

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】令和6年10月2日(2024.10.2)

【国際公開番号】WO2022/051583  
 【公表番号】特表2023-540350(P2023-540350A)  
 【公表日】令和5年9月22日(2023.9.22)  
 【年通号数】公開公報(特許)2023-179  
 【出願番号】特願2023-515095(P2023-515095)  
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 9 8 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 8 7 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 3 5 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 0 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 9 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 1 9 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4                    C S P  
 C 0 7 D 4 9 8 / 0 4  
 C 0 7 D 4 9 8 / 1 4  
 C 0 7 D 4 8 7 / 0 4  
 C 0 7 D 4 8 7 / 1 2  
 A 6 1 K 3 1 / 4 3 5 3  
 A 6 1 K 3 1 / 4 0 7  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0    1 1 1  
 A 6 1 P 2 5 / 0 0  
 A 6 1 P 2 5 / 1 8  
 A 6 1 P 1 1 / 0 0  
 A 6 1 P 9 / 0 4  
 A 6 1 P 1 9 / 1 0

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年9月2日(2024.9.2)

40

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

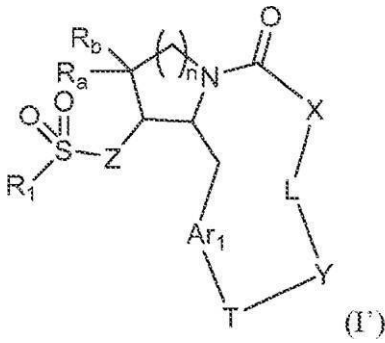
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1')の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

50



10

式中、

Xは、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_3-C_8シクロアルキル$ 、 $C_6-C_{10}$ アリール、 $3\sim 8$ 員ヘテロシクロアルキル、または $5\sim 10$ 員ヘテロアリールであり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_3-C_8シクロアルキル$ 、 $C_6-C_{10}$ アリール、 $3\sim 8$ 員ヘテロシクロアルキル、または $5\sim 10$ 員ヘテロアリールは、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6$ ハロアルキル、または $C_1-C_6$ アルコキシで置換されていてもよく；

Lは、存在しないか、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-NH)_{n1}-$ 、 $-(NH-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-NH)_{n1}-$ 、または $-(NH-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ であり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-NH)_{n1}-$ 、 $-(NH-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-NH)_{n1}-$ 、または $-(NH-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ は、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、または $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ で置換されていてもよく； $n1$ は、 $1\sim 6$ の範囲の整数であり；

20

Yは、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、または $C_2-C_6アルケニル$ であり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、または $C_2-C_6アルケニル$ は、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6$ ハロアルキル、または $C_1-C_6$ アルコキシで置換されていてもよく；

30

$n$ は、 $0\sim 3$ の範囲の整数であり；

$R_a$ および $R_b$ は、それぞれ独立してH、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、もしくは $C_2-C_6アルキニル$ であり、ここで $-O(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、もしくは $C_2-C_6アルキニル$ は、1つもしくは複数の $R_s$ で置換されていてもよい；または $R_a$ および $R_b$ は、それらが結合する原子と一緒に、 $C_3-C_7シクロアルキル$ もしくは $3\sim 7$ 員ヘテロシクロアルキルを形成し、ここで $C_3-C_7シクロアルキル$ もしくは $3\sim 7$ 員ヘテロシクロアルキルは、1つもしくは複数の $R_s$ で置換されていてもよく；

40

各 $R_s$ は、独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-O(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $C_2-C_6アルキニル$ 、または $C_1-C_6$ ハロアルキルであり；

Zは、 $-O-$ または $-NR_Z-$ であり；ここで $R_Z$ は、Hまたは $C_1-C_6アルキル$ であり；

$R_1$ は、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $-SH$ 、 $-S(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-S(C_6-C_{10}アリール)$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $C_2-C_6アルキニル$ 、 $C_1-C_6$ ハロアルキル、 $C_1-C_6$ アルコキシ、 $C_6-C_{10}$ アリール、 $5\sim 10$ 員ヘテロアリール、 $C_3-C_7シクロアルキル$ 、 $3\sim 7$ 員ヘテロシクロアルキル、 $-O-(C_6-C_{10}アリール)$ 、 $-O-(5\sim 10$ 員ヘテロアリール)、 $-O-(C_3-C_{10}シクロアルキル)$ 、 $-O-(3\sim 7$ 員ヘテロシクロアルキル)、 $-NH-(C_6-C_{10}アリール)$ 、 $-NH-(5\sim 10$ 員ヘテロアリール)、 $-NH-(C_3-C_1$

50

0シクロアルキル)、または-NH-(3~7員ヘテロシクロアルキル)であり、ここで-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-S(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーール)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーール、5~10員ヘテロアリーール、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、3~7員ヘテロシクロアルキル、-O-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーール)、-O-(5~10員ヘテロアリーール)、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、-O-(3~7員ヘテロシクロアルキル)、-NH-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーール)、-NH-(5~10員ヘテロアリーール)、-NH-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、または-NH-(3~7員ヘテロシクロアルキル)は、1つまたは複数のR<sub>1s</sub>で置換されていてもよく;

各R<sub>1s</sub>は、独立してオキソ、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-S(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、または3~7員ヘテロシクロアルキルであり;

Ar<sub>1</sub>は、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーールまたは5~10員ヘテロアリーールであり、ここでC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーールまたは5~10員ヘテロアリーールは、1つまたは複数のR<sub>A1</sub>で置換されていてもよく;

各R<sub>A1</sub>は、独立してAr<sub>2</sub>、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり;

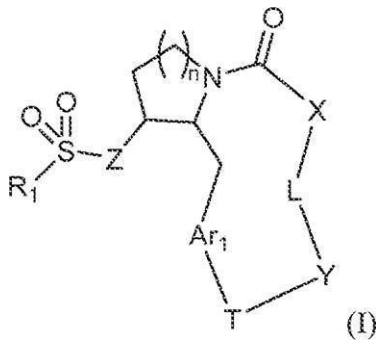
Tは、存在しないかまたはAr<sub>2</sub>であり;

各Ar<sub>2</sub>は、独立してC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーールまたは5~10員ヘテロアリーールであり、ここでC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリーールまたは5~10員ヘテロアリーールは、1つまたは複数のR<sub>A2</sub>で置換されていてもよく;

各R<sub>A2</sub>は、独立してハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルである。

【請求項2】

式(1)の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、請求項1記載の化合物:



30

【請求項3】

Xが-O-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

【請求項4】

Xが、-NH-または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-であり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-が、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

40

【請求項5】

Xが、-NH-または-N(CH<sub>3</sub>)-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

【請求項6】

Xが、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

50

## 【請求項 7】

Xが、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよいアゼチジニルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 8】

Lが存在しない、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 9】

Lが、-O-、-NH-、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-、-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-NH)<sub>n1</sub>-、または-(NH-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-であり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-、-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-NH)<sub>n1</sub>-、または-(NH-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-が、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

10

## 【請求項 10】

Lが-O-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 11】

Lが、-NH-または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-であり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-が、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

20

## 【請求項 12】

Lが、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルであり、ここでC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルが、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 13】

Lが、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-または-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-であり、ここで-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-または-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-が、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

30

## 【請求項 14】

Lが、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-または-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-であり、ここで-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-または-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-が、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよい、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 15】

n1が、1～3の範囲の整数である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

40

## 【請求項 16】

Yが-O-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 17】

Yが-NH-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 18】

Yが、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 19】

nが1である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

50

## 【請求項 20】

$n$ が2である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 21】

$R_a$ および $R_b$ が、それぞれ独立してHもしくはハロゲンであるか；または $R_a$ および $R_b$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、1つもしくは複数の $R_S$ で置換されていてもよい $C_3$ - $C_7$ シクロアルキルを形成する、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 22】

$R_a$ および $R_b$ のうちの1つがHであり、 $R_a$ および $R_b$ のうちの1つがハロゲンである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 23】

$R_a$ および $R_b$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成する、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 24】

Zが-O-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 25】

Zが-NH-である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 26】

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_1$ - $C_6$ アルキルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 27】

$R_1$ が、メチルまたはエチルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 28】

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_3$ - $C_7$ シクロアルキルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 29】

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよいシクロプロピルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 30】

少なくとも1つの $R_{1S}$ がハロゲンである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 31】

$Ar_1$ が、1つまたは複数の $R_{A1}$ で置換されていてもよい $C_6$ - $C_{10}$ アリアルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 32】

$Ar_1$ が、1つまたは複数の $R_{A1}$ で置換されていてもよい5~10員ヘテロアリアルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 33】

少なくとも1つの $R_{A1}$ が $Ar_2$ である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 34】

少なくとも1つの $R_{A1}$ が、1つまたは複数の $R_{A2}$ で置換されていてもよい $C_6$ - $C_{10}$ アリアルである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 35】

少なくとも1つの $R_{A1}$ がハロゲンである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 36】

Tが存在しない、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 37】

Tが $Ar_2$ である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 38】

少なくとも1つの $R_{A1}$ が $Ar_2$ であり、Tが存在しない、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 39】

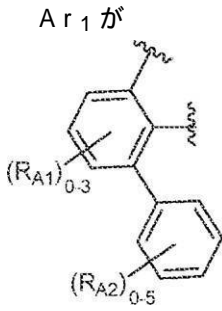
10

20

30

40

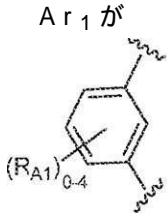
50



であり、Tが存在しない、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

10

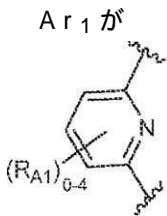
【請求項40】



であり、TがAr<sub>2</sub>である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

20

【請求項41】



であり、TがAr<sub>2</sub>である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

【請求項42】

少なくとも1つのAr<sub>2</sub>が、1つまたは複数のRA<sub>2</sub>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

30

【請求項43】

少なくとも1つのAr<sub>2</sub>が、1つまたは複数のRA<sub>2</sub>で置換されていてもよい5~10員ヘテロアリールである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

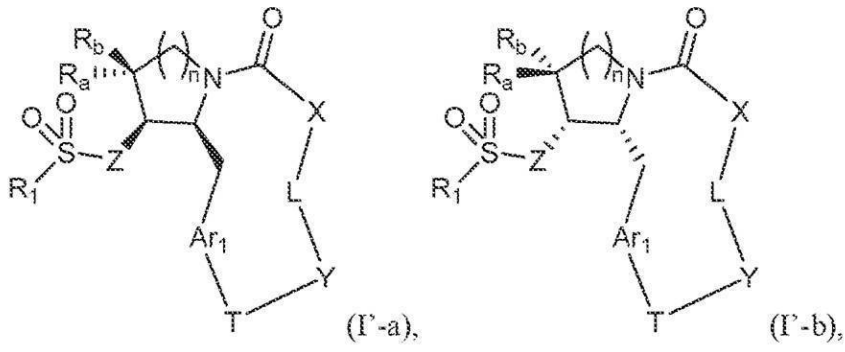
【請求項44】

少なくとも1つのRA<sub>2</sub>がハロゲンである、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

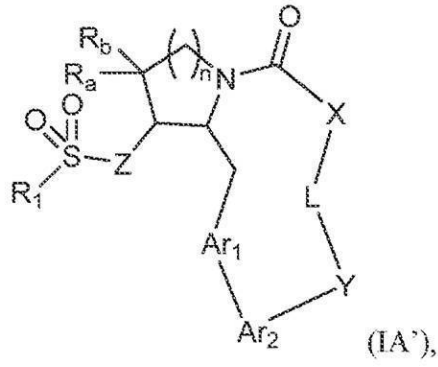
【請求項45】

式(I'-a)、(I'-b)、(IA')、(IA'-a)、(IA'-b)、(IB')、(IB'-a)、(IB'-b)、(II')、(II'-a)、(II'-b)、(IIA')、(IIA'-a)、(IIA'-b)、(IIB')、(IIB'-a)、(IIB'-b)、(IIIA')、(IIIA'-a)、(IIIA'-b)、(IIIB')、(IIIB'-a)、もしくは(IIIB'-b)、(IVA')、(IVA'-a)、(IVA'-b)、(VA')、(VA'-a)、もしくは(VA'-b)の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物：

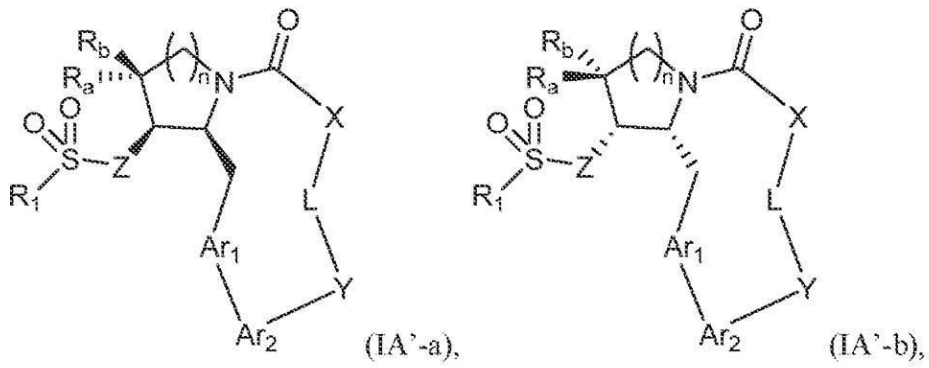
40



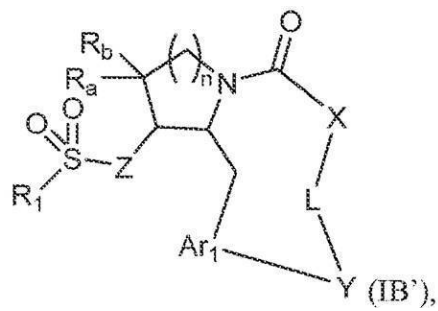
10



20

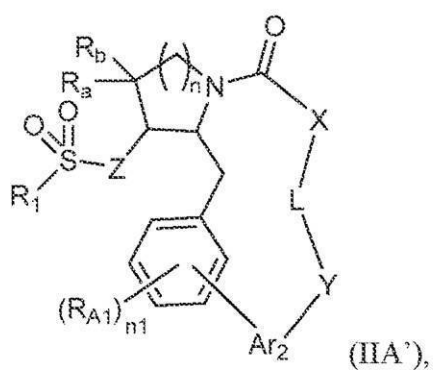
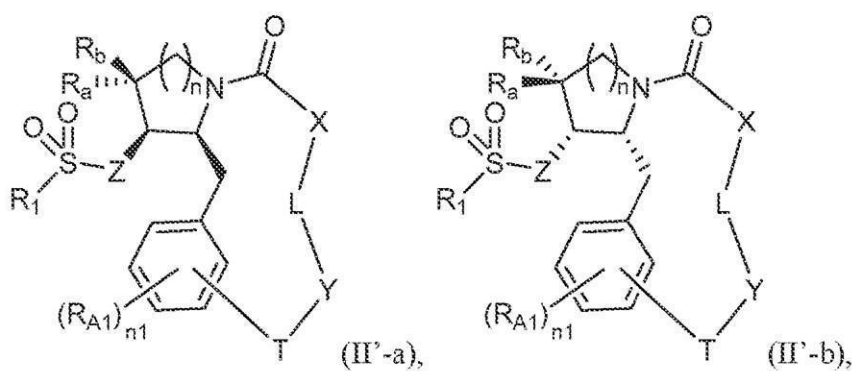
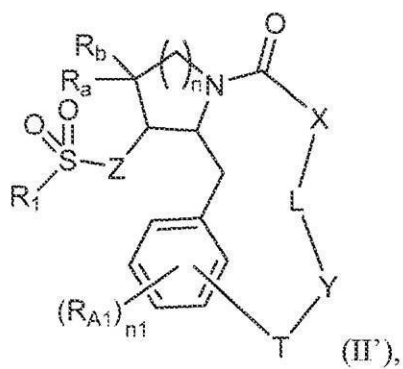
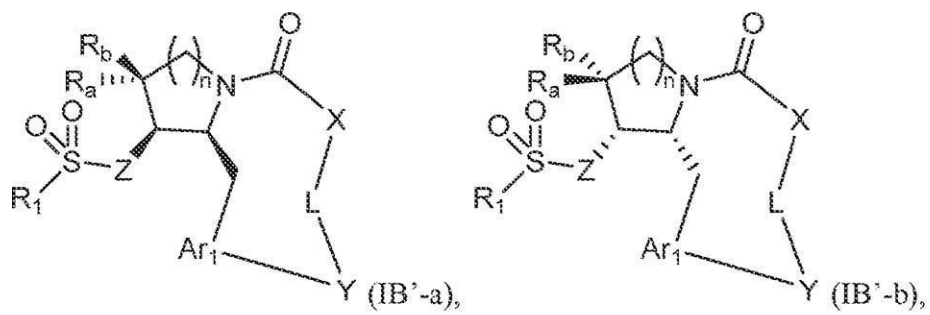


