14.9, 3.0 Hz), 4.27-4.56 (5H, m), 6.56-7.01 (3H, m), 7.12 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.89 (2H, d, J = 8.7 Hz).
86	686 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.37 (9H, s), 2.90 (6H, s), 2.91-2.95 (1H, m), 3.13 (1H, dd, J = 13.9, 4.2 Hz), 3.51-3.77 (4H, m), 3.95 (1H, d, J = 12.6 Hz), 4.08 (2H, dd, J = 5.3, 2.9 Hz), 4.21 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.45 (1H, dd, J = 4.0, 2.5 Hz), 5.99 (1H, t, J = 8.3 Hz), 6.68 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.03 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.89 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.90 (1H, br s).
87	700 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.36 (9H, s), 2.34 (2H, ddd, J = 32.9, 14.8, 7.4 Hz), 2.88 (6H, s), 3.07-3.14 (4H, m), 3.57-3.61 (2H, m), 3.95-4.12 (3H, m), 4.21-4.32 (1H, m), 4.44 (1H, dd, J = 4.7, 2.5 Hz), 5.98 (1H, br s), 6.68 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.02 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.51 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.91 (1H, br s).

表２４６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
88	586 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 2.90 (6H, s), 3.10-3.18 (1H, m), 3.64-3.71 (2H, m), 3.77-4.15 (8H, m), 4.53 (1H, dd, J = 4.3, 1.9 Hz), 6.75 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.05 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.54 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93-8.05 (3H, m).
89	600 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 2.52-2.69 (2H, m), 2.90 (6H, s), 2.93-2.98 (2H, m), 3.12-3.20 (2H, m), 3.25-3.33 (2H, m), 3.65 (1H, d, J = 12.6 Hz), 3.98-4.12 (4H, m), 4.49 (1H, dd, J = 4.2, 2.3 Hz), 6.78 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.71 (2H, br s), 7.90 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.04 (1H, t, J = 5.6 Hz).
90	459 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.35-2.43 (1H, m), 2.79-2.84 (1H, m), 2.95-3.04 (1H, m), 3.05-3.15 (1H, m), 3.80 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.22-4.39 (2H, m), 4.44-4.53 (2H, m), 6.65 (2H, d, J = 8.4 Hz), 6.78 (1H, br s), 7.00 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
91	526 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.94 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.30-1.43 (2H, m), 1.59-1.68 (2H, m), 2.13 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 13.8, 11.4, 3.1 Hz), 2.70 (2H, t, J = 7.7 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.0, 11.2, 2.9 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.3, 2.8 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.6, 2.6 Hz), 4.43-4.55 (4H, m), 7.13 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.36 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.3 Hz).
92	513 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.45 (1H, ddd, J = 13.9, 11.1, 3.0 Hz), 2.86 (1H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 3.07 (6H, s), 3.13 (1H, ddd, J = 14.6, 10.8, 3.3 Hz), 3.79 (1H, dt, J = 14.4, 3.3 Hz), 4.24 (1H, dt, J = 13.7, 2.8 Hz), 4.42-4.55 (4H, m), 6.67 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.22 (1H, t, J = 6.2 Hz), 7.33 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.64 (2H, d, J = 9.0 Hz).

表２４７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
93	485 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.83 (3H, s), 2.77-3.27 (5H, m), 3.40-3.58 (2H, m), 3.81-3.93 (1H, m), 4.16-4.25 (1H, m), 4.31-4.36 (3H, m), 6.65 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.14 (1H, t, J = 5.2 Hz).
94	601 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.42 (2H, dd, J = 11.7, 3.8 Hz), 2.67 (1H, d, J = 10.5 Hz), 2.96 (6H, s), 3.09-3.19 (1H, m), 3.17 (1H, d, J = 17.0 Hz), 3.27 (1H, d, J = 17.0 Hz), 3.35 (1H, dt, J = 12.1, 1.4 Hz), 3.65 (3H, s), 3.68-3.76 (1H, m), 4.28 (1H, d, J = 5.3 Hz), 4.38 (1H, d, J = 6.0 Hz), 4.50 (1H, dt, J = 3.5, 1.8 Hz), 6.72 (2H, d, J = 5.7 Hz), 7.07 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.60 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.62-7.66 (1H, m), 7.86 (2H, d, J = 8.7 Hz).
95	614 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.52 (6H, s), 2.87-2.94 (1H, m), 2.95 (6H, s), 3.13 (1H, ddd, J = 14.5, 11.5, 3.0 Hz), 3.53-3.73 (2H, m), 3.81 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.20-4.55 (6H, m), 6.69 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.80 (1H, t, J = 5.1 Hz), 7.05 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.3 Hz).
96	587 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.99 (1H, dd, J = 11.5, 2.8 Hz), 2.25 (1H, td, J = 11.8, 3.1 Hz), 2.63 (1H, d, J = 10.5 Hz), 2.96 (6H, s), 3.05 (1H, d, J = 17.7 Hz), 3.19 (1H, d, J = 17.7 Hz), 3.19-3.33 (2H, m), 3.86 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.34-4.43 (3H, m), 6.71 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.89 (1H, t, J = 4.3 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.51 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.7 Hz), 11.20 (1H, br s).
97	540 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.32 (6.0H, s), 1.67 (2.0H, q, J = 7.3 Hz), 1.91 (0.3H, s), 2.13 (2.7H, s), 2.36-2.46 (0.7H, m), 2.80 (0.7H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.13-3.22 (0.8H, m), 3.83 (0.7H, d, J = 14.7 Hz), 4.28 (0.7H, d, J = 12.4 Hz), 4.46-4.59 (3.7H, m), 7.11-7.15 (0.7H, m), 7.35 (1.8H, d, J = 7.5 Hz), 7.52 (1.9H, d, J = 8.7 Hz), 7.61 (1.9H, d, J = 7.9 Hz), 7.78 (1.9H, d, J = 8.3 Hz).

表２４８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
98	543 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.33 (9H, s), 2.16 (3H, s), 2.37-2.46 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.1, 3.8 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.07-3.16 (1H, m), 3.81 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.27 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.34-4.54 (4H, m), 6.91 (1H, br s), 7.18 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.32 (1H, br s), 7.41 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).
99	488 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.14 (3H, s), 2.39-2.46 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.5, 4.0 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.14-3.22 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.30 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.48-4.54 (4H, m), 7.11 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.31 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.41 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.05 (2H, d, J = 7.9 Hz).
100	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.92 (0.3H, s), 2.13 (2.6H, s), 2.37-2.45 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.97-3.04 (1H, m), 3.10-3.18 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.24-4.40 (2H, m), 4.42-4.50 (3H, m), 7.07 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.34 (4H, d, J = 2.0 Hz), 7.41 (4H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
101	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.11 (3H, s), 2.35-2.46 (1H, m), 2.81-2.88 (1H, m), 2.95-3.04 (1H, m), 3.10-3.17 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.44-4.49 (4H, m), 7.06-7.08 (1H, br m), 7.24 (2H, s), 7.41 (3H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.2 Hz).
102	654 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.34-1.45 (2H, m), 2.23-2.59 (5H, m), 2.86-3.22 (9H, m), 3.53 (1H, d, J = 13.6 Hz), 3.76 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.17-4.58 (4H, m), 4.76-4.95 (1H, m), 6.49-6.61 (1H, m), 6.64-6.75 (2H, m), 6.99-7.14 (2H, m), 7.46-7.63 (2H, m), 7.81-7.92 (2H, m).

表２４９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
103	538 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ: 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.89 (1H, dd, J = 14.1, 3.7 Hz), 2.95-3.08 (2H, m), 3.22-3.33 (1H, m), 3.62-3.81 (4H, m), 3.98 (1H, d, J = 15.0 Hz), 4.21 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.40-4.49 (2H, m), 4.62 (1H, d, J = 6.6 Hz), 4.64-4.69 (1H, m), 7.39 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.58 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.64 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).
104	656 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 2.34-2.59 (5H, m), 2.83-3.04 (7H, m), 3.05-3.27 (2H, m), 3.53 (1H, d, J = 13.9 Hz), 3.59-3.84 (5H, m), 4.23-4.43 (4H, m), 4.77 (1H, d, J = 13.9 Hz), 6.52-6.60 (1H, m), 6.69 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.04 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.7 Hz).
105	676 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 2.39-2.55 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 2.94 (6H, s), 3.04-3.21 (1H, m), 3.42 (1H, d, J = 16.6 Hz), 3.65-3.88 (4H, m), 4.18-4.61 (5H, m), 6.57-6.74 (3H, m), 7.05 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.28-7.36 (4H, m), 7.51 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.87 (2H, d, J = 8.3 Hz).
106	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 2.12 (3H, s), 2.35 (1H, ddd, J = 14.6, 11.2, 2.9 Hz), 2.78 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.7, 11.7, 3.2 Hz), 3.87 (1H, dt, J = 14.7, 3.2 Hz), 3.98 (3H, s), 4.28-4.62 (5H, m), 7.01 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.33 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.22 (2H, d, J = 8.7 Hz).
107	514 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 2.14 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 14.4, 11.8, 2.7 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 3.22 (1H, ddd, J = 14.8, 11.8, 3.1 Hz), 3.88 (1H, dt, J = 14.7, 2.8 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.1, 2.5 Hz), 4.44-4.61 (4H, m), 7.02 (1H, t, J = 6.4 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.96 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.26 (2H, d, J = 8.3 Hz), 9.50 (1H, br s).

表２５０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
108	524 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.36-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.6 Hz), 2.94-3.04 (1H, m), 3.10-3.19 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 13.2 Hz), 3.95 (3H, s), 4.28 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.37-4.54 (4H, m), 6.95 (1H, br s), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.44 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.76 (2H, d, J = 7.7 Hz).
109	527 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.57-1.61 (2H, m), 1.67-1.74 (4H, m), 2.15 (3H, s), 2.35-2.44 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.3, 3.9 Hz), 2.95-3.03 (1H, m), 3.07-3.16 (1H, m), 3.13-3.18 (4H, m), 3.80 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.24-4.42 (3H, m), 4.45-4.53 (2H, m), 6.78 (1H, br s), 6.89 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
110	670 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.82 (6H, t, J = 7.3 Hz), 1.34-1.52 (4H, m), 2.26-2.56 (4H, m), 2.83-3.03 (7H, m), 3.06-3.22 (2H, m), 3.66-3.82 (2H, m), 4.05-4.68 (5H, m), 4.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 6.51-6.61 (1H, m), 6.70 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.00-7.13 (2H, m), 7.52 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.86 (2H, d, J = 8.3 Hz).
111	529 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.69 (2H, dd, J = 13.8, 3.4 Hz), 2.98-3.05 (1H, m), 3.12-3.19 (1H, m), 3.95 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.46-4.63 (4H, m), 4.98 (1H, d, J = 15.2 Hz), 6.31 (2H, br s), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.63 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
112	555 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.82-3.04 (3H, m), 3.20-3.40 (3H, m), 3.82 (2H, d, J = 14.1 Hz), 3.89-3.97 (2H, m), 4.42-4.63 (4H, m), 7.38 (4H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz).

