

【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4年12月1日(2022.12.1)

【国際公開番号】WO2020/118060
 【公表番号】特表2022-510683(P2022-510683A)
 【公表日】令和4年1月27日(2022.1.27)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-015
 【出願番号】特願2021-531987(P2021-531987)

【国際特許分類】

10

C 0 7 J 3/00(2006.01)
 C 0 7 J 43/00(2006.01)
 A 6 1 K 31/56(2006.01)
 A 6 1 K 31/58(2006.01)
 A 6 1 P 25/00(2006.01)
 A 6 1 P 25/20(2006.01)
 A 6 1 P 25/18(2006.01)
 A 6 1 P 25/08(2006.01)
 A 6 1 P 25/28(2006.01)
 A 6 1 P 25/02(2006.01)
 A 6 1 P 25/04(2006.01)
 A 6 1 P 25/36(2006.01)
 A 6 1 P 9/00(2006.01)
 A 6 1 P 27/16(2006.01)
 A 6 1 P 25/24(2006.01)

20

【F I】

C 0 7 J 3/00
 C 0 7 J 43/00 C S P
 A 6 1 K 31/56
 A 6 1 K 31/58
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/02 1 0 3
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 25/24

30

40

【手続補正書】

【提出日】令和4年11月22日(2022.11.22)

【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】

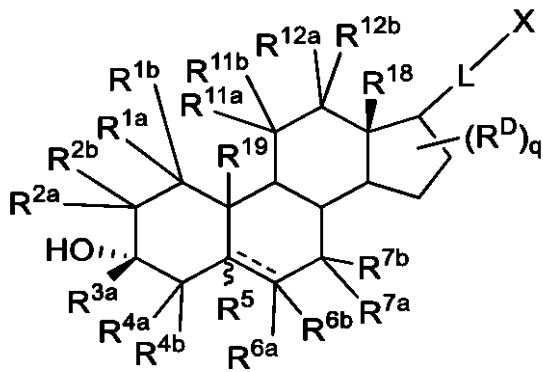
【特許請求の範囲】

50

【請求項 1】

式 (I) :

【化 197】



(I)

10

[式中 :

【化 198】

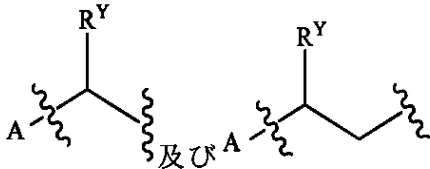


は単結合または二重結合を表し、二重結合が存在する場合、 R^{6a} または R^{6b} のうち一方が存在せず、 R^5 は存在しない；

20

Lは

【化 199】



(式中、AはC17との結合点を表す) からなる群より選択され；

30

Xは、 $-C(O)N(R^{55a})(R^{55b})$ 、 $-N(R^{55a})(R^{55b})$ 、 $-N(R^{55b})C(O)(R^{55a})$ 、及び R^{55c} からなる群より選択され；

R^Y は、独立して、水素、シアノ、ハロアルキル、または非置換アルキルであり；

R^{55c} は、炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールまたは置換もしくは非置換アリールであり；

R^{55a} 及び R^{55b} は、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)SR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2R^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A1}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-S(=O)_2OR^{A1}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{A1})_2$ であり、各 R^{A1} が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシ

40

50

クリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、硫黄保護基（硫黄結合時）であるか、2つの R^{A1} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成し；あるいは

R^{55a} 及び R^{55b} は、介在原子と一緒にあって、置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく；

R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{11a} 、 R^{11b} 、 R^{12a} 、及び R^{12b} のそれぞれは独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)SR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2R^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A1}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-S(=O)_2OR^{A1}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{A1})_2$ であり、各 R^{A1} が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、または硫黄保護基（硫黄結合時）であるか、あるいは、 R^{11a} と R^{11b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか； R^{12a} と R^{12b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか； R^{4a} と R^{4b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか； R^{7a} と R^{7b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか； R^{2a} と R^{2b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか、 R^{1a} と R^{1b} が連結されてオキソ(=O)基を形成し；

R^{3a} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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^5 は、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^{6a} 及び R^{6b} のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} と R^{6b} が連結されてオキソ(=O)基を形成し；

各 R^D は独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、オキソ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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、 $-OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})_2$ 、 $-SR^{C3}$ 、 $-C(=O)R^{C3}$ 、 $-C(=O)OR^{C3}$ 、 $-C(=O)SR^{C3}$ 、 $-C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)R^{C3}$ 、 $-OC(=O)OR^{C3}$ 、 $-OC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2R^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、

3)₂、 $-SC(=O)R^{C3}$ 、 $-SC(=O)OR^{C3}$ 、 $-SC(=O)SR^{C3}$ 、 $-SC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C3}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{C3})_2$ であり、各 R^{C3} が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、または硫黄保護基（硫黄結合時）であり；

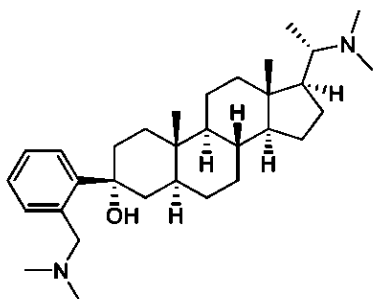
R^{18} は、置換または非置換アルキルであり；

R^{19} は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルであり；

q は、1、2、3、4、または5であり；

ただし、化合物は

【化200】

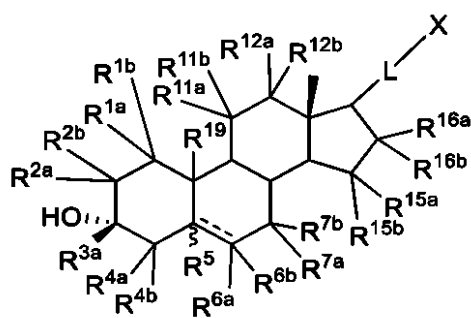


またはその薬学的に許容される塩ではない]の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

前記式(I)の化合物が、式(I-I)

【化201】



(I-I)

[式中、

R^{15a} 、 R^{15b} 、 R^{16a} 、及び R^{16b} のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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、 $-OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})_2$ 、 $-SR^{C3}$ 、 $-C(=O)R^{C3}$ 、 $-C(=O)OR^{C3}$ 、 $-C(=O)SR^{C3}$ 、 $-C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)R^{C3}$ 、 $-OC(=O)OR^{C3}$ 、 $-OC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2R^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-SC(=O)R^{C3}$ 、 $-SC(=$

10

20

30

40

50

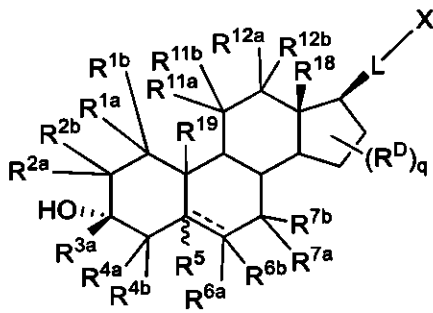
O) OR^{C3} 、 $-SC(=O)SR^{C3}$ 、 $-SC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C3}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{C3})_2$ であり、各 R^{C3} が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、または硫黄保護基（硫黄結合時）であるか、 R^{15a} と R^{15b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか、 R^{16a} と R^{16b} が連結されてオキソ(=O)基を形成する]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に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項3】