30



40

50



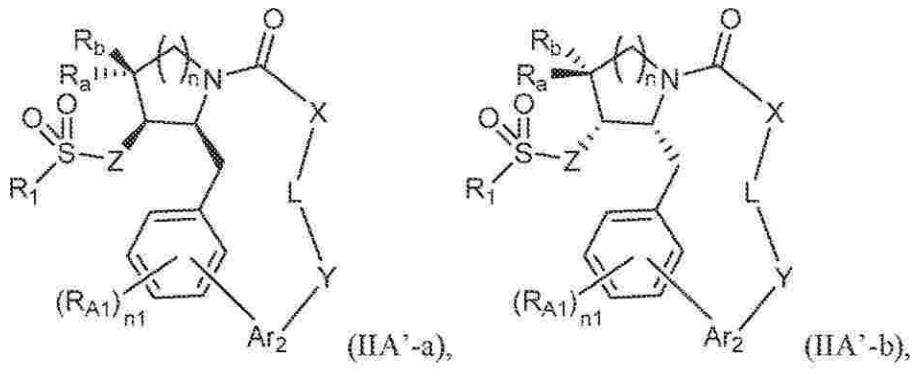
10

20

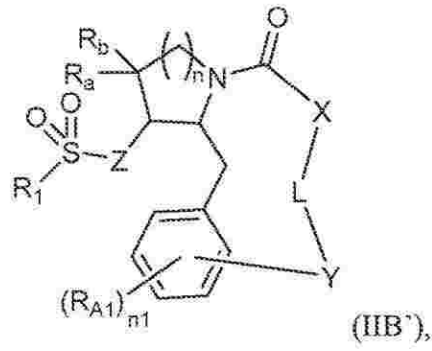
30

40

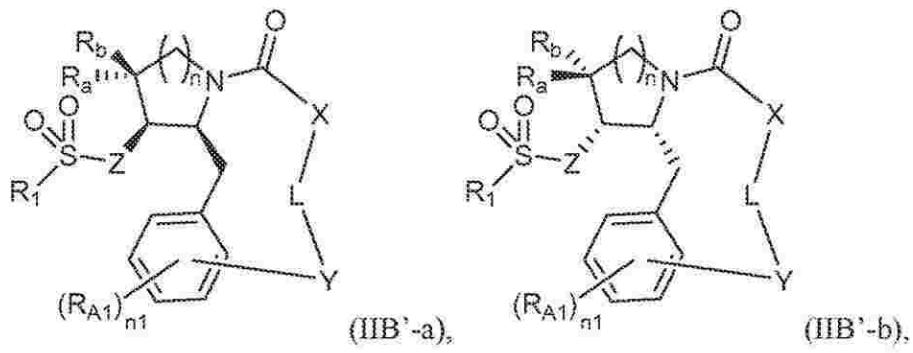
50



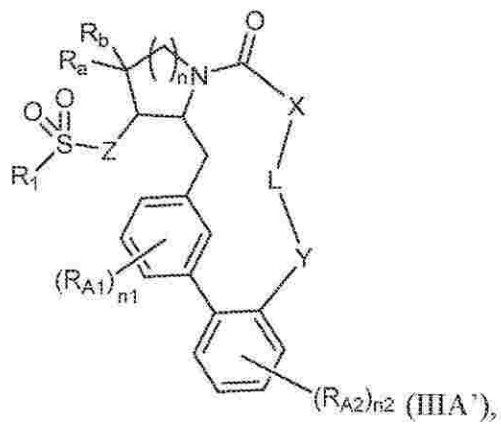
10



20

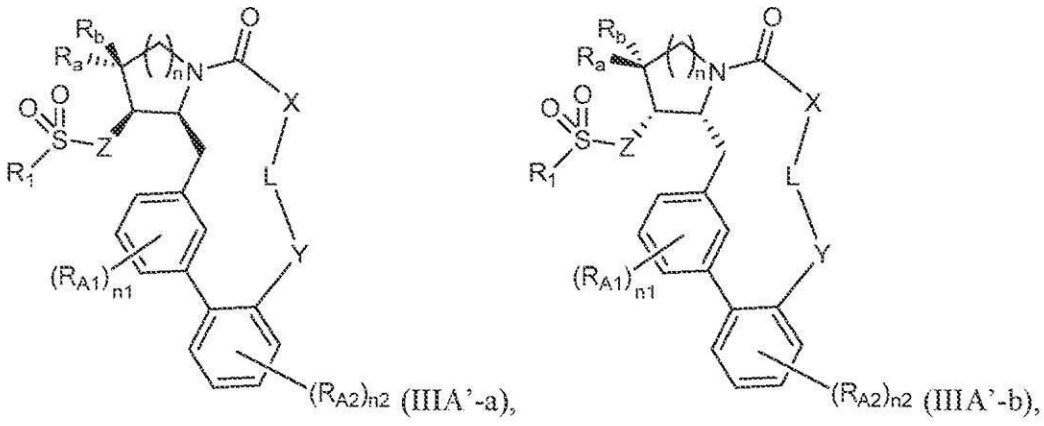


30

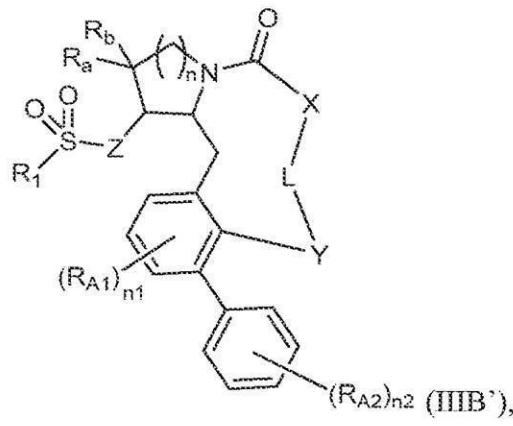


40

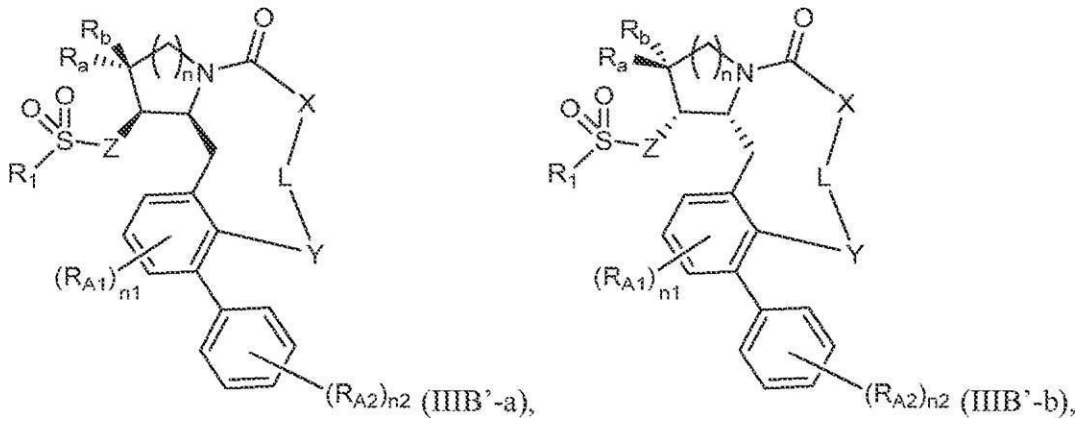
50



10



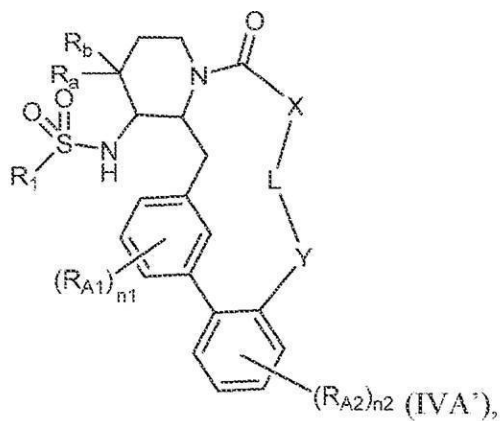
20



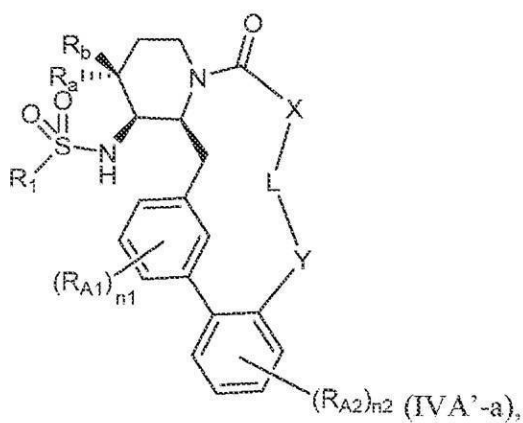
30

40

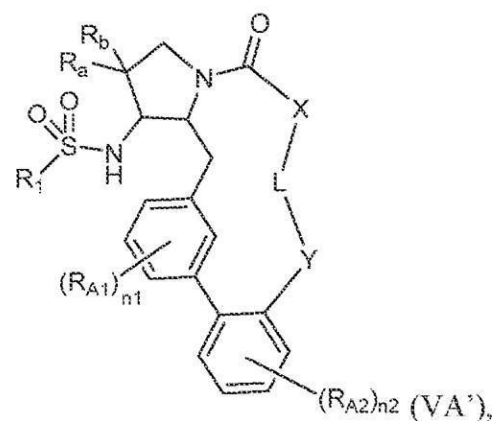
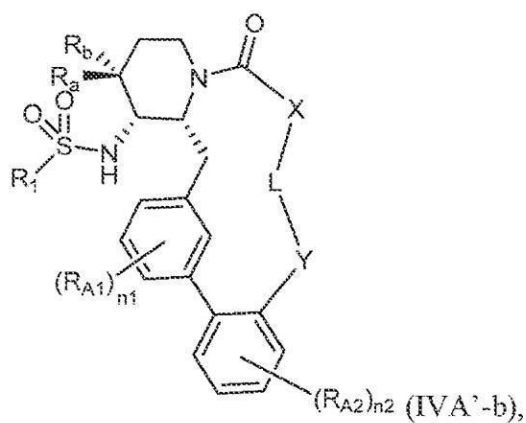
50



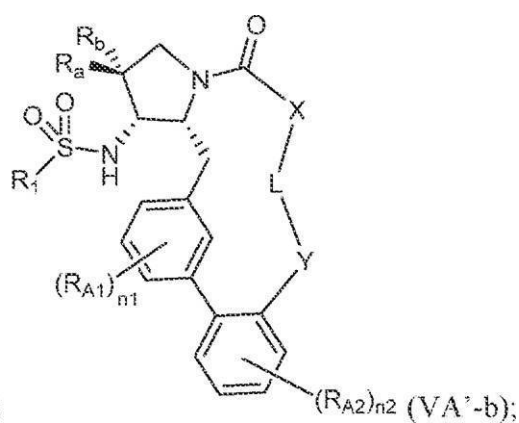
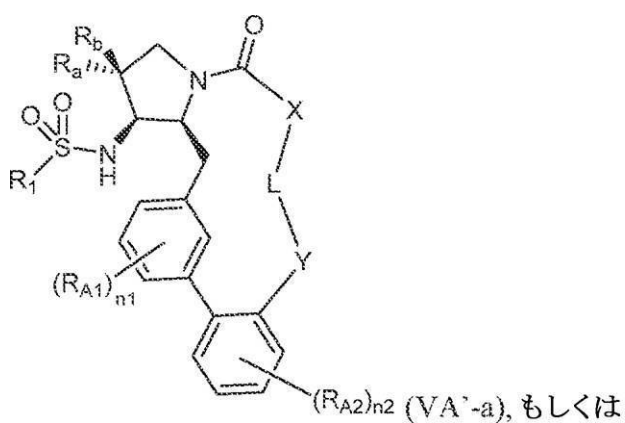
10



20



30



40

式中、

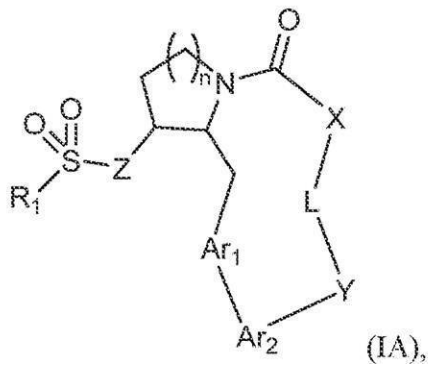
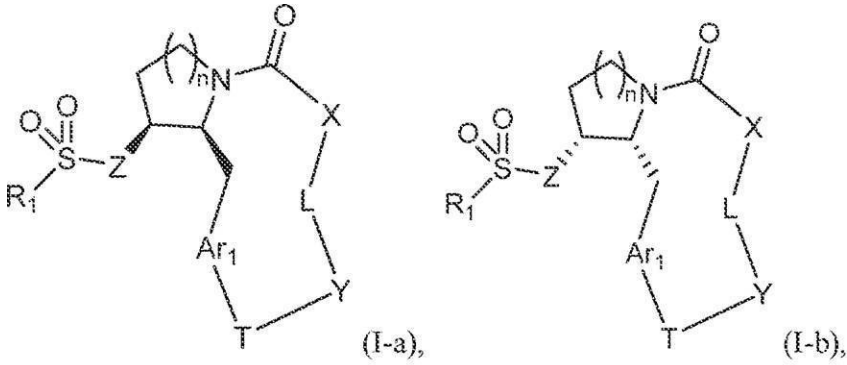
$n_1$  は、0 ~ 4 の範囲の整数であり；

$n_2$  は、0 ~ 4 の範囲の整数である。

50

## 【請求項 46】

式 (I-a)、(I-b)、(IA)、(IA-a)、(IA-b)、(IB)、(IB-a)、(IB-b)、(II)、(II-a)、(II-b)、(IIA)、(IIA-a)、(IIA-b)、(IIB)、(IIB-a)、(IIB-b)、(IIIA)、(IIIA-a)、(IIIA-b)、(IIIB)、(IIIB-a)、もしくは(IIIB-b)、(IVA)、(IVA-a)、(IVA-b)、(VA)、(VA-a)、もしくは(VA-b)の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、前記請求項のいずれか一項記載の化合物：



