

【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5年2月9日(2023.2.9)

【国際公開番号】WO2020/163248

【公表番号】特表2022-519636(P2022-519636A)

【公表日】令和4年3月24日(2022.3.24)

【年通号数】公開公報(特許)2022-052

【出願番号】特願2021-545714(P2021-545714)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 5 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 8 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 3 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 P 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 5 / 2 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

30

A 6 1 P 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 5 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 9 8 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

40

A 6 1 P 1 3 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

50

A 6 1 P 5/14(2006.01)
 A 6 1 P 3/02(2006.01)
 A 6 1 P 27/04(2006.01)
 A 6 1 P 37/08(2006.01)
 A 6 1 P 31/12(2006.01)
 A 6 1 P 17/02(2006.01)
 A 6 1 P 31/22(2006.01)
 A 6 1 P 31/04(2006.01)
 A 6 1 P 33/00(2006.01)
 A 6 1 P 27/10(2006.01)
 A 6 1 P 1/00(2006.01)
 A 6 1 P 1/04(2006.01)
 A 6 1 P 25/18(2006.01)
 A 6 1 P 9/00(2006.01)
 C 1 2 N 15/09(2006.01)

10

【 F I 】

C 0 7 D 451/04 C S P
 A 6 1 K 48/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 13/02
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 25/02 1 0 3
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 7/04
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 5/24
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 19/00
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 31/53
 C 0 7 D 451/14
 C 0 7 D 498/08
 A 6 1 K 31/5386
 C 0 7 D 519/00 3 0 1
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 3/06

20

30

40

50

A 6 1 P 25/06		
A 6 1 P 25/04		
A 6 1 P 29/00	1 0 1	
A 6 1 P 19/02		
A 6 1 P 17/06		
A 6 1 P 3/04		
A 6 1 P 27/06		
A 6 1 P 5/14		
A 6 1 P 3/02	1 0 2	
A 6 1 P 27/04		10
A 6 1 P 37/08		
A 6 1 P 31/12		
A 6 1 P 29/00		
A 6 1 P 17/02		
A 6 1 P 31/22		
A 6 1 P 31/04		
A 6 1 P 33/00		
A 6 1 P 27/10		
A 6 1 P 1/00		
A 6 1 P 1/04		20
A 6 1 P 25/18		
A 6 1 P 9/00		
C 1 2 N 15/09	Z Z N A	

【手続補正書】

【提出日】令和5年2月1日(2023.2.1)

【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

30

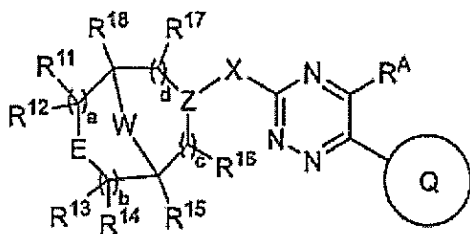
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a)式(I)の化合物であって、

【化1】



40

式(I)

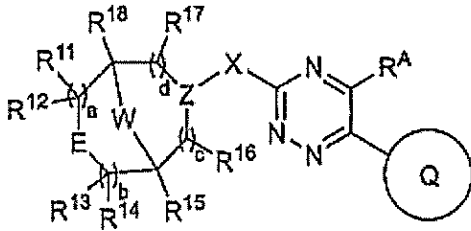
式中、

Xが、-O-、-S-、または-NR³-であり、Zが、CR²であり、R²が、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキルであり、かつ

50

R^3 が、水素、 $-CN$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、または $-C_1-C_4$ アルキレン- OR^1 である、化合物であるか、または (b) 式 (I) の化合物であって、

【化 2】



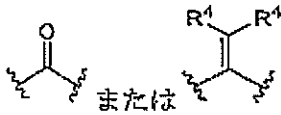
式 (I)

10

式中、

X が、

【化 3】



20

であり、

Z が、N または CR^2 であり、

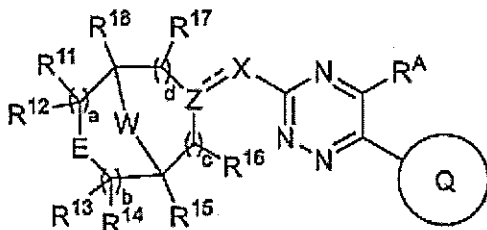
R^2 が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、かつ

30

R^4 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルである、化合物であるか、または

(c) 式 (II) の化合物であって、

【化 4】



式 (II)

40

式中、

50

【化 5】



が、単結合または二重結合であり、

Xが、

【化 6】



10

であり、Zが、Cであるか、または

Xが、

【化 7】



であり、Zが、NまたはC R²であり、

20

R²が、存在する場合、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキルであり、かつ

R⁴が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルである、化合物であって、

Eが、-NR^E-、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、または-S(=O)(=NR^E)-であり、

R^Aが、水素、重水素、F、Cl、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₄シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ヘテロシクロアルキルであり、

30

R^Eが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃アルキニルであり、

環Qが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

Wが、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換 C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

40

Rが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり、

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、およびR¹⁷が各々独立して、水素、重水素

50

、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{15} および R^{18} が、(i)同じであり、水素および重水素から選択されるか、(ii)同じであり、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択されるか、または(iii)同じではなく、水素、重水素、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

aが、0または1であり、

bが、0であり、

cが、1であり、かつ

dが、0または1である、化合物、

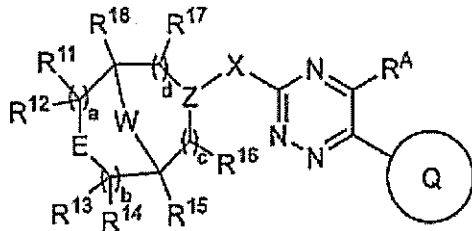
10

である化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項2】

式(I)の化合物であって、

【化8】



式(I)

20

式中、

Xが、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR^3-$ であり、

Zが、 CR^2 であり、

R^2 が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、かつ

R^3 が、水素、 $-CN$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、または $-C_1-C_4$ アルキレン $-OR^1$ である化合物である、

30

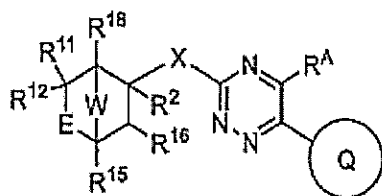
請求項1に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項3】

式(I)の前記化合物が式(Ia)の構造を有するか、または

40

【化 9】

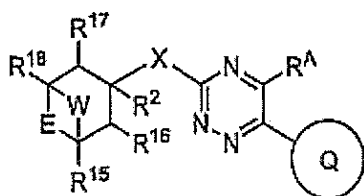


式 (I a)

10

式 (I) の前記化合物が式 (I d) の構造を有する、

【化 10】



式 (I d)

20

請求項 1 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項 4】

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールで置換された 2-ヒドロキシ-フェニルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項 5】

環 Q が、置換もしくは非置換ヘテロアリールで置換された 2-ヒドロキシ-フェニルであり、ヘテロアリールが置換される場合、それが、

30

重水素、ハロゲン、-OH、-NO₂、-CN、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、-N(R¹)₂、-C(=O)R¹、-OC(=O)R¹、-C(=O)OR¹、-C(=O)N(R¹)₂、置換もしくは非置換 C₁-C₆アルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₆アルケニル、置換もしくは非置換 C₂-C₆アルキニル、置換もしくは非置換 C₁-C₆アルコキシ、置換もしくは非置換 C₃-C₇シクロアルキル、および置換もしくは非置換 C₂-C₇ヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換され、

式中、R¹ が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 4 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

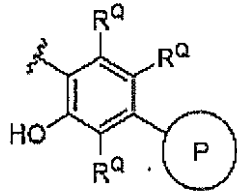
40

【請求項 6】

環 Q が

50

【化 1 1】



であり、式中、 R^Q が各々独立して、水素、重水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_2CH_3$ 、および $-OCH(CH_3)_2$ から選択され、かつ

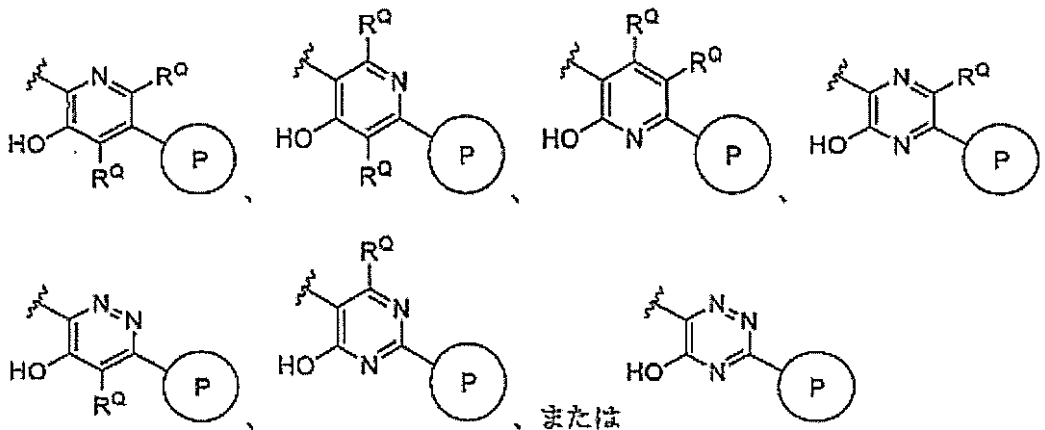
10

環Pは、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項7】

環Qが、

【化 1 2】



20

30

であり、式中、 R^Q が各々独立して、水素、重水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_2CH_3$ 、および $-OCH(CH_3)_2$ から選択され、かつ