10

前記式(I)の化合物が、式(I-a)：

【化202】



(I-a)

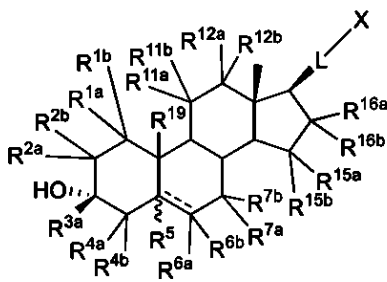
20

またはその薬学的に許容される塩である、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項4】

前記式(I)の化合物が、式(I-Ia)：

【化203】



(I-Ia)

30

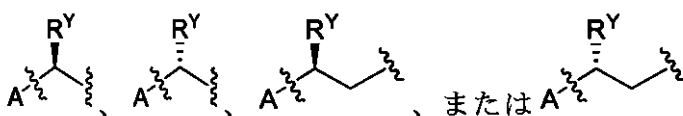
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項2に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項5】

Lが、

40

【化204】



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塩。

【請求項6】

Lが、

50

【請求項 13】

X が、 $-N(R^{55a})(R^{55b})$ である、請求項 1 ~ 11 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塩。

【請求項 14】

X が、 $-C(O)N(R^{55a})(R^{55b})$ である、請求項 1 ~ 11 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塩。

【請求項 15】

R^{55a} が、水素またはメチルであり、 R^{55b} が、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 1 ~ 14 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塩。

10

【請求項 16】

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 1 ~ 14 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塩。

【請求項 17】

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 1 ~ 14 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塩。

20

【請求項 18】

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、置換カルボシクリル、置換ヘテロシクリル、置換アリール、または置換ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 19】

R^{55a} および R^{55b} の少なくとも 1 つが、水素以外である、請求項 1 ~ 14 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塩。

30

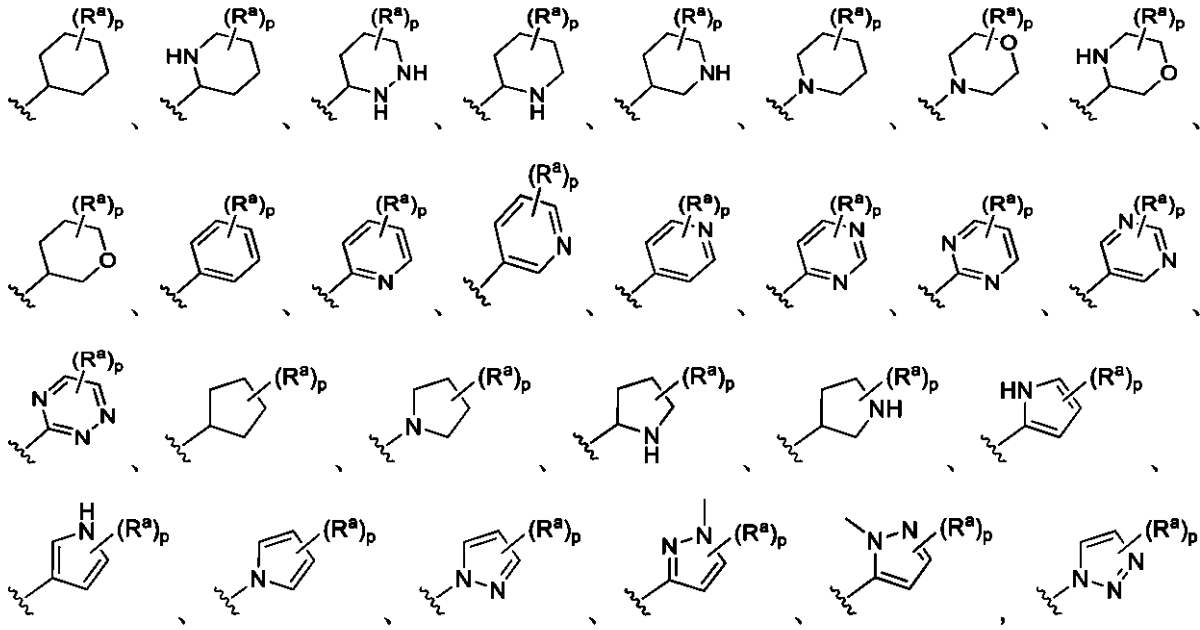
【請求項 20】

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、

40

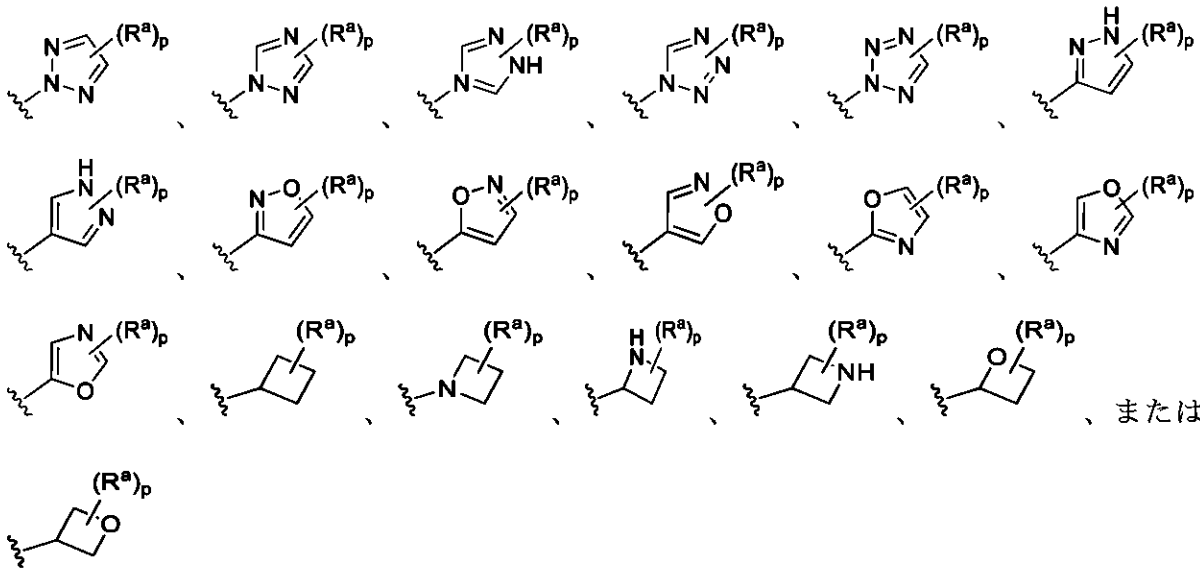
50

【化 2 1 1】



10

【化 2 1 2】



20

30

であり；

式中：

各 R^a は、独立して、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

40

各 R^{D4} は、独立して、水素、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

50

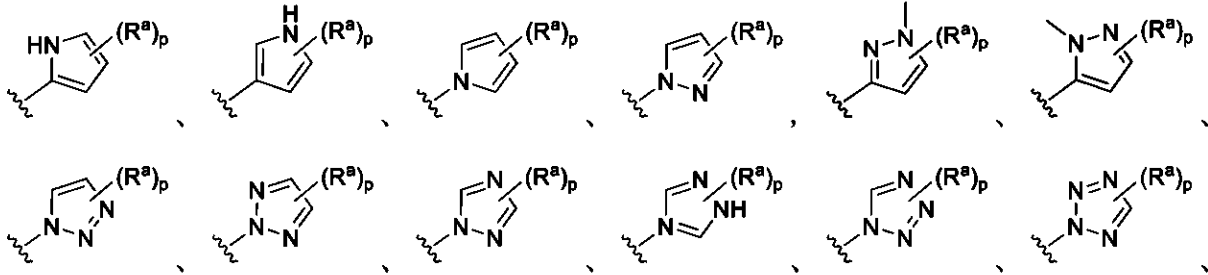
3 - 6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₆ - 10 アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、または窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、または 11 である、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 2 1】