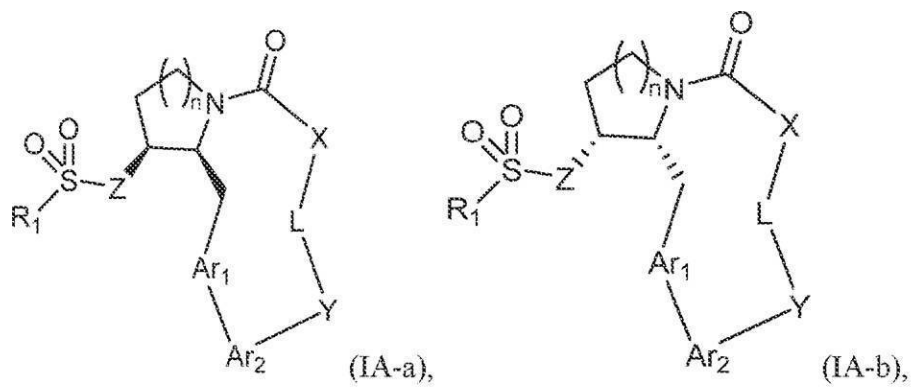
10

20

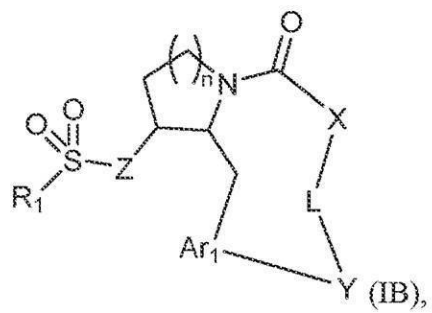
30

40

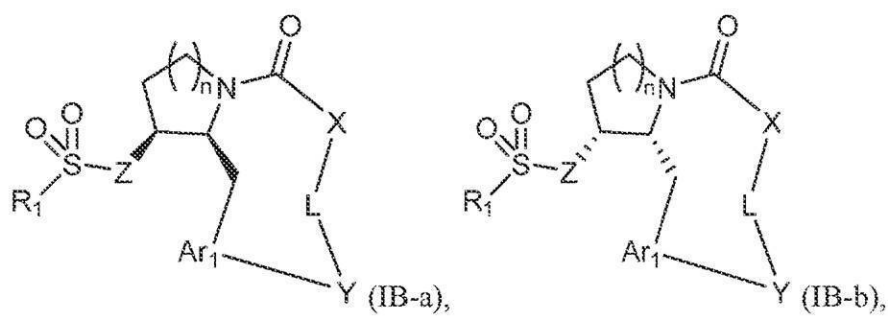
50



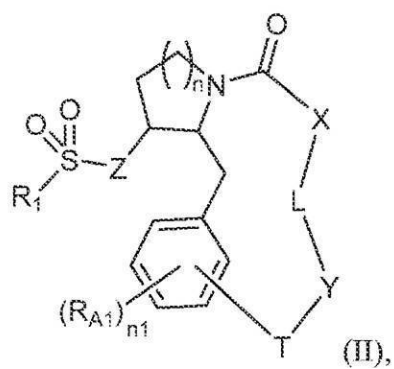
10



20

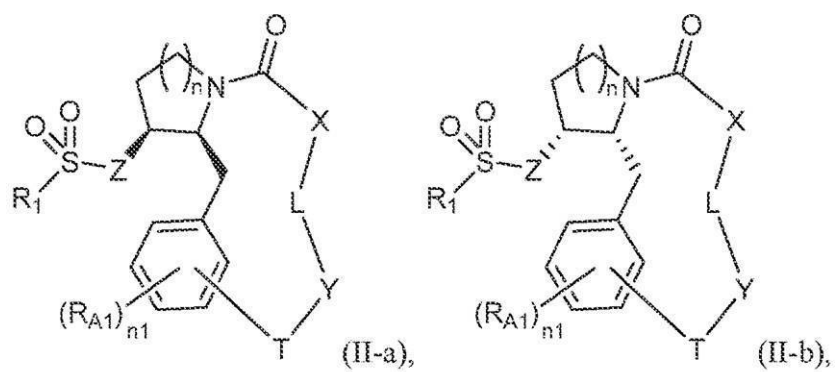


30

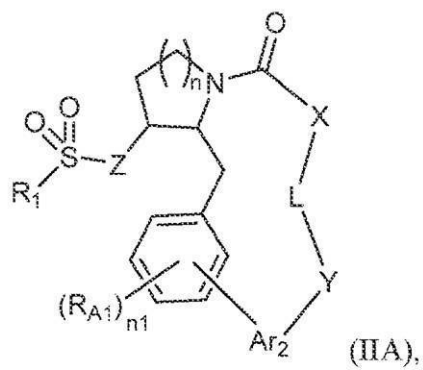


40

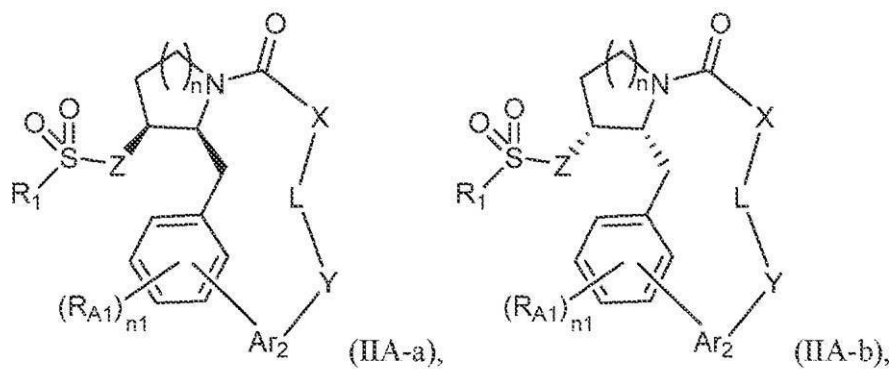
50



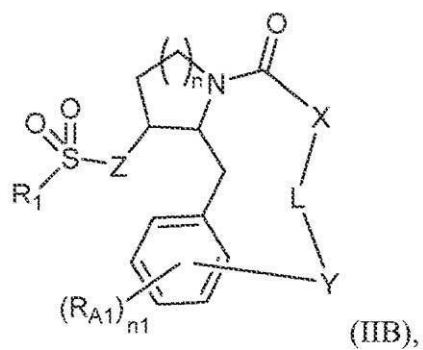
10



20

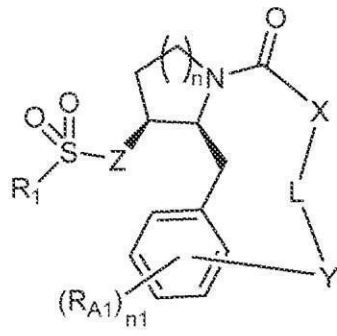


30

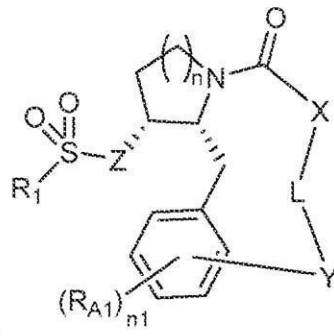


40

50

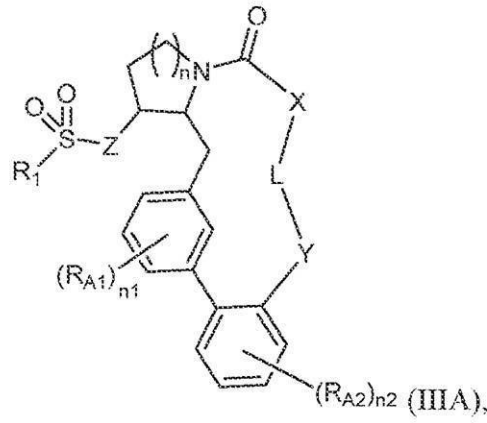


(IIB-a),



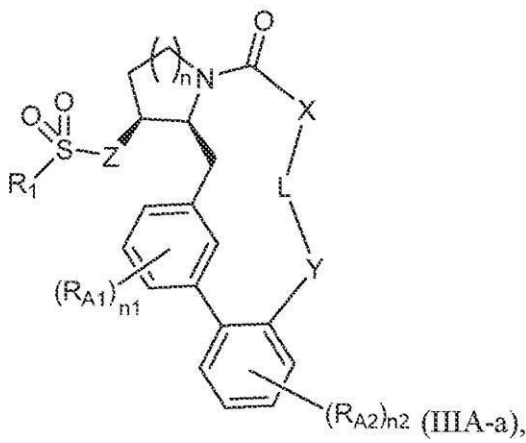
(IIB-b),

10

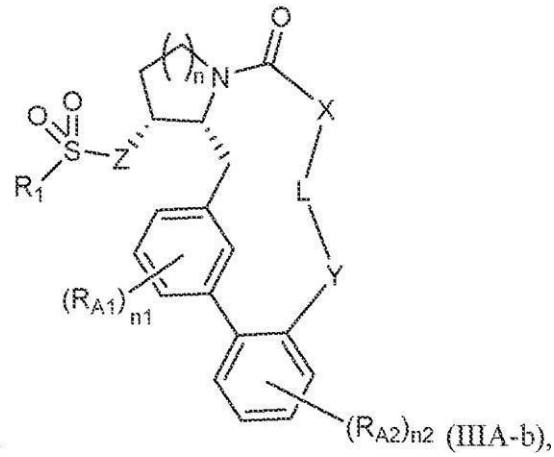


(IIIA),

20



(IIIA-a),

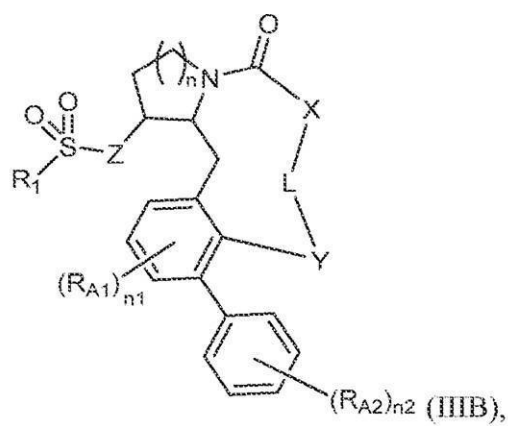


(IIIA-b),

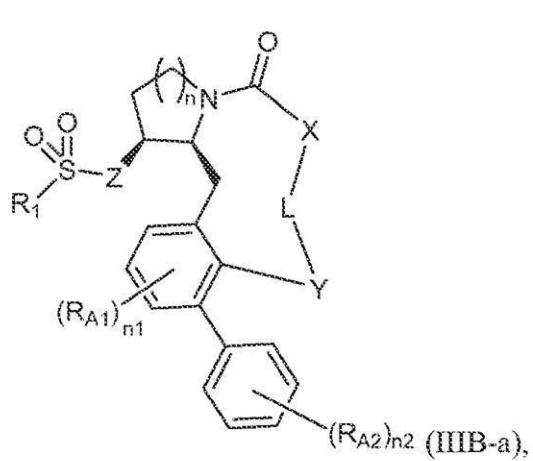
30

40

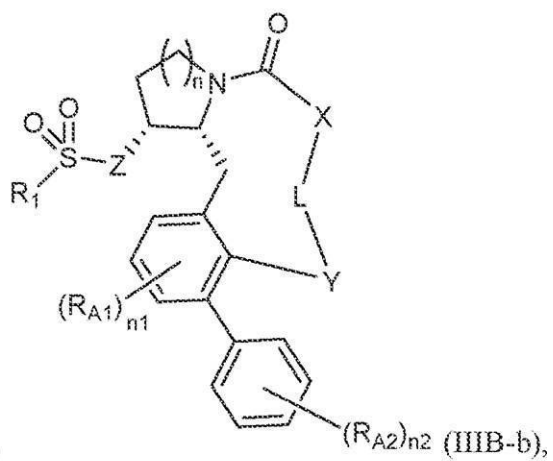
50



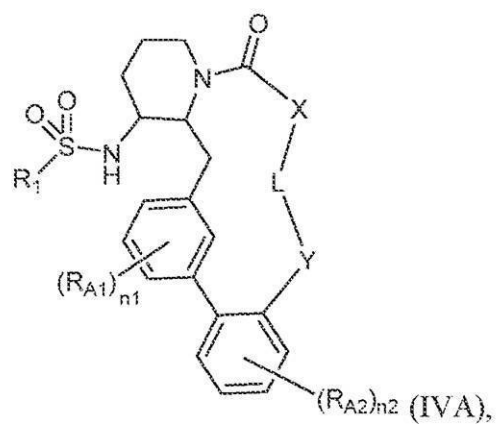
10



20

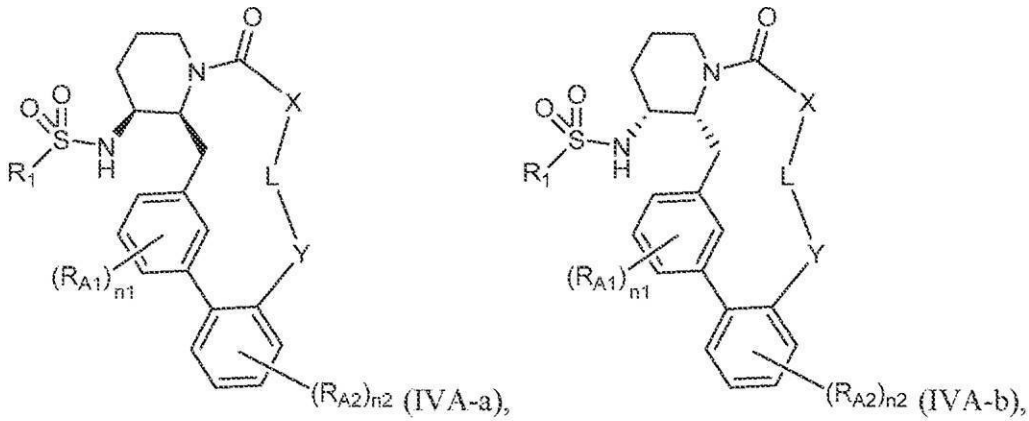


30

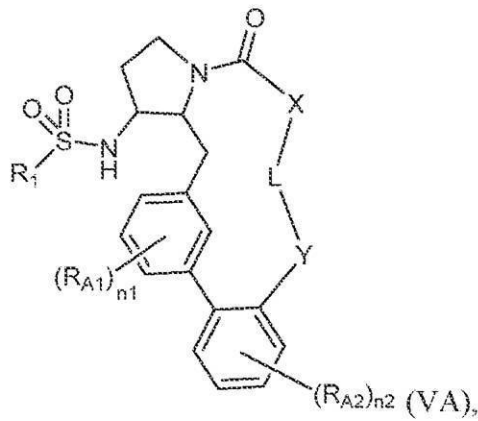


40

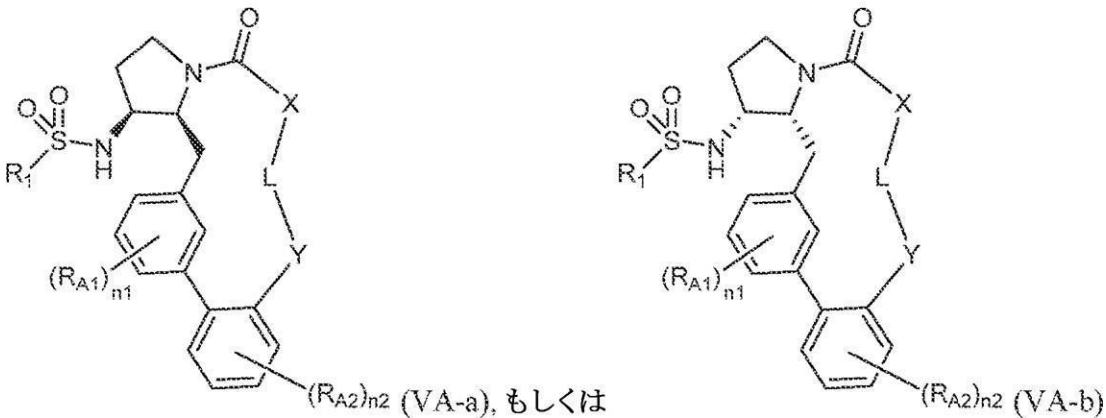
50



10



20



30

式中、

$n_1$ は、0～4の範囲の整数であり；

$n_2$ は、0～4の範囲の整数である。

【請求項47】

表A1に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

40

【請求項48】

表A2に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

【請求項49】

表B1に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

【請求項50】

表B2に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記請求項のいずれか一項記載の化合物。

50

## 【請求項 5 1】

本明細書に記載される方法によって獲得可能な、または獲得される化合物であって、任意で、該方法が、スキーム1～5に記載される1つまたは複数の段階を含む、該化合物。

## 【請求項 5 2】

前記請求項のいずれか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される希釈剤または担体とを含む、薬学的組成物。

## 【請求項 5 3】

前記化合物が、表A1、A2、B1、およびB2に記載される化合物より選択される、前記請求項のいずれか一項記載の薬学的組成物。

10

## 【請求項 5 4】

前記請求項のいずれか一項記載の化合物を含む、オレキシン-2受容体活性をモジュレートする方法における使用のための組成物であって、該方法が、細胞を該化合物と接触させる段階を含み、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該組成物。

## 【請求項 5 5】

疾患または障害の治療または予防の必要のある対象において疾患または障害を治療または予防するための、前記請求項のいずれか一項記載の化合物を含む組成物または前記請求項のいずれか一項記載の薬学的組成物。

## 【請求項 5 6】

オレキシン-2受容体活性をモジュレートすることにおける使用のための、前記請求項のいずれか一項記載の化合物を含む組成物または前記請求項のいずれか一項記載の薬学的組成物であって、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該組成物または薬学的組成物。

20

## 【請求項 5 7】

オレキシン-2受容体活性をモジュレートするための医薬の製造における、前記請求項のいずれか一項記載の化合物の使用であって、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該使用。

## 【請求項 5 8】

疾患または障害を治療または予防するための医薬の製造における、前記請求項のいずれか一項記載の化合物の使用。

30

## 【請求項 5 9】

疾患または障害が、関係付けられたオレキシン-2受容体と関連する、前記請求項のいずれか一項記載の組成物、薬学的組成物、または使用。

## 【請求項 6 0】

疾患または障害が、ナルコレプシー、過眠障害、神経変性障害、神経障害、希少遺伝性障害の症状、精神障害、メンタルヘルス障害、概日リズム障害、メタボリックシンドローム、骨粗鬆症、心不全、昏睡、または麻酔からの覚醒促進である、前記請求項のいずれか一項記載の組成物、薬学的組成物、または使用。

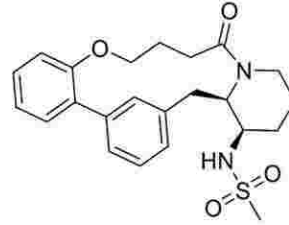
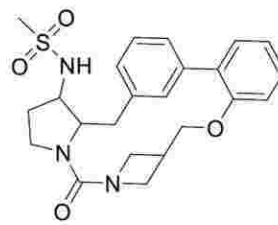
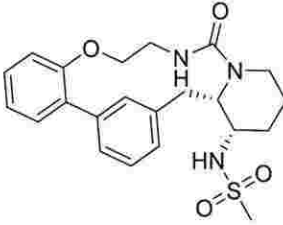
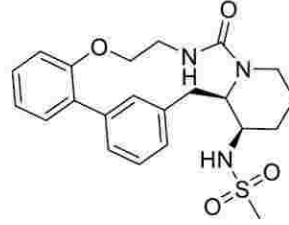
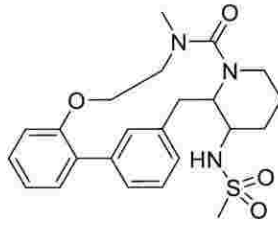
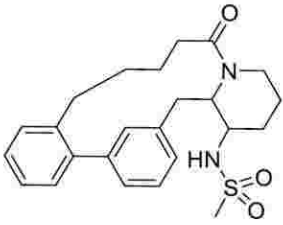
## 【請求項 6 1】

疾患または障害が、ナルコレプシー、特発性過眠症、睡眠時無呼吸、または不眠である、前記請求項のいずれか一項記載の組成物、薬学的組成物、または使用。

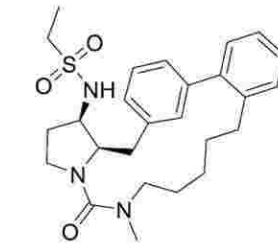
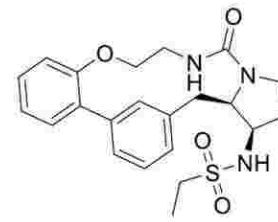
40

## 【請求項 6 2】

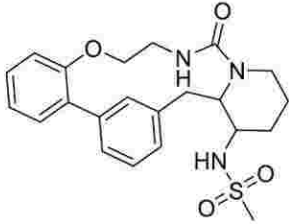
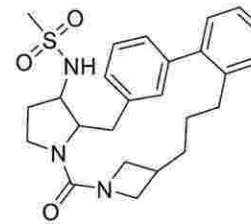
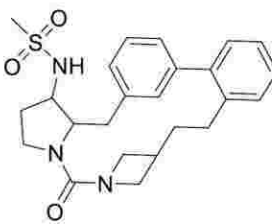
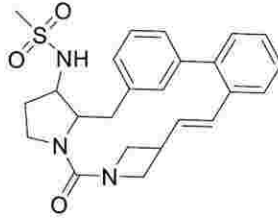
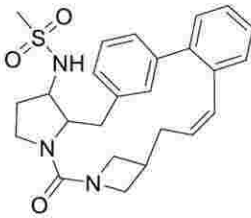
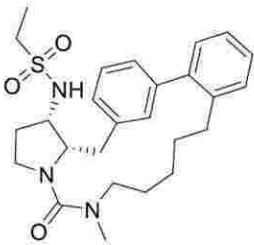
前記化合物が、以下：



10



20

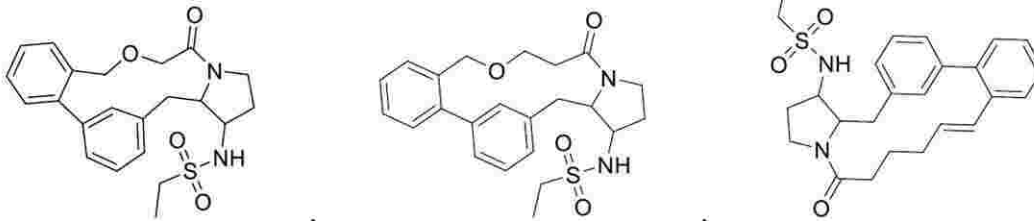
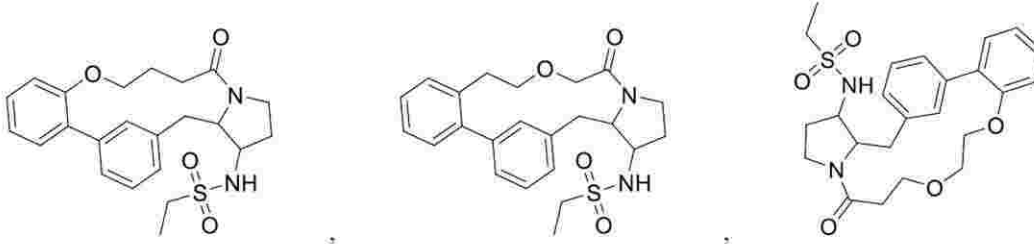


30

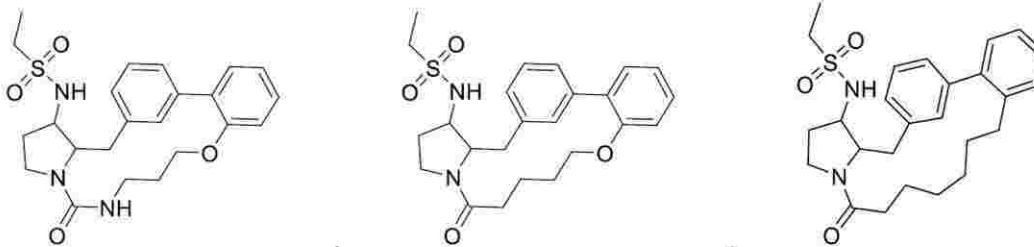
40

50

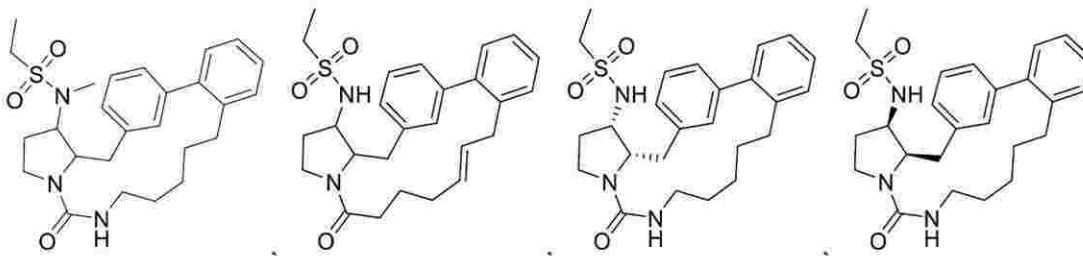




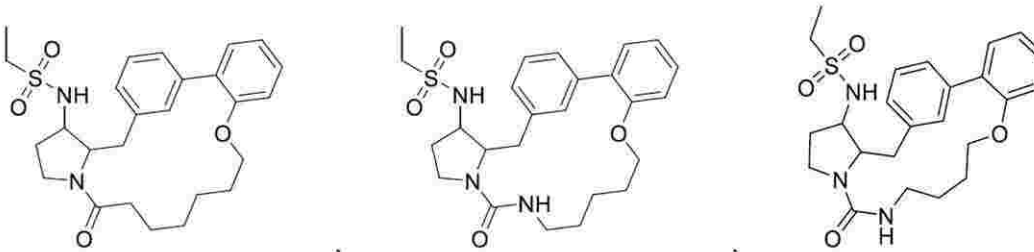
10



20

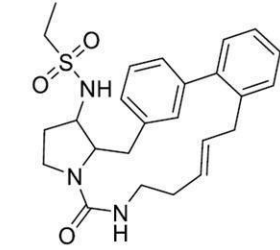
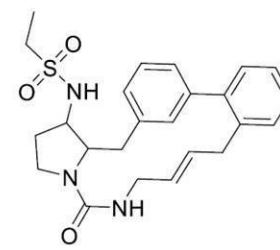
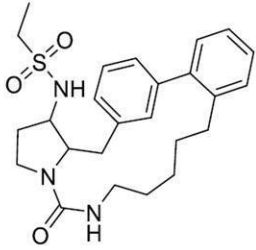
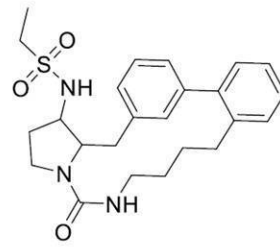
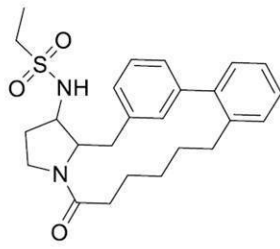
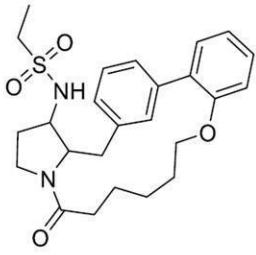


30

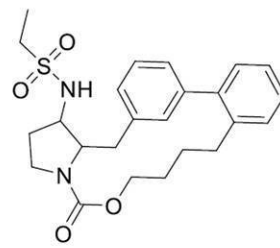
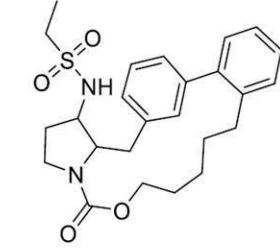
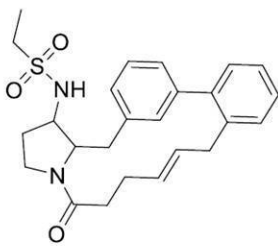


40

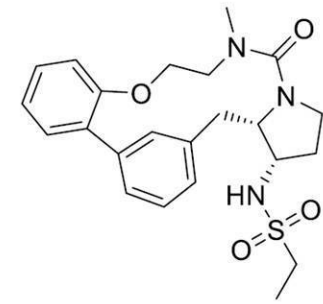
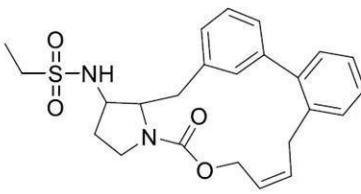
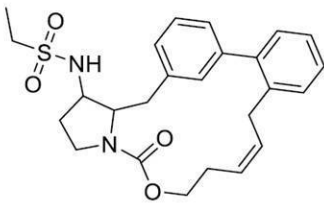
50



10



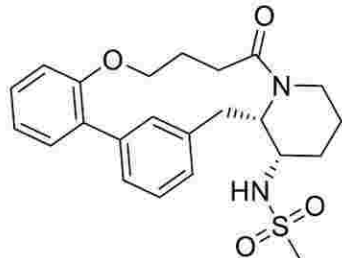
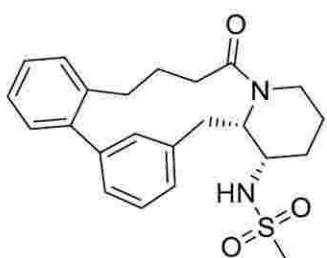
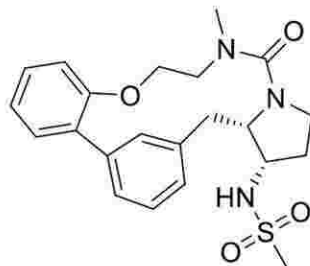
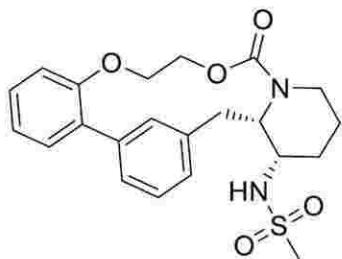
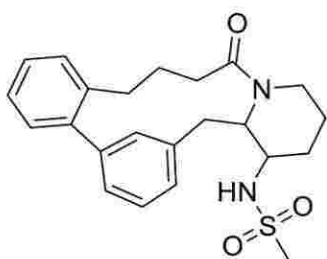
20