表２５１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
113	670 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.34-2.57 (6H, m), 2.59-2.71 (2H, m), 2.76-2.90 (2H, m), 2.96 (6H, s), 3.04-3.19 (1H, m), 3.62-3.73 (4H, m), 3.79 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.20-4.39 (3H, m), 4.40-4.49 (1H, m), 4.58 (1H, d, J = 12.8 Hz), 6.50-6.61 (1H, m), 6.70 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.05 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.87 (2H, d, J = 8.3 Hz).
114	684 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.88 (6H, t, J = 7.3 Hz), 1.41-1.59 (4H, m), 2.37-2.56 (5H, m), 2.56-2.92 (5H, m), 2.96 (6H, s), 3.06-3.22 (1H, m), 3.78 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.18-4.36 (3H, m), 4.41-4.47 (1H, m), 4.57 (1H, d, J = 13.9 Hz), 6.55-6.65 (1H, m), 6.70 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.3 Hz).
115	567 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.18 (3H, d, J = 1.1 Hz), 2.77-2.90 (2H, m), 2.93-3.03 (1H, m), 3.37-3.47 (1H, m), 3.78-3.93 (2H, m), 4.39 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.53 (2H, d, J = 6.2 Hz), 4.55-4.59 (1H, m), 6.13 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.17 (1H, t, J = 6.2 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
116	554 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.91 (0H, s), 2.15 (3H, s), 2.36-2.44 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 2.94-3.04 (1H, m), 3.13-3.23 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.4 Hz), 4.46-4.54 (4H, m), 7.05 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.29 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.40 (4H, d, J = 8.6 Hz), 7.52 (4H, t, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz).
117	486 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25-1.28 (12H, m), 1.91 (0.3H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.35-2.43 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 14.1, 4.9 Hz), 2.87-2.94 (1H, m), 2.96-3.03 (1H, m), 3.11-3.18 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.4 Hz), 4.36-4.52 (4H, m), 6.88-6.91 (1H, br m), 7.13 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２５２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
118	458 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.89 (0.3H, s), 2.12 (2.7H, s), 2.24-2.32 (1H, m), 2.70-2.89 (4H, m), 2.95-3.04 (1H, m), 3.42-3.61 (2H, m), 3.69 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.18 (1H, d, J = 13.4 Hz), 4.39-4.46 (2H, m), 6.62-6.65 (1H, br m), 7.16-7.24 (3H, m), 7.32 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.1 Hz).
119	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.30 (6.2H, d, J = 7.2 Hz), 1.92 (0.3H, s), 2.15 (2.6H, s), 2.35-2.49 (0.9H, m), 2.83 (0.9H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.95-3.08 (1.0H, m), 3.12-3.22 (0.9H, m), 3.85 (0.8H, d, J = 13.9 Hz), 4.29 (0.9H, d, J = 12.8 Hz), 4.43-4.63 (3.9H, m), 7.08-7.17 (0.9H, m), 7.37-7.60 (6.0H, m), 7.78 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
120	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.5H, d, J = 7.2 Hz), 1.90 (0.3H, s), 2.13 (2.7H, s), 2.37-2.49 (0.9H, m), 2.87 (0.9H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.93-3.16 (2.0H, m), 3.80 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.27 (0.9H, d, J = 13.2 Hz), 4.45-4.53 (1.9H, m), 4.63 (2.2H, d, J = 6.0 Hz), 6.92-7.01 (0.8H, m), 7.35-7.46 (4.0H, m), 7.53 (1.0H, d, J = 7.2 Hz), 7.66 (1.1H, d, J = 7.9 Hz), 7.73-7.79 (2.0H, m).
121	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.3H, d, J = 7.2 Hz), 1.91 (0.3H, s), 2.13 (2.6H, s), 2.33-2.46 (0.9H, m), 2.81 (0.9H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.94-3.06 (1.0H, m), 3.08-3.22 (0.9H, m), 3.84 (0.8H, d, J = 14.3 Hz), 4.27 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.39-4.57 (3.9H, m), 7.02-7.19 (3.8H, m), 7.33-7.44 (3.0H, m), 7.77 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
122	653 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.81-1.36 (5H, m), 1.60-1.78 (6H, m), 2.26-2.35 (2H, m), 2.39-2.52 (1H, m), 2.80-2.91 (1H, m), 2.95 (6H, s), 3.05-3.20 (1H, m), 3.66-3.83 (1H, m), 4.18-4.47 (4H, m), 4.52-4.66 (1H, m), 6.54-6.62 (1H, m), 6.65-6.74 (2H, m), 6.96-7.14 (2H, m), 7.47-7.60 (2H, m), 7.81-7.93 (2H, m).

表２５３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
123	574 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.86-3.07 (4H, m), 3.31-3.46 (1H, m), 3.57-4.20 (2H, m), 4.27-4.59 (2H, m), 4.52 (2H, d, J = 6.0 Hz), 7.13 (1H, br s), 7.28-7.45 (9H, m), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).
124	588 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.38-2.49 (1H, m), 2.70 (1H, dd, J = 13.9, 4.2 Hz), 2.94-3.03 (1H, m), 3.15-3.26 (1H, m), 3.76-3.93 (3H, m), 4.32 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.42-4.64 (4H, m), 7.11-7.30 (6H, m), 7.37 (4H, t, J = 9.0 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
125	604 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45-2.54 (1H, m), 2.88 (1H, dd, J = 13.6, 3.9 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.16-3.26 (1H, m), 3.84 (1H, d, J = 15.0 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.47-4.64 (4H, m), 4.78 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.93 (1H, d, J = 13.7 Hz), 6.90-6.97 (3H, m), 7.15 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.21-7.28 (2H, m), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).
126	536 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.2H, d, J = 7.2 Hz), 1.91 (0.3H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.32-2.46 (0.9H, m), 2.80 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.96-3.05 (1.1H, m), 3.09-3.22 (1.0H, m), 3.83 (0.9H, d, J = 15.1 Hz), 4.27 (0.9H, d, J = 13.2 Hz), 4.38-4.54 (4.0H, m), 6.90-7.06 (4.7H, m), 7.08-7.14 (0.9H, m), 7.18 (1.9H, d, J = 8.3 Hz), 7.30-7.44 (3.9H, m), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
127	502 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.33 (6.2H, d, J = 6.0 Hz), 1.91 (0.3H, s), 2.15 (2.8H, s), 2.34-2.44 (0.9H, m), 2.81 (0.9H, dd, J = 14.1, 4.7 Hz), 2.95-3.04 (1.0H, m), 3.07-3.17 (1.0H, m), 3.81 (0.9H, d, J = 13.9 Hz), 4.21-4.40 (3.0H, m), 4.45-4.59 (3.0H, m), 6.79-6.88 (2.9H, m), 7.11 (1.9H, d, J = 8.7 Hz), 7.39 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).

表２５４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
128	487 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.3H, d, J = 7.2 Hz), 1.90 (0.2H, s), 2.15 (2.8H, s), 2.35-2.45 (0.9H, m), 2.81 (1.0H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.90-3.06 (7.0H, m), 3.08-3.22 (1.0H, m), 3.81 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.21-4.56 (4.8H, m), 6.50-6.60 (1.9H, m), 6.61-6.69 (1.0H, m), 6.86-6.94 (0.8H, m), 7.20 (1.0H, t, J = 7.9 Hz), 7.38 (2.0H, d, J = 8.7 Hz), 7.75 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
129	487 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.4H, d, J = 6.4 Hz), 1.88 (0.2H, s), 2.12 (2.7H, s), 2.23-2.37 (0.9H, m), 2.64-2.81 (7.1H, m), 2.91-3.05 (1.1H, m), 3.10-3.19 (0.9H, m), 3.86 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.23 (0.9H, d, J = 13.6 Hz), 4.41-4.67 (4.1H, m), 6.99-7.09 (1.1H, m), 7.17 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.34-7.43 (2.0H, m), 7.70-7.79 (2.0H, m).
130	585 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.09 (3H, t, J = 7.3 Hz), 2.11-2.51 (2H, m), 2.52-2.69 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.96 (6H, s), 3.05-3.20 (1H, m), 3.79 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.19-4.39 (3H, m), 4.40-4.47 (1H, m), 4.58 (1H, d, J = 13.6 Hz), 6.53-6.63 (1H, m), 6.70 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.87 (2H, d, J = 8.3 Hz).
131	647 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.31-2.50 (0.9H, m), 2.74 (0.8H, dd, J = 13.9, 3.8 Hz), 2.96 (6.4H, s), 3.07-3.22 (1.2H, m), 3.59-4.02 (3.0H, m), 4.24-4.55 (4.0H, m), 4.64 (0.8H, d, J = 13.9 Hz), 6.54-6.65 (1.0H, m), 6.71 (2.1H, d, J = 8.7 Hz), 7.08 (2.2H, d, J = 8.7 Hz), 7.17-7.35 (5.0H, m), 7.49 (2.1H, d, J = 8.3 Hz), 7.85 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
132	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.01 (1H, br s), 2.12 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.3, 11.4, 3.3 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.3, 4.3 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 14.7, 11.8, 3.1 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.8, 3.0 Hz), 4.26 (1H, dt, J = 13.0, 3.0 Hz), 4.43-4.59 (4H, m), 4.82 (2H, s), 7.10 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.57 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.85 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２５５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
133	539 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.69-2.80 (2H, m), 2.94-3.03 (1H, m), 3.29-3.38 (1H, m), 3.64-3.73 (3H, m), 3.80 (1H, dt, J = 14.1, 3.1 Hz), 4.25 (2H, td, J = 17.1, 8.0 Hz), 4.45-4.61 (4H, m), 7.16 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.38 (4H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).
134	603 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, dd, J = 6.9, 1.9 Hz), 2.90-3.08 (2H, m), 3.11 (1H, dd, J = 13.1, 4.5 Hz), 3.41-3.50 (1H, m), 3.92 (1H, dt, J = 13.8, 3.2 Hz), 4.07 (1H, d, J = 12.6 Hz), 4.47-4.58 (3H, m), 4.60-4.64 (1H, m), 7.08-7.12 (1H, m), 7.21 (1H, br s), 7.27-7.32 (3H, m), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.46 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.52 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (1H, dd, J = 7.9, 0.7 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.6 Hz).
135	629 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.85-3.04 (3H, m), 3.40-3.50 (1H, m), 3.89-4.03 (2H, m), 4.48 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.53 (2H, d, J = 6.2 Hz), 4.61 (1H, d, J = 2.6 Hz), 6.77 (1H, s), 7.18 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.23-7.29 (1H, m), 7.30-7.37 (4H, m), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74-7.81 (4H, m).
136	530 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.15 (3H, s), 2.47 (1H, ddd, J = 13.9, 11.5, 3.0 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.5, 11.6, 3.4 Hz), 3.85 (1H, dt, J = 13.3, 3.1 Hz), 3.93 (3H, s), 3.97 (3H, s), 4.30 (1H, dt, J = 13.6, 3.1 Hz), 4.46-4.60 (4H, m), 6.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.14 (1H, t, J = 6.6 Hz), 7.27 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.48 (1H, dd, J = 8.5, 2.2 Hz), 7.62 (2H, d, J = 7.9 Hz).

表２５６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
137	486 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.14 (3H, s), 2.34-2.46 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.8, 4.5 Hz), 2.86-2.95 (1H, m), 2.95-3.04 (1H, m), 3.10-3.19 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.35-4.47 (2H, m), 4.50 (2H, d, J = 12.1 Hz), 6.90 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
138	492 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.12 (3H, s), 2.25-2.36 (1H, m), 2.70-2.95 (4H, m), 2.95-3.07 (1H, m), 3.49 (2H, q, J = 6.7 Hz), 3.72 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.21 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.39 (1H, d, J = 3.7 Hz), 4.43 (1H, d, J = 13.5 Hz), 6.69 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.29 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.4 Hz).
139	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.54-1.65 (2H, m), 1.65-1.74 (2H, m), 1.75-1.86 (2H, m), 2.01-2.11 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.35-2.45 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.5, 4.2 Hz), 2.93-3.04 (2H, m), 3.10-3.19 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.34-4.54 (4H, m), 6.88 (1H, br s), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.22 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
140	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.84 (6H, t, J = 7.4 Hz), 1.09-1.26 (4H, m), 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.45-1.65 (4H, m), 2.15 (3H, s), 2.33-2.44 (1H, m), 2.46-2.57 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.8, 4.5 Hz), 2.95-3.05 (1H, m), 3.11-3.20 (1H, m), 3.84 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.36-4.55 (4H, m), 6.89 (1H, br s), 7.11 (4H, s), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２５７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
141	554 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.92 (0.3H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.37-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 2.96-3.03 (1H, m), 3.14-3.21 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.45-4.54 (4H, m), 7.02-7.05 (1H, br m), 7.29-7.47 (7H, m), 7.55 (3H, t, J = 6.9 Hz), 7.76-7.78 (2H, m).
142	554 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 1.92 (0.3H, s), 2.15 (2.6H, s), 2.38-2.45 (0.8H, m), 2.83 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.96-3.03 (1.1H, m), 3.15-3.22 (0.9H, m), 3.85 (0.8H, d, J = 14.3 Hz), 4.30 (0.9H, d, J = 13.2 Hz), 4.46-4.56 (3.8H, m), 7.00-7.02 (0.8H, br m), 7.26-7.33 (5.0H, m), 7.41-7.46 (5.0H, m), 7.77 (1.9H, d, J = 8.2 Hz).
143	514 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.38 (1H, ddd, J = 13.8, 11.0, 2.7 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.8, 11.6, 3.5 Hz), 3.47 (3H, s), 3.84 (1H, dt, J = 14.8, 3.2 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 13.9, 3.2 Hz), 4.44-4.56 (6H, m), 7.07 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.33 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.53 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8.3 Hz).
144	472 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.22-1.29 (8.8H, m), 1.91 (0.2H, s), 2.15 (2.6H, s), 2.36-2.43 (0.9H, m), 2.64 (2.0H, q, J = 7.6 Hz), 2.82 (0.9H, dd, J = 13.1, 3.9 Hz), 2.96-3.03 (1.1H, m), 3.10-3.17 (1.0H, m), 3.82 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (0.9H, d, J = 13.5 Hz), 4.36-4.52 (4.0H, m), 6.87-6.90 (0.8H, br m), 7.12 (1.7H, d, J = 7.9 Hz), 7.18 (2.2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39 (2.1H, d, J = 8.4 Hz), 7.75 (2.0H, d, J = 8.2 Hz).