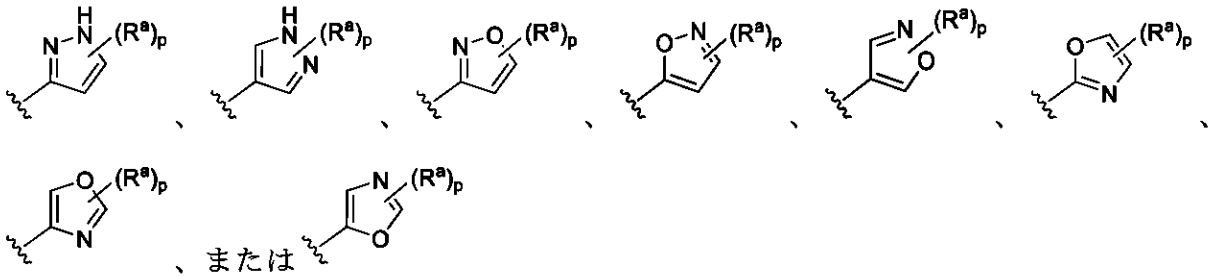
R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、

【化 2 1 3】



10

【化 2 1 4】



20

であり；

式中：

各 R^a は、独立して、水素、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR^{D4}、-N(R^{D4})₂、-C(=O)R^{D4}、-C(=O)OR^{D4}、-C(=O)N(R^{D4})₂、-OC(=O)R^{D4}、-OC(=O)OR^{D4}、-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}、-OC(=O)N(R^{D4})₂、-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}、-S(=O)₂R^{D4}、-S(=O)₂OR^{D4}、-OS(=O)₂R^{D4}、-S(=O)₂N(R^{D4})₂、または -N(R^{D4})S(=O)₂R^{D4}、置換もしくは非置換 C₁ - 6 アルキル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルケニル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルキニル、置換もしくは非置換 C₃ - 6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₆ - 10 アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

30

40

各 R^{D4} は、独立して、水素、置換もしくは非置換 C₁ - 6 アルキル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルケニル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルキニル、置換もしくは非置換 C₃ - 6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₆ - 10 アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、または窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

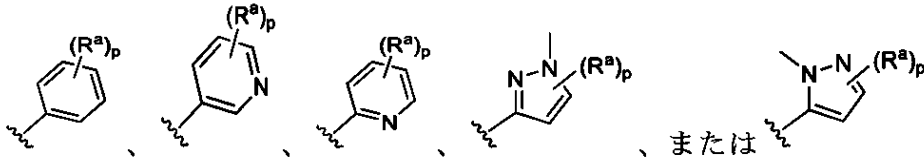
p は、0、1、2、または 3 である、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 2 2】

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、

50

【化 2 1 5】



であり；

式中：

各 R^a は、独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})_2$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{OS}(=\text{O})_2\text{R}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})_2$ 、または $-\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{\text{D}4}$ 、置換もしくは非置換 C_1-6 アルキル、置換もしくは非置換 C_2-6 アルケニル、置換もしくは非置換 C_2-6 アルキニル、置換もしくは非置換 C_3-6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

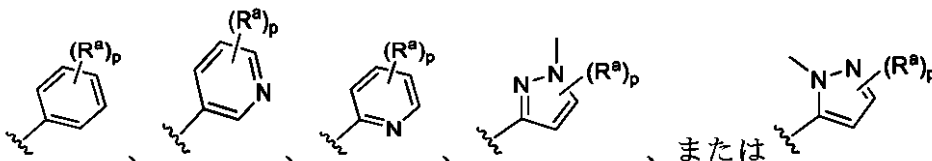
各 $\text{R}^{\text{D}4}$ は、独立して、水素、置換もしくは非置換 C_1-6 アルキル、置換もしくは非置換 C_2-6 アルケニル、置換もしくは非置換 C_2-6 アルキニル、置換もしくは非置換 C_3-6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、または窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの $\text{R}^{\text{D}4}$ 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

p は、0、1、2、3、4、または 5 である、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 2 3】

R^{55a} 及び R^{55b} が、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、

【化 2 1 6】



であり；

式中：

各 R^a は、独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{\text{D}4}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{D}4})_2$ 、置換もしくは非置換 C_1-6 アルキル、置換または非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

各 $\text{R}^{\text{D}4}$ は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C_1-6 アルキルであり；

p は、0、1、または 2 である、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 2 4】

R^{55a} 及び R^{55b} が、介在原子と一緒に置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成する、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 2 5】

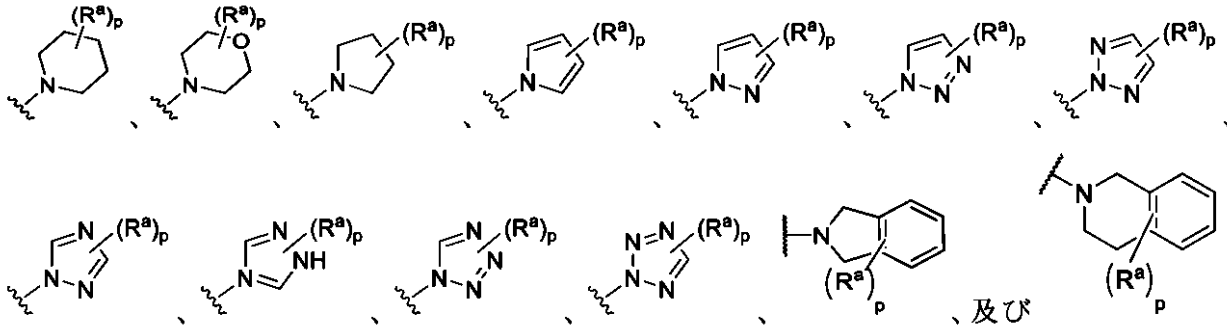
R^{55a} 及び R^{55b} が、介在原子と一緒に置換

30

40

50

【化 2 1 7】



10

からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、

式中：

各 R^a は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

20

各 R^{D4} は、独立して、水素、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{6-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、または窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