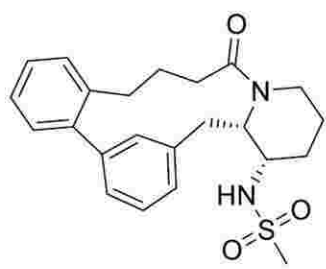
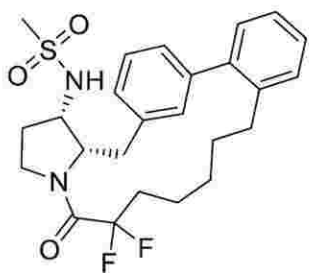
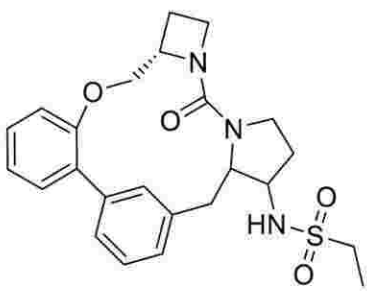
30

40

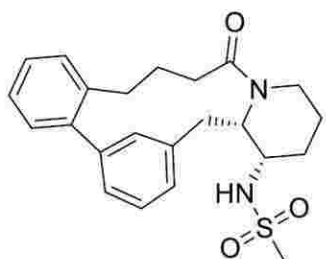
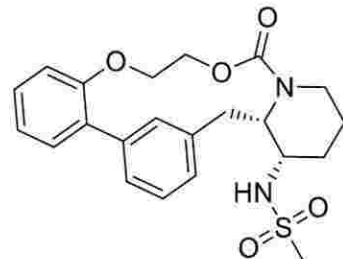
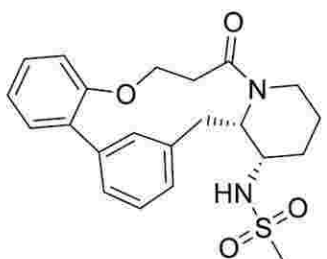
50



10



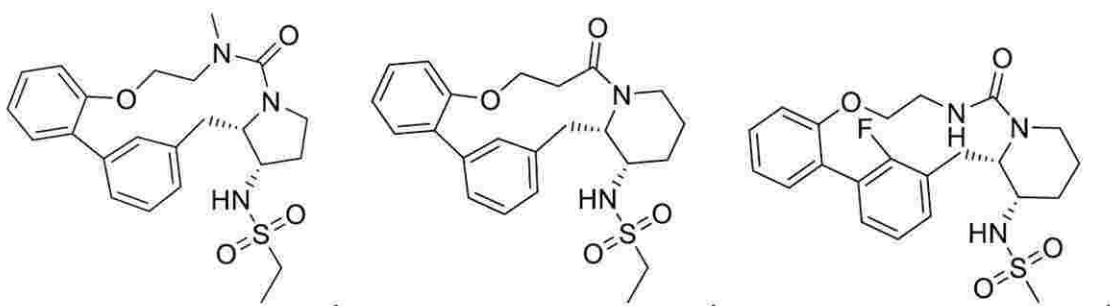
20



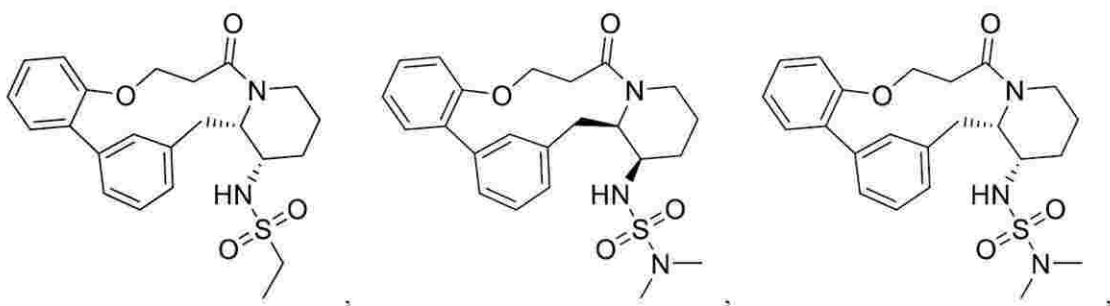
30

40

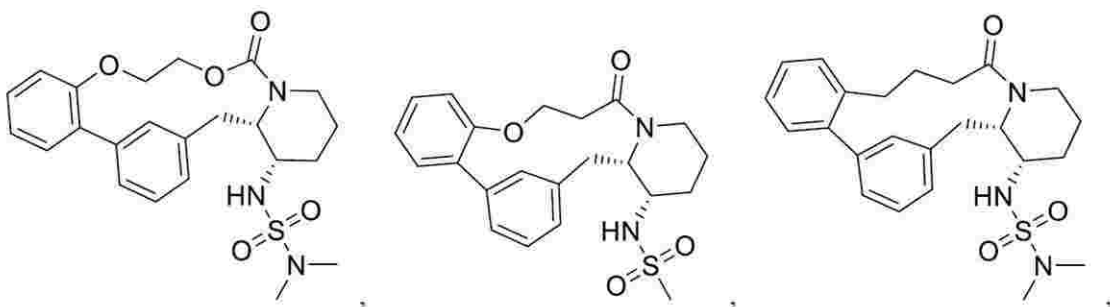
50



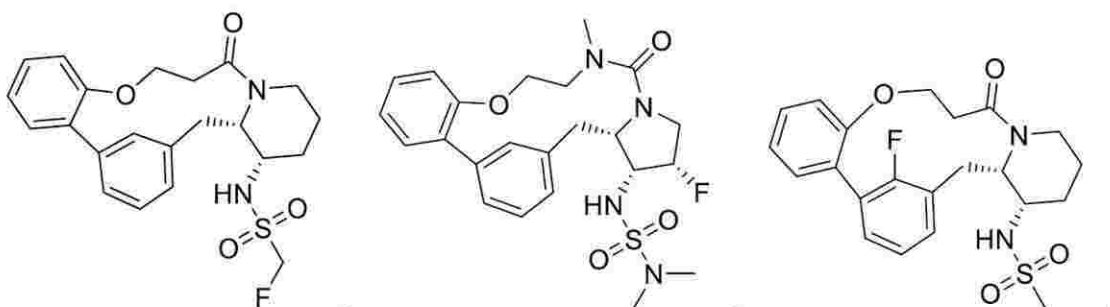
10



20

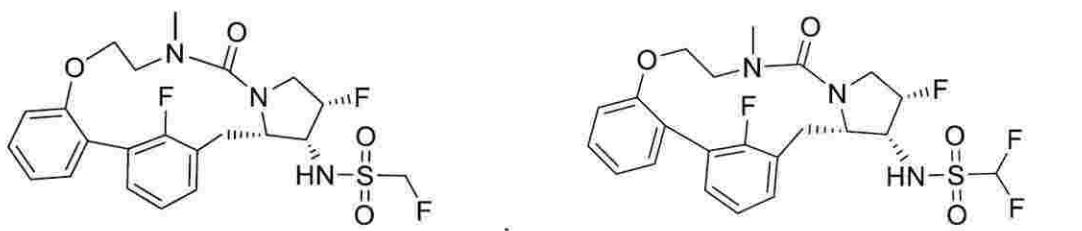
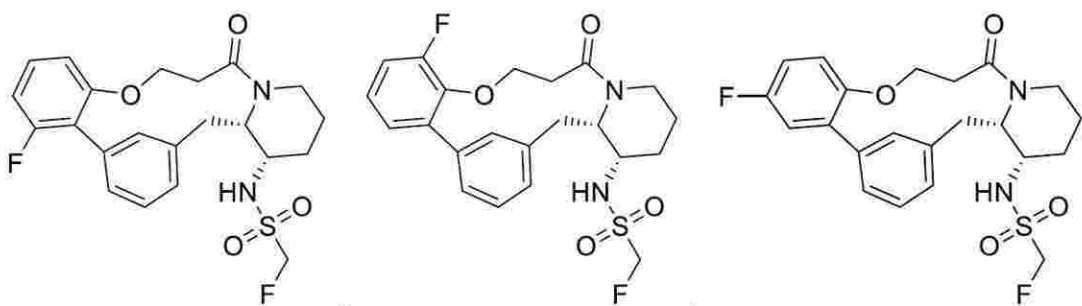
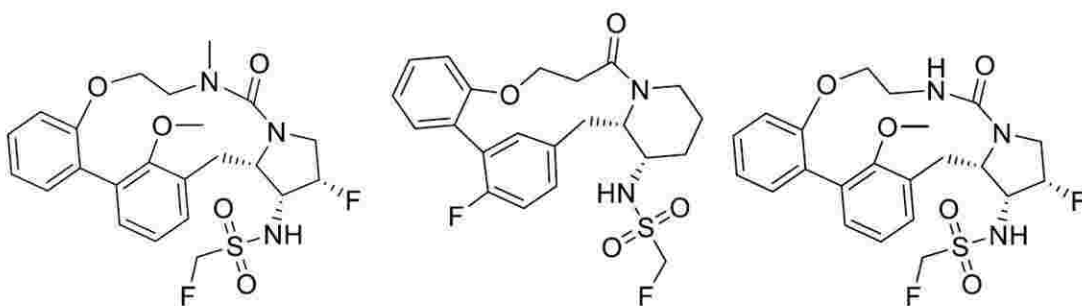
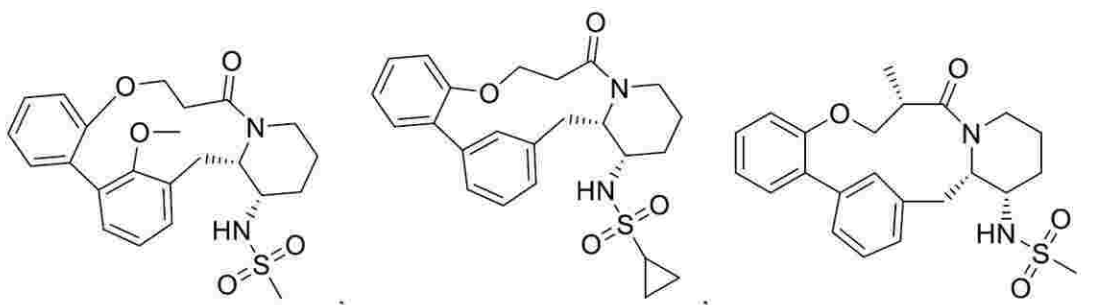


30



40

50



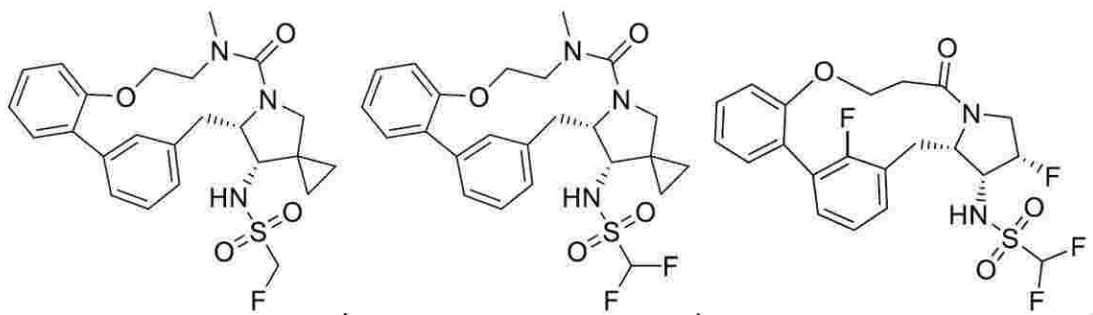
10

20

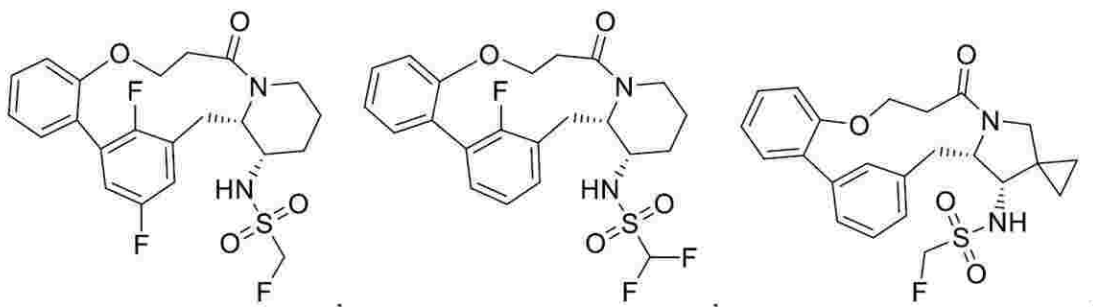
30

40

50



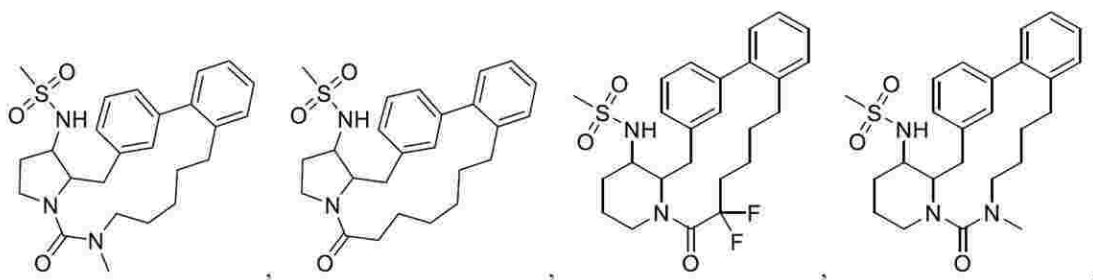
10



20

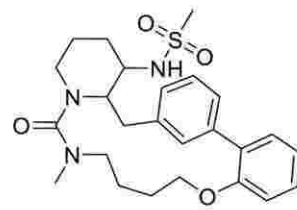
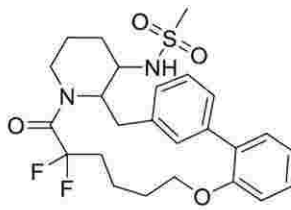
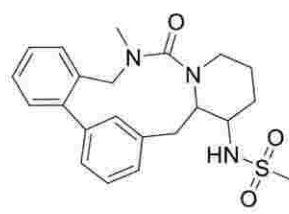
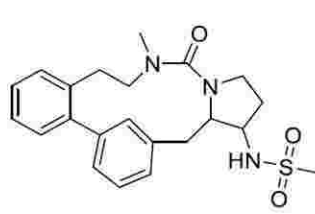
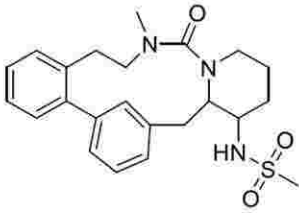
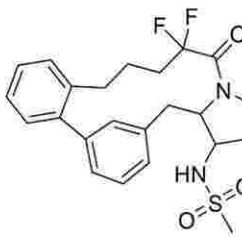
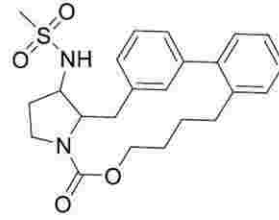
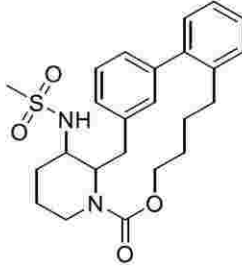
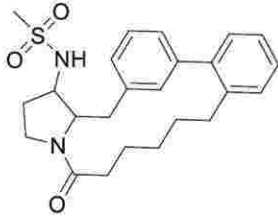
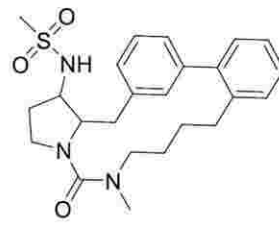
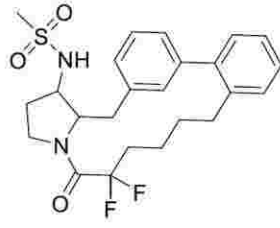
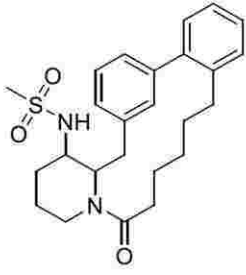


30



40

50



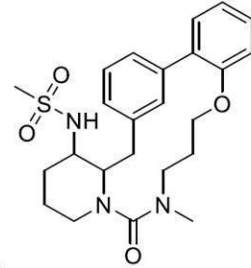
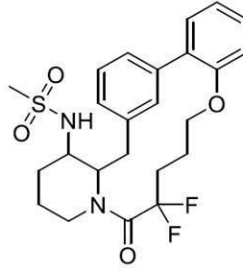
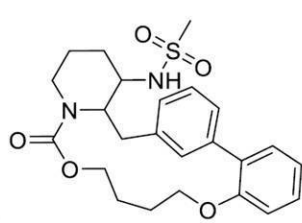
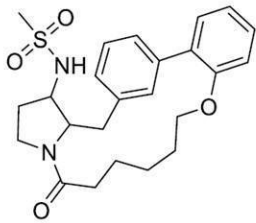
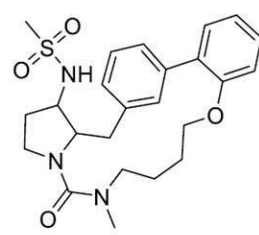
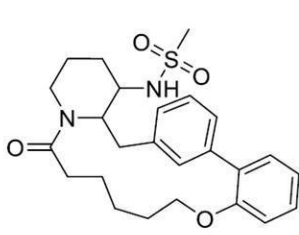
10

20

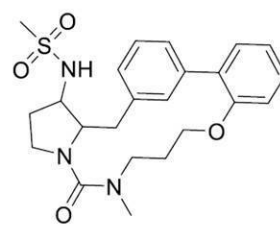
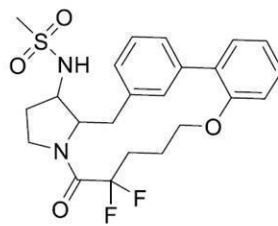
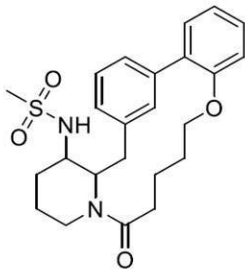
30

40

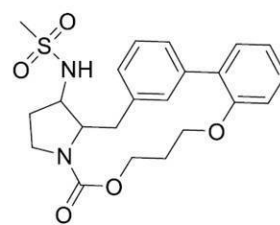
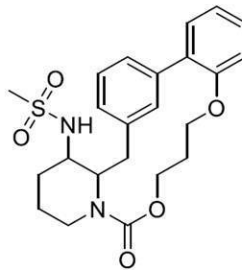
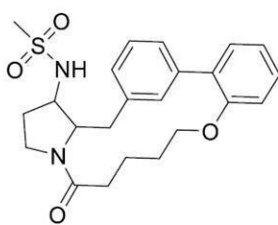
50



10



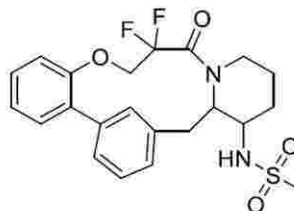
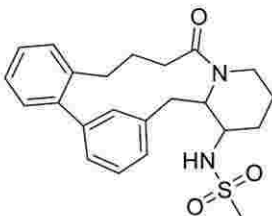
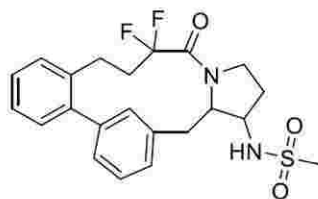
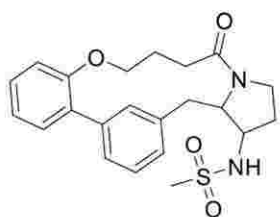
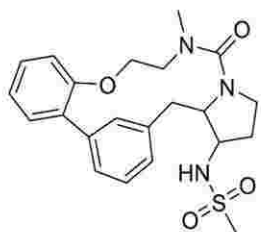
20



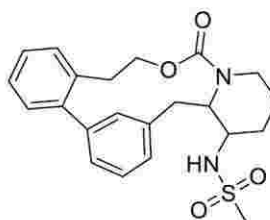
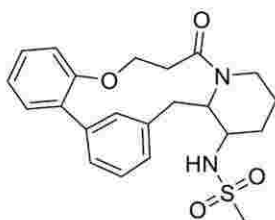
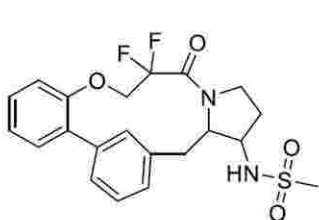
30