表２５８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
145	472 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.28 (5.9H, d, J = 6.8 Hz), 1.79-1.86 (1.9H, m), 1.92 (0.3H, s), 2.13 (2.6H, s), 2.34-2.42 (0.8H, m), 2.63 (1.9H, t, J = 7.6 Hz), 2.78 (0.8H, dd, J = 13.1, 3.9 Hz), 2.96-3.03 (1.0H, m), 3.08-3.15 (0.9H, m), 3.22-3.34 (2.0H, m), 3.82 (0.8H, d, J = 14.3 Hz), 4.27 (0.8H, d, J = 13.5 Hz), 4.40-4.48 (1.8H, m), 6.65-6.66 (0.8H, br m), 7.19 (2.9H, t, J = 10.0 Hz), 7.27-7.31 (2.0H, m), 7.42 (2.1H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2.0H, d, J = 8.2 Hz).
146	527 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.76 (1H, dd, J = 11.7, 3.4 Hz), 1.98-2.10 (1H, m), 2.61 (1H, d, J = 11.7 Hz), 2.79 (1H, d, J = 17.0 Hz), 2.86-2.97 (1H, m), 3.04 (1H, d, J = 17.0 Hz), 3.27-3.40 (1H, m), 3.52 (1H, d, J = 11.7 Hz), 3.87-3.96 (1H, m), 4.38-4.53 (3H, m), 5.39 (1H, s), 6.93-6.96 (1H, m), 7.18 (2H, d, J = 4.1 Hz), 7.23 (2H, d, J = 4.1 Hz), 7.55 (1H, s), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.96 (2H, d, J = 8.3 Hz).
147	567 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.22-1.28 (6H, m), 2.02-2.09 (0.5H, m), 2.12-2.23 (0.5H, m), 2.54-2.97 (5H, m), 3.17-3.34 (1H, m), 3.36-3.47 (1H, m), 3.70 (1H, ddd, J = 17.2, 9.3, 5.6 Hz), 3.79-3.92 (1H, m), 4.36-4.56 (2H, m), 4.46-4.49 (0.5H, br m), 4.53-4.56 (0.5H, br m), 6.87 (0.5H, t, J = 5.5 Hz), 7.10-7.20(4.5H, m), 7.75-7.84 (2H, m), 7.84-8.05 (3H, m).
148	641 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.72-2.97 (2H, m), 3.09-3.24 (1H, m), 3.37-3.54 (1H, m), 3.58-3.74 (2H, m), 4.28-4.56 (4H, m), 6.68-6.79 (1H, m), 6.89-6.99 (1H, m), 7.08-7.36 (9H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.7 Hz).

表２５９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
149	492 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.12 (3H, s), 2.30 (1H, td, J = 12.7, 3.5 Hz), 2.74 (1H, dd, J = 13.2, 4.1 Hz), 2.87-3.06 (4H, m), 3.55 (2H, ddd, J = 12.9, 6.9, 1.6 Hz), 3.76 (1H, d, J = 15.1 Hz), 4.22 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.40 (1H, d, J = 4.1 Hz), 4.45 (1H, d, J = 13.2 Hz), 6.63 (1H, br s), 7.12-7.25 (3H, m), 7.32-7.43 (3H, m), 7.73 (2H, d, J = 8.3 Hz).
150	492 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.29 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.12 (3H, s), 2.26-2.38 (1H, m), 2.70-3.07 (5H, m), 3.42-3.59 (2H, m), 3.75 (1H, d, J = 15.1 Hz), 4.22 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.39 (1H, d, J = 3.4 Hz), 4.44 (1H, d, J = 13.6 Hz), 6.64 (1H, br s), 7.05 (1H, dt, J = 6.8, 1.7 Hz), 7.18 (1H, s), 7.25 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.3 Hz).
151	513 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.29 (6.5H, d, J = 6.8 Hz), 1.90 (0.4H, s), 2.12 (2.7H, s), 2.35-2.50 (0.9H, m), 2.81 (0.9H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.95-3.08 (1.3H, m), 3.11-3.26 (1.0H, m), 3.83 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.26 (0.9H, d, J = 12.8 Hz), 4.39-4.56 (3.3H, m), 4.58-4.74 (1.1H, m), 7.27-7.34 (1.0H, m), 7.42 (2.1H, d, J = 8.7 Hz), 7.67 (1.2H, d, J = 7.9 Hz), 7.72-7.82 (3.1H, m).
152	445 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.27 (6.5H, d, J = 7.2 Hz), 1.93 (0.3H, s), 2.12 (2.8H, s), 2.41-2.55 (0.9H, m), 2.85-3.06 (2.2H, m), 3.22-3.32 (1.0H, m), 3.86 (0.9H, d, J = 14.7 Hz), 4.32 (0.9H, d, J = 13.9 Hz), 4.45-4.67 (4.2H, m), 7.15-7.23 (2.1H, m), 7.40 (1.9H, d, J = 8.3 Hz), 7.62-7.71 (1.1H, m), 7.72-7.79 (1.1H, m), 7.83 (1.9H, d, J = 8.7 Hz), 8.50-8.55 (1.0H, m).
153	648 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：2.38-2.58 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 2.96 (6H, s), 3.06-3.26 (1H, m), 3.81 (1H, d, J = 17.3 Hz), 3.93 (1H, d, J = 15.1 Hz), 4.21 (1H, d, J = 15.4 Hz), 4.26-4.55 (3H, m), 4.73 (1H, d, J = 14.7 Hz), 6.55-6.77 (3H, m), 7.02-7.20 (3H, m), 7.46-7.66 (3H, m), 7.80-7.92 (2H, m), 8.41-8.55 (1H, m).

表２６０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
154	648 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 2.33-2.50 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.6, 3.8 Hz), 2.96 (6H, s), 3.06-3.22 (1H, m), 3.72-3.88 (2H, m), 3.95 (1H, d, J = 15.8 Hz), 4.22-4.42 (3H, m), 4.45-4.53 (1H, m), 4.66 (1H, d, J = 13.2 Hz), 6.60-6.66 (1H, m), 6.70 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.07 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.18-7.25 (1H, m), 7.47-7.59 (3H, m), 7.87 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.42-8.53 (2H, m).
155	641 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.6 Hz), 2.88-3.02 (3H, m), 3.42-3.51 (1H, m), 3.66 (2H, s), 3.89-4.03 (2H, m), 4.48 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.53 (2H, d, J = 6.0 Hz), 4.60-4.63 (1H, m), 7.14-7.22 (2H, m), 7.28-7.35 (3H, m), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.42 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.54 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.4 Hz).
156	607 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ : 1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.72-1.81 (4H, m), 2.47-2.58 (4H, m), 2.72-2.85 (2H, m), 2.94-3.02 (1H, m), 3.34-3.44 (1H, m), 3.77-3.91 (2H, m), 4.35 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.53 (2H, d, J = 6.0 Hz), 4.55-4.58 (1H, m), 7.15 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.6 Hz).
157	586 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz) δ : 2.97-4.00 (10H, m), 3.57 (6H, s), 4.08-4.23 (2H, m), 4.49-4.64 (2H, m), 7.18-7.28 (2H, m), 7.50 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.96 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.11-8.18 (2H, m), 8.60-8.76 (1H, m).
158	654 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.36-1.82 (10H, m), 2.40-2.56 (1H, m), 2.62-2.85 (2H, m), 2.89-2.93 (1H, m), 2.95 (6H, s), 3.14 (1H, ddd, J = 13.7, 11.2, 3.7 Hz), 3.63-3.72 (1H, m), 3.78 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.20-4.68 (4H, m), 6.64 (1H, t, J = 5.2 Hz), 6.69 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.05 (2H, d, J = 9.3 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.8 Hz).

表２６１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
159	640 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.56-1.89 (8H, m), 2.49 (1H, td, J = 13.1; 3.8 Hz), 2.62-2.75 (2H, m), 2.86-2.95 (1H, m), 2.95 (6H, s), 3.14 (1H, dt, J = 16.5, 6.2 Hz), 3.76 (1H, t, J = 14.3 Hz), 4.10-4.70 (5H, m), 6.66 (1H, t, J = 6.5 Hz), 6.69 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.05 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.2 Hz).
160	656 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.37-2.59 (5H, m), 2.87-2.93 (1H, m), 2.96 (6H, s), 3.13 (1H, t, J = 11.2 Hz), 3.49-3.82 (7H, m), 4.14-4.77 (5H, m), 6.57 (1H, t, J = 5.1 Hz), 6.69 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.04 (2H, d, J = 9.7 Hz), 7.52 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.88 (2H, d, J = 9.0 Hz).
161	538 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.19 (3H, s), 2.58 (1H, td, J = 13.0, 3.7 Hz), 3.12 (1H, td, J = 13.3, 3.5 Hz), 3.24 (1H, dd, J = 13.5, 4.6 Hz), 3.77 (1H, dt, J = 13.7, 2.4 Hz), 4.38-4.68 (5H, m), 6.98 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.30 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.45 (1H, dd, J = 8.7, 1.7 Hz), 7.49 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.9 Hz), 8.07 (1H, d, J = 8.6 Hz).
162	540 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.76 (6H, t, J = 7.4 Hz), 1.51-1.60 (2H, m), 1.69-1.80 (2H, m), 2.13 (3H, s), 2.36-2.49 (2H, m), 2.78 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 3.18 (1H, ddd, J = 14.4, 11.4, 3.5 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.5, 3.0 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.4, 3.2 Hz), 4.45-4.58 (4H, m), 7.13 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.35 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz).
163	514 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.77 (6H, t, J = 7.4 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.48-1.59 (2H, m), 1.62-1.74 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.27-2.35 (1H, m), 2.35-2.45 (1H, m), 2.82 (1H, dd, J = 13.7, 4.4 Hz), 2.93-3.04 (1H, m), 3.11-3.21 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.37-4.54 (4H, m), 6.89 (1H, br s), 7.11 (4H, s), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz).

表２６２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
164	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.10 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 14.0, 11.4, 2.9 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.5, 4.2 Hz), 3.20 (1H, ddd, J = 14.3, 11.3, 3.4 Hz), 3.94 (1H, dt, J = 14.0, 3.2 Hz), 4.32 (1H, dt, J = 13.6, 3.1 Hz), 4.41-4.59 (4H, m), 7.06 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.29 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.65-7.74 (2H, m), 7.78 (1H, dd, J = 8.8, 1.8 Hz), 7.92-8.02 (3H, m), 8.44 (1H, d, J = 1.5 Hz).
165	548, 550 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.14 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 14.1, 11.5, 3.3 Hz), 2.85 (1H, dd, J = 13.2, 4.0 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.6, 11.2, 3.3 Hz), 3.85 (1H, dt, J = 13.7, 2.9 Hz), 4.34 (1H, dt, J = 14.3, 2.9 Hz), 4.44-4.60 (4H, m), 6.98 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.61 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2H, dd, J = 7.7, 1.1 Hz), 8.00 (1H, t, J = 1.9 Hz).
166	556 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 2.13 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 14.0, 11.1, 3.2 Hz), 2.67 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.9, 4.6 Hz), 3.05 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.17 (1H, ddd, J = 14.6, 11.5, 3.6 Hz), 3.67 (3H, s), 3.82 (1H, dt, J = 14.6, 2.7 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.6, 2.8 Hz), 4.45-4.59 (4H, m), 7.10 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.4 Hz).
167	552 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.23-1.32 (1H, m), 1.41 (4H, t, J = 10.0 Hz), 1.79 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.88 (4H, d, J = 8.6 Hz), 2.13 (3H, s), 2.41 (1H, ddd, J = 14.0, 11.4, 3.3 Hz), 2.56-2.63 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.7, 4.2 Hz), 3.16 (1H, ddd, J = 14.8, 11.6, 3.5 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.6, 2.9 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.2, 3.4 Hz), 4.44-4.58 (4H, m), 7.11 (1H, t, J = 5.6 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.61 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２６３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
168	514 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ：1.71 (1.7H, s), 1.89 (1.3H, s), 2.83-3.87 (4H, m), 3.95-4.66 (5H, m), 7.40 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.54-7.72 (3H, m), 7.80-7.98 (1H, m), 8.10-8.20 (1H, m), 8.21-8.33 (1H, m), 8.63-8.84 (1H, m).
169	516 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ：1.29 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.33 (6.2H, s), 1.91 (0.2H, s), 2.08 (2.7H, s), 2.34-2.44 (0.9H, m), 2.79 (0.9H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.96-3.05 (1.1H, m), 3.12-3.22 (1.0H, m), 3.61 (2.0H, s), 3.78 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.20 (0.9H, d, J = 13.6 Hz), 4.28-4.55 (4.0H, m), 6.96-7.05 (0.9H, m), 7.20 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.32-7.44 (4.0H, m), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
170	625 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ：1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.34 (3H, t, J = 7.2 Hz), 2.81-3.03 (3H, m), 3.35-3.44 (1H, m), 3.87-3.93 (1H, m), 4.04-4.10 (1H, m), 4.32 (2H, q, J = 7.1 Hz), 4.33-4.37 (1H, m), 4.52 (2H, d, J = 6.2 Hz), 4.58-4.61 (1H, m), 7.15 (1H, t, J = 6.3 Hz), 7.33 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.44 (1H, s), 7.56 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.6 Hz).
171	597 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400 MHz) δ：1.26 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.83-3.05 (3H, m), 3.34-3.50 (1H, m), 3.73-3.97 (2H, m), 4.36-4.66 (4H, m), 7.27-7.35 (2H, m), 7.38 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.43-7.65 (3H, m), 7.76 (2H, d, J = 7.9 Hz).
172	588 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ：1.26 (6.0H, d, J = 7.0 Hz), 2.36-2.46 (1.0H, m), 2.70 (1.0H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 2.85-3.05 (1.4H, m), 3.14-3.28 (1.0H, m), 3.51-3.76 (0.9H, m), 3.80-3.95 (2.4H, m), 4.22-4.50 (3.4H, m), 4.65 (1.0H, d, J = 13.9 Hz), 4.98 (0.2H, d, J = 13.4 Hz), 6.73-6.76 (0.9H, br m), 7.09-7.32 (9.0H, m), 7.71-7.81 (2.0H, m), 7.92-7.99 (2.0H, m).