環Pが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

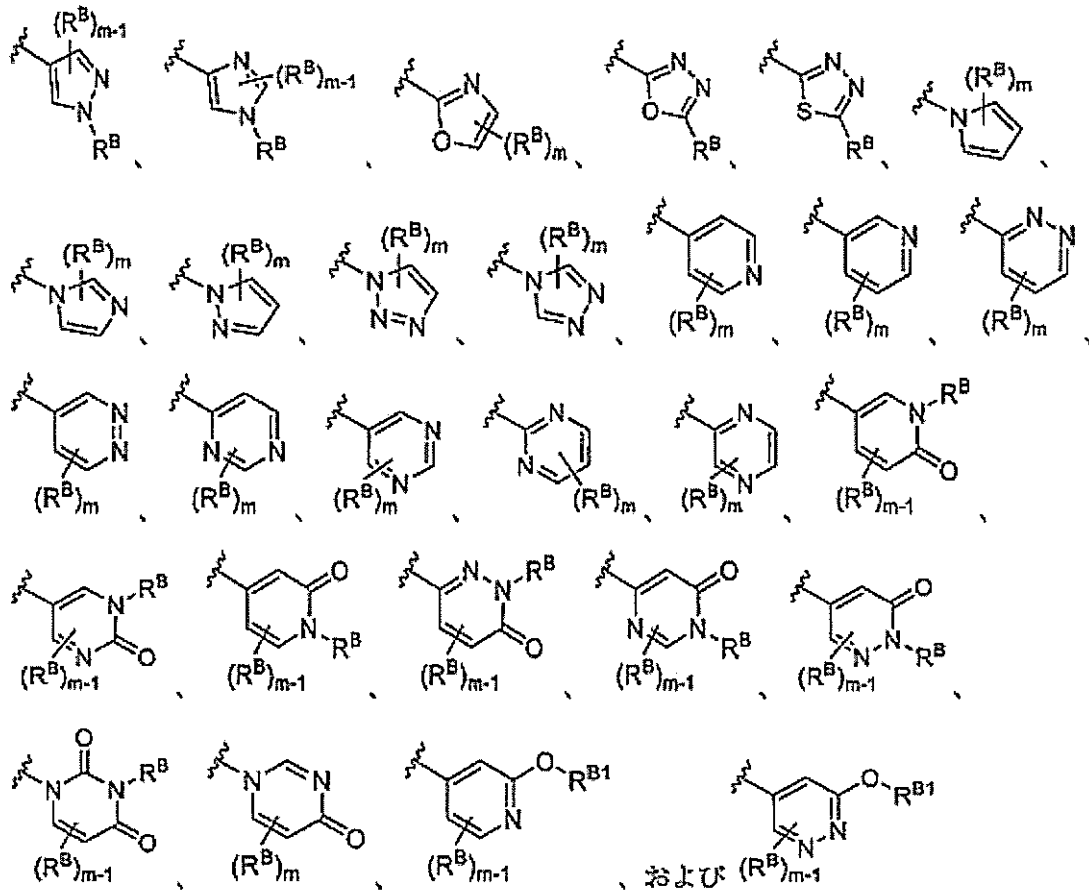
【請求項8】

環Pが、

40

50

【化 1 3】



10

20

からなる群から選択されるヘテロアリアルであり、

式中、 R^B が各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、重水素置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OC D_3$ 、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリアル、および置換もしくは非置換ヘテロアリアルから選択され、