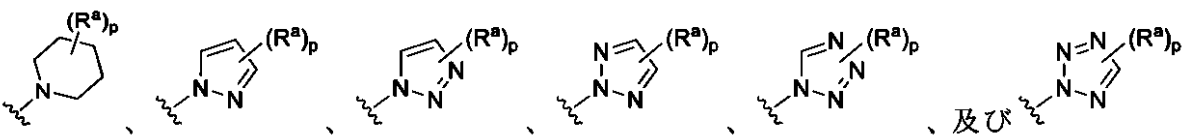
30

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、または 10 である、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 2 6】

R^{55a} 及び R^{55b} が、介在原子と一緒に、

【化 2 1 8】



40

からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、

式中：

各 R^a は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非

50

置換 C₃₋₆ カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₆₋₁₀ アリール、または置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

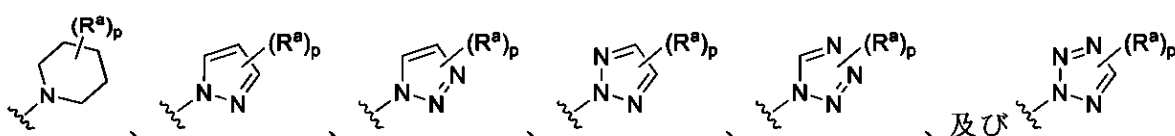
各 R^{D4} は、独立して、水素、置換もしくは非置換 C₁₋₆ アルキル、置換もしくは非置換 C₂₋₆ アルケニル、置換もしくは非置換 C₂₋₆ アルキニル、置換もしくは非置換 C₃₋₆ カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₆₋₁₀ アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、または窒素保護基（窒素結合時）窒素保護基であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成し；

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、または 10 である、請求項 1 ~ 14 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塩。 10

【請求項 27】

R^{55a} 及び R^{55b} が、介在原子と一緒にあって、

【化 219】



からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、 20

式中：

各 R^a は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、-CN、-OR^{D4}、-N(R^{D4})₂、または置換もしくは非置換 C₁₋₆ アルキルであり；

各 R^{D4} は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C₁₋₆ アルキルであり；

p は、0、1、または 2 である、請求項 1 ~ 14 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塩。

【請求項 28】

X が、R^{55c} である、請求項 1 ~ 11 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塩。 30

【請求項 29】

R^{55c} が、置換もしくは非置換フェニル、またはヘテロアリール環に少なくとも 1 個の窒素を含む炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 11 及び 28 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塩。

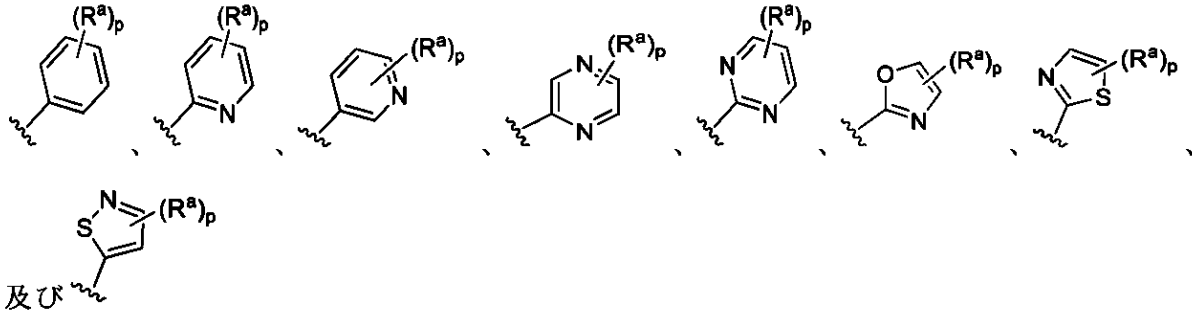
【請求項 30】

R^{55c} が、置換もしくは非置換フェニル、またはピリジル、イソチアゾリル、チアゾリル、ピリミジル、ピラジニル、もしくはオキサゾリルからなる群より選択される炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 11、28 もしくは 29 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塩。

【請求項 31】 40

R^{55c} が、

【化 2 2 0】



10

からなる群より選択され、

式中：

各 R^a は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

各 R^{D4} は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

p は、0、1、または2である、請求項 1 ~ 11 及び 28 ~ 30 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塩。

20

【請求項 3 2】

R^5 が、 R^{19} に対してシス位置にある水素またはメチルである、請求項 1 ~ 31 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塩。

【請求項 3 3】

R^5 が、 R^{19} に対してトランス位置にある水素またはメチルである、請求項 1 ~ 31 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塩。

【請求項 3 4】

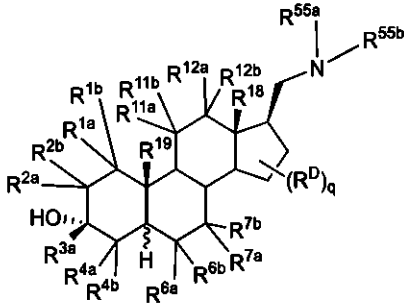
前記式 (I) の化合物が、式 (I - b)、(I - c)、(I - d)、(I - e)、(I - l)、(I - m)、(I - n)、または (I - p)：