表２６４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
173	584 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.25 (6.0H, d, J = 6.7 Hz), 2.36-2.53 (2.6H, m), 2.60-2.74 (2.2H, m), 2.79-2.95 (2.9H, m), 3.00-3.07 (0.3H, m), 3.15-3.23 (0.7H, m), 3.29-3.37 (0.2H, m), 3.66 (3.0H, s), 3.85 (1.2H, d, J = 14.1 Hz), 4.27-4.38 (2.9H, m), 4.41 (2.9H, d, J = 5.6 Hz), 4.50-4.52 (0.8H, br m), 4.60 (0.9H, d, J = 13.4 Hz), 6.71-6.76 (0.9H, br m), 7.13 (1.9H, d, J = 8.1 Hz), 7.21 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.73-7.78 (0.4H, br m), 7.82 (1.6H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (2.0H, d, J = 8.1 Hz).
174	598 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.25 (6.4H, d, J = 7.0 Hz), 1.78-1.93 (2.1H, m), 2.23-2.45 (4.4H, m), 2.55-2.63 (0.8H, m), 2.81 (0.8H, dd, J = 13.4, 3.9 Hz), 2.91 (1.0H, h, J = 7.0 Hz), 2.96-3.03 (0.2H, m), 3.16-3.26 (1.4H, m), 3.26-3.35 (1.4H, m), 3.65 (3.1H, s), 3.70-3.79 (1.4H, m), 3.80-3.87 (1.4H, m), 4.27-4.43 (3.1H, m), 4.47-4.50 (0.9H, br m), 4.58 (1.1H, d, J = 13.4 Hz), 4.90 (0.2H, d, J = 14.6 Hz), 6.69-6.76 (1.0H, br m), 7.12 (2.0H, d, J = 8.1 Hz), 7.21 (2.0H, t, J = 4.1 Hz), 7.74 (0.3H, d, J = 7.9 Hz), 7.81 (1.6H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
175	589 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.25 (6.0H, d, J = 7.0 Hz), 2.37-2.44 (1.0H, m), 2.80 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 2.88-2.95 (1.0H, m), 3.16-3.28 (1.2H, m), 3.56-3.70 (0.5H, m), 3.71-3.98 (3.0H, m), 4.26-4.33 (0.3H, br m), 4.38-4.47 (0.2H, m), 4.53 (0.9H, s), 4.61 (0.2H, br s), 4.68 (0.9H, d, J = 13.4 Hz), 4.91-4.99 (0.1H, m), 7.69-7.78 (1.7H, m), 7.81 (1.7H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 8.36-8.41 (0.2H, m), 8.43-8.47 (0.8H, m), 8.47-8.51 (1.0H, m).
176	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.16 (3H, s), 2.37-2.40 (1H, m), 2.79-2.96 (2H, m), 3.17-3.20 (1H, m), 3.85 (1H, d, J = 15.2 Hz), 4.26-4.66 (5H, m), 6.70 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.2 Hz).

表２６５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
177	541 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.10 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.39 (1H, dt, J = 18.4, 6.6 Hz), 2.61 (1H, dd, J = 14.2, 3.9 Hz), 2.85-2.96 (1H, m), 3.06-3.22 (3H, m), 3.85 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.07 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.27-4.54 (4H, m), 5.39 (1H, t, J = 5.0 Hz), 6.90 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.4 Hz).
178	589 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.46 (1H, td, J = 13.1, 3.2 Hz), 2.71 (1H, dd, J = 14.3, 3.3 Hz), 2.84-2.95 (1H, m), 3.11 (1H, ddd, J = 15.3, 12.2, 3.0 Hz), 3.92 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.17 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.45-4.62 (4H, m), 6.92-7.02 (2H, m), 7.13-7.22 (4H, m), 7.24-7.33 (4H, m), 7.83 (2H, d, J = 8.6 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.07 (1H, s).
179	555 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.84-3.35 (6H, m), 3.69-3.91 (4H, m), 4.29-4.60 (4H, m), 7.03 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.13-7.21 (4H, m), 7.78 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.2 Hz).
180	597 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.30-2.61 (5H, m), 2.82-3.27 (4H, m), 3.46-3.90 (6H, m), 4.09-4.98 (5H, m), 6.51-6.74 (1H, m), 7.07-7.24 (4H, m), 7.72-8.02 (4H, m).
181	517 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.30 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.16 (3H, s), 2.34-2.43 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.3, 4.1 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 2.99 (3H, s), 3.08-3.17 (1H, m), 3.49 (2H, t, J = 5.7 Hz), 3.77-3.86 (3H, m), 4.21-4.32 (2H, m), 4.37-4.53 (3H, m), 6.77 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.83 (1H, br s), 7.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).
182	556, 558 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.29 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.10 (3H, s), 2.35-2.48 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.93-3.07 (1H, m), 3.08-3.20 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.40-4.52 (4H, m), 7.08-7.19 (2H, m), 7.34-7.44 (3H, m), 7.54 (1H, d, J = 1.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２６６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
183	520 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.11 (3H, s), 2.40 (1H, td, J = 12.6, 3.0 Hz), 2.79-3.06 (3H, m), 3.07-3.21 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.39-4.56 (4H, m), 7.01 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 7.9, 1.5 Hz), 7.16-7.27 (2H, m), 7.40 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.7 Hz).
184	567 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.16 (3H, d, J = 1.1 Hz), 2.84-3.02 (3H, m), 3.38-3.48 (1H, m), 3.78-3.95 (2H, m), 4.37-4.48 (3H, m), 4.58-4.65 (1H, br m), 6.13 (1H, d, J = 1.1 Hz), 6.79 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.12 (4H, d, J = 8.2 Hz), 7.18 (4H, d, J = 8.2 Hz), 7.77 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.4 Hz).
185	569 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 2.01 (3.0H, s), 2.46-2.58 (0.8H, m), 2.82-3.00 (2.0H, m), 3.13-3.30 (0.9H, m), 3.34-3.49 (0.3H, m), 3.56-3.68 (0.3H, m), 3.70-3.81 (0.3H, m), 3.82-3.96 (1.1H, m), 4.21 (1.4H, d, J = 4.1 Hz), 4.32-4.45 (3.4H, m), 4.53-4.56 (1.0H, m), 4.91 (0.2H, d, J = 12.8 Hz), 6.23-6.42 (0.9H, br m), 6.51-6.58 (0.2H, br m), 6.67-6.75 (0.6H, br m), 7.12 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.72-7.84 (2.1H, m), 7.97 (2.0H, d, J = 7.9 Hz).
186	641 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.39 (9.0H, s), 2.34-2.55 (2.3H, m), 2.75-2.98 (3.0H, m), 3.12-3.50 (0.3H, m), 3.57-3.76 (0.9H, m), 3.81-3.90 (1.0H, m), 4.26-4.43 (3.1H, m), 4.46-4.61 (1.9H, m), 4.87-5.07 (0.4H, m), 5.08-5.21 (0.7H, m), 6.60-6.74 (1.0H, m), 7.07-7.18 (2.6H, m), 7.21 (2.6H, d, J = 8.3 Hz), 7.72-7.77 (0.6H, m), 7.81 (1.6H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).

表２６７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
187	570 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.25 (6.4H, d, J = 7.2 Hz), 2.37-2.76 (4.4H, m), 2.79-3.05 (3.0H, m), 3.13-3.25 (0.9H, m), 3.68-3.92 (1.4H, m), 4.24-4.44 (3.0H, m), 4.49-4.62 (2.0H, m), 4.82-4.91 (0.2H, br m), 6.75 (1.0H, t, J = 5.8 Hz), 7.12 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.72-7.75 (0.3H, br m), 7.81 (1.6H, d, J = 8.7 Hz), 7.97 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
188	583 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.25 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 1.83 (0.6H, s), 1.89 (2.7H, s), 2.32-2.56 (2.8H, br m), 2.76-2.98 (3.8H, br m), 3.17-3.27 (1.5H, m), 3.33-3.48 (2.2H, m), 3.55-3.77 (1.9H, m), 3.87 (1.3H, d, J = 13.2 Hz), 4.24-4.43 (4.0H, m), 4.44-4.53 (2.6H, m), 4.95 (0.5H, d, J = 13.9 Hz), 6.12-6.25 (1.5H, br m), 6.50-6.61 (0.5H, br m), 6.68-6.77 (0.9H, br m), 7.08-7.18 (2.7H, m), 7.21 (2.7H, d, J = 7.9 Hz), 7.73 (0.5H, d, J = 8.3 Hz), 7.81 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.93-7.99 (2.6H, m).
189	541 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.21-1.25 (6H, m), 2.38-3.38 (6H, br m), 3.56-3.89 (1H, br m), 4.13-4.58 (3H, br m), 7.01-7.23 (4H, br m), 7.72-8.00 (6H, br m).
190	584 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.25 (6H, d, J = 7.2 Hz), 1.91-1.93 (2H, m), 2.36-2.41 (4H, m), 2.61-2.67 (1H, m), 2.82-2.92 (2H, m), 3.16-3.26 (1H, m), 3.78-3.84 (1H, m), 4.31-4.39 (3H, m), 4.52-4.56 (2H, m), 6.70-6.74 (1H, m), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.73 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2H, d, J = 8.7 Hz).
191	603 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ: 1.21 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.78-2.90 (1H, m), 3.08-3.30 (2H, m), 3.44-3.54 (1H, m), 3.88-4.15 (2H, br m), 4.37 (2H, d, J = 6.0 Hz), 4.68 (2H, br s), 6.89 (1H, br s), 7.05-7.16 (5H, m), 7.28-7.34 (1H, m), 7.50-7.59 (2H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.00 (2H, d, J = 7.9 Hz).