30

R^{B1} が、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから選択され、かつ

m が、1、2、または3である、請求項6または7に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

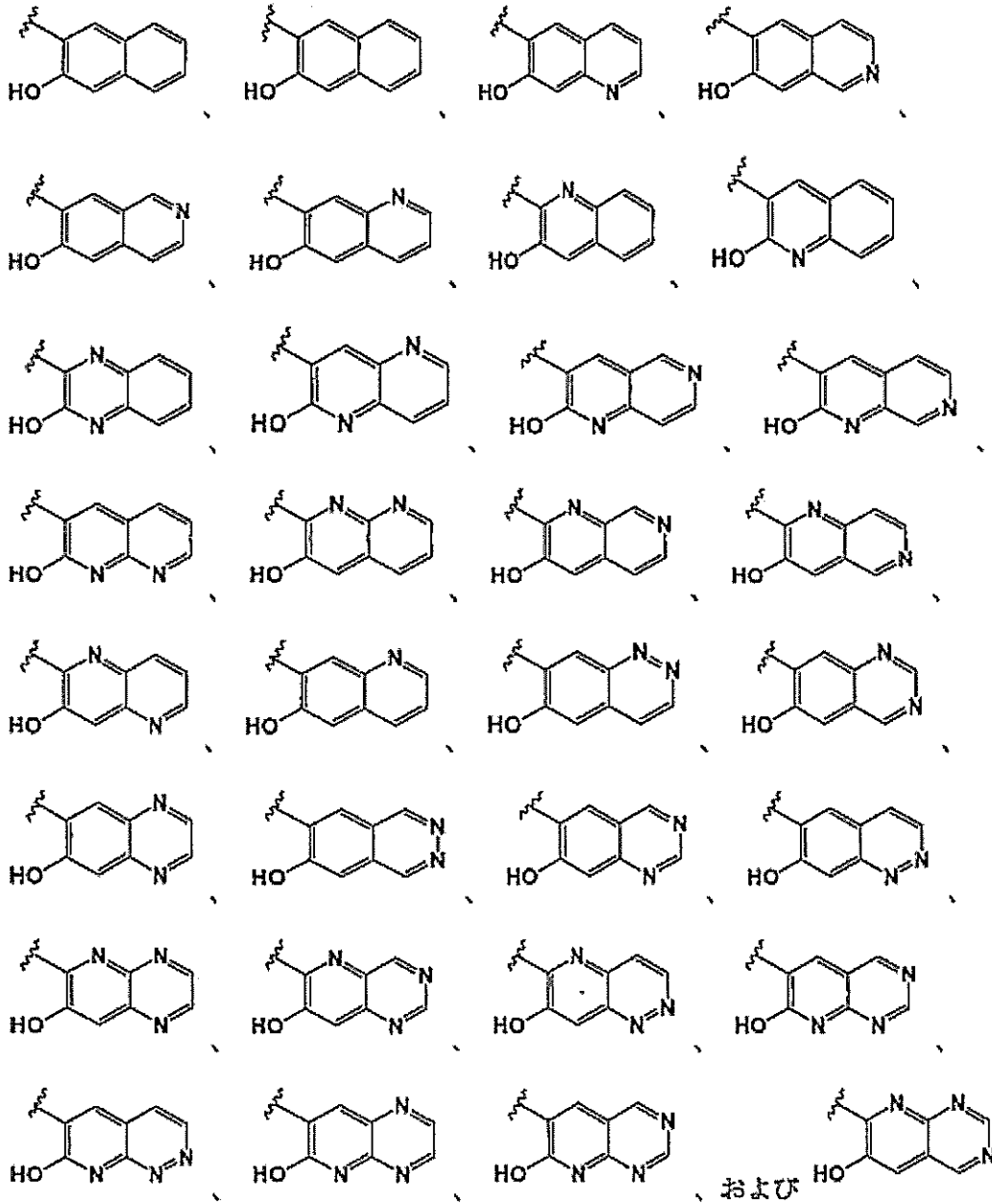
40

【請求項9】

環Qが、

50

【化 1 4】



10

20

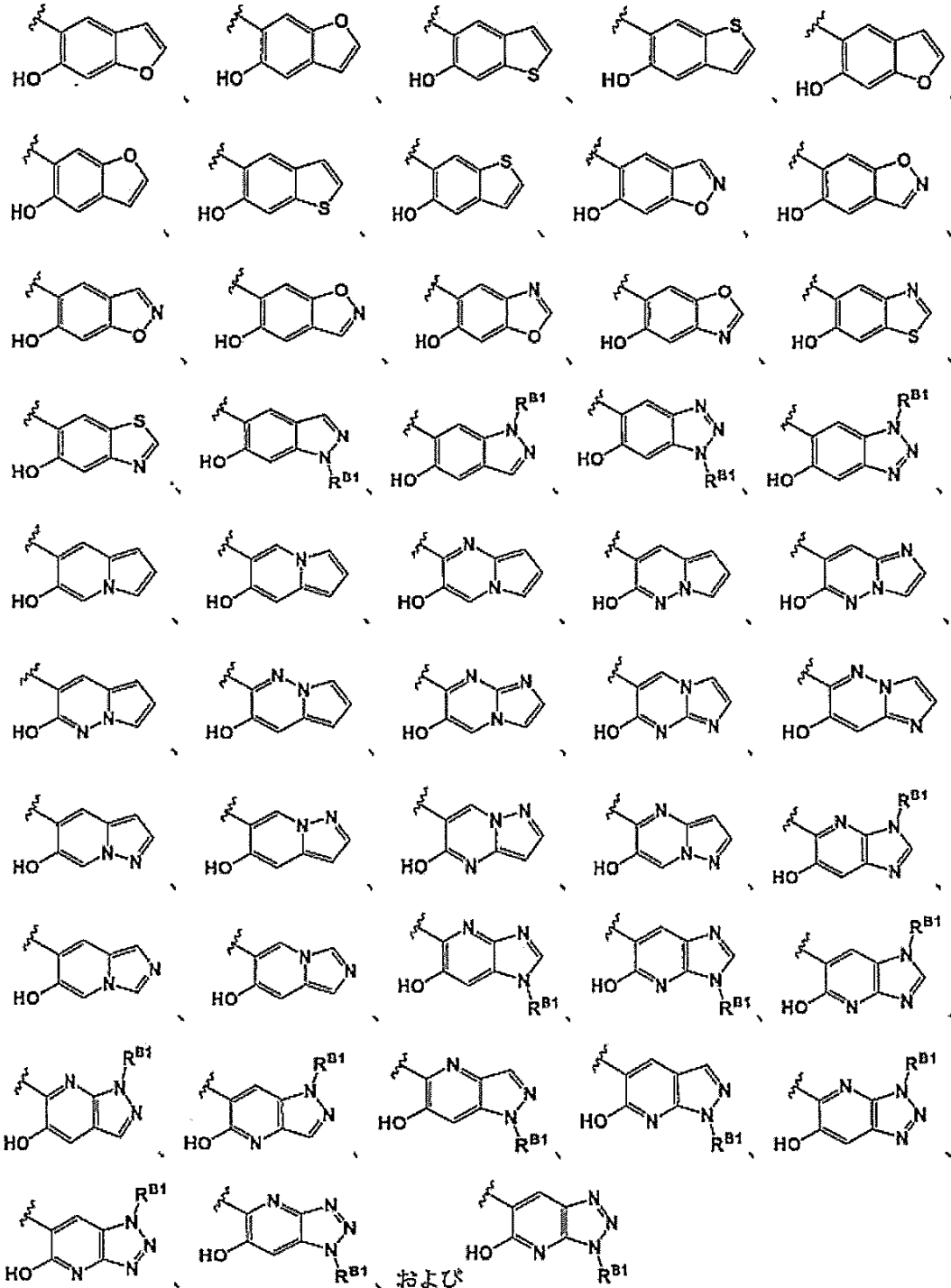
30

40

50

からなる群から選択されるか、または環 Q が、

【化 15】



10

20

30

40

からなる群から選択され、

式中、 R^{B1} が、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_{1}-C_{6}$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_{1}-C_{6}$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_{1}-C_{6}$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_{3}-7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_{2}-C_{7}$ ヘテロシクロアルキルから選択される、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項10】

Wが $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、または $-CH_2OCH_2-$ である、請求項1

50

～ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項 1 1】

R が、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、シクロプロピル、またはオキセタニルである、請求項 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項 1 2】

R^{16} および R^{17} のうちの 1 つ以上が独立して、F、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、および $-CF_3$ から選択される、請求項 1 ～ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。 10

【請求項 1 3】

R^A が水素である、請求項 1 ～ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【請求項 1 4】

R^{15} および R^{18} の両方が水素であるか、または R^{15} および R^{18} の両方が重水素である、請求項 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。 20

【請求項 1 5】

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、および R^{18} のうちの少なくとも 1 つが F であるか、または R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、および R^{18} のうちの少なくとも 1 つがフッ素を含む、請求項 1 ～ 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは薬学的に許容されるその溶媒和物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0838

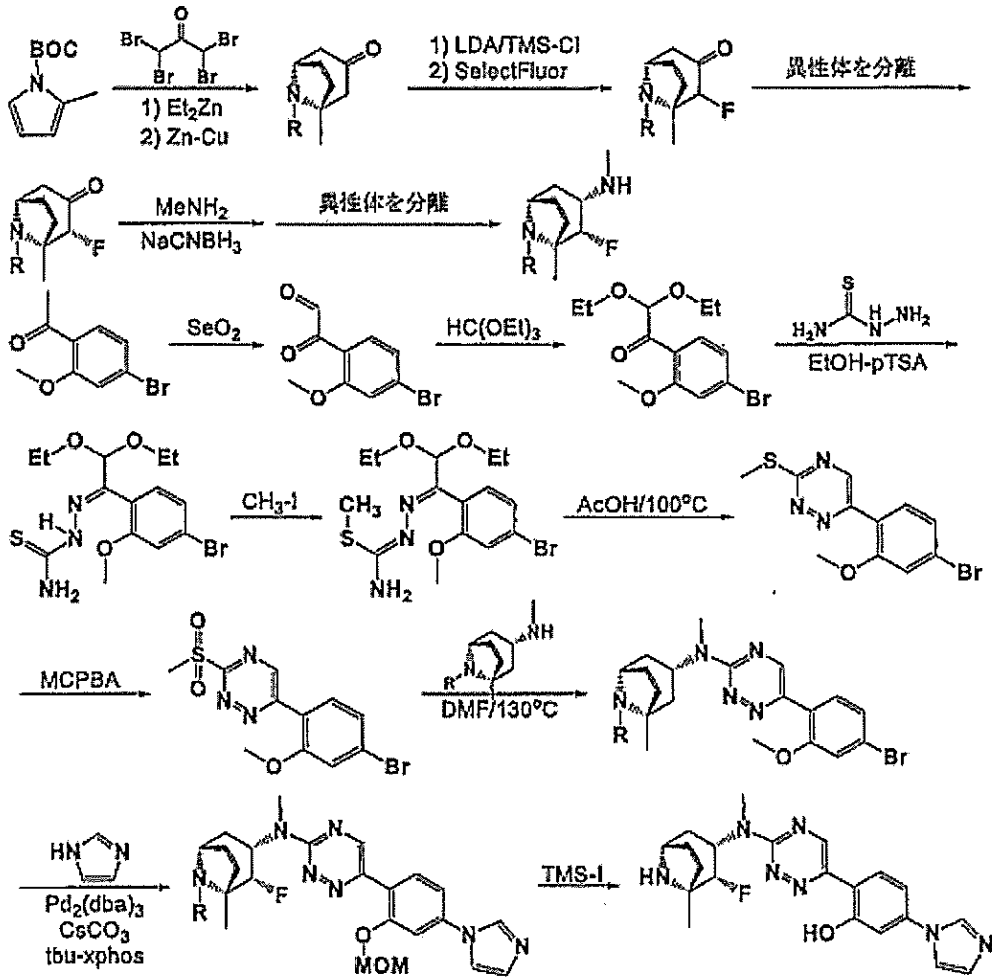
【補正方法】変更 30

【補正の内容】

【0838】

いくつかの実施形態では、本明細書に記載の S M S M を調製するためのスキームは、スキーム 75 である。

【化 2 6 4】

R = BOC = -CO₂tBu

10

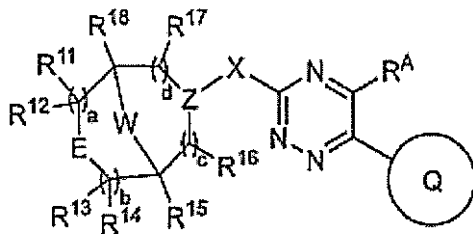
20

30

本発明は以下の発明の態様を包含する。

〔項目 1〕 式 (I) の化合物であって、

【化 2 6 5】



式 (I)

40

式中、

E が、-NR-、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、または-S(=O)(=NR^E)-であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₄シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ヘテロシクロアルキルであり、

50

R^Eが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃アルキニルであり、環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、X が、-O-、-S-、または-NR³-であり、Z が、CR²であり、

W が、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換 C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

10

R が、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり、

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R²が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキルであり、

20

R³が、水素、-CN、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、または-C₁-C₄アルキレン-OR¹であり、

R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、および R¹⁷が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R¹⁵および R¹⁸が、(i) 同じであり、水素および重水素から選択されるか、(i i) 同じであり、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択されるか、または (i i i) 同じではなく、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