30

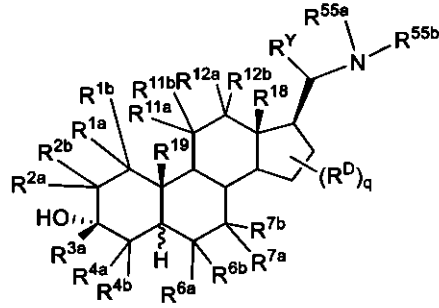
40

50

【化 2 2 1】

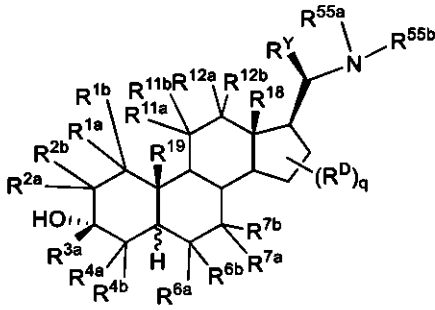


(I - b)、

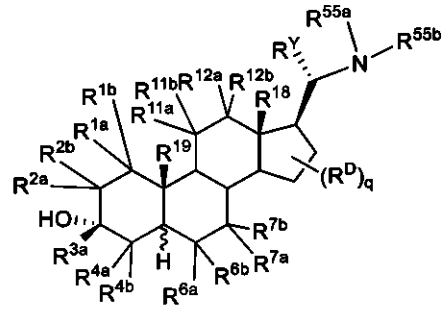


(I - c)、

10

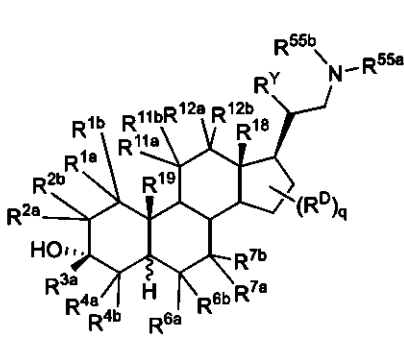


(I - d)、

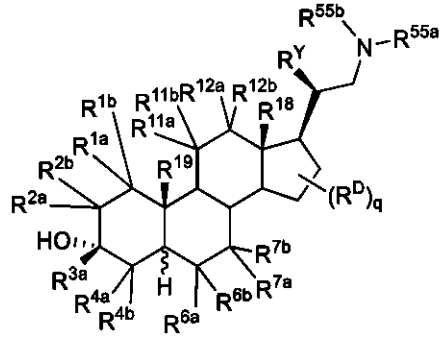


(I - e)、

20



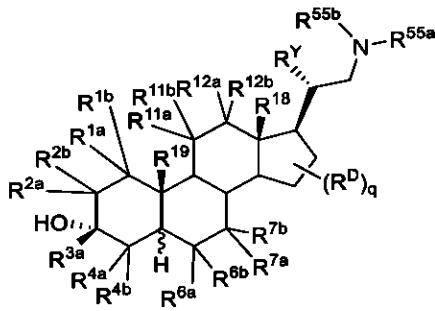
(I - l)、



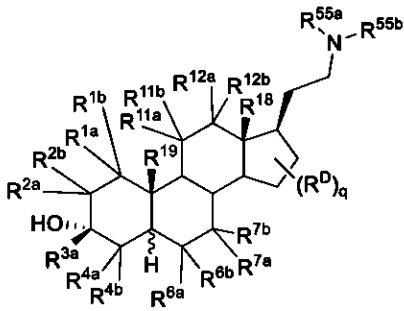
(I - m)、

30

【化 2 2 2】



(I - n)、



(I - p)

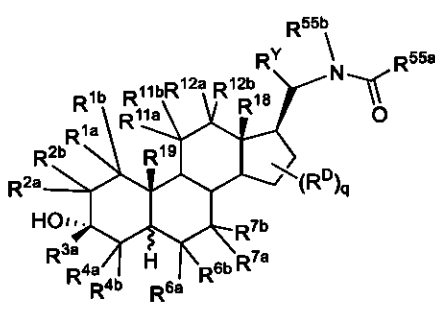
40

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

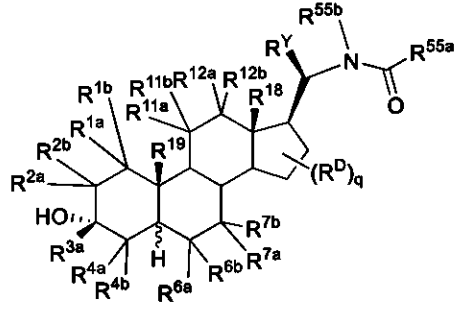
【請求項 3 5】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - f)、(I - g)、または (I - h) :

【化 2 2 3】

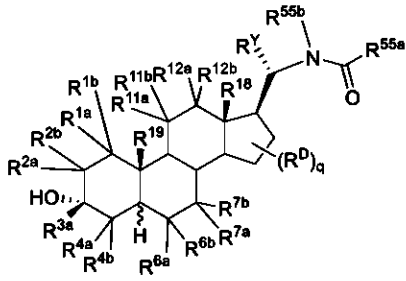


(I - f)、



(I - g)、

10



(I - h)

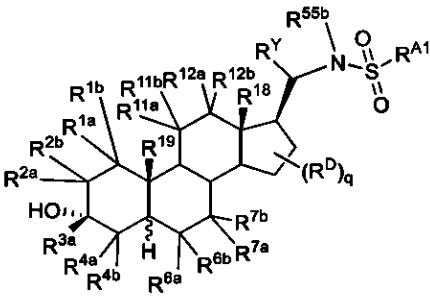
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

20

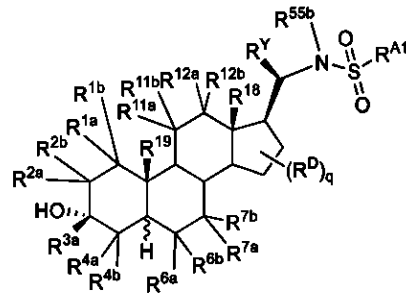
【請求項 3 6】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - i)、(I - j)、または (I - k) :

【化 2 2 4】



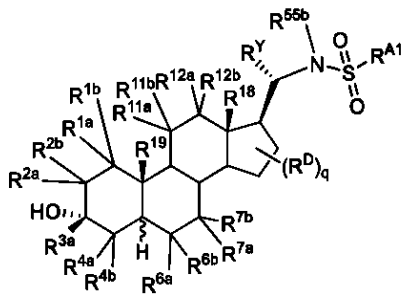
(I - i)、



(I - j)、

30

【化 2 2 5】



(I - k)

40

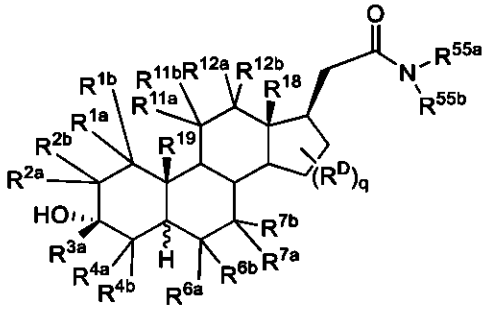
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 3 7】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - o) :

50

【化 2 2 6】



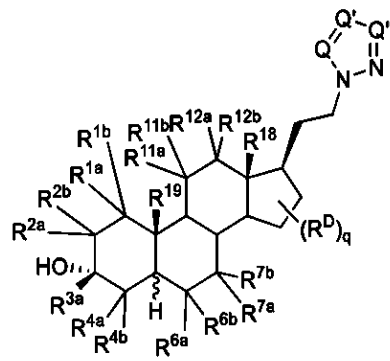
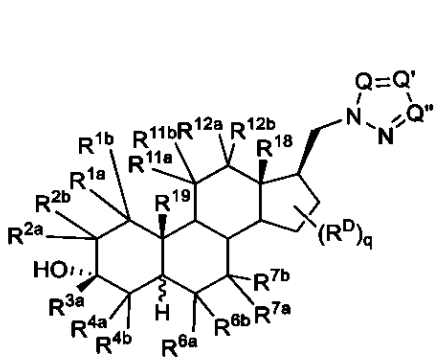
10

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

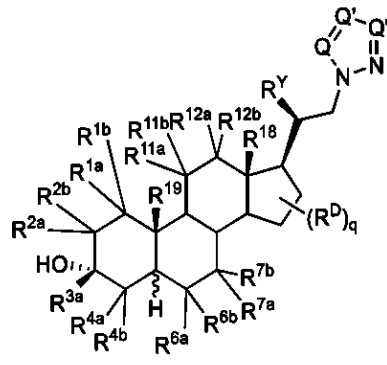
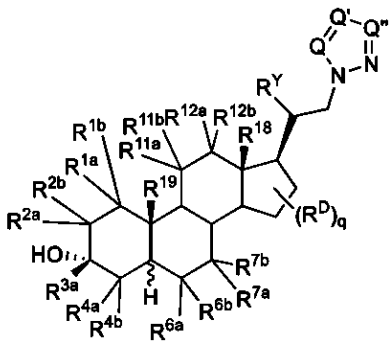
【請求項 3 8】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - q q)、(I - q)、(I - s)、(I - t)、または (I - u) :