40

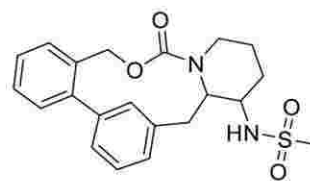
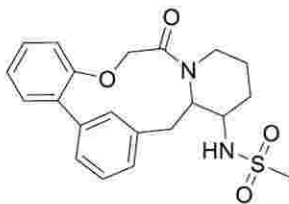
50



10



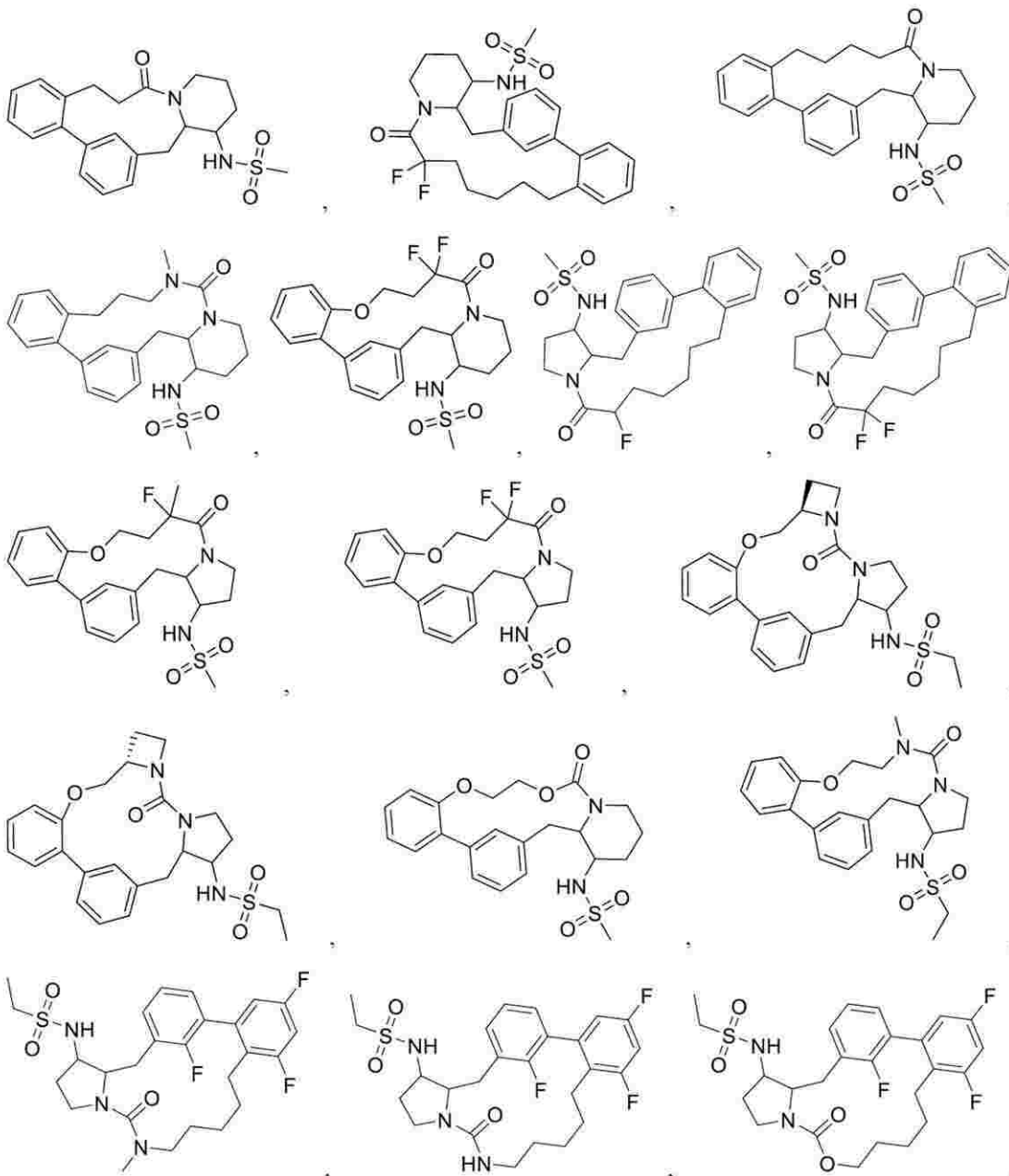
20



30

40

50



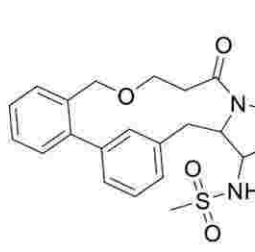
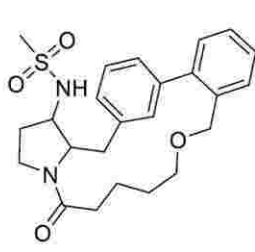
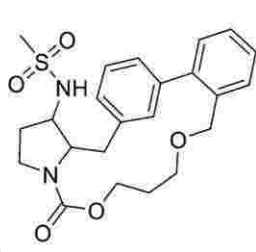
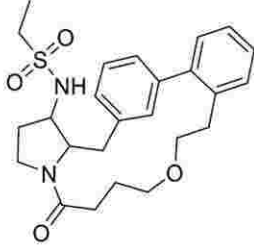
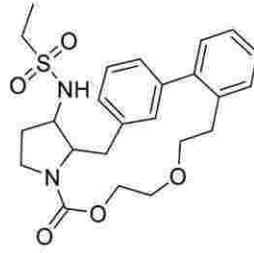
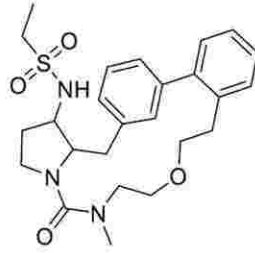
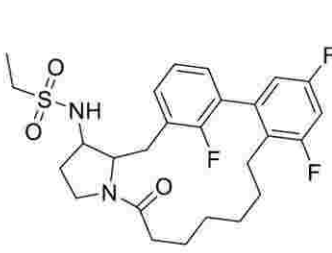
10

20

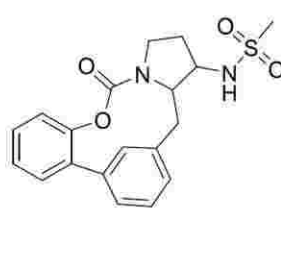
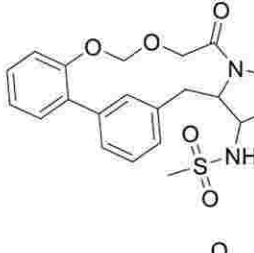
30

40

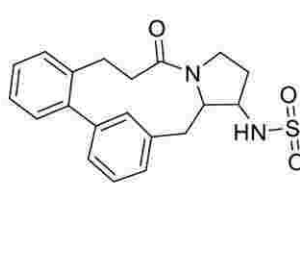
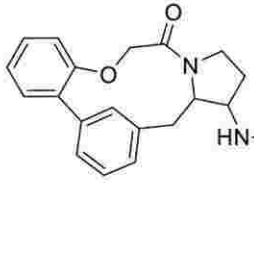
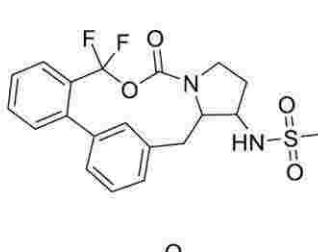
50



10



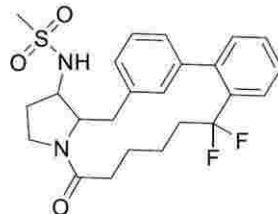
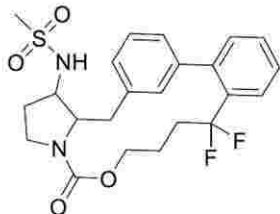
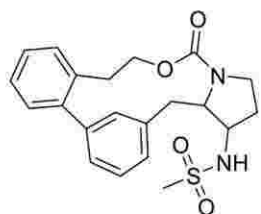
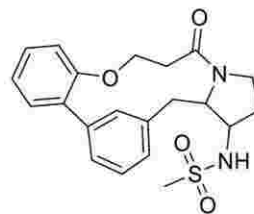
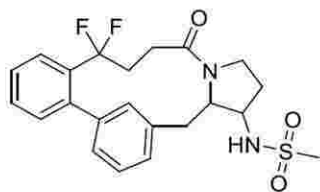
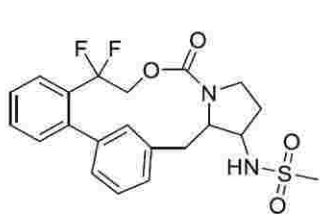
20



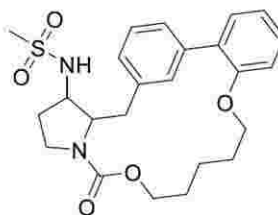
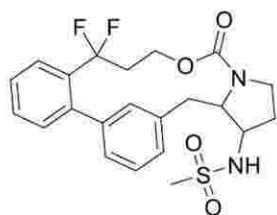
30

40

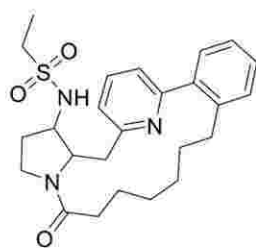
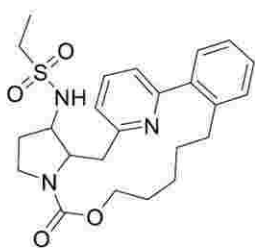
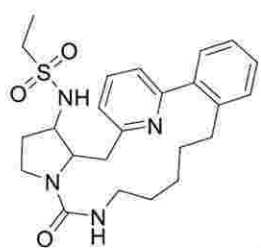
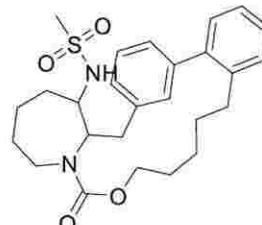
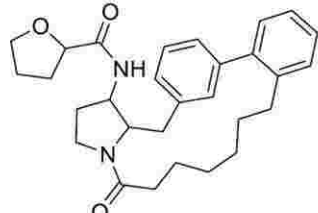
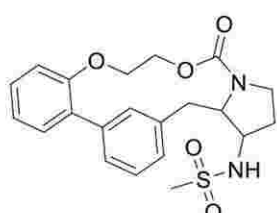
50



10



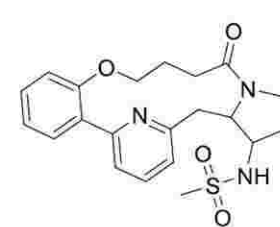
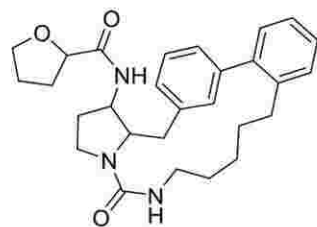
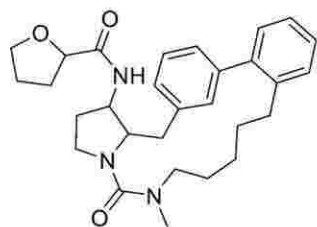
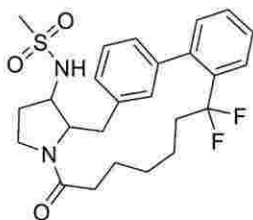
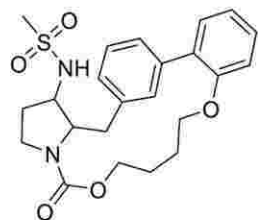
20



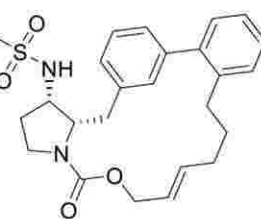
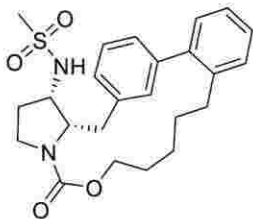
30

40

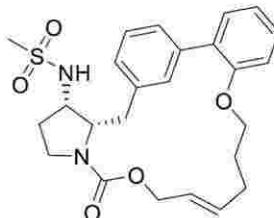
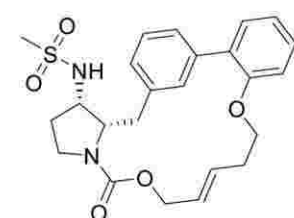
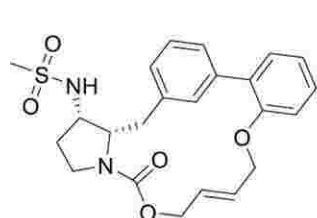
50



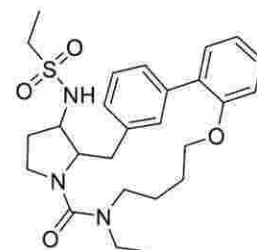
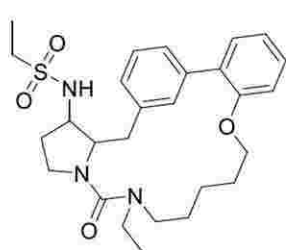
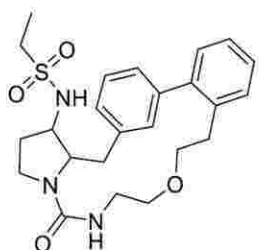
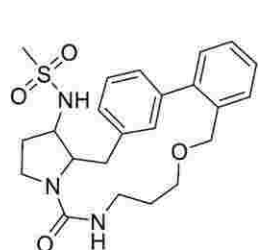
10



20

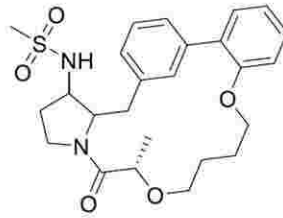
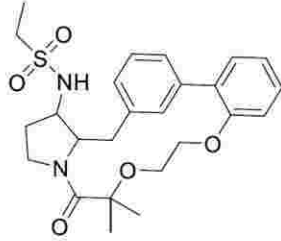
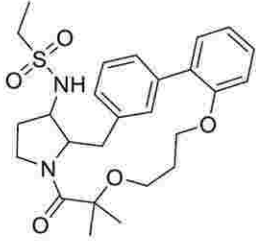
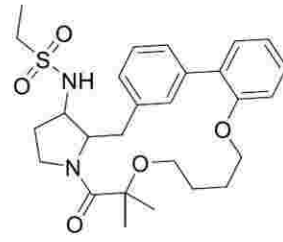
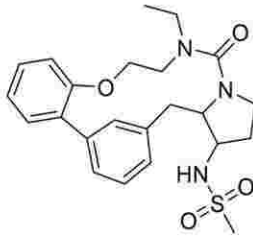
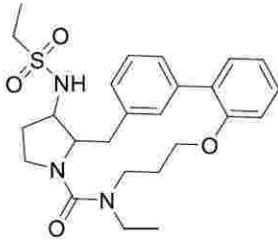


30

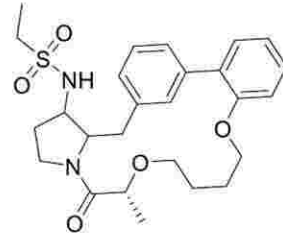
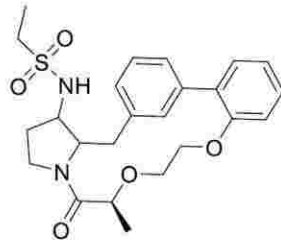
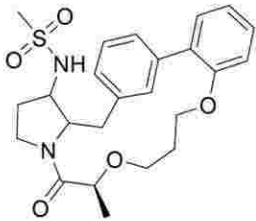


40

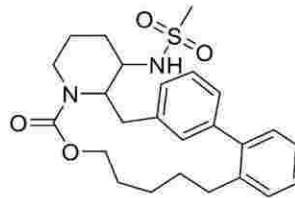
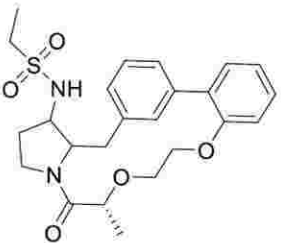
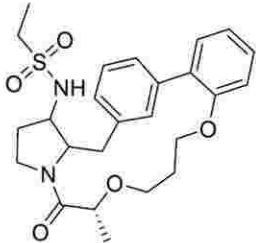
50



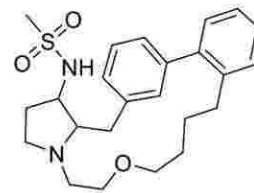
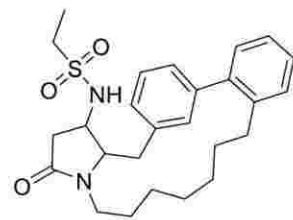
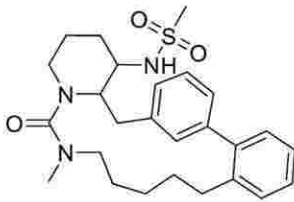
10



20

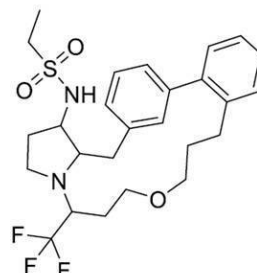
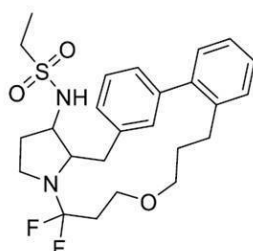
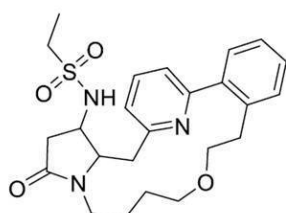
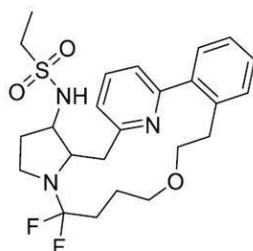
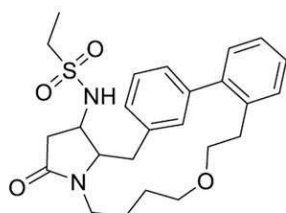
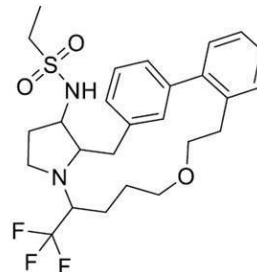
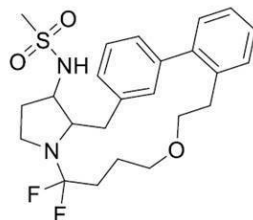
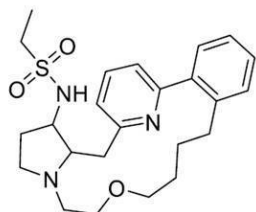
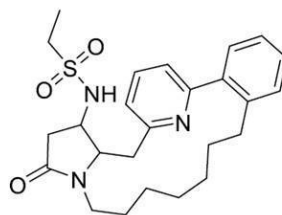
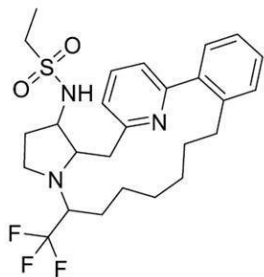
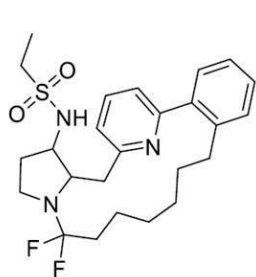