30

a が、0 または 1 であり、

b が、0 であり、

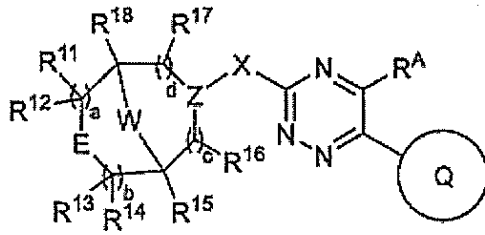
c が、1 であり、

d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 2] 式 (I) の化合物であって、

40

【化 2 6 6】



式 (I)

10

式中、

E が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

20

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

X が、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR^3-$ であり、

Z が、 CR^2 であり、

W が、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり

30

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R^2 が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、

R^3 が、水素、 $-CN$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、または $-C_1-C_4$ アルキレン $-OR^1$ であり、

40

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{16} 、および R^{17} が各々独立して、水素、重水素、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{15} および R^{18} が同じであり、水素および重水素から選択され、

a が、0 または 1 であり、

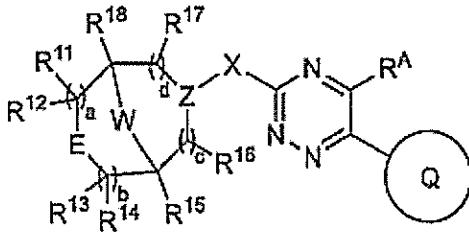
b が、0 であり、

c が、1 であり、

50

dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目3〕 式(I)の化合物であって、
【化267】



式(I)

10

式中、

Eが、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^Aが、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₄シクロアルキル、または置換もしくは非置換C₂-C₃ヘテロシクロアルキルであり、

20

R^Eが、水素、置換もしくは非置換C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換C₂-C₃アルキニルであり、

環Qが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

Xが、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR^3-$ であり、

Zが、 CR^2 であり、

Wが、置換もしくは非置換C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

30

Rが、水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり、

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

40

R²が、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキルであり、

R³が、水素、 $-CN$ 、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、または $-C_1-C_4$ アルキレン $-OR^1$ であり、

R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、およびR¹⁷が各々独立して、水素、重水素、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

50

$R^{1,5}$ および $R^{1,8}$ が同じであり、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

a が、0 または 1 であり、

b が、0 であり、

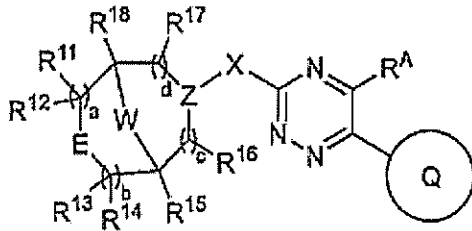
c が、1 であり、

d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 4] 式 (I) の化合物であって、

【化 268】

10



式 (I)

20

式中、

E が、 $-NR^E$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

30

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

X が、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR^3-$ であり、

Z が、 CR^2 であり、

W が、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり、

40

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R^2 が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、

R^3 が、水素、 $-CN$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは

50

は非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、または -C₁-C₄アルキレン-OR¹であり、

R^{1.1}、R^{1.2}、R^{1.3}、R^{1.4}、R^{1.6}、およびR^{1.7}が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{1.5}およびR^{1.8}が同じではなく、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

aが、0または1であり、

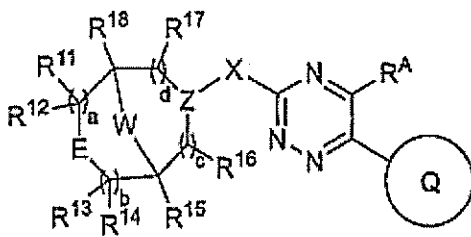
bが、0であり、

cが、1であり、

dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目5] 式(I)の化合物であって、

【化269】



式(I)

式中、

Eが、-NR-、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、または-S(=O)(=NR^E)-であり、

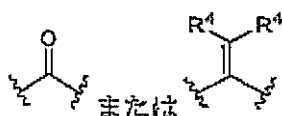
R^Aが、水素、重水素、F、Cl、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₄シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ヘテロシクロアルキルであり、

R^Eが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃アルキニルであり、

環Qが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

Xが、

【化270】



であり、

Zが、NまたはCR²であり、

Wが、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換 C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C₃-C

8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C₂-C₇ ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆ シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₅ ヘテロシクロアルキルであり、

R¹ が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆ シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R² が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキルであり、

R⁴ が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルであり、

R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、および R¹⁷ が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R¹⁵ および R¹⁸ が、(i) 同じであり、水素および重水素から選択されるか、(ii) 同じであり、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルからなる群から選択されるか、または (iii) 同じではなく、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルからなる群から選択され、

a が、0 または 1 であり、

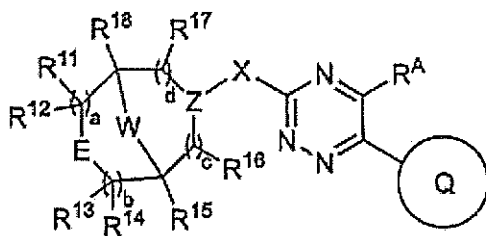
b が、0 であり、

c が、1 であり、

d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 6] 式 (I) の化合物であって、

【化 271】



式 (I)

式中、

E が、-NR^E-、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、または -S(=O)(=NR^E)- であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₄ シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ ヘテロシクロアルキルであり、

10

20

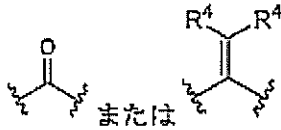
30

40

50

R^Eが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃アルキニルであり、
環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、
X が、

【化 2 7 2】



10

であり、

Z が、N または C R² であり、

W が、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換 C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり

20

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R²が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキルであり、

R⁴が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルであり、

30

R^{1 1}、R^{1 2}、R^{1 3}、R^{1 4}、R^{1 6}、および R^{1 7}が各々独立して、水素、重水素、F、-O R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{1 5}および R^{1 8}が同じであり、F、-O R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

a が、0 または 1 であり、

b が、0 であり、

c が、1 であり、

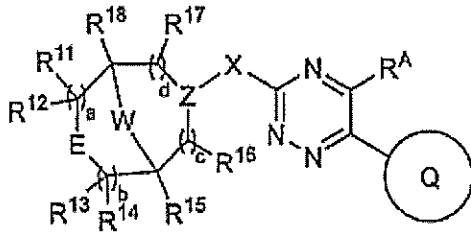
d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

40

[項目 7] 式 (I) の化合物であって、

50

【化 2 7 3】



式 (I)

10

式中、

E が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

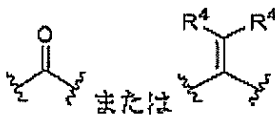
R^A が、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

X が、

【化 2 7 4】



または

であり、

Z が、N または CR^2 であり、

W が、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり、

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R^2 が、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、

R^4 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルであり、

30

40

50

R^{1 1}、R^{1 2}、R^{1 3}、R^{1 4}、R^{1 6}、およびR^{1 7}が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{1 5}およびR^{1 8}が同じではなく、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

aが、0または1であり、

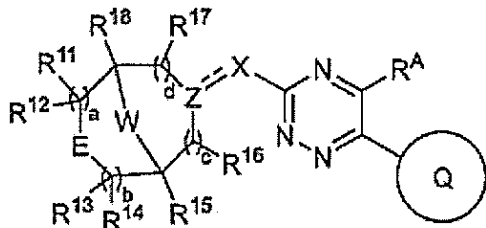
bが、0であり、

cが、1であり、

dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【項目8】 式(I I)の化合物であって、

【化275】



式(I I)

式中、

Eが、-NR^E-、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、または-S(=O)(=NR^E)-であり、

R^Aが、水素、重水素、F、C₁、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₄シクロアルキル、または置換もしくは非置換C₂-C₃ヘテロシクロアルキルであり、

R^Eが、水素、置換もしくは非置換C₁-C₃アルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₃アルケニル、または置換もしくは非置換C₂-C₃アルキニルであり、

環Qが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

【化276】



が、単結合または二重結合であり、

Xが、

【化277】



であり、Zが、Cであるか、または

Xが、

10

20

30

40

50

【化 2 7 8】



であり、Zが、Nまたは CR^2 であり、

Wが、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

Rが、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり、

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R^2 が、存在する場合、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、

R^4 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルであり、

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{16} 、および R^{17} が各々独立して、水素、重水素、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{15} および R^{18} が、(i)同じであり、水素および重水素から選択されるか、(ii)同じであり、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択されるか、または(iii)同じではなく、水素、重水素、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

aが、0または1であり、

bが、0であり、

cが、1であり、

dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目9] 式(II)の化合物であって、

10

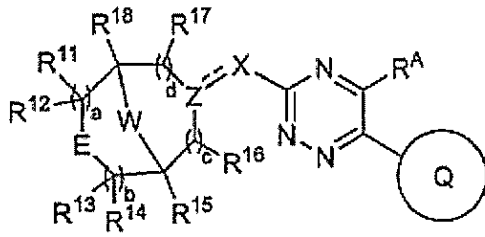
20

30

40

50

【化 2 7 9】



式 (I I)