【化 2 2 7】

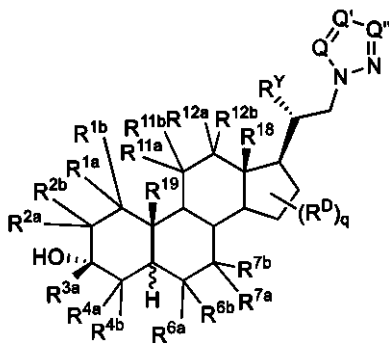


20



30

【化 2 2 8】



40

50

[式中、

Q、Q'、及びQ''はそれぞれ独立して、 \emptyset またはNであり；

R^wは、水素、シアノ、-NH₂、または置換もしくは非置換アルキルであり；

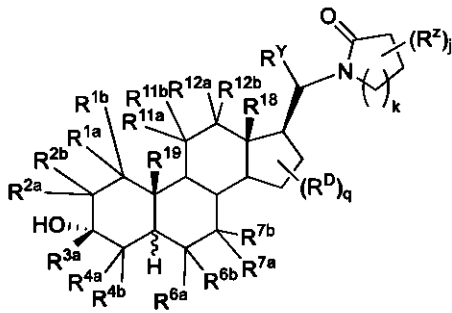
Q、Q'、及びQ''の少なくとも1つが \emptyset である]

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に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項39】

前記式(I)の化合物が、式(I-r)：

【化229】



10

[式中、

kは、1または2であり；

R^zは、置換もしくは非置換アルキルまたは置換もしくは非置換アリールであるか、あるいは隣接する炭素上の2つのR^zが介在原子と結合して置換または非置換アリールを形成し；

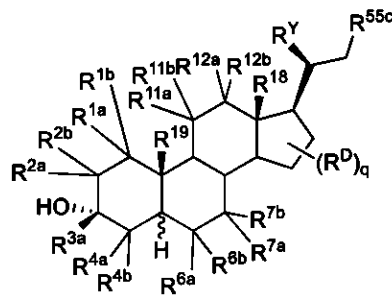
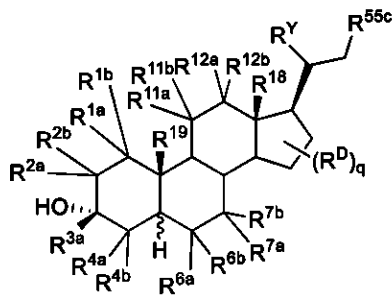
jは、0、1、2、3、4、5、または6である]

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に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項40】

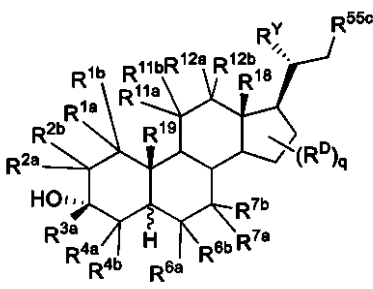
前記式(I)の化合物が、式(I-v)、(I-w)、または(I-x)：

【化230】



30

【化231】



40

50

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 4 1】

R^{55c} が、置換もしくはまたは非置換フェニル、またはヘテロアリール環に少なくとも 1 個の窒素を含む炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 4 0 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 4 2】

R^{55c} が、置換もしくは非置換フェニル、またはピリジル、イソチアゾリル、チアゾリル、ピリミジル、ピラジニル、及びオキサゾリルからなる群より選択される炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 4 0 または 4 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。 10

【請求項 4 3】

R^{19} が、水素または置換もしくは非置換アルキルである、請求項 1 ~ 4 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塩。

【請求項 4 4】

R^{19} が、水素または置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 4 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塩。

【請求項 4 5】

R^{19} が、 $-CH_2OCH_3$ である、請求項 1 ~ 4 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塩。 20

【請求項 4 6】

R^{19} が、水素または非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 4 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塩。

【請求項 4 7】

R^{19} が、非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 4 3 及び 4 6 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塩。

【請求項 4 8】

R^{19} が、メチルである、請求項 1 ~ 4 3、4 6 もしくは 4 7 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塩。

【請求項 4 9】

R^{19} が、エチルである、請求項 1 ~ 4 3、4 6 もしくは 4 7 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塩。 30

【請求項 5 0】

R^{18} が、非置換アルキルである、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 5 1】

R^{18} が、非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 もしくは 5 0 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 5 2】

R^{18} が、メチルまたはエチルである、請求項 1、5 0 もしくは 5 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塩。 40

【請求項 5 3】

R^{18} が、置換アルキルである、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 5 4】

各 R^D が、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、オキソ、ヒドロキシ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 5 5】

各 R^D が、独立して、水素、オキソ、置換もしくは非置換アルキル、ヒドロキシ、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、請求項 1 もしくは 5 4 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

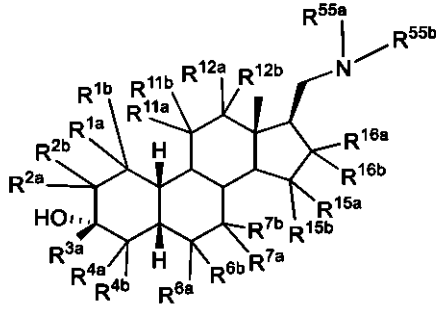
【請求項 5 6】

各 R^D が、独立して、水素、オキソ、メチル、エチル、ヒドロキシ、またはシクロプロピルである、請求項 1、5 4 もしくは 5 5 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

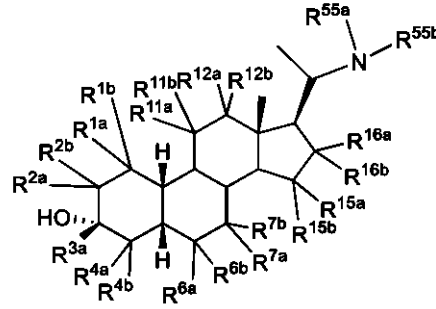
【請求項 5 7】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I b)、(I - I c)、(I - I d)、(I - I e)、(I - I l)、(I - I m)、(I - I n)、(I - I p 1)、または (I - I p 2) :

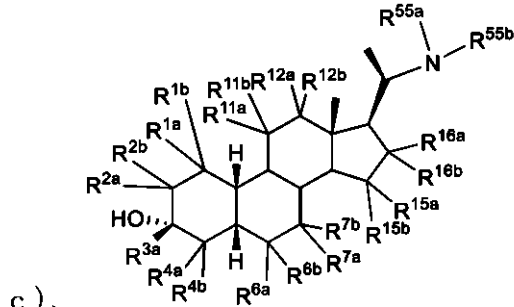
【化 2 3 2】



(I - I b)、

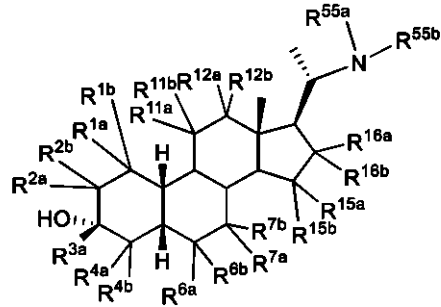


(I - I c)



c)、

(I - I d)、



(I - I e)