表２６８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
192	488 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.46 (3H, t, J = 6.9 Hz), 2.15 (3H, s), 2.40 (1H, dt, J = 18.5, 6.3 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.1, 4.7 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.7, 11.3, 3.5 Hz), 3.80 (1H, dt, J = 14.6, 2.9 Hz), 4.10 (2H, q, J = 7.1 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.3, 3.1 Hz), 4.39-4.53 (4H, m), 6.90 (1H, t, J = 5.2 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.8 Hz).
193	502 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.07 (3H, t, J = 7.5 Hz), 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.85 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.15 (3H, s), 2.40 (1H, dt, J = 18.1, 6.8 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.86-2.95 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.3, 11.2, 3.0 Hz), 3.80 (1H, dt, J = 14.5, 2.5 Hz), 3.99 (2H, t, J = 6.1 Hz), 4.27 (1H, dt, J = 13.5, 3.0 Hz), 4.37-4.53 (4H, m), 6.90 (1H, t, J = 5.6 Hz), 6.98 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.8 Hz).
194	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.91 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.85-1.94 (1H, m), 2.15 (3H, s), 2.38 (1H, ddd, J = 14.2, 11.3, 3.4 Hz), 2.56 (2H, d, J = 7.1 Hz), 2.79 (1H, dd, J = 12.7, 3.9 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.14 (1H, ddd, J = 14.8, 11.5, 3.7 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 15.1, 3.4 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 14.3, 2.8 Hz), 4.35-4.53 (4H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.31 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
195	578 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (5.8H, d, J = 6.8 Hz), 2.46-2.50 (0.8H, m), 2.88-2.95 (2.0H, m), 3.16-3.27 (1.4H, m), 3.60-4.02 (3.3H, m), 4.27-4.39 (2.7H, m), 4.55-4.59 (1.0H, m), 4.75 (0.7H, d, J = 14.3 Hz), 4.94-4.97 (0.3H, br m), 6.79-6.91 (2.1H, m), 7.13 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.43 (0.3H, br s), 7.51 (0.8H, s), 7.74-7.80 (2.1H, m), 7.97 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).

表２６９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
196	476 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 1.02-1.35 (6.1H, m), 1.58-1.65 (3.1H, m), 1.85-1.99 (2.9H, m), 2.10 (2.1H, s), 2.73-3.14 (3.5H, m), 3.36-3.53 (1.8H, m), 3.83 (0.7H, d, J = 12.4 Hz), 4.11-4.15 (0.9H, m), 4.40-4.43 (2.3H, m), 4.64-4.67 (0.3H, br m), 5.02-5.03 (0.7H, br m), 7.47-7.50 (2.0H, m), 7.66 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 8.58-8.60 (0.7H, br m), 8.77-8.80 (0.3H, br m).
197	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.2H, d, J = 7.2 Hz), 1.88 (0.2H, s), 2.13 (2.8H, s), 2.24-2.39 (1.0H, m), 2.75 (0.9H, dd, J = 13.2, 4.1 Hz), 2.92-3.16 (2.0H, m), 3.74-3.89 (7.1H, m), 4.18-4.51 (4.9H, m), 6.37-6.49 (2.0H, m), 7.10 (1.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.14-7.20 (0.9H, m), 7.38 (1.9H, d, J = 8.3 Hz), 7.74 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
198	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6.2H, d, J = 6.8 Hz), 1.89 (0.3H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.33-2.46 (0.9H, m), 2.80 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.95-3.05 (1.1H, m), 3.09-3.19 (1.0H, m), 3.79 (0.9H, d, J = 13.6 Hz), 3.88 (6.1H, s), 4.26 (0.9H, d, J = 13.2 Hz), 4.32-4.54 (4.0H, m), 6.74-6.87 (3.2H, m), 6.93-7.00 (0.8H, m), 7.40 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
199	599 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.76-1.89 (2H, m), 2.29-2.52 (3H, m), 2.65 (1H, dd, J = 14.2, 3.6 Hz), 2.85-2.96 (1H, m), 3.08-3.34 (3H, m), 3.84 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.05 (1H, d, J = 13.5 Hz), 4.25-4.56 (4H, m), 5.63 (1H, t, J = 5.5 Hz), 6.96 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.12-7.24 (4H, m), 7.81 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.97 (2H, d, J = 9.5 Hz).
200	632 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.44 (1H, dt, J = 18.3, 6.6 Hz), 2.69 (1H, dd, J = 14.6, 3.5 Hz), 2.83-2.95 (7H, m), 3.12 (1H, ddd, J = 15.0, 11.9, 2.7 Hz), 3.90 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.14 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.44-4.53 (3H, m), 4.58 (1H, br s), 6.69 (2H, d, J = 9.0 Hz), 6.94 (1H, t, J = 5.9 Hz), 7.13-7.23 (6H, m), 7.66 (1H, s), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.1 Hz).

表２７０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
201	575 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24-1.27 (6H, m), 2.70-3.33 (4H, m), 3.38-3.55 (1H, m), 3.80-3.99 (1H, m), 4.17-4.53 (4H, br m), 6.63 (1H, t, J = 4.9 Hz), 7.07-7.25 (5H, m), 7.28-7.36 (1H, m), 7.71-7.84 (2H, br m), 7.95 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.67 (2H, d, J = 5.6 Hz).
202	515 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.93 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.54-1.66 (2H, m), 2.16 (3H, s), 2.35-2.44 (1H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.5, 4.2 Hz), 2.93 (3H, s), 2.94-3.04 (1H, m), 3.06-3.17 (1H, m), 3.27 (2H, t, J = 7.4 Hz), 3.80 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.23-4.40 (3H, m), 4.44-4.54 (2H, m), 6.64 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.73 (1H, br s), 7.05 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
203	498 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.80-1.86 (4H, m), 2.15 (3H, s), 2.42 (1H, td, J = 12.2, 3.3 Hz), 2.76-2.94 (6H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.5, 11.4, 3.5 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.4, 2.6 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 13.9, 2.9 Hz), 4.41 (2H, dd, J = 5.2, 4.7 Hz), 4.46-4.53 (2H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.51 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.53 (1H, s).
204	484 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.12-2.20 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.41 (1H, td, J = 12.8, 3.4 Hz), 2.79-3.01 (6H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.4, 11.6, 3.3 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.5, 2.9 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.3, 2.9 Hz), 4.35-4.42 (2H, m), 4.46-4.52 (2H, m), 6.87 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.34 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.61 (1H, dd, J = 7.9, 1.1 Hz), 7.67 (1H, d, J = 0.9 Hz).

表２７１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
205	486 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.96 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.62-1.72 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.38 (1H, ddd, J = 14.2, 11.6, 3.3 Hz), 2.67 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.79 (1H, dd, J = 14.3, 4.4 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.14 (1H, ddd, J = 14.8, 11.7, 3.4 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.3, 2.9 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.1, 3.0 Hz), 4.35-4.43 (2H, m), 4.46-4.53 (2H, m), 6.88 (1H, t, J = 6.2 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.4 Hz).
206	520 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.23 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.45 (1H, ddd, J = 14.1, 11.2, 3.1 Hz), 2.84-2.92 (2H, m), 3.18 (1H, ddd, J = 14.4, 11.1, 3.5 Hz), 3.89 (1H, dt, J = 14.3, 3.0 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 13.8, 3.2 Hz), 4.37-4.44 (2H, m), 4.50-4.56 (2H, m), 6.85 (1H, t, J = 4.7 Hz), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.18 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.43-7.53 (3H, m), 7.61 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.4 Hz).
207	528 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.16 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 15.1, 11.9, 3.6 Hz), 2.83-2.95 (2H, m), 3.18 (1H, ddd, J = 14.6, 11.8, 3.1 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.6, 3.1 Hz), 4.30-4.57 (5H, m), 6.75 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.89 (2H, d, J = 8.8 Hz).
208	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.35 (9H, s), 2.15 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 13.7, 11.2, 3.1 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.2, 4.4 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.15 (1H, ddd, J = 14.7, 11.4, 3.5 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.1, 3.1 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.1, 3.1 Hz), 4.36-4.53 (4H, m), 6.91 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.14 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.55 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz).

表２７２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
209	470 (M-2HCl+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 2.68-2.89 (1H, m), 2.90-3.14 (1H, m), 3.22 (1H, d, J = 12.4 Hz), 3.52-3.73 (2H, m), 3.91 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.15 (2H, d, J = 4.9 Hz), 4.75 (1H, d, J = 3.8 Hz), 4.95 (1H, br s), 7.24 (3H, br s), 7.96 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.05 (2H, d, J = 7.9 Hz), 8.46 (1H, br s), 8.81 (1H, br s), 9.70 (1H, br s).
210	458 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.15 (3H, s), 2.34-2.43 (4H, m), 2.81 (1H, dd, J = 13.1, 3.8 Hz), 2.94-3.03 (1H, m), 3.09-3.16 (1H, m), 3.81 (1H, d, J = 14.4 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.35-4.52 (4H, m), 6.88-6.90 (1H, br m), 7.10 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.15 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.3 Hz).
211	590 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.48 (1H, td, J = 13.2, 3.0 Hz), 2.73 (1H, dd, J = 15.0, 3.3 Hz), 2.83-2.96 (1H, m), 3.11 (1H, ddd, J = 15.2, 12.2, 2.7 Hz), 3.94 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.18 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.43-4.64 (4H, m), 7.00 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.11-7.22 (4H, m), 7.72-7.87 (3H, m), 8.01 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.22-8.33 (2H, m), 8.51 (1H, d, J = 2.4 Hz).
212	612 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.59-1.63 (4H, br m), 2.20-2.44 (4H, m), 2.57-2.61 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.4, 4.0 Hz), 2.86-2.95 (1H, m), 3.18-3.22 (1H, m), 3.64 (3H, s), 3.84 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.37-4.45 (3H, m), 4.57 (2H, d, J = 13.6 Hz), 6.71-6.72 (1H, m), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.73-7.77 (1H, br m), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.3 Hz).
213	598 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.23-2.64 (4H, m), 2.83-2.90 (2H, m), 3.19-3.23 (1H, m), 3.67-3.83 (2H, m), 4.32-4.40 (3H, m), 4.53-4.57 (2H, m), 6.74-6.77 (1H, br m), 7.12 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.73-7.75 (0H, br m), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２７３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
214	474 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.39 (1H, dt, J = 18.5, 6.6 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 14.1, 4.0 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.14 (1H, ddd, J = 14.7, 11.7, 3.3 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 14.5, 2.6 Hz), 3.89 (3H, s), 4.28 (1H, dt, J = 13.3, 2.6 Hz), 4.37-4.53 (4H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.00 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.77 (2H, d, J = 9.0 Hz).
215	516 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.20 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.34 (1H, td, J = 12.7, 3.7 Hz), 2.76 (1H, dd, J = 13.2, 4.0 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.8, 11.7, 3.4 Hz), 3.29-3.37 (1H, m), 3.82 (1H, dt, J = 14.3, 3.0 Hz), 3.92 (3H, s), 4.28 (1H, dt, J = 13.0, 2.8 Hz), 4.36-4.53 (4H, m), 6.90-6.95 (1H, m), 6.92 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.62-7.69 (2H, m).
216	508 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.16 (3H, s), 2.42 (1H, ddd, J = 14.1, 11.4, 3.2 Hz), 2.82-2.96 (2H, m), 3.16 (1H, ddd, J = 14.6, 11.3, 3.3 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 15.3, 2.8 Hz), 3.99 (3H, s), 4.32 (1H, dt, J = 14.0, 3.4 Hz), 4.39-4.55 (4H, m), 6.83 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.73 (1H, dd, J = 8.5, 2.5 Hz), 7.85 (1H, d, J = 2.4 Hz).
217	546 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.22 (3H, s), 2.62 (1H, td, J = 12.7, 3.0 Hz), 2.86-2.96 (1H, m), 3.05 (1H, ddd, J = 15.0, 12.0, 3.2 Hz), 3.15 (1H, dd, J = 13.6, 4.3 Hz), 3.63 (2H, s), 3.64 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.85 (1H, dt, J = 14.2, 2.1 Hz), 4.36 (2H, d, J = 5.7 Hz), 4.46-4.67 (3H, m), 6.83 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.93 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.08 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.48 (1H, dd, J = 8.5, 2.3 Hz), 7.84 (1H, d, J = 2.2 Hz).

表２７４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
218	560 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 14.1, 11.5, 2.9 Hz), 2.62 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.9, 4.6 Hz), 2.85-2.92 (1H, m), 2.95 (2H, t, J = 7.1 Hz), 3.13 (1H, ddd, J = 14.4, 11.5, 3.3 Hz), 3.64 (3H, s), 3.79 (1H, dt, J = 13.4, 2.9 Hz), 3.92 (3H, s), 4.26 (1H, dt, J = 13.2, 2.6 Hz), 4.37-4.52 (4H, m), 6.92 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.95 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.66 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.71 (1H, dd, J = 8.8, 2.4 Hz).
219	578 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.39-2.45 (1H, m), 2.86-2.93 (2H, m), 3.13-3.23 (1H, m), 3.91 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.43-4.48 (4H, m), 4.55-4.58 (1H, br m), 4.75 (1H, d, J = 16.6 Hz), 5.26 (1H, d, J = 16.6 Hz), 6.80-6.83 (1H, br m), 6.89 (1H, s), 7.06 (1H, s), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.22 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.46 (1H, s), 7.82 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz).
220	579 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.39-2.49 (1H, m), 2.87-2.96 (2H, m), 3.19-3.23 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.39-4.43 (3H, m), 4.57-4.61 (2H, m), 5.44 (1H, d, J = 16.2 Hz), 5.53 (1H, d, J = 16.2 Hz), 6.82-6.83 (1H, br m), 7.14 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.23 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, s), 7.71 (1H, s), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz).
221	532 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.22 (3H, s), 2.60 (1H, td, J = 13.2, 2.8 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.05 (1H, ddd, J = 14.5, 12.0, 2.8 Hz), 3.14 (1H, dd, J = 12.8, 4.2 Hz), 3.64 (3H, s), 3.65 (2H, s), 3.82 (1H, dt, J = 13.7, 2.4 Hz), 4.35 (1H, d, J = 2.9 Hz), 4.36 (1H, d, J = 2.6 Hz), 4.46 (1H, dt, J = 13.0, 2.7 Hz), 4.57 (1H, d, J = 3.7 Hz), 4.63 (1H, d, J = 13.7 Hz), 6.84 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.96 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.09 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.19 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.48 (1H, dd, J = 9.0, 2.2 Hz), 7.86 (1H, d, J = 2.0 Hz), 9.50 (1H, br s).