10

式中、

E が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

20

【化 2 8 0】



が、単結合または二重結合であり、

X が、

【化 2 8 1】

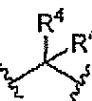


30

であり、Z が、C であるか、または

X が、

【化 2 8 2】



40

であり、Z が、N または CR^2 であり、

W が、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり

50

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R^2 が、存在する場合、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキルであり、

R^4 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルであり、

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{16} 、および R^{17} が各々独立して、水素、重水素、 F 、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{15} および R^{18} が同じであり、水素および重水素から選択され、

a が、0 または 1 であり、

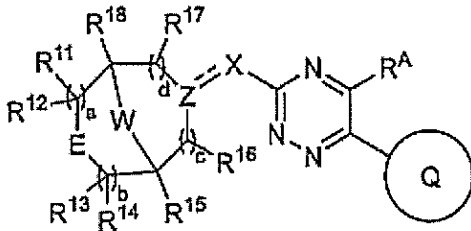
b が、0 であり、

c が、1 であり、

d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 10] 式 (II) の化合物であって、

【化 283】



式 (II)

式中、

E が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^A が、水素、重水素、 F 、 Cl 、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

【化 284】

が、単結合または二重結合であり、

X が、

10

20

30

40

50

【化 2 8 5】



であり、Zが、Cであるか、または

Xが、

【化 2 8 6】



10

であり、Zが、NまたはC R²であり、

Wが、置換もしくは非置換 C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換 C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換 C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

Rが、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり、

20

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R²が、存在する場合、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキルであり、

R⁴が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、-C D₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルであり、

30

R^{1.1}、R^{1.2}、R^{1.3}、R^{1.4}、R^{1.6}、およびR^{1.7}が各々独立して、水素、重水素、F、-O R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{1.5}およびR^{1.8}が同じであり、F、-O R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

aが、0または1であり、

bが、0であり、

cが、1であり、

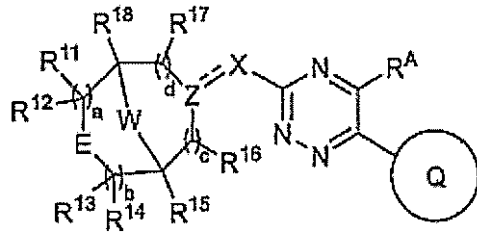
dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

40

[項目 1 1] 式 (I I) の化合物であって、

50

【化 2 8 7】



式 (I I)

10

式中、

E が、 $-NR-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、または $-S(=O)(=NR^E)-$ であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_4 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニル、または置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルキニルであり、

20

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

【化 2 8 8】



が、単結合または二重結合であり、

X が、

【化 2 8 9】



30

であり、Z が、C であるか、または

X が、

【化 2 9 0】



40

であり、Z が、N または CR^2 であり、

W が、置換もしくは非置換 C_1-C_3 アルキレン、置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレン、置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレン、または置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキレンであり、

R が、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキルであり、

R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$

50

置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆ シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R²が、存在する場合、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキルであり、

R⁴が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルであり、

R^{1.1}、R^{1.2}、R^{1.3}、R^{1.4}、R^{1.6}、および R^{1.7} が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R^{1.5} および R^{1.8} が同じではなく、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキルからなる群から選択され、

a が、0 または 1 であり、

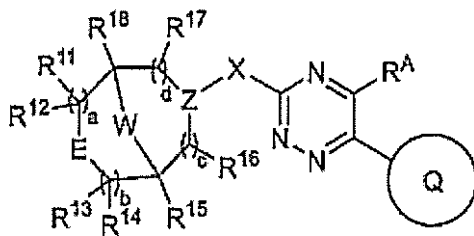
b が、0 であり、

c が、1 であり、

d が、0 または 1 である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 1.2] 式 (I) の化合物であって、

【 化 2.9.1 】



式 (I)

式中、

E が、-NR⁻、-O⁻、-S⁻、-S(=O)⁻、-S(=O)₂⁻、または -S(=O)(=NR^E)⁻ であり、

R^A が、水素、重水素、F、Cl、-CN、-OR¹、-SR¹、-S(=O)R¹、-S(=O)₂R¹、置換もしくは非置換 C₁-C₄ アルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ハロアルキル、置換もしくは非置換 C₁-C₄ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₄ シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ ヘテロシクロアルキルであり、

R^E が、水素、置換もしくは非置換 C₁-C₃ アルキル、置換もしくは非置換 C₃-C₆ シクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₅ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換 C₂-C₃ アルケニル、または置換もしくは非置換 C₂-C₃ アルキニルであり、

環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

X が、

10

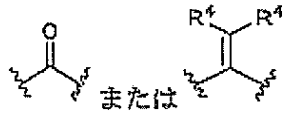
20

30

40

50

【化 2 9 2】



であり、

Zが、NまたはCR²であり、

Wが、置換もしくは非置換C₁-C₃アルキレン、置換もしくは非置換C₂-C₃アルケニレン、置換もしくは非置換C₁-C₂ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換C₃-C₈シクロアルキレン、または置換もしくは非置換C₂-C₇ヘテロシクロアルキレンであり、

Rが、水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、または置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキルであり、

R¹が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキル、置換もしくは非置換C₃-C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換C₂-C₅ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

R²が、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、-CD₃、または置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキルであり、

R⁴が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、-CD₃、置換もしくは非置換C₁-C₄ハロアルキル、または置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキルであり、

R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁶、およびR¹⁷が各々独立して、水素、重水素、F、-OR¹、置換もしくは非置換C₁-C₄アルキル、置換もしくは非置換C₁-C₄フルオロアルキル、および置換もしくは非置換C₁-C₄ヘテロアルキルからなる群から選択され、

R¹⁵およびR¹⁸が同じであり、水素および重水素から選択され、

aが、0または1であり、

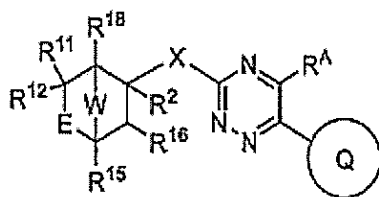
bが、0であり、

cが、1であり、

dが、0または1である、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目13] 式(I)の前記化合物が式(Ia)の構造を有する、項目12に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【化 2 9 3】



式 (I a)

10

20

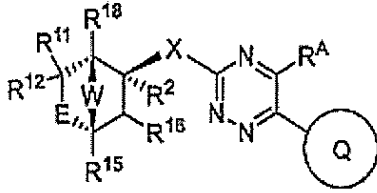
30

40

50

[項目 1 4] 式 (I) の前記化合物が式 (I b) の構造を有する、項目 1 2 または 1 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【化 2 9 4】

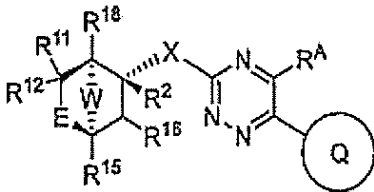


式 (I b)

10

[項目 1 5] 式 (I) の前記化合物が式 (I c) の構造を有する、項目 1 2 または 1 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【化 2 9 5】

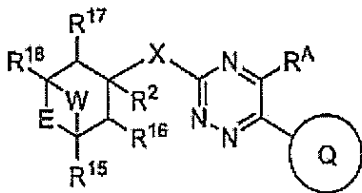


式 (I c)

20

[項目 1 6] 式 (I) の前記化合物が式 (I d) の構造を有する、項目 1 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【化 2 9 6】



式 (I d)

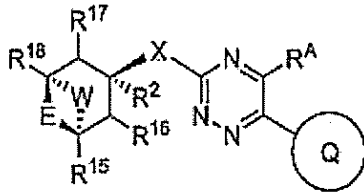
30

[項目 1 7] 式 (I) の前記化合物が式 (I e) の構造を有する、項目 1 2 または 1 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

40

50

【化 2 9 7】

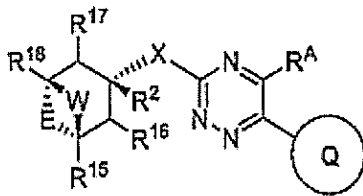


式 (I e)

10

〔項目 1 8〕 式 (I) の前記化合物が式 (I f) の構造を有する、項目 1 2 または 1 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

【化 2 9 8】



式 (I f)

20

〔項目 1 9〕 環 Q が置換もしくは非置換アリールである、項目 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 0〕 環 Q が、