30



40

50



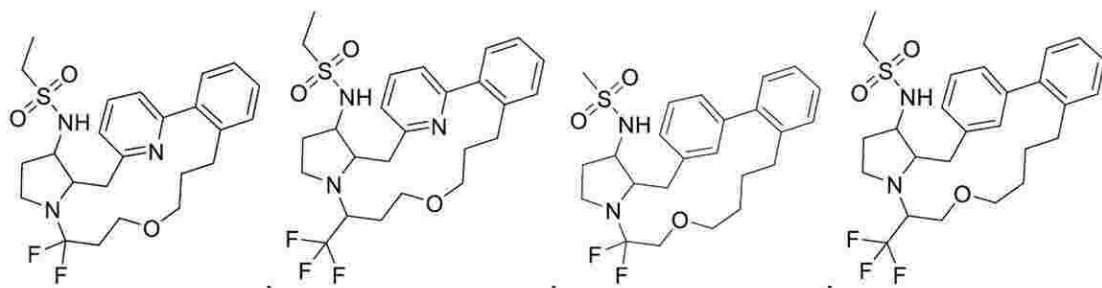
10

20

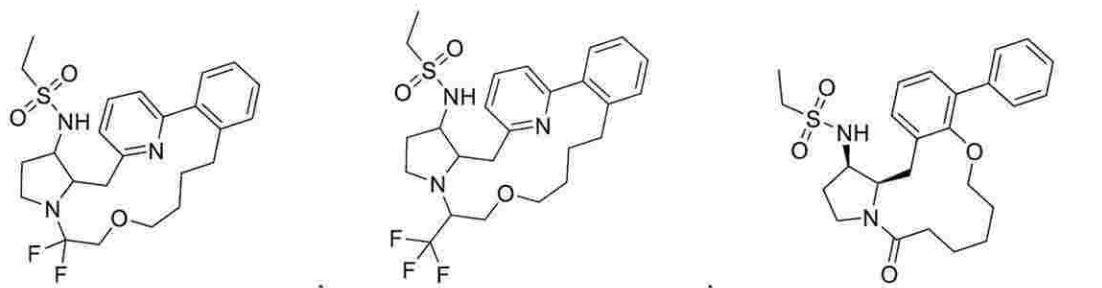
30

40

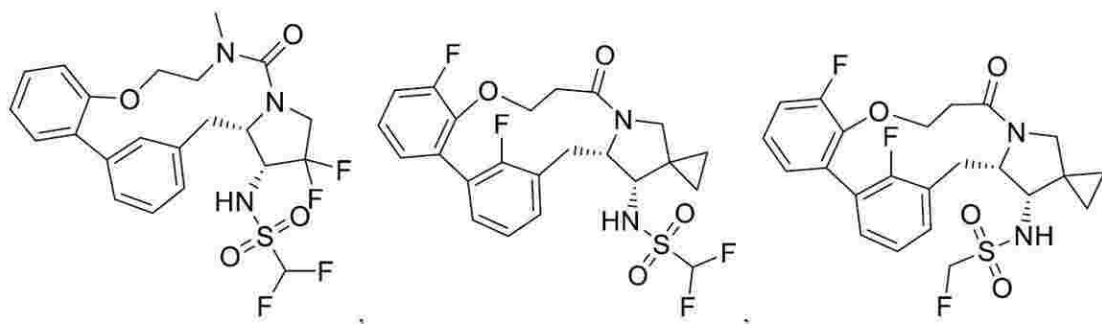
50



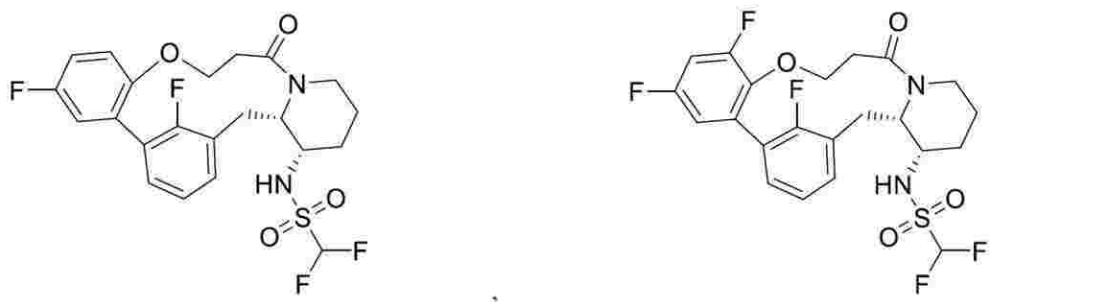
10



20

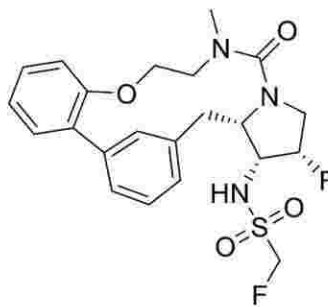
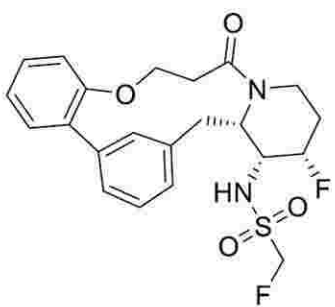
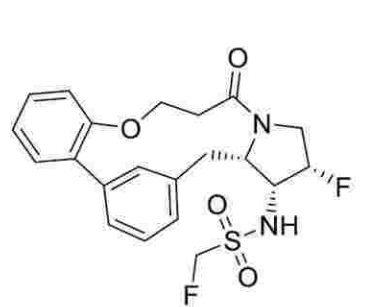
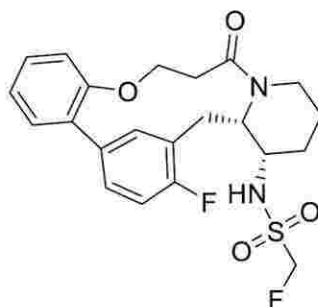
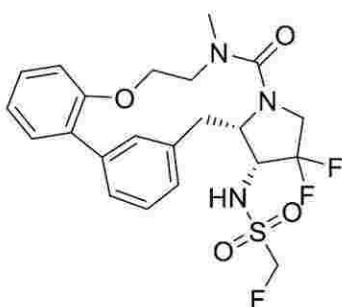
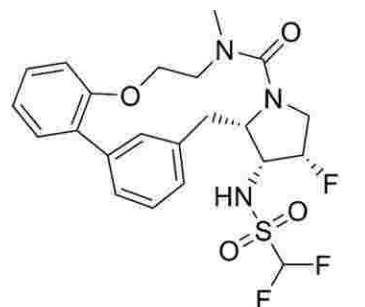
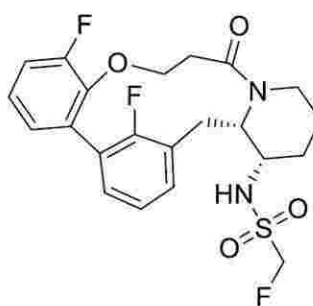
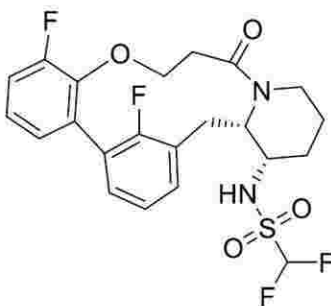
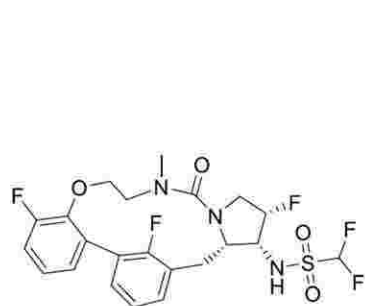
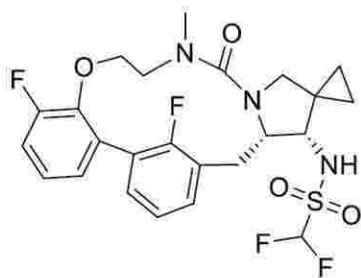
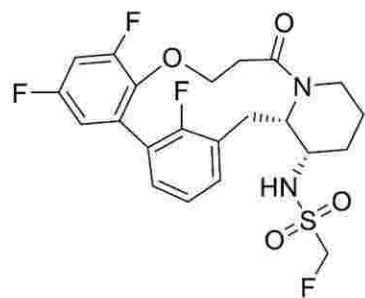


30



40

50



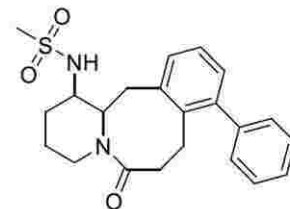
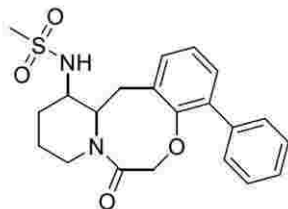
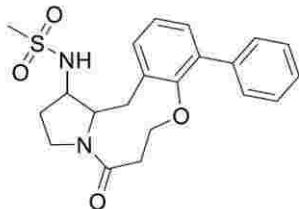
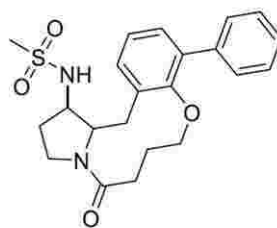
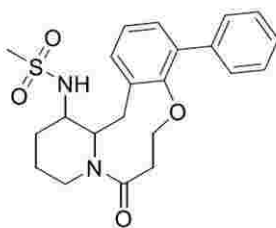
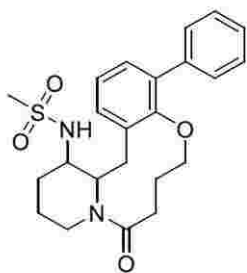
10

20

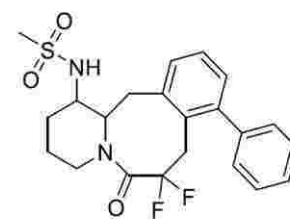
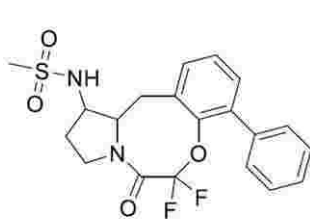
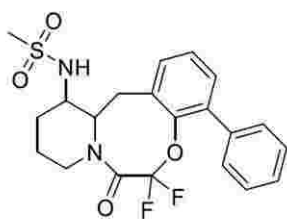
30

40

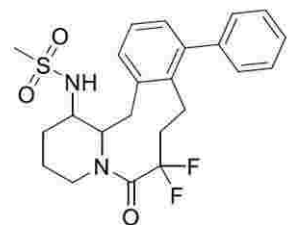
50



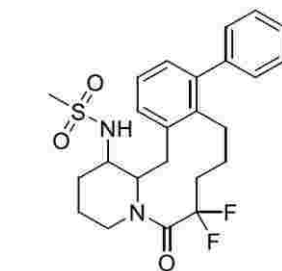
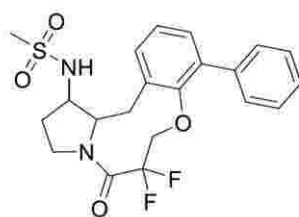
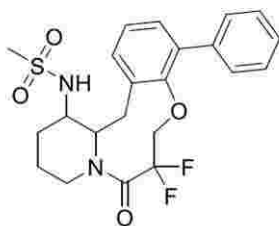
10



20

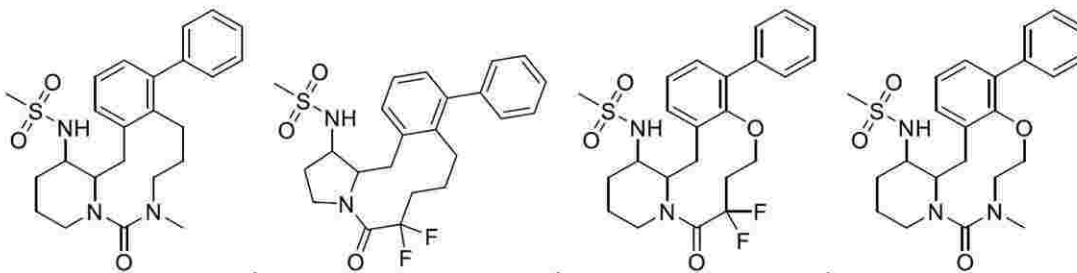


30

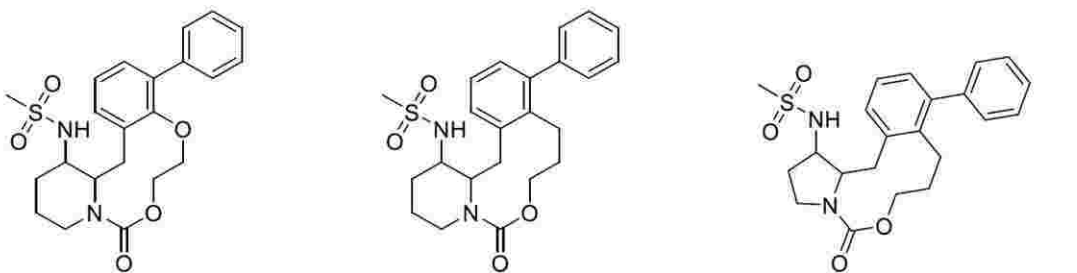


40

50



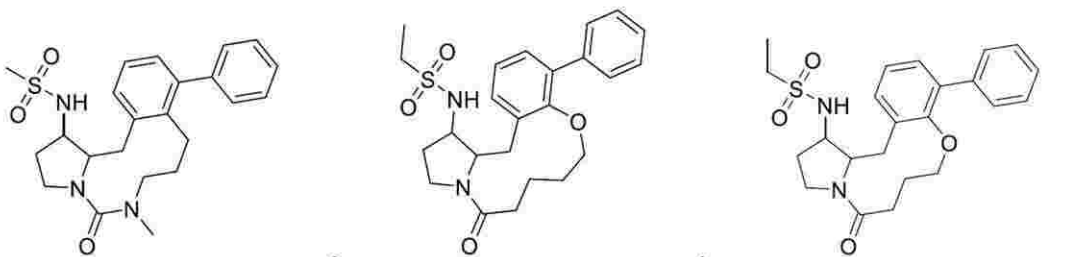
10



20

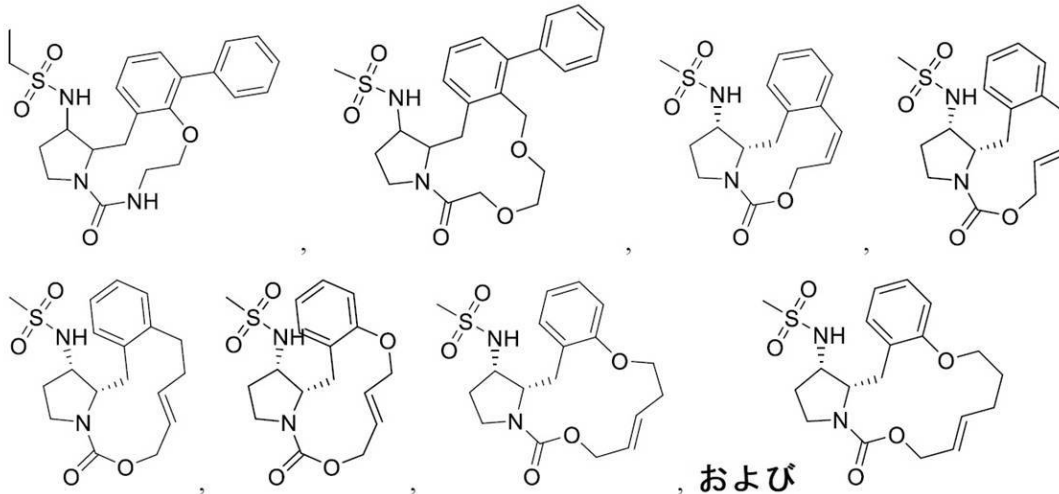


30



40

50



から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはそのいずれか 1 つの薬学的に許容される塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】1 3 5 4

20

【補正方法】変更

【補正の内容】

【1 3 5 4】

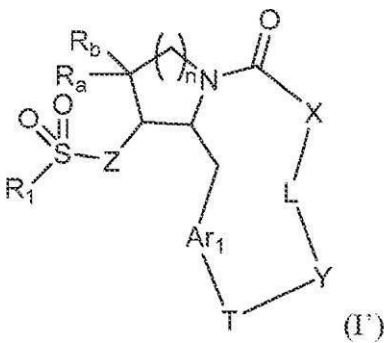
上記の説明は、例証のためにのみ提示されたものであって、本開示を開示された正確な形態に限定することを意図したのではなく、本明細書に添付される特許請求の範囲によって限定することを意図したものである。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (I') の化合物、またはその薬学的に許容される塩；

30



式中、

40

X は、-O-、-NH-、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール、3~8員ヘテロシクロアルキル、または5~10員ヘテロアリールであり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール、3~8員ヘテロシクロアルキル、または5~10員ヘテロアリールは、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよく；

L は、存在しないか、-O-、-NH-、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-、-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-NH)<sub>n1</sub>-、または-(NH-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-

50

であり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-O)<sub>n1</sub>-、-(O-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-NH)<sub>n1</sub>-、-(NH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル))<sub>n1</sub>-、-((C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル)-NH)<sub>n1</sub>-、または-(NH-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル))<sub>n1</sub>-は、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、または-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>で置換されていてもよく；n<sub>1</sub>は、1~6の範囲の整数であり；

Yは、-O-、-NH-、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルであり、ここで-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルは、1つまたは複数のハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよく；

10

nは、0~3の範囲の整数であり；

R<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>は、それぞれ独立してH、ハロゲン、-CN、-OH、-O(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、もしくはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり、ここで-O(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、もしくはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルは、1つもしくは複数のR<sub>S</sub>で置換されていてもよい；またはR<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>は、それらが結合する原子と一緒にあって、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキルもしくは3~7員ヘテロシクロアルキルを形成し、ここでC<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキルもしくは3~7員ヘテロシクロアルキルは、1つもしくは複数のR<sub>S</sub>で置換されていてもよく；

各R<sub>S</sub>は、独立してハロゲン、-CN、-OH、-O(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；

20

Zは、-O-または-NR<sub>Z</sub>-であり；ここでR<sub>Z</sub>は、HまたはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>1</sub>は、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SH、-S(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール、5~10員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、3~7員ヘテロシクロアルキル、-O-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、-O-(5~10員ヘテロアリール)、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、-O-(3~7員ヘテロシクロアルキル)、-NH-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、-NH-(5~10員ヘテロアリール)、-NH-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、または-NH-(3~7員ヘテロシクロアルキル)であり、ここで-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-S(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-S(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール、5~10員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、3~7員ヘテロシクロアルキル、-O-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、-O-(5~10員ヘテロアリール)、-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、-O-(3~7員ヘテロシクロアルキル)、-NH-(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール)、-NH-(5~10員ヘテロアリール)、-NH-(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>シクロアルキル)、または-NH-(3~7員ヘテロシクロアルキル)は、1つまたは複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよく；

30

各R<sub>1S</sub>は、独立してオキソ、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-S(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>シクロアルキル、または3~7員ヘテロシクロアルキルであり；

40

Ar<sub>1</sub>は、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールまたは5~10員ヘテロアリールであり、ここでC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールまたは5~10員ヘテロアリールは、1つまたは複数のR<sub>A1</sub>で置換されていてもよく；

各R<sub>A1</sub>は、独立してAr<sub>2</sub>、ハロゲン、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

Tは、存在しないかまたはAr<sub>2</sub>であり；

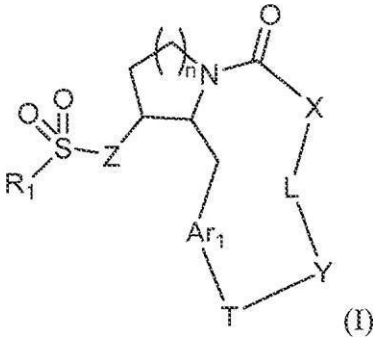
各Ar<sub>2</sub>は、独立してC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールまたは5~10員ヘテロアリールであり、ここでC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールまたは5~10員ヘテロアリールは、1つまたは複数のR<sub>A2</sub>で置換されていてもよく；

50

各 $R_{A2}$ は、独立してハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_1-C_6ハロアルキル$ 、 $C_1-C_6アルコキシ$ 、 $C_1-C_6ハロアルコキシ$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、または $C_2-C_6アルキニル$ である。

(項目2)

式(1)の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、項目1記載の化合物：



10

(項目3)

Xが $-O-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目4)

Xが、 $-NH-$ または $-N(C_1-C_6アルキル)-$ であり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ が、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6ハロアルキル$ 、または $C_1-C_6アルコキシ$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

20

(項目5)

Xが、 $-NH-$ または $-N(CH_3)-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目6)

Xが、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6ハロアルキル$ 、または $C_1-C_6アルコキシ$ で置換されていてもよい $C_1-C_6アルキル$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目7)

Xが、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ 、 $C_1-C_6ハロアルキル$ 、または $C_1-C_6アルコキシ$ で置換されていてもよいアゼチジニルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

30

(項目8)

Lが存在しない、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目9)

Lが、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-NH)_{n1}-$ 、 $-(NH-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-NH)_{n1}-$ 、または $-(NH-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ であり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ 、 $C_1-C_6アルキル$ 、 $C_2-C_6アルケニル$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-O)_{n1}-$ 、 $-(O-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ 、 $-((C_1-C_6アルキル)-NH)_{n1}-$ 、 $-(NH-(C_1-C_6アルキル))_{n1}-$ 、 $-((C_2-C_6アルケニル)-NH)_{n1}-$ 、または $-(NH-(C_2-C_6アルケニル))_{n1}-$ が、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6アルキル)$ 、または $-N(C_1-C_6アルキル)_2$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