表２７５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
222	546 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.11 (3H, s), 2.49 (1H, ddd, J = 13.7, 10.8, 3.3 Hz), 2.67 (2H, t, J = 6.7 Hz), 2.81-2.99 (4H, m), 3.16 (1H, ddd, J = 14.7, 11.3, 3.4 Hz), 3.76 (1H, dt, J = 14.7, 3.4 Hz), 3.92 (3H, s), 4.13 (1H, dt, J = 13.5, 3.0 Hz), 4.37-4.48 (4H, m), 6.91 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.03 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.19-7.22 (1H, m), 7.20 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.71 (2H, d, J = 7.9 Hz).
223	544 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.29 (6.3H, d, J = 6.8 Hz); 1.58 (8.7H, s), 1.90 (0.3H, s), 2.14 (2.8H, s), 2.33-2.45 (0.9H, m), 2.79 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 2.96-3.05 (1.0H, m), 3.11-3.21 (1.0H, m), 3.66 (3.0H, s), 3.84 (1.0H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (0.9H, d, J = 13.2 Hz), 4.38-4.54 (4.1H, m), 6.91-6.99 (0.9H, m), 7.17 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.32 (2.1H, d, J = 8.7 Hz), 7.40 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
224	488 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.29 (6.2H, d, J = 7.2 Hz), 1.79 (0.8H, t, J = 5.5 Hz), 1.91 (0.2H, s), 2.09 (2.7H, s), 2.34-2.44 (0.9H, m), 2.79 (0.9H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.85 (2.1H, t, J = 6.4 Hz), 2.96-3.05 (1.0H, m), 3.10-3.20 (1.0H, m), 3.72-3.82 (0.9H, m), 3.82-3.92 (2.0H, m), 4.20 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.29-4.55 (3.9H, m), 6.95-7.03 (0.8H, m), 7.15-7.24 (4.1H, m), 7.40 (1.9H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
225	527 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.04-1.24 (6H, m), 2.50-3.80 (6H, m), 3.92-4.87 (6H, m), 6.99-7.16 (4H, br m), 7.52-7.63 (2H, br m), 7.81 (2H, br s), 8.06-8.32 (3H, m).
226	474 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.80 (1H, br s), 2.13 (3H, s), 2.38 (1H, dt, J = 17.3, 6.9 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.9, 4.9 Hz), 2.93-3.20 (2H, m), 3.80 (1H, dt, J = 14.3, 3.3 Hz), 4.24 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.36-4.54 (4H, m), 4.68 (2H, d, J = 4.6 Hz), 6.99 (1H, t, J = 5.1 Hz), 7.22 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.32-7.43 (4H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.4 Hz).

表２７６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
227	490 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.15 (3H, s), 2.37-2.43 (1H, m), 2.48 (3H, s), 2.81 (1H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.96-3.05 (1H, m), 3.10-3.16 (1H, m), 3.82 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.28 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.39-4.48 (4H, m), 6.92 (1H, t, J = 4.1 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.23 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.3 Hz).
228	578 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.40-2.45 (1H, m), 2.85-2.93 (2H, m), 3.15-3.25 (1H, m), 3.89 (1H, d, J = 14.7 Hz), 4.28-4.61 (5H, m), 4.90 (1H, br s), 5.19 (2H, abq, J = 24.9, 16.2 Hz), 6.28-6.29 (1H, br m), 6.77-6.80 (1H, br m), 7.14 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.22 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.44 (1H, s), 7.51 (1H, s), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (2H, d, J = 8.7 Hz).
229	579 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.40-2.48 (1H, m), 2.87-2.96 (2H, m), 3.14-3.24 (1H, m), 3.92 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.38-4.58 (5H, m), 5.16 (1H, d, J = 16.6 Hz), 5.39 (1H, d, J = 16.6 Hz), 6.79-6.81 (1H, br m), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.22 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.93 (1H, s), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.13 (1H, s).
230	579 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.42-2.49 (1H, m), 2.87-2.96 (2H, m), 3.14-3.18 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.42 (4H, dt, J = 21.0, 7.9 Hz), 4.57-4.61 (1H, br m), 4.69 (1H, d, J = 16.6 Hz), 5.52 (1H, d, J = 16.6 Hz), 6.81-6.84 (1H, br m), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.15 (2H, s).

表２７７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
231	530 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.28 (6.3H, d, J = 7.2 Hz), 1.60 (6.0H, s), 1.90 (0.3H, s), 2.11 (2.7H, s), 2.33-2.46 (1.1H, m), 2.79 (1.3H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 2.95-3.04 (1.3H, m), 3.10-3.20 (1.1H, m), 3.80 (0.8H, d, J = 14.7 Hz), 4.22 (0.9H, d, J = 12.8 Hz), 4.34-4.52 (4.0H, m), 7.00-7.08 (0.9H, m), 7.19 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.34-7.43 (4.1H, m), 7.75 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
232	472 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.19-1.32 (9.4H, m), 1.91 (0.2H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.33-2.45 (0.9H, m), 2.64 (2.1H, q, J = 7.5 Hz), 2.81 (0.9H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.95-3.04 (1.0H, m), 3.09-3.18 (0.9H, m), 3.82 (0.9H, d, J = 14.7 Hz), 4.28 (0.9H, d, J = 13.6 Hz), 4.33-4.55 (4.0H, m), 6.85-6.93 (0.9H, m), 7.09-7.22 (4.2H, m), 7.39 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.75 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
233	557 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 1.29 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.54 (6.2H, s), 1.91 (0.3H, s), 2.14 (2.7H, s), 2.30-3.08 (8.8H, br m), 3.12-3.22 (1.3H, m), 3.83 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.27 (0.9H, d, J = 13.9 Hz), 4.39-4.54 (4.0H, m), 6.96-7.04 (0.9H, m), 7.15-7.23 (4.2H, m), 7.42 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.77 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).
234	514 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ: 0.86 (4.1H, d, J = 4.1 Hz), 1.29 (6.3H, d, J = 6.8 Hz), 1.83-1.90 (0.8H, m), 1.91 (0.2H, s), 2.09 (2.7H, s), 2.32-2.45 (0.9H, m), 2.79 (0.9H, dd, J = 13.8, 4.3 Hz), 2.93-3.06 (1.1H, m), 3.10-3.20 (1.0H, m), 3.66 (2.1H, d, J = 5.3 Hz), 3.78 (0.9H, d, J = 13.9 Hz), 4.20 (0.9H, d, J = 12.8 Hz), 4.29-4.53 (4.0H, m), 6.93-7.04 (0.8H, m), 7.18 (2.1H, d, J = 8.3 Hz), 7.34 (2.1H, d, J = 7.9 Hz), 7.41 (1.9H, d, J = 8.7 Hz), 7.76 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).

表２７８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
235	532 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.41 (1H, ddd, J = 14.1, 11.3, 2.9 Hz), 2.81 (1H, dd, J = 13.9, 4.4 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.17 (1H, ddd, J = 14.4, 11.5, 3.3 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.0, 3.3 Hz), 3.92 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.31 (1H, dt, J = 13.3, 2.6 Hz), 4.36-4.54 (4H, m), 6.89 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.09 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.93 (1H, dd, J = 8.0, 2.5 Hz), 8.26 (1H, d, J = 2.2 Hz).
236	502 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.18 (3H, t, J = 7.5 Hz), 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.38 (1H, td, J = 12.6, 3.2 Hz), 2.65 (2H, q, J = 7.5 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.5, 4.4 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.7, 11.6, 3.4 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.4, 2.8 Hz), 3.91 (3H, s), 4.27 (1H, dt, J = 13.1, 2.6 Hz), 4.36-4.53 (4H, m), 6.91 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.59 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.68 (1H, dd, J = 8.9, 2.8 Hz).
237	514 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.91 (9H, s), 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.37 (1H, ddd, J = 14.2, 11.4, 3.2 Hz), 2.58 (2H, s), 2.78 (1H, dd, J = 13.6, 4.7 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.15 (1H, ddd, J = 14.5, 11.5, 3.4 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.8, 3.2 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 13.5, 2.8 Hz), 4.35-4.53 (4H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.29 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.2 Hz).
238	532 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.41 (1H, ddd, J = 13.9, 11.4, 3.2 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.6, 3.9 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.15 (1H, ddd, J = 14.4, 11.5, 3.3 Hz), 3.80 (1H, dt, J = 13.7, 3.0 Hz), 3.83 (3H, s), 4.29 (1H, dt, J = 13.5, 2.5 Hz), 4.35-4.53 (4H, m), 4.71 (2H, s), 6.87 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.01 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.79 (2H, d, J = 9.0 Hz).

表２７９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
239	499 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.41 (1H, ddd, J = 14.2, 11.0, 2.8 Hz), 2.84-2.95 (2H, m), 3.19 (1H, ddd, J = 14.7, 11.1, 3.5 Hz), 3.78 (1H, dt, J = 14.6, 2.8 Hz), 4.05 (3H, s), 4.29-4.59 (5H, m), 6.75 (1H, t, J = 5.1 Hz), 7.08-7.24 (5H, m), 7.99 (1H, dd, J = 8.9, 2.1 Hz), 8.05 (1H, d, J = 2.4 Hz).
240	530 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.37 (9H, s), 2.16 (3H, s), 2.35 (1H, ddd, J = 14.3, 11.6, 3.2 Hz), 2.77 (1H, dd, J = 13.3, 4.3 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.9, 11.6, 3.5 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 14.5, 3.1 Hz), 3.93 (3H, s), 4.29 (1H, dt, J = 13.6, 2.7 Hz), 4.35-4.53 (4H, m), 6.95 (1H, d, J = 8.8 Hz), 6.95 (1H, t, J = 4.4 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.68-7.72 (2H, m).
241	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.45-1.54 (2H, m), 1.66-1.83 (4H, m), 1.98-2.07 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.34 (1H, ddd, J = 14.6, 11.6, 3.4 Hz), 2.77 (1H, dd, J = 13.1, 4.3 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.4, 11.6, 3.2 Hz), 3.31 (1H, ddd, J = 9.6, 7.1, 2.3 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.3, 2.5 Hz), 3.91 (3H, s), 4.27 (1H, dt, J = 13.8, 2.9 Hz), 4.35-4.53 (4H, m), 6.91 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.93 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.13 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.64-7.69 (2H, m).
242	579 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.40-2.46 (1H, m), 2.86-2.93 (2H, m), 3.16-3.20 (1H, m), 3.90 (1H, d, J = 15.8 Hz), 4.42-4.53 (4H, m), 5.45 (1H, d, J = 15.8 Hz), 5.68 (1H, d, J = 16.2 Hz), 6.70-6.74 (1H, br m), 7.15 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.23 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.65 (2H, s), 7.81 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.7 Hz).