重水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-C(=O)R^1$ 、 $-OC(=O)R^1$ 、 $-C(=O)OR^1$ 、 $-C(=O)N(R^1)_2$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_6 アルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_6 アルケニル、置換もしくは非置換 C_2-C_6 アルキニル、置換もしくは非置換 C_1-C_6 アルコキシ、置換もしくは非置換 C_3-C_7 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_7 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、および置換もしくは非置換ヘテロアリールから独立して選択される 1、2、または 3 個の置換基で置換された 2-ヒドロキシ-フェニルであり、

30

式中、 R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_6 シクロアルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 9 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

40

〔項目 2 1〕 環 Q が、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールで置換された 2-ヒドロキシ-フェニルである、項目 2 0 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 2〕 環 Q が、置換もしくは非置換アリールで置換された 2-ヒドロキシ-フェニルであり、アリールが置換される場合、それが、

重水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-C(=O)R^1$ 、 $-OC(=O)R^1$ 、 $-C(=O)OR^1$ 、 $-C(=O)N(R^1)_2$ 、置換もしくは非置換 C_1-C_6 アルキル、置換もしくは非置換 C_2-C_6 アルケニル、置換もしくは非置換 C_2-C_6 アルキニル、置換もしくは非置換 C_1-C_6 アルコキシ、置換もしくは非置換 C_3-C_7 シクロアルキル、および置換もし

50

くは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換され、

式中、 R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_5$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 2 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

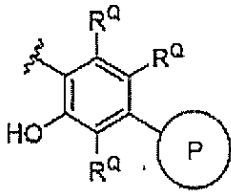
〔項目 2 3〕 環 Q が、置換もしくは非置換ヘテロアリールで置換された 2-ヒドロキシ-フェニルであり、ヘテロアリールが置換される場合、それが、

重水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-C(=O)R^1$ 、 $-OC(=O)R^1$ 、 $-C(=O)OR^1$ 、 $-C(=O)N(R^1)_2$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換もしくは非置換 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換され、

式中、 R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_5$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 2 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 4〕 環 Q が

【化 2 9 9】



であり、式中、 R^Q が各々独立して、水素、重水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_2CH_3$ 、および $-OCH(CH_3)_2$ から選択され、環 P は、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 5〕 環 Q が置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 6〕 環 Q が置換もしくは非置換 5 員もしくは 6 員単環式ヘテロアリールである、項目 2 5 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 7〕 環 Q が置換もしくは非置換 6 員単環式ヘテロアリールである、項目 2 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目 2 8〕 環 Q が、以下から選択される 6 員単環式ヘテロアリールであり、環 Q が、

10

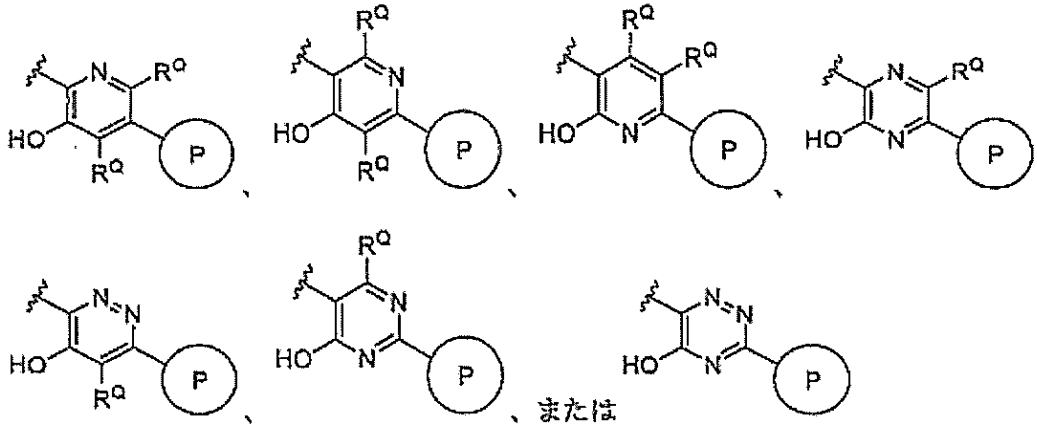
20

30

40

50

【化 3 0 0】



であり、式中、 R^Q が各々独立して、水素、重水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_2CH_3$ 、および $-OCH(CH_3)_2$ から選択され、環Pが、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目27に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

20

〔項目29〕 R^Q が各々独立して、水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、または $-OCH_3$ から選択される、項目24または28に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目30〕 環Pが置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目24または28に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物

〔項目31〕 環Pが、

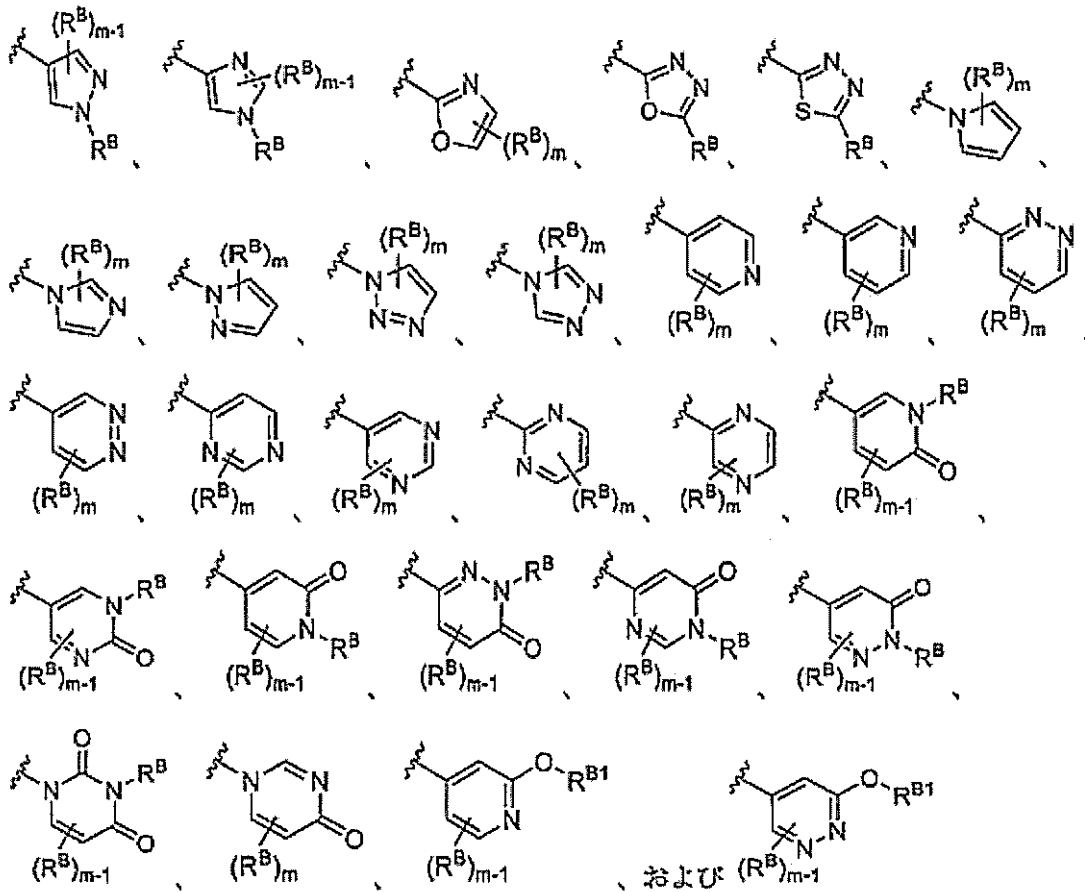
30

30

40

50

【化 3 0 1】



10

20

からなる群から選択されるヘテロアリーールであり、
 式中、

30

式中、 R^B が各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、重水素置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OCD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリーール、および置換もしくは非置換ヘテロアリーールから選択され、

R^{B1} が、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

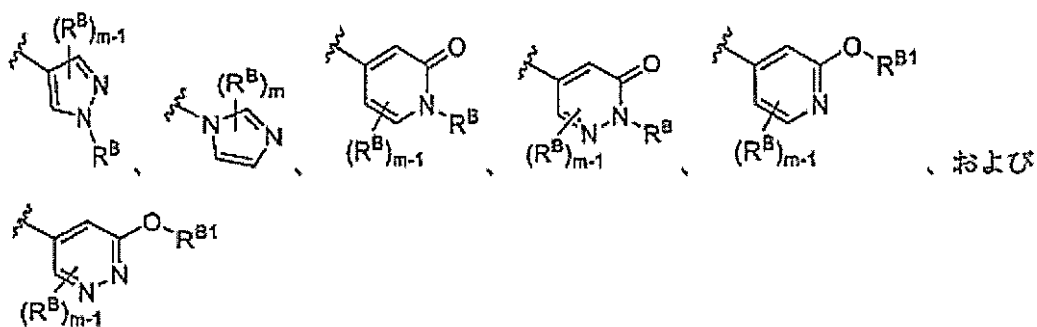
40

m が、1、2、または3である、項目30に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 3 2] 環 P が、