40

(項目10)

Lが $-O-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目11)

Lが、 $-NH-$ または $-N(C_1-C_6アルキル)-$ であり、ここで $-N(C_1-C_6アルキル)-$ が、1つ

50

または複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、または $-N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 2)

$L$ が、 $C_1-C_6$ アルキルまたは $C_2-C_6$ アルケニルであり、ここで $C_1-C_6$ アルキルまたは $C_2-C_6$ アルケニルが、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、または $-N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 3)

$L$ が、 $-((C_1-C_6\text{アルキル})-O)_{n1}$ または $-(O-(C_1-C_6\text{アルキル}))_{n1}$ であり、ここで $-((C_1-C_6\text{アルキル})-O)_{n1}$ または $-(O-(C_1-C_6\text{アルキル}))_{n1}$ が、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、または $-N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 4)

$L$ が、 $-((C_1-C_6\text{アルキル})-NH)_{n1}$ または $-(NH-(C_1-C_6\text{アルキル}))_{n1}$ であり、ここで $-((C_1-C_6\text{アルキル})-NH)_{n1}$ または $-(NH-(C_1-C_6\text{アルキル}))_{n1}$ が、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、または $-N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$ で置換されていてもよい、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 5)

$n1$ が、1~3の範囲の整数である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 6)

$Y$ が $-O-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 7)

$Y$ が $-NH-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 8)

$Y$ が、1つまたは複数のハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、 $-N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$ 、 $C_1-C_6$ ハロアルキル、または $C_1-C_6$ アルコキシで置換されていてもよい $C_1-C_6$ アルキルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 1 9)

$n$ が1である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 0)

$n$ が2である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 1)

$R_a$ および $R_b$ が、それぞれ独立してHもしくはハロゲンであるか；または $R_a$ および $R_b$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、1つもしくは複数の $R_S$ で置換されていてもよい $C_3-C_7$ シクロアルキルを形成する、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 2)

$R_a$ および $R_b$ のうちの1つがHであり、 $R_a$ および $R_b$ のうちの1つがハロゲンである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 3)

$R_a$ および $R_b$ が、それらが結合する原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成する、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 4)

$Z$ が $-O-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 5)

$Z$ が $-NH-$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 6)

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_1-C_6$ アルキルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 2 7)

$R_1$ が、メチルまたはエチルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

50

10

20

30

40

(項目 28)

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_3$ - $C_7$ シクロアルキルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 29)

$R_1$ が、1つまたは複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよいシクロプロピルである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 30)

少なくとも1つの $R_{1S}$ がハロゲンである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 31)

$Ar_1$ が、1つまたは複数の $R_{A1}$ で置換されていてもよい $C_6$ - $C_{10}$ アリールである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 32)

$Ar_1$ が、1つまたは複数の $R_{A1}$ で置換されていてもよい5~10員ヘテロアリールである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 33)

少なくとも1つの $R_{A1}$ が $Ar_2$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 34)

少なくとも1つの $R_{A1}$ が、1つまたは複数の $R_{A2}$ で置換されていてもよい $C_6$ - $C_{10}$ アリールである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 35)

少なくとも1つの $R_{A1}$ がハロゲンである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 36)

Tが存在しない、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 37)

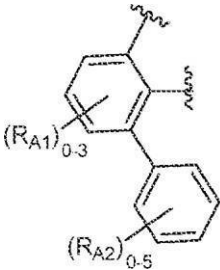
Tが $Ar_2$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 38)

少なくとも1つの $R_{A1}$ が $Ar_2$ であり、Tが存在しない、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 39)

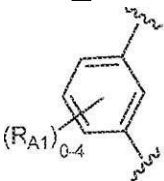
$Ar_1$ が



であり、Tが存在しない、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 40)

$Ar_1$ が



であり、Tが $Ar_2$ である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目 41)

$Ar_1$ が

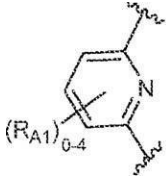
10

20

30

40

50



であり、TがAr<sub>2</sub>である、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目42)

少なくとも1つのAr<sub>2</sub>が、1つまたは複数のR<sub>A2</sub>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

10

(項目43)

少なくとも1つのAr<sub>2</sub>が、1つまたは複数のR<sub>A2</sub>で置換されていてもよい5~10員ヘテロアリールである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目44)

少なくとも1つのR<sub>A2</sub>がハロゲンである、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目45)

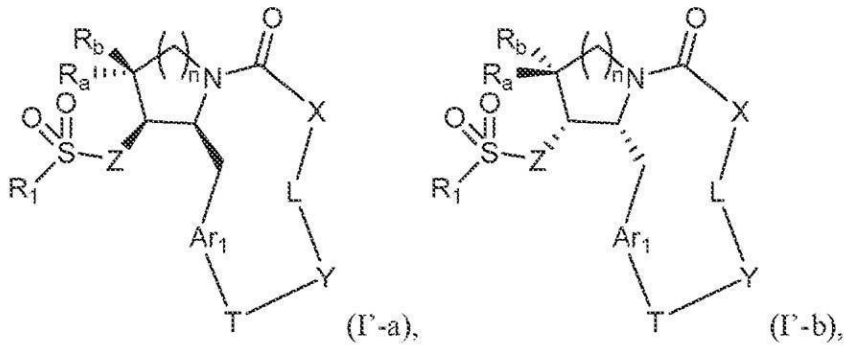
式(I'-a)、(I'-b)、(IA')、(IA'-a)、(IA'-b)、(IB')、(IB'-a)、(IB'-b)、(II')、(II'-a)、(II'-b)、(IIA')、(IIA'-a)、(IIA'-b)、(IIB')、(IIB'-a)、(IIB'-b)、(IIIA')、(IIIA'-a)、(IIIA'-b)、(IIIB')、(IIIB'-a)、もしくは(IIIB'-b)、(IVA')、(IVA'-a)、(IVA'-b)、(VA')、(VA'-a)、もしくは(VA'-b)の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、前記項目のいずれか一項記載の化合物：

20

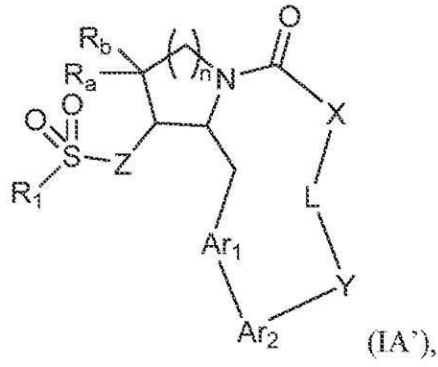
30

40

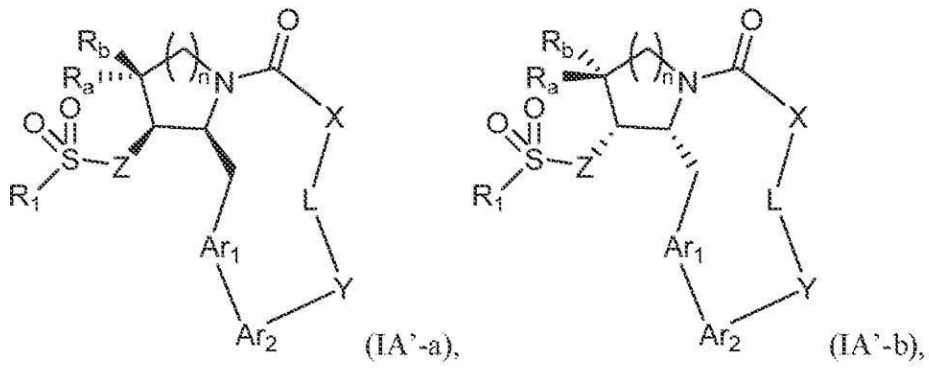
50



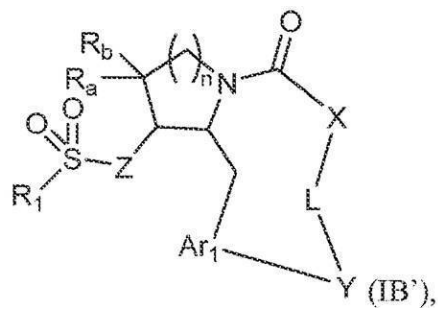
10



20



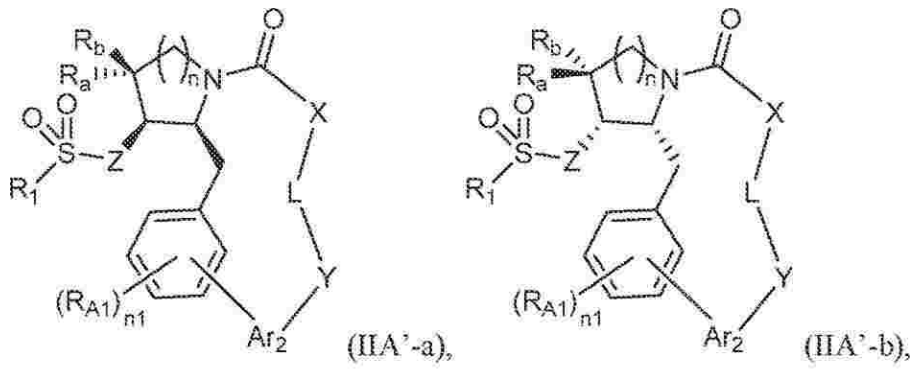
30



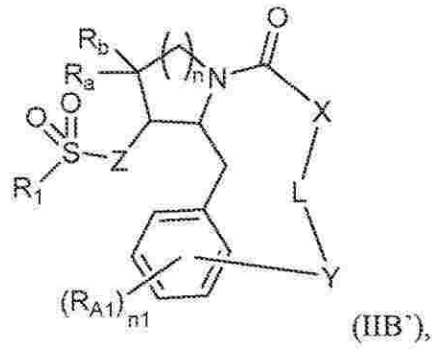
40

50

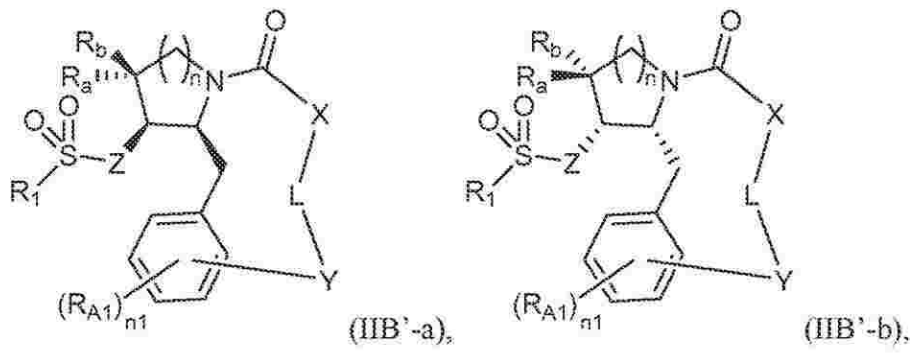




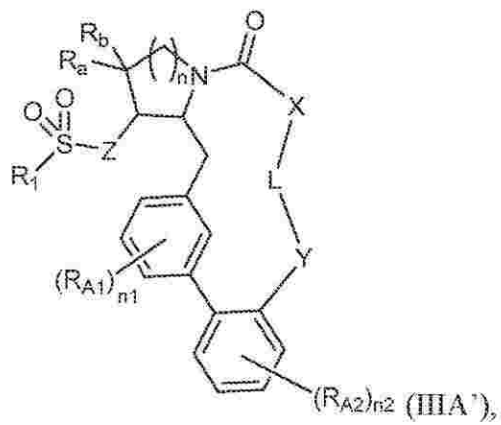
10



20

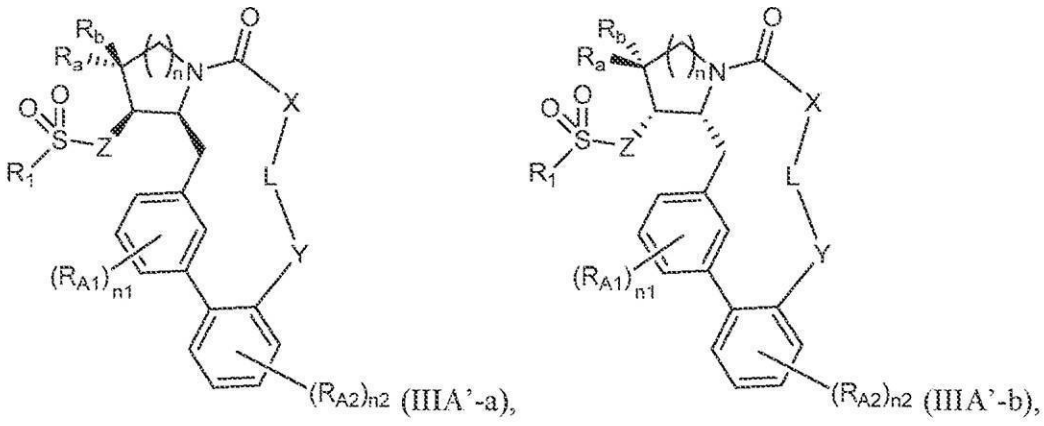


30

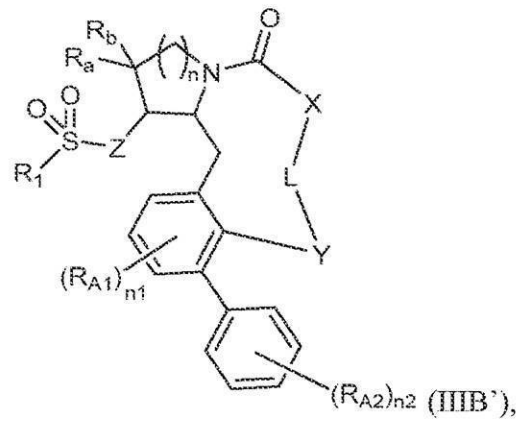


40

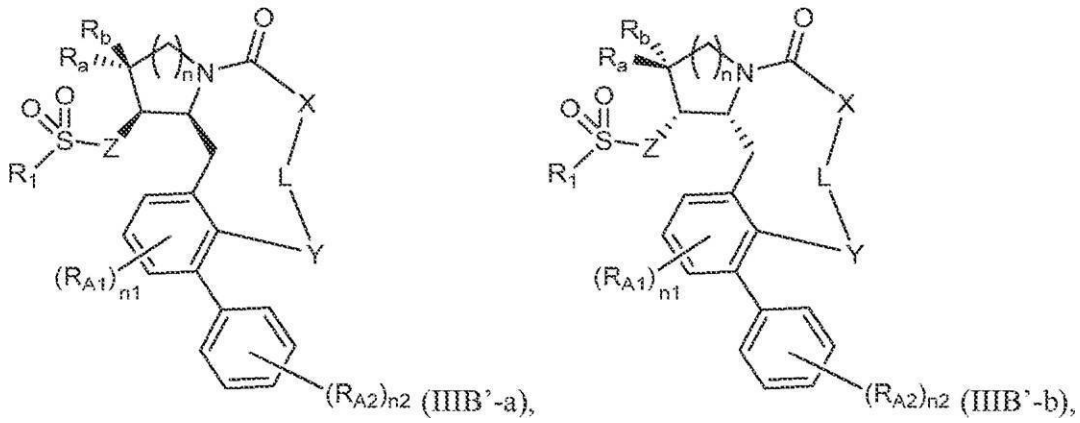
50



10



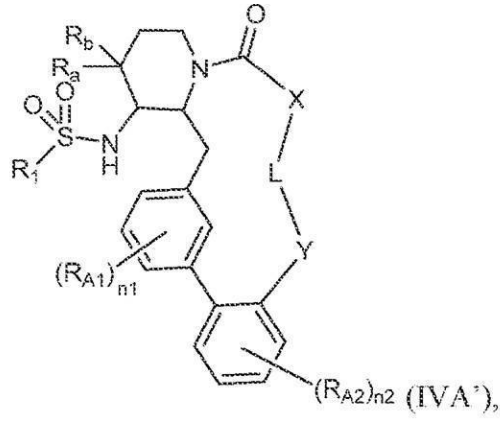
20



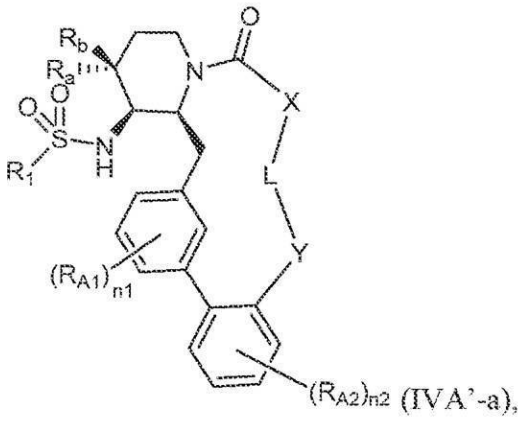
30

40

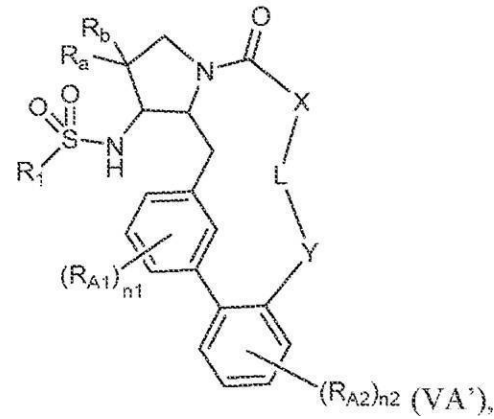
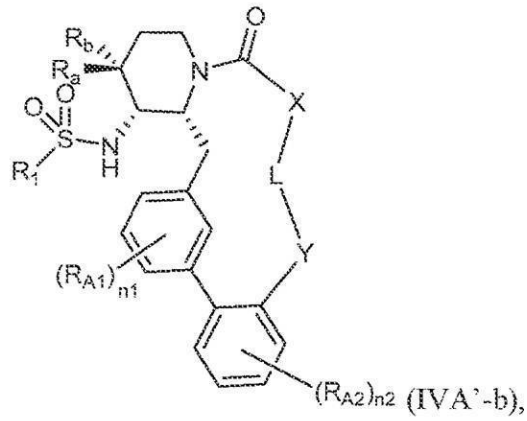
50



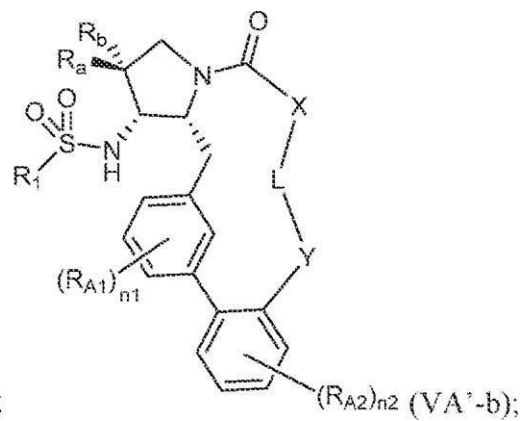
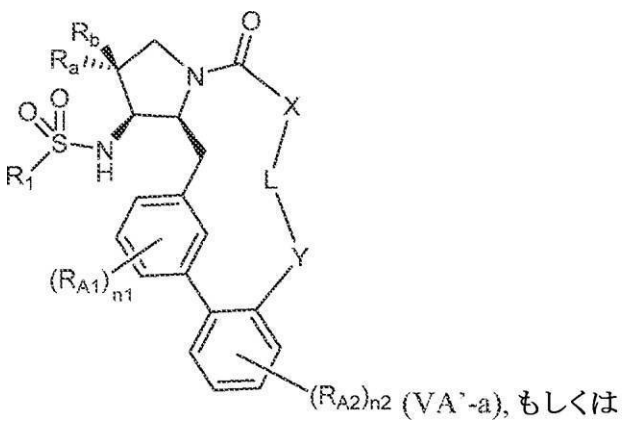
10