- I e)、

10

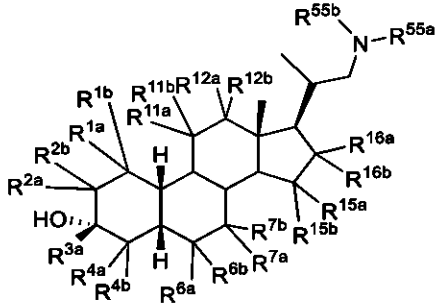
20

30

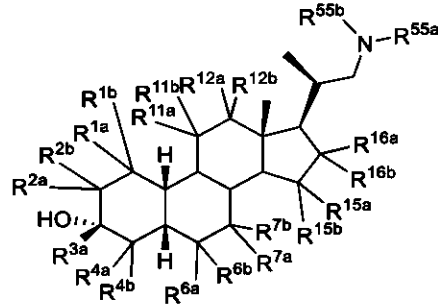
40

50

【化 2 3 3】

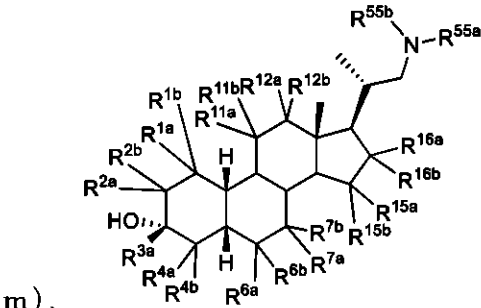


(I - I l)、



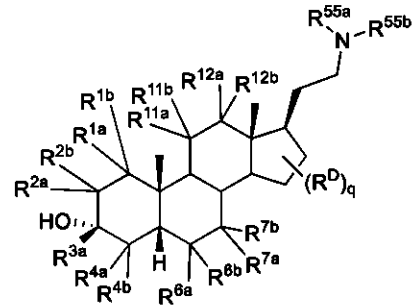
(I - I

10



m)、

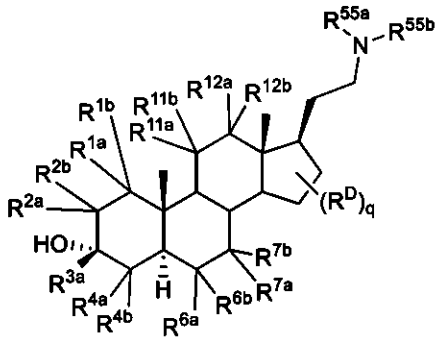
(I - I n)、



(I - I

20

p 1)、



(I - I p 2)

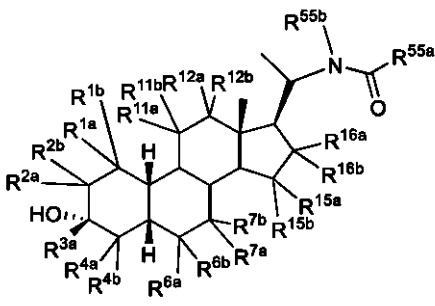
30

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

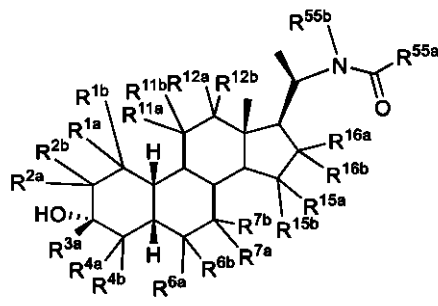
【請求項 5 8】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I f)、(I - I g)、または (I - I h) :

【化 2 3 4】



(I - I f)、

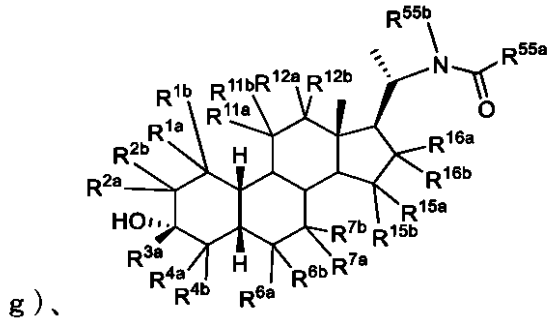


(I - I

40

50

【化 2 3 5】



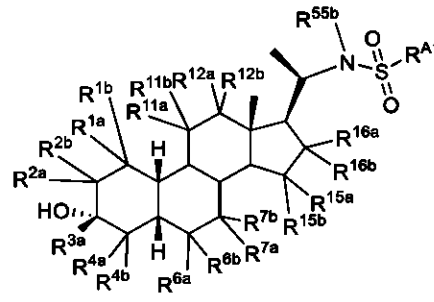
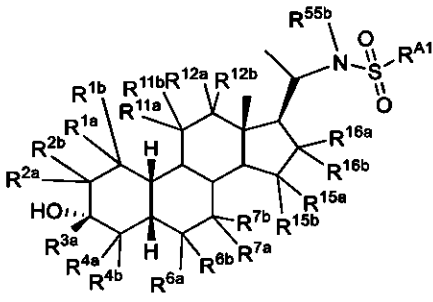
10

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

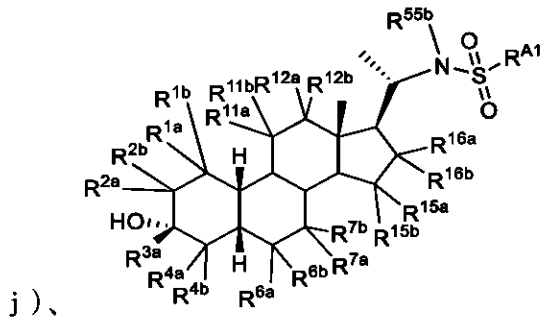
【請求項 5 9】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I i)、(I - I j)、または (I - I k) :

【化 2 3 6】



20



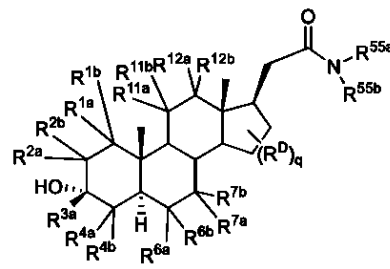
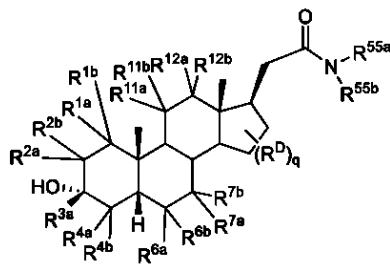
30

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 6 0】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I o 1) または (I - I o 2) :