50

【化 3 0 2】



10

からなる群から選択されるヘテロアリアルであり、

式中、 R^B が各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、重水素置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OCD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリアル、および置換もしくは非置換ヘテロアリアルから選択され、

20

R^{B1} が、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

m が、1、2、または3である、項目30に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目33〕 R^B が各々独立して、水素、重水素、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-CN$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OH$

、または $-OCH_3$ から選択される、項目31または32に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

30

〔項目34〕 R^B が各々独立して、 H 、 $-F$ 、または $-OCH_3$ である、項目33に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目35〕 R^{B1} が、水素、重水素、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、または $-CD_3$ から選択される、項目31または32に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目36〕 m が、0または1である、項目31または32に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目37〕 環Qが、

重水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-SR^1$ 、 $-S(=O)R^1$ 、 $-S(=O)_2R^1$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-C(=O)R^1$ 、 $-OC(=O)R^1$ 、 $-C(=O)OR^1$ 、 $-C(=O)N(R^1)_2$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換もしくは非置換 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリアル、および置換もしくは非置換ヘテロアリアルから独立して選択される0、1、および2個の置換基で3位が置換された2-ナフチルであり、

40

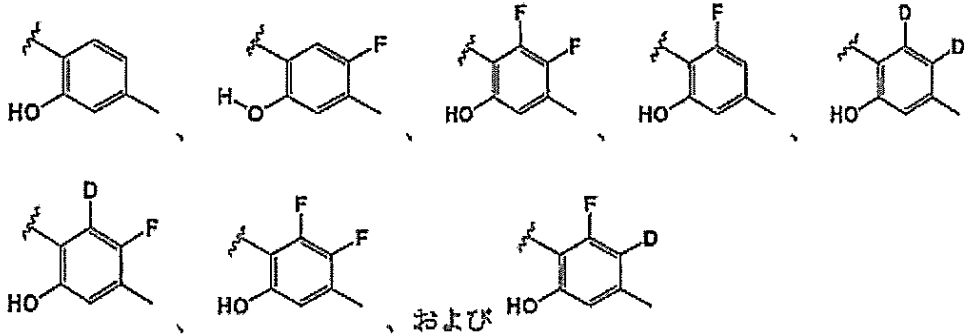
式中、 R^1 が各々独立して、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換もしくは非置換 $C_2 - C$

50

5 ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 18 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 38] 環 Q が、

【化 303】

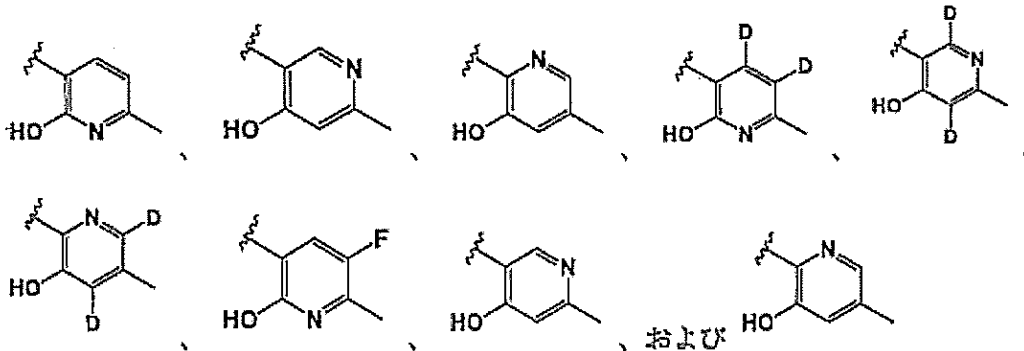


10

からなる群から選択される、項目 1 ~ 18 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 39] 環 Q が、

【化 304】



20

30

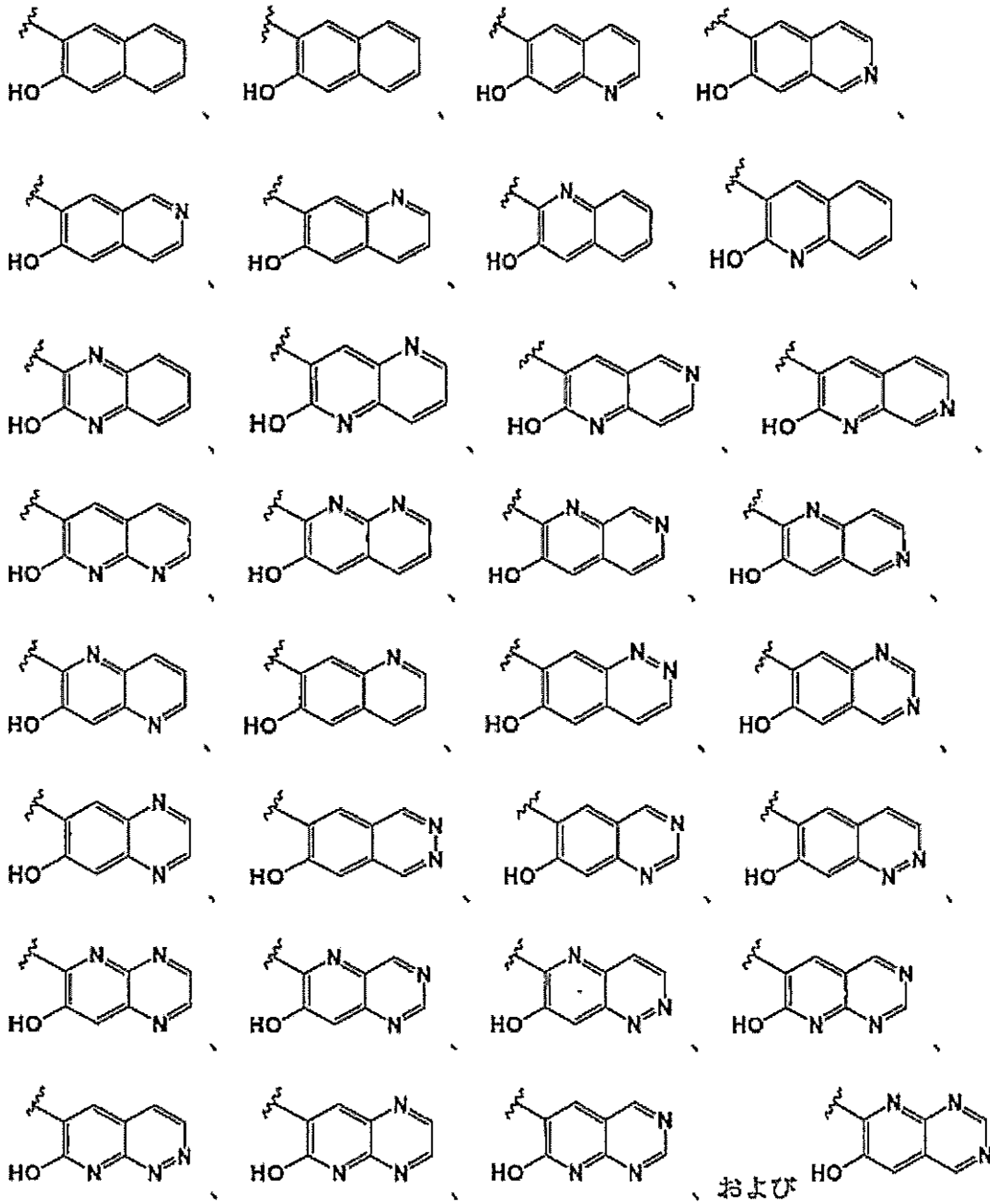
からなる群から選択される、項目 1 ~ 18 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 40] 環 Q が、