20



30



40

式中、

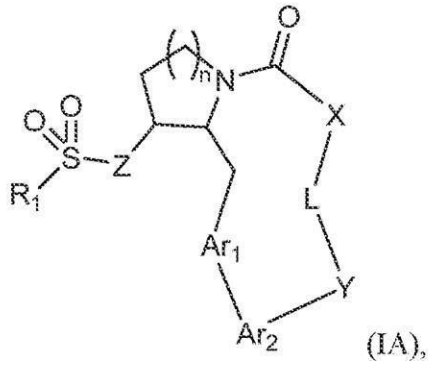
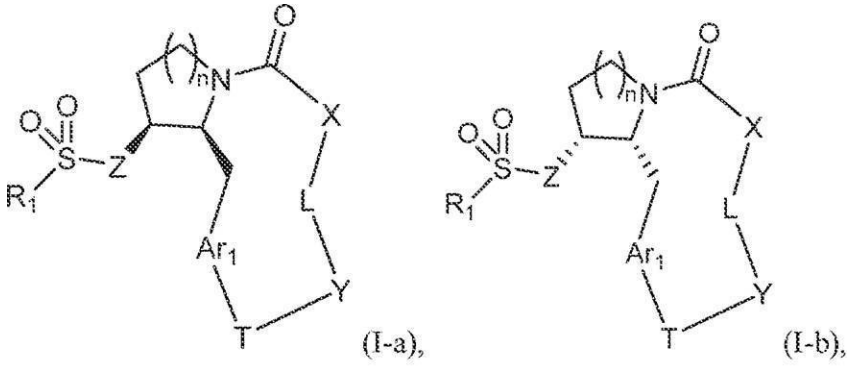
n1は、0～4の範囲の整数であり；

n2は、0～4の範囲の整数である。

50

( 項目 4 6 )

式 ( I - a )、( I - b )、( I A )、( I A - a )、( I A - b )、( I B )、( I B - a )、( I B - b )、( I I )、( I I - a )、( I I - b )、( I I A )、( I I A - a )、( I I A - b )、( I I B )、( I I B - a )、( I I B - b )、( I I I A )、( I I I A - a )、( I I I A - b )、( I I I B )、( I I I B - a )、もしくは ( I I I B - b )、( I V A )、( I V A - a )、( I V A - b )、( V A )、( V A - a )、もしくは ( V A - b ) の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、前記項目のいずれか一項記載の化合物：



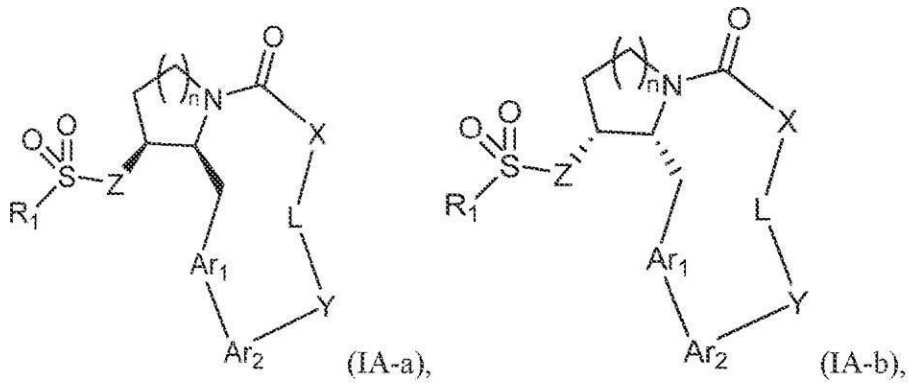
10

20

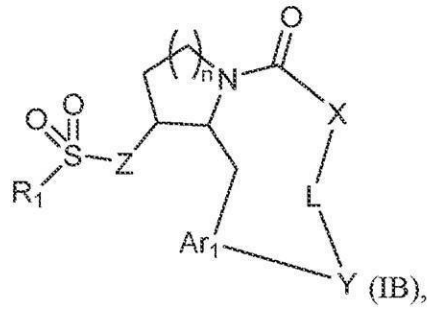
30

40

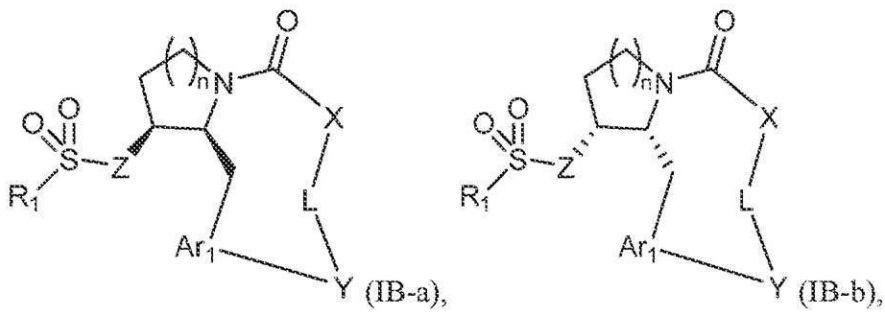
50



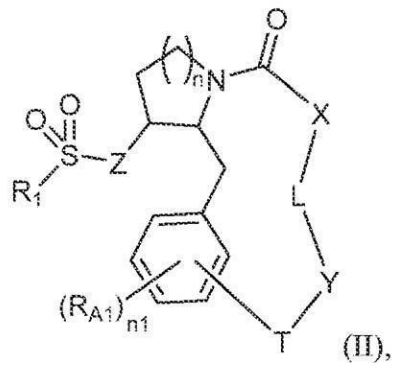
10



20

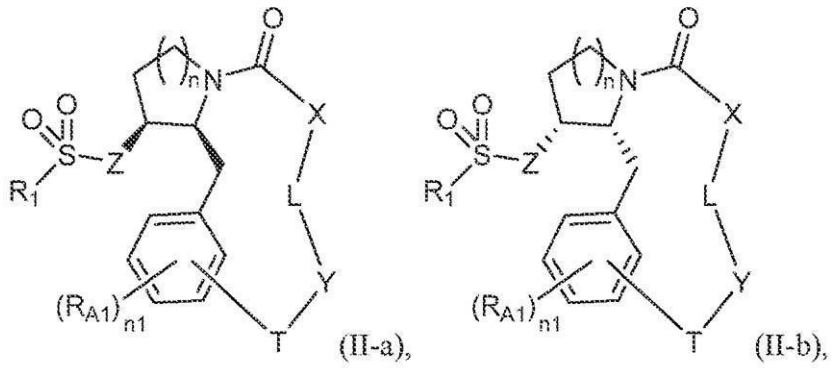


30

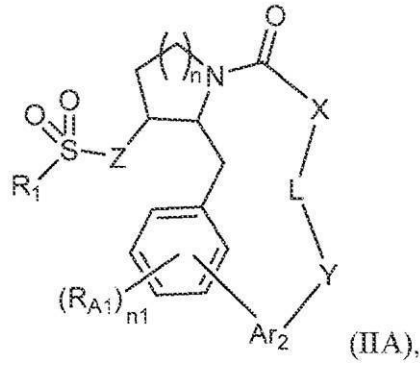


40

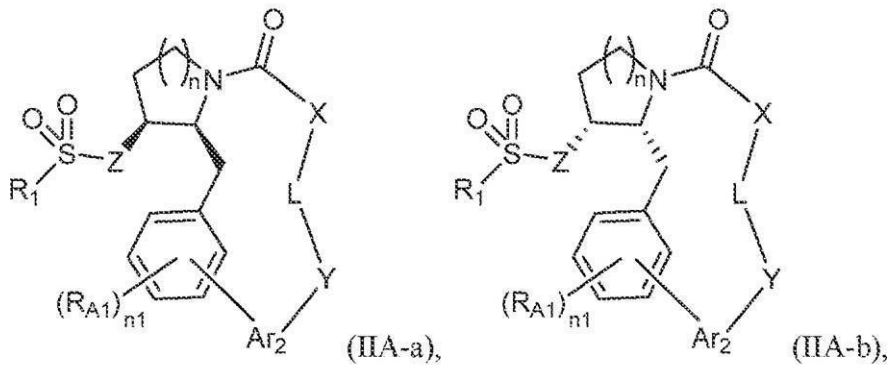
50



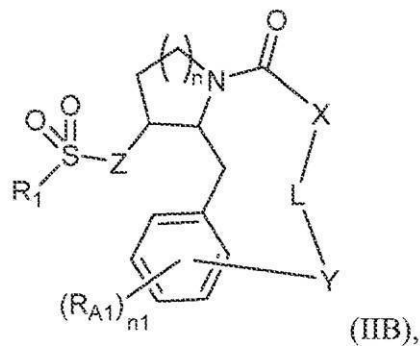
10



20

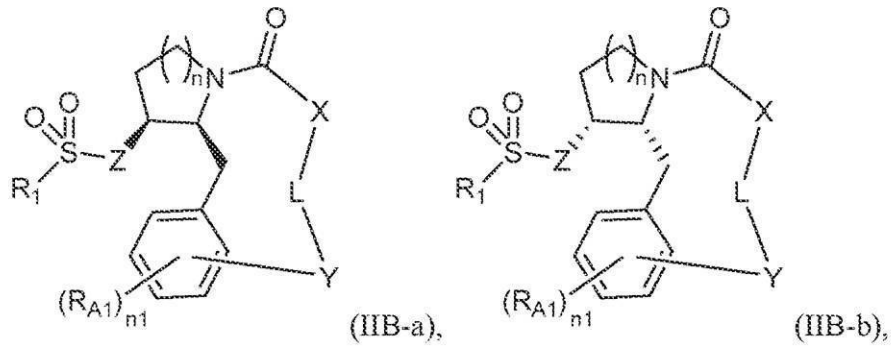


30

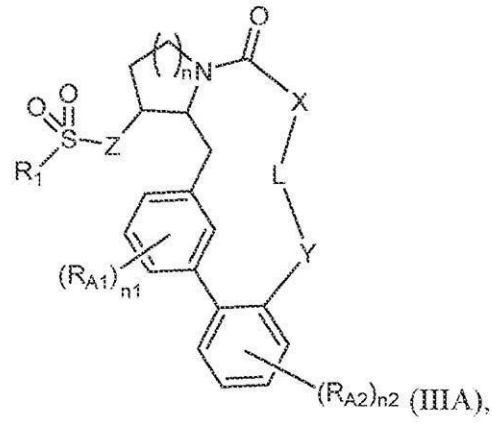


40

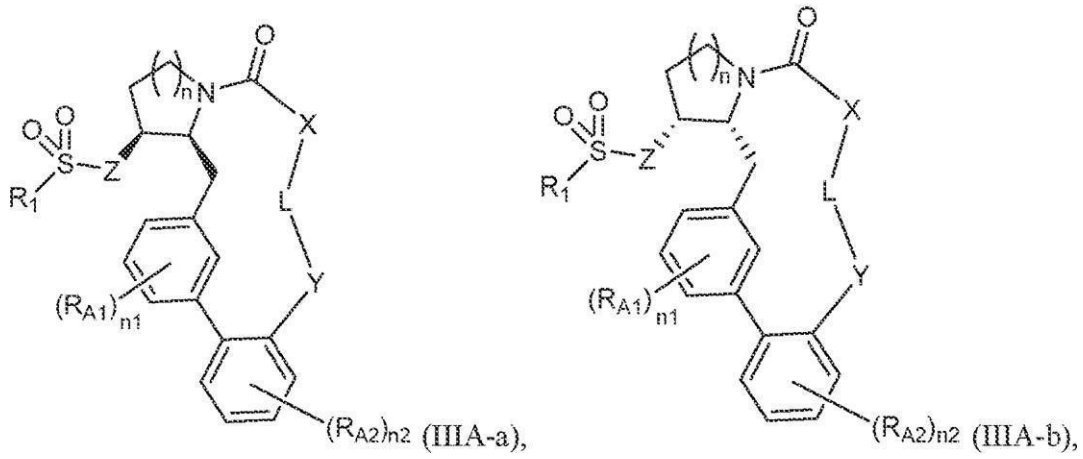
50



10



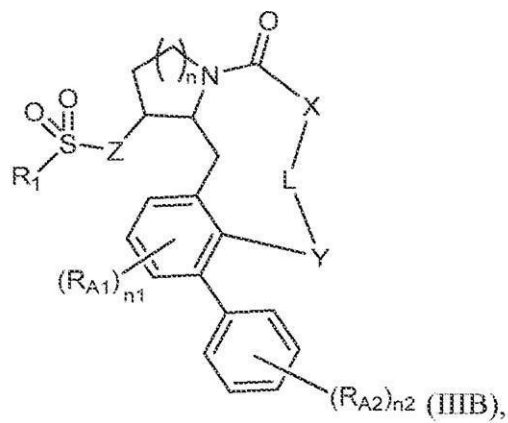
20



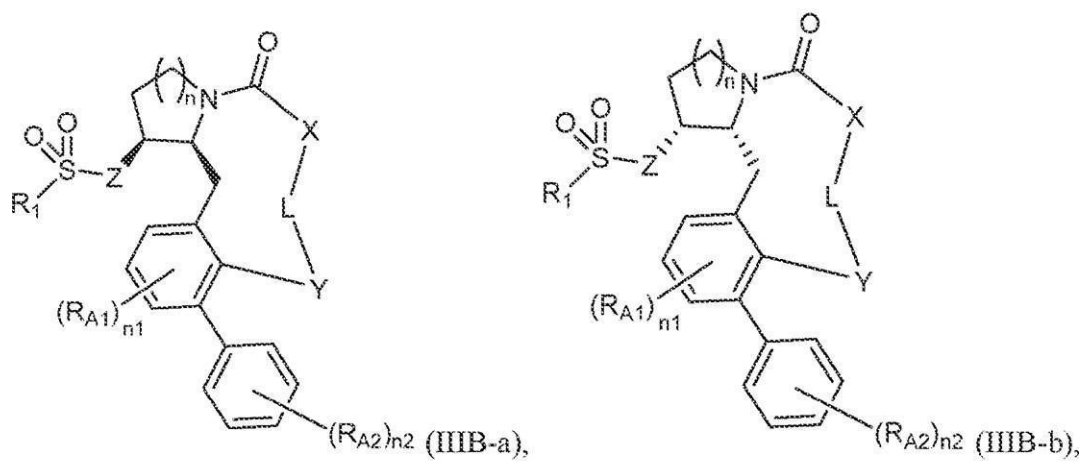
30

40

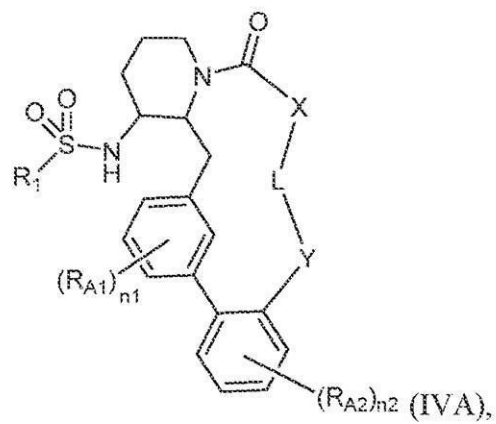
50



10



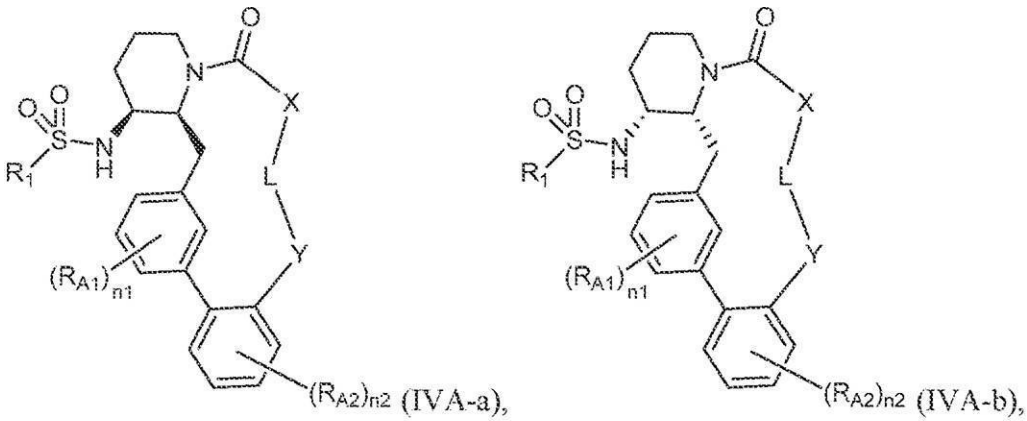
20



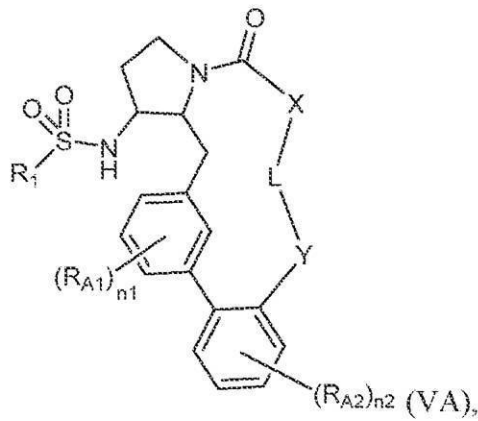
30

40

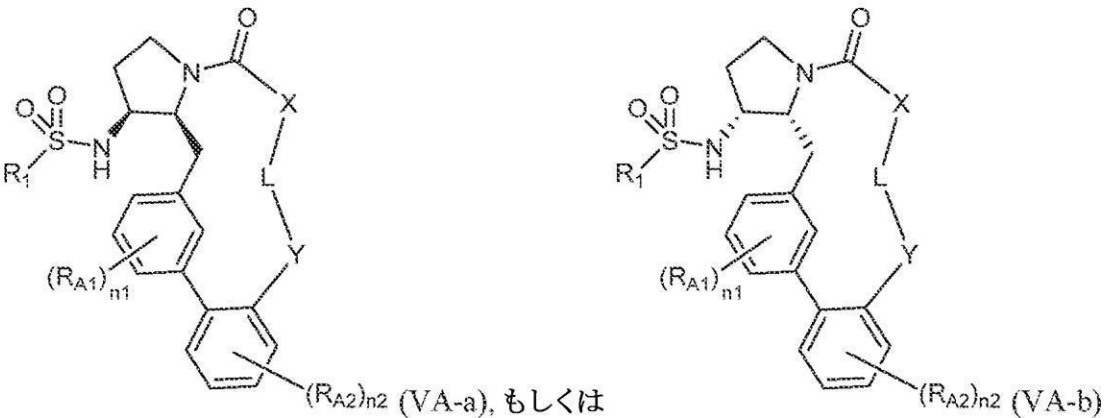
50



10



20



30

式中、

n1は、0～4の範囲の整数であり；

n2は、0～4の範囲の整数である。

(項目47)

表A1に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

40

(項目48)

表A2に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目49)

表B1に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

(項目50)

表B2に記載される化合物およびその薬学的に許容される塩より選択される、前記項目のいずれか一項記載の化合物。

50

(項目 5 1)

本明細書に記載される方法によって獲得可能な、または獲得される化合物であって、任意で、該方法が、スキーム1~5に記載される1つまたは複数の段階を含む、該化合物

(項目 5 2)

前記項目のいずれか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される希釈剤または担体とを含む、薬学的組成物。

(項目 5 3)

前記化合物が、表A1、A2、B1、およびB2に記載される化合物より選択される、前記項目のいずれか一項記載の薬学的組成物。

(項目 5 4)

細胞を前記項目のいずれか一項記載の化合物の有効量と接触させる段階を含む、オレキシン-2受容体活性をモジュレートする方法であって、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該方法。

(項目 5 5)

その必要のある対象において疾患または障害を治療または予防する方法であって、該対象に、前記項目のいずれか一項記載の化合物または薬学的組成物の治療有効量を投与する段階を含む、該方法。

(項目 5 6)

オレキシン-2受容体活性をモジュレートすることにおける使用のための、前記項目のいずれか一項記載の化合物または薬学的組成物であって、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該化合物または薬学的組成物。

(項目 5 7)

疾患または障害を治療または予防することにおける使用のための、前記項目のいずれか一項記載の化合物または薬学的組成物。

(項目 5 8)

オレキシン-2受容体活性をモジュレートするための医薬の製造における、前記項目のいずれか一項記載の化合物の使用であって、任意で、該活性がインビトロまたはインビボ活性である、該使用。

(項目 5 9)

疾患または障害を治療または予防するための医薬の製造における、前記項目のいずれか一項記載の化合物の使用。

(項目 6 0)

疾患または障害が、関係付けられたオレキシン-2受容体と関連する、前記項目のいずれか一項記載の方法、化合物、薬学的組成物、または使用。

(項目 6 1)

疾患または障害が、ナルコレプシー、過眠障害、神経変性障害、神経障害、希少遺伝性障害の症状、精神障害、メンタルヘルス障害、概日リズム障害、メタボリックシンドローム、骨粗鬆症、心不全、昏睡、または麻酔からの覚醒促進である、前記項目のいずれか一項記載の方法、化合物、薬学的組成物、または使用。

(項目 6 2)

疾患または障害が、ナルコレプシー、特発性過眠症、睡眠時無呼吸、または不眠である、前記項目のいずれか一項記載の方法、化合物、薬学的組成物、または使用。

10

20

30

40

50