表２８０

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
243	603 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.42 (1H, dt, J = 18.2, 6.8 Hz), 2.64 (1H, dd, J = 14.1, 4.2 Hz), 2.85-2.97 (1H, m), 3.12 (1H, ddd, J = 15.3, 11.7, 2.6 Hz), 4.10 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.21-4.54 (7H, m), 5.90 (1H, t, J = 5.3 Hz), 6.89 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.18-7.24 (3H, m), 7.27-7.31 (4H, m), 7.81 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.4 Hz).
244	597 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 6.6 Hz), 2.74-3.11 (3H, m), 3.36-3.92 (3H, m), 4.20-4.70 (4H, m), 6.94-7.20 (4H, br m), 7.63-7.79 (2H, br m), 7.86-8.01 (2H, br m).
245	691 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.22-1.31 (9H, m), 2.40-2.50 (1H, m), 2.70 (1H, dd, J = 14.8, 3.5 Hz), 2.85-2.96 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.91 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.16 (1H, d, J = 13.0 Hz), 4.25 (2H, q, J = 7.0 Hz), 4.44-4.61 (6H, m), 6.84 (2H, d, J = 9.0 Hz), 6.95 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.12-7.24 (6H, m), 7.83 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (1H, s), 8.00 (2H, d, J = 7.9 Hz).
246	663 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 400MHz) δ : 1.20 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.79-2.89 (1H, m), 3.02 (1H, ddd, J = 14.4, 10.2, 2.9 Hz), 3.19 (1H, dd, J = 14.3, 4.2 Hz), 3.64-3.84 (2H, m), 4.03 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.23 (2H, s), 4.39-4.50 (3H, m), 4.59 (1H, br s), 6.85 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.09-7.20 (6H, m), 7.80 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz).
247	472 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.95 (3.2H, t, J = 7.3 Hz), 1.24 (3.3H, t, J = 7.5 Hz), 1.67 (2.2H, td, J = 15.0, 7.4 Hz), 1.92 (0.3H, s), 2.15 (2.7H, s), 2.33-2.42 (0.9H, m), 2.60-2.70 (4.2H, m), 2.79 (0.9H, dd, J = 13.6, 4.5 Hz), 3.08-3.18 (1.0H, m), 3.83 (0.9H, d, J = 14.3 Hz), 4.28 (0.9H, d, J = 13.9 Hz), 4.33-4.55 (4.1H, m), 6.83-6.90 (0.9H, m), 7.08-7.21 (4.2H, m), 7.34 (2.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.74 (2.0H, d, J = 8.3 Hz).

表２８１

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
248	518 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.20 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.82 (3H, s), 2.83-2.91 (2H, m), 3.07-3.15 (1H, m), 3.52-3.61 (2H, m), 3.90 (3H, s), 3.93-4.02 (1H, m), 4.12-4.23 (3H, m), 4.44 (1H, dd, J = 4.4, 2.2 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.20 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.83 (1H, dd, J = 8.8, 1.8 Hz), 7.98 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.04 (1H, t, J = 5.7 Hz), 10.03 (1H, br s).
249	518 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.20 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.83 (3H, s), 2.83-2.91 (1H, m), 2.98-3.11 (2H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 3.87-3.98 (1H, m), 4.18-4.24 (1H, m), 4.20 (2H, d, J = 6.4 Hz), 4.30-4.33 (2H, m), 4.40 (1H, dd, J = 5.0, 2.3 Hz), 6.96 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.12-7.17 (4H, m), 7.67 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.97 (1H, t, J = 5.0 Hz), 10.13 (1H, br s).
250	546 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 13.8, 11.2, 3.2 Hz), 2.80 (1H, dd, J = 13.6, 4.3 Hz), 2.85 (2H, t, J = 6.2 Hz), 2.87-2.94 (1H, m), 3.14 (1H, ddd, J = 14.7, 11.5, 3.2 Hz), 3.75 (3H, s), 3.80 (1H, dt, J = 14.1, 2.9 Hz), 4.25-4.53 (5H, m), 4.32 (2H, t, J = 6.2 Hz), 6.89 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.00 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.8 Hz).
251	460 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.17 (3H, s), 2.40 (1H, ddd, J = 14.2, 11.3, 3.6 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.5, 5.1 Hz), 2.85-2.94 (1H, m), 3.15 (1H, ddd, J = 14.8, 11.7, 3.4 Hz), 3.82 (1H, dt, J = 14.6, 3.1 Hz), 4.23 (1H, dt, J = 14.3, 3.4 Hz), 4.36-4.49 (4H, m), 6.95-7.00 (1H, m), 6.95 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.14 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.88 (1H, br s).

表２８２

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
252	641 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 2.54 (2.8H, t, J = 6.7 Hz), 2.65 (2.0H, t, J = 6.8 Hz), 2.81-2.95 (1.7H, m), 3.17-3.25 (0.8H, m), 3.67 (3.1H, s), 3.85-3.95 (1.0H, m), 4.21-4.23 (1.5H, m), 4.31-4.40 (3.5H, m), 4.49-4.56 (1.0H, m), 6.40-6.54 (1.1H, m), 6.67-6.71 (0.7H, m), 7.12 (2.0H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2.1H, d, J = 8.2 Hz), 7.74-7.82 (2.0H, m), 7.97 (2.0H, d, J = 8.2 Hz).
253	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.28 (6H, d, J = 7.2 Hz), 1.32 (9H, s), 2.15 (3H, s), 2.32-2.45 (1H, m), 2.80 (1H, dd, J = 13.9, 4.5 Hz), 2.93-3.07 (1H, m), 3.08-3.23 (1H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.7 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.34-4.55 (4H, m), 6.89 (1H, br s), 7.15 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.32-7.43 (4H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz).
254	625 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45 (3H, s), 2.89 (1H, h J = 6.8 Hz), 3.01-3.07 (1H, m), 3.15 (1H, dd, J = 13.4, 4.7 Hz), 3.39-3.49 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.88 (2H, d, J = 10.2 Hz), 4.38-4.39 (2H, m), 4.51 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.61-4.64 (1H, br m), 6.75 (1H, t, J = 5.5 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.18 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.99 (2H, d, J = 7.9 Hz).
255	625 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.82-3.02 (3H, m), 3.40-3.46 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.69 (3H, s), 3.85-3.90 (2H, m), 4.41-4.43 (3H, br m), 4.60-4.63 (1H, br m), 6.41 (1H, s), 6.76-6.78 (1H, m), 7.13 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２８３

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
256	691 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.23-1.32 (9H, m), 2.41-2.50 (1H, m), 2.69 (1H, dd, J = 14.3, 3.4 Hz), 2.85-2.95 (1H, m), 3.05-3.15 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.17-4.26 (4H, m), 4.47-4.50 (3H, m), 4.57-4.58 (4H, m), 6.29-6.32 (1H, m), 6.56 (1H, dd, J = 8.3, 1.9 Hz), 6.93 (2H, t, J = 8.5 Hz), 7.03 (1H, t, J = 2.3 Hz), 7.15 (3H, d, J = 9.0 Hz), 7.20 (2H, d, J = 6.2 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.15 (1H, s).
257	580 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (7H, d, J = 7.2 Hz), 2.39-2.53 (1H, m), 2.86-3.01 (0H, m), 3.16-3.22 (1H, m), 3.95 (1H, d, J = 15.1 Hz), 4.38-4.51 (4H, m), 4.60 (1H, s), 5.42 (1H, d, J = 16.6 Hz), 5.72 (1H, d, J = 16.6 Hz), 6.83-6.85 (1H, br m), 7.13 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.23 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.69 (1H, s).
258	537 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (7H, d, J = 7.2 Hz), 2.37-2.47 (1H, m), 2.88-2.96 (2H, m), 3.09-3.19 (1H, m), 3.81 (2H, s), 3.92 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.34-4.42 (4H, m), 4.52-4.55 (1H, br m), 6.75-6.78 (1H, br m), 7.11 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.22 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.3 Hz).
259	611 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.0 Hz), 2.84-3.01 (4H, m), 3.46-3.50 (3H, m), 3.72 (1H, d, J = 13.2 Hz), 3.91 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.38-4.41 (2H, m), 4.49 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.60 (1H, s), 6.28 (1H, s), 6.81-6.85 (1H, br m), 7.09-7.19 (4H, m), 7.76 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.96 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２８４

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
260	663 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 300MHz) δ : 1.23 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.87 (1H, h, J = 6.8 Hz), 3.01-3.11 (1H, m), 3.23 (1H, dd, J = 14.1, 4.3 Hz), 3.70-3.78 (1H, m), 3.84-3.86 (1H, m), 4.10 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.27 (2H, s), 4.44 (2H, s), 4.51 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.62-4.64 (1H, br m), 6.65 (1H, dd, J = 7.9, 4.0 Hz), 6.92 (1H, t, J = 2.1 Hz), 6.99 (1H, d, J = 4.5 Hz), 7.13-7.17 (5H, m), 7.84 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.05 (2H, d, J = 7.9 Hz), 8.55-8.58 (1H, br m).
261	580 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 300MHz) δ : 1.23-1.27 (6.3H, m), 2.79-2.90 (2.1H, m), 3.12-3.17 (0.6H, m), 3.29-3.32 (0.4H, m), 3.55-3.59 (0.7H, m), 3.84-4.08 (5.0H, m), 4.33-4.37 (2.6H, m), 4.63-4.66 (1.2H, m), 4.79-4.83 (0.5H, m), 7.19-7.23 (4.0H, m), 7.78 (0.7H, d, J = 8.3 Hz), 7.87 (1.0H, d, J = 8.3 Hz), 7.97 (0.6H, d, J = 7.5 Hz), 8.07 (1.0H, d, J = 8.3 Hz).
262	527 (M-2HCl+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 300MHz) δ : 2.55-3.54 (9H, m), 3.58-4.28 (6H, m), 4.53-4.69 (2H, m), 7.21 (3H, br s), 7.84-7.99 (4H, m), 8.00-8.22 (4H, m), 8.59-8.83 (1H, m).
263	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.36 (1H, td, J = 12.6, 3.5 Hz), 2.82 (1H, dd, J = 13.5, 4.6 Hz), 2.87-2.94 (1H, m), 3.19 (1H, ddd, J = 14.4, 11.9, 3.4 Hz), 3.85 (1H, dt, J = 14.6, 2.4 Hz), 4.27-4.60 (5H, m), 6.71 (1H, t, J = 5.0 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.04 (1H, d, J = 7.7 Hz), 8.11 (1H, s).
264	512 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.60-1.70 (4H, m), 1.83-1.90 (2H, m), 2.15 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 14.5, 11.5, 3.4 Hz), 2.78-2.94 (6H, m), 3.13 (1H, ddd, J = 14.4, 11.6, 3.3 Hz), 3.83 (1H, dt, J = 14.1, 2.6 Hz), 4.28 (1H, dt, J = 14.0, 3.3 Hz), 4.40 (1H, d, J = 5.7 Hz), 4.42 (1H, d, J = 5.7 Hz), 4.47-4.53 (2H, m), 6.88 (1H, t, J = 5.8 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.22 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.53-7.57 (2H, m).

表２８５

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
265	653 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 400 MHz) δ : 1.23 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.80-2.96 (2H, m), 3.04-3.13 (1H, m), 3.50-3.62 (1H, m), 3.68 (1H, d, J = 12.1 Hz), 4.00 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.10 (1H, d, J = 15.0 Hz), 4.19 (1H, d, J = 11.9 Hz), 4.42-4.56 (2H, m), 7.11 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.16 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39-7.50 (3H, m), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.89 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.94 (2H, d, J = 8.4 Hz).
266	618 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.32-2.47 (1H, m), 2.72 (1H, dd, J = 12.7, 4.7 Hz), 2.84-2.97 (1H, m), 3.14-3.28 (1H, m), 3.48-3.93 (6H, m), 4.21-5.02 (5H, m), 6.71-6.86 (3H, m), 6.99-7.24 (6H, m), 7.69-8.04 (4H, m).
267	618 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.44-2.56 (1H, m), 2.77-3.33 (3H, m), 3.52-4.04 (6H, m), 4.14-5.00 (5H, m), 6.65-6.92 (3H, m), 7.06-7.25 (6H, m), 7.71-8.05 (4H, m).
268	618 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.34-2.47 (1H, m), 2.65-2.76 (1H, m), 2.85-2.99 (1H, m), 3.16-3.29 (1H, m), 3.69-3.97 (6H, m), 4.34-4.68 (5H, m), 6.64-6.82 (4H, m), 7.10-7.25 (5H, m), 7.70-8.00 (4H, m).
269	623 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.49-2.56 (1H, m), 2.75 (1H, dd, J = 14.3, 3.5 Hz), 2.87-2.93 (1H, m), 3.15-3.22 (1H, m), 3.94 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.13 (1H, d, J = 11.7 Hz), 4.41-4.60 (4H, m), 6.84-6.87 (1H, br m), 6.95 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.16-7.21 (5H, m), 7.33 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.89 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (3H, t, J = 8.5 Hz).
270	623 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.45 (1H, td, J = 13.2, 3.2 Hz), 2.70 (1H, dd, J = 14.6, 3.3 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 3.06-3.14 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 14.8 Hz), 4.17 (1H, d, J = 13.7 Hz), 4.47-4.50 (3H, m), 4.59 (1H, s), 6.95-6.98 (2H, m), 7.14-7.22 (6H, m), 7.38 (1H, s), 7.84 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.21 (1H, s).