40

50

【化 3 0 5】



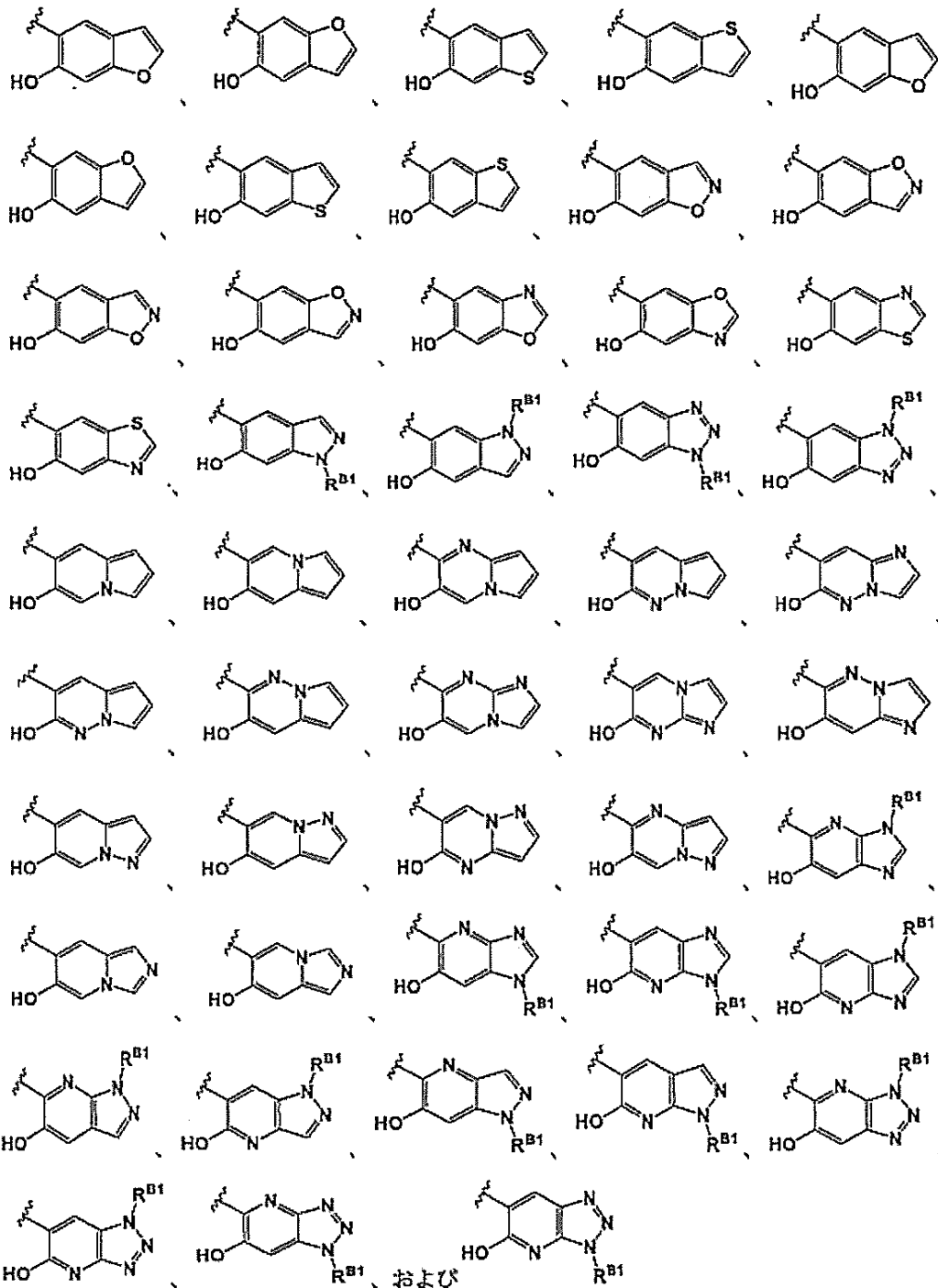
からなる群から選択される、項目 1 ~ 18 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目 4 1] 環 Q が、

40

50

【化 3 0 6】



からなる群から選択され、

式中、 R^{B1} が、水素、重水素、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CD_3$ 、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、置換もしくは非置換 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 $C_3 - 7$ シクロアルキル、および置換もしくは非置換 $C_2 - C_7$ ヘテロシクロアルキルから選択される、項目1～18のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目42] W が置換もしくは非置換 $C_1 - C_3$ アルキレンである、項目1～41のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される

10

20

30

40

50

溶媒和物。

〔項目43〕 Wが $-CH_2-$ である、項目42に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目44〕 Wが $-CH_2CH_2-$ である、項目42に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目45〕 Wが $-CH_2CH_2CH_2-$ である、項目42に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目46〕 Wが置換もしくは非置換 C_1-C_2 ヘテロアルキレンである、項目1~41のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

10

〔項目47〕 Wが $-CH_2OCH_2-$ である、項目46に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目48〕 Wが $-CH_2O-$ であり、式中、Oが R^{1-8} 基を有する炭素原子に結合している、項目13~15および19~41のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目49〕 Wが置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレンまたは置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレンである、項目1~41のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目50〕 Wが置換もしくは非置換 C_3-C_8 シクロアルキレンである、項目49に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

20

〔項目51〕 Wがシクロプロピレンである、項目50に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目52〕 Wが置換もしくは非置換 C_2-C_3 アルケニレンである、項目49に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目53〕 Wが $-CH=CH-$ である、項目52に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目54〕 Rが、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキル、置換もしくは非置換 C_3-C_5 シクロアルキル、または置換もしくは非置換 C_2-C_4 ヘテロシクロアルキルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

30

〔項目55〕 Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2CH_2OH$ 、 $-C(OH)(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2C(=O)OCH_3$ 、 $-CH_2C(=O)OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2C(=O)NHCH_3$ 、 $-CH_2C(=O)N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHCH_3$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、シクロプロピル、シクロブチル、オキセタニル、アジリジニル、またはアゼチジニルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

40

〔項目56〕 Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、シクロプロピル、またはオキセタニルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目57〕 Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、シクロプロピル、またはオキセタニルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容され

50

る塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目58] Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、シクロプロピル、またはオキセタニルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目59] Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、またはシクロプロピルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目60] Rが、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、シクロプロピル、またはオキセタニルである、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目61] Rが、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目62] Rが水素である、項目1~53のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目63] $R^{1.1}$ 、 $R^{1.2}$ 、および $R^{1.6}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OR^1$ 、置換も

しくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルから選択される、項目1~15または19~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目64] $R^{1.1}$ 、 $R^{1.2}$ 、および $R^{1.6}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-OCH_2CH_2OH$ 、 $-OCH_2CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CHF_2$ 、および $-CH_2CF_3$ から選択される、項目1~15または19~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目65] $R^{1.1}$ 、 $R^{1.2}$ 、および $R^{1.6}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、および $-CF_3$ から

選択される、項目1~15または19~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目66] $R^{1.1}$ 、 $R^{1.2}$ 、および $R^{1.6}$ が水素である、項目1~15または19~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目67] $R^{1.6}$ および $R^{1.7}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OR^1$ 、置換もしくは非置換

C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 フルオロアルキル、および置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルから選択される、項目1~12または16~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目68] $R^{1.6}$ および $R^{1.7}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-OCH_2CH_2OH$ 、 $-OCH_2CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CHF_2$ 、および $-CH_2CF_3$ から選択される、項目1~12または16~62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目69] $R^{1.6}$ および $R^{1.7}$ のうちの一つ以上が独立して、F、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、および $-CF_3$ か

10

20

30

40

50

ら選択される、項目1～12または16～62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目70〕 $R^{1.6}$ および $R^{1.7}$ が水素である、項目1～12または16～62のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目71〕 R^2 が、水素、 $-CH_3$ 、または $-OCH_3$ である、項目1～70のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目72〕 R^2 が水素である、項目71に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目73〕 R^A が、水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、項目1～72のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目74〕 R^A が、水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、項目1～72のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目75〕 R^A が、水素、F、Cl、 $-CN$ 、 $-CH_3$ 、または $-OCH_3$ である、項目1～72のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目76〕 R^A が、水素、F、Cl、または $-CH_3$ である、項目1～72のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目77〕 R^A が水素である、項目1～72のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目78〕 $R^{1.5}$ および $R^{1.8}$ の両方が水素である、項目12～77のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目79〕 $R^{1.5}$ および $R^{1.8}$ の両方が重水素である、項目12～77のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目80〕 R^4 が各々独立して、水素、置換もしくは非置換 C_1-C_4 アルキル、置換もしくは非置換 C_1-C_4 ハロアルキル、または置換もしくは非置換 C_1-C_4 ヘテロアルキルである、項目12～79のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目81〕 R^4 が各々独立して、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2NHCH_3$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、項目12～79のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目82〕 R^4 が各々独立して、水素、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、項目12～79のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目83〕 R^4 が各々水素である、項目12～79のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目84〕 R^4 が各々 $-CH_3$ である、項目12～79のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

〔項目85〕 化合物であって、表1A～1Jおよび表6～9から選択される、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

10

20

30

40

50

[項目86] R¹₁、R¹₂、R¹₃、R¹₄、R¹₅、R¹₆、R¹₇、およびR¹₈のうち少なくとも1つがFである、項目1～12のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目87] R¹₁、R¹₂、R¹₃、R¹₄、R¹₅、R¹₆、R¹₇、およびR¹₈のうち少なくとも1つがフッ素を含む、項目1～12のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物。

[項目88] 項目1～87のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物と、薬学的に許容される賦形剤または担体と、を含む、薬学的組成物。

[項目89] 状態または疾患を治療する方法であって、それを必要とする対象に、項目1～87のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物を投与することを含む、方法。

[項目90] 状態または疾患の治療用の薬剤の製造における、項目1～87のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは薬学的に許容される溶媒和物の使用。

10

20

30

40

50