表２８６

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
271	623 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45 (1H, td, J = 13.0, 2.9 Hz), 2.70 (1H, dd, J = 14.6, 3.3 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 3.06-3.14 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 14.6 Hz), 4.17 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.46-4.51 (3H, m), 4.59 (1H, s), 6.96 (1H, t, J = 5.2 Hz), 7.10-7.25 (8H, m), 7.83 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.16 (1H, s).
272	619 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.56 (1H, td, J = 12.7, 3.2 Hz), 2.77 (1H, dd, J = 13.8, 3.2 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 3.16-3.23 (1H, m), 3.88-3.92 (4H, m), 4.08 (1H, d, J = 11.9 Hz), 4.46 (2H, d, J = 5.5 Hz), 4.54-4.58 (2H, m), 6.84-6.97 (4H, m), 7.15-7.20 (4H, m), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.87 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.94 (1H, s), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz).
273	619 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45 (1H, td, J = 13.2, 3.1 Hz), 2.70 (1H, dd, J = 14.4, 3.4 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 3.06-3.15 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.92 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.16 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.47-4.52 (3H, m), 4.59 (1H, s), 6.56 (1H, d, J = 8.2 Hz), 6.85 (1H, d, J = 7.9 Hz), 6.94 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.02 (1H, t, J = 2.2 Hz), 7.13-7.21 (5H, m), 7.83 (2H, d, J = 8.4 Hz), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz), 8.09 (1H, s).
274	627 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 2.52-2.65 (4.8H, m), 2.87-2.99 (1.9H, m), 3.24-3.32 (0.7H, m), 3.84 (1.0H, d, J = 13.7 Hz), 3.95-3.97 (0.3H, m), 4.21 (1.6H, d, J = 3.3 Hz), 4.29-4.37 (3.7H, m), 4.55-4.60 (1.0H, m), 4.89 (0.2H, d, J = 13.9 Hz), 6.73-6.79 (1.0H, br m), 6.96-7.02 (0.8H, br m), 7.12 (2.0H, d, J = 7.7 Hz), 7.21 (2.1H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2.0H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (2.0H, d, J = 8.2 Hz).

表２８７

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
275	647 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.45-2.49 (1H, m), 2.71 (1H, dd, J = 14.7, 3.4 Hz), 2.89 (1H, t, J = 7.0 Hz), 3.06-3.17 (1H, m), 3.90-3.94 (4H, m), 4.18 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.49-4.52 (3H, m), 4.60 (1H, br s), 6.96 (1H, t, J = 6.0 Hz), 7.16 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.54 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.68 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.93-7.93 (1H, br m), 8.01 (2H, d, J = 8.7 Hz), 8.24 (1H, s).
276	647 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.45-2.49 (1H, m), 2.71 (1H, dd, J = 14.7, 3.4 Hz), 2.90 (1H, h, J = 7.2 Hz), 3.05-3.15 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.95 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.18 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.49-4.52 (3H, m), 4.60 (1H, s), 6.97 (1H, t, J = 5.3 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.37 (2H, d, J = 4.3 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.94 (2H, d, J = 6.4 Hz), 8.01 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.47 (1H, br s).
277	619 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45 (1H, dt, J = 18.1, 6.5 Hz), 2.70 (1H, dd, J = 14.8, 3.5 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.07-3.15 (1H, m), 3.76 (3H, s), 3.91 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.16 (1H, d, J = 12.4 Hz), 4.47-4.52 (3H, m), 4.58 (1H, s), 6.82 (2H, d, J = 9.0 Hz), 6.94 (1H, t, J = 5.4 Hz), 7.14-7.22 (6H, m), 7.82-7.84 (3H, m), 8.00 (2H, d, J = 8.2 Hz).
278	580 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.26 (6H, d, J = 7.2 Hz), 2.43-2.46 (1H, m), 2.91-2.95 (2H, m), 3.12-3.22 (1H, m), 3.93 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.43-4.54 (5H, m), 5.59-5.65 (1H, m), 6.01 (1H, d, J = 16.2 Hz), 6.76 (1H, br s), 7.15 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.23 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.99 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.54 (1H, s).
279	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.45-2.49 (1H, m), 2.88-2.92 (2H, m), 3.21-3.34 (4H, m), 3.83-3.88 (1H, m), 4.22-4.45 (6H, m), 6.75 (1H, br s), 7.12 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.98 (2H, d, J = 8.3 Hz).

表２８８

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
280	484 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 0.66-0.71 (2H, m), 0.92-0.99 (2H, m), 1.28 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.84-1.93 (1H, m), 2.15 (3H, s), 2.35-2.44 (1H, m), 2.77-2.84 (1H, m), 2.94-3.05 (1H, m), 3.08-3.17 (1H, m), 3.81 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.28 (5H, d, J = 13.9 Hz), 4.32-4.53 (4H, m), 6.86 (1H, br s), 7.04 (4H, d, J = 8.4 Hz), 7.09 (4H, d, J = 8.4 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.75 (2H, d, J = 8.4 Hz).
281	665 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.96 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.21-1.32 (9H, m), 1.68 (2H, td, J = 15.0, 7.4 Hz), 2.39-2.48 (1H, m), 2.63-2.70 (3H, m), 2.85-2.94 (1H, m), 2.99-3.11 (1H, m), 3.91 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.08 (1H, d, J = 12.8 Hz), 4.25 (2H, q, J = 7.2 Hz), 4.37-4.50 (3H, m), 4.54-4.60 (3H, m), 6.51-6.59 (1H, m), 6.87-6.94 (1H, m), 7.03-7.08 (2H, m), 7.12-7.21 (5H, m), 7.36 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.19 (1H, s).
282	637 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.94 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.22 (6H, d, J = 7.2 Hz), 1.66 (2H, td, J = 14.6, 6.9 Hz), 2.16-2.30 (1H, m), 2.53 (1H, d, J = 14.3 Hz), 2.65 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.80-2.92 (1H, m), 2.94-3.07 (1H, m), 3.66 (1H, d, J = 14.7 Hz), 3.77 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.25-4.58 (6H, m), 6.47 (1H, d, J = 7.9 Hz), 6.68 (1H, d, J = 8.3 Hz), 6.93 (1H, s), 7.01-7.17 (5H, m), 7.28-7.35 (3H, m), 7.70 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.12 (1H, s).
283	522 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 7.1 Hz), 2.15 (3H, s), 2.53 (1H, ddd, J = 14.1, 10.8, 3.6 Hz), 2.73 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 2.96 (1H, dd, J = 14.2, 5.2 Hz), 3.17 (2H, t, J = 6.7 Hz), 3.18-3.25 (1H, m), 3.83 (1H, dt, J = 14.3, 2.9 Hz), 4.20 (1H, dt, J = 13.7, 3.0 Hz), 4.37-4.50 (4H, m), 6.88 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.91 (1H, t, J = 4.6 Hz), 7.14 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.47 (1H, d, J = 3.3 Hz), 11.25 (1H, br s).

表２８９

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
284	542 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.39 (1H, ddd, J = 13.7, 11.0, 3.1 Hz), 2.83 (1H, dd, J = 13.2, 4.2 Hz), 2.86-2.94 (1H, m), 3.15 (1H, ddd, J = 14.7, 11.5, 3.5 Hz), 3.81 (1H, dt, J = 13.8, 2.9 Hz), 4.31 (1H, dt, J = 13.7, 2.9 Hz), 4.37-4.55 (6H, m), 6.82 (1H, t, J = 4.9 Hz), 7.05 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.8 Hz).
285	633 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 300MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.80-2.89 (1H, h, J = 6.8 Hz), 3.03-3.13 (1H, m), 3.25 (1H, dd, J = 14.1, 4.3 Hz), 3.71-3.77 (1H, m), 3.85-3.90 (1H, m), 4.13 (1H, d, J = 13.9 Hz), 4.25 (2H, d, J = 3.4 Hz), 4.54 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.65 (1H, br s), 7.10 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.43 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.85 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.94 (2H, d, J = 6.8 Hz), 8.06 (2H, d, J = 7.9 Hz).
286	633 (M+H).	1H-NMR (CD_3OD, 300MHz) δ : 1.21 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.84 (1H, h, J = 6.8 Hz), 3.04-3.13 (1H, m), 3.26 (1H, dd, J = 14.1, 4.3 Hz), 3.73-3.78 (1H, m), 3.86-3.88 (1H, m), 4.13 (1H, d, J = 13.6 Hz), 4.26 (2H, d, J = 3.0 Hz), 4.53 (1H, d, J = 14.7 Hz), 4.63-4.64 (1H, br m), 7.10 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.16 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.60 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.85 (2H, d, J = 8.3 Hz), 8.00 (1H, t, J = 1.9 Hz), 8.05 (2H, d, J = 8.3 Hz).
287	492 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 300MHz) δ : 0.99 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.65-1.78 (2H, m), 2.17 (3H, s), 2.57 (1H, ddd, J = 13.9, 11.3, 3.2 Hz), 2.82 (2H, t, J = 7.5 Hz), 2.91 (1H, dd, J = 13.9, 6.8 Hz), 2.96 (1H, dd, J = 13.6, 4.1 Hz), 3.19 (1H, ddd, J = 14.7, 11.3, 3.4 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.4, 3.1 Hz), 4.29 (1H, dt, J = 13.7, 2.9 Hz), 4.42 (1H, d, J = 5.3 Hz), 4.43 (1H, d, J = 5.3 Hz), 4.47-4.57 (2H, m), 6.81 (1H, d, J = 3.8 Hz), 6.87 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.14 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.21 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.48 (1H, d, J = 3.8 Hz).

表2-90

実施例番号	MS ESI m/e:	NMR
288	542 (M+H).	1H-NMR (DMSO-d_6, 400MHz, 120℃) δ : 1.19 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.81 (3H, s), 2.76-3.20 (3H, m), 3.56-3.68 (2H, m), 3.96-4.26 (2H, m), 4.04 (3H, s), 4.10 (1H, d, J = 5.5 Hz), 4.12 (1H, d, J = 6.0 Hz), 4.48 (1H, dd, J = 5.0, 2.3 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.37 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.94 (1H, dd, J = 8.8, 2.4 Hz), 8.08 (1H, t, J = 5.2 Hz), 8.42 (1H, d, J = 2.4 Hz), 12.05 (1H, br s).
289	508 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.24 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (3H, s), 2.61 (1H, ddd, J = 13.6, 10.6, 3.3 Hz), 2.86-2.93 (1H, m), 2.98 (1H, dd, J = 14.0, 4.3 Hz), 3.21 (1H, ddd, J = 14.9, 11.6, 3.5 Hz), 3.84 (1H, dt, J = 14.8, 3.3 Hz), 3.89 (2H, s), 4.20 (1H, dt, J = 13.7, 2.9 Hz), 4.39-4.52 (4H, m), 6.92 (1H, t, J = 5.5 Hz), 6.95 (1H, d, J = 3.7 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20 (2H, d, J = 8.2 Hz); 7.49 (1H, d, J = 3.1 Hz), 10.15 (1H, br s).
290	570 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.18 (6.0H, d, J = 6.8 Hz), 1.25-1.33 (3.1H, m), 2.54-2.62 (0.7H, m), 2.80-2.88 (1.0H, m), 2.92-3.01 (1.0H, m), 3.15-3.22 (1.0H, m), 3.36-3.44 (0.3H, m), 3.66-3.73 (0.5H, m), 3.81 (0.7H, d, J = 14.8 Hz), 4.14-4.40 (5.5H, m), 4.56 (1.0H, d, J = 14.1 Hz), 4.80 (0.3H, d, J = 13.9 Hz), 6.35-6.39 (0.2H, br m), 6.57-6.62 (0.7H, br m), 7.05-7.09 (1.9H, m), 7.14 (2.0H, d, J = 8.2 Hz), 7.67-7.75 (1.9H, m), 7.88-7.92 (2.1H, m).
291	500 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.22-1.31 (12H, m), 2.15 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.39 (1H, dt, J = 17.7, 6.4 Hz), 2.76-3.19 (5H, m), 3.82 (1H, d, J = 14.1 Hz), 4.24-4.56 (5H, m), 6.72 (1H, s), 7.02-7.10 (3H, m), 7.38 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.6 Hz).
292	504 (M+H).	1H-NMR ($CDCl_3$, 400MHz) δ : 1.21-1.31 (12H, m), 2.12 (3H, s), 2.34-2.45 (1H, m), 2.77-3.18 (4H, m), 3.83 (1H, d, J = 14.3 Hz), 4.29 (1H, d, J = 13.2 Hz), 4.38-4.54 (4H, m), 6.85-7.00 (3H, m), 7.14 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.6 Hz).