【化 2 3 7】



40

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 に記載の化合物または薬学的

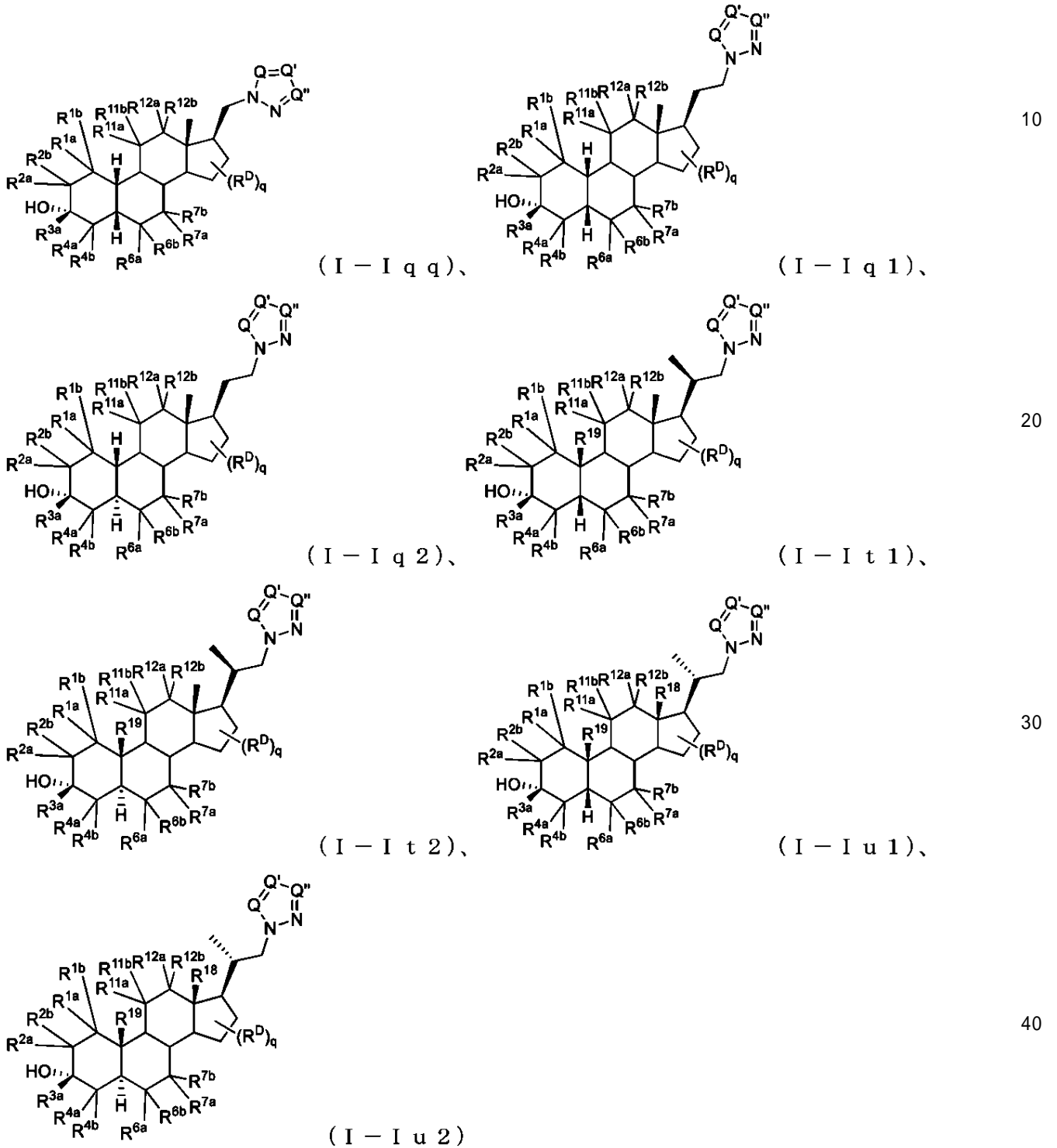
50

に許容される塩。

【請求項 6 1】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I q q)、(I - I q 1)、(I - I q 2)、(I - I t 1)、(I - I t 2)、(I - I u 1)、または (I - I u 2) :

【化 2 3 8】



[式中、

Q、Q'、及び Q'' はそれぞれ独立して、または N であり；

R^w は、水素、シアノ、-NH₂、または置換もしくは非置換アルキルであり；

Q、Q'、及び Q'' の少なくとも 1 つが必ずある]

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 に記載の化合物または薬学的 50

に許容される塩。

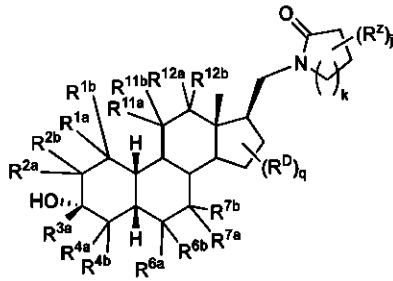
【請求項 6 2】

R¹⁹ が、水素、メチル、エチル、またはメトキシメチルである、請求項 6 1 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

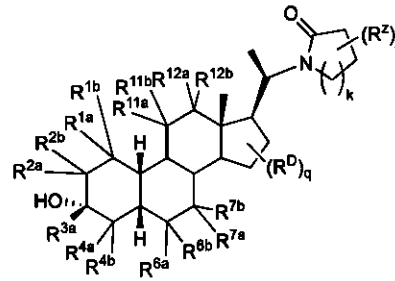
【請求項 6 3】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I r r)、(I - I r 1)、または (I - I r 2) :

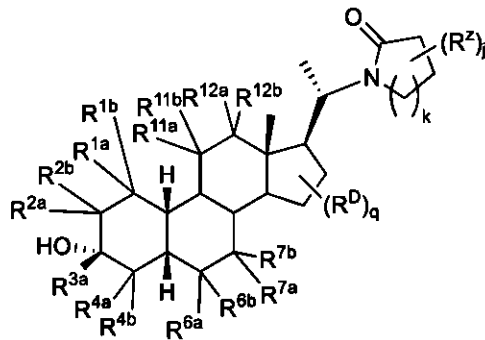
【化 2 3 9】



(I - I r r)、



(I - I r 1)、



(I - I r 2)

[式中、

k は、1 または 2 であり；

R² は、置換もしくは非置換アルキルまたは置換もしくは非置換アリールであるか、あるいは隣接する炭素上の 2 つの R² が介在原子と結合して置換または非置換アリールを形成し；

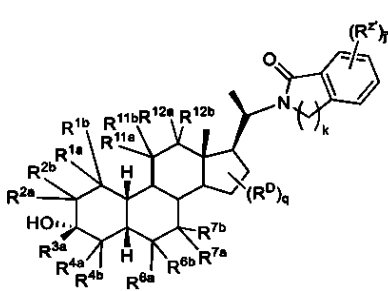
j は、0、1、2、3、4、5、または 6 である]

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

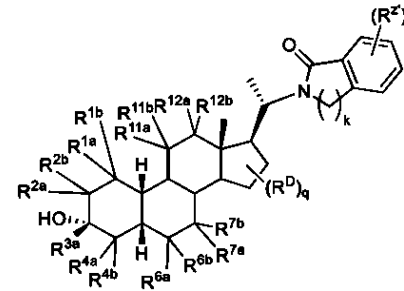
【請求項 6 4】

前記式 (I) の化合物が、式 (I - I r 3) または (I - I r 4) :

【化 2 4 0】



(I - I r 3)、



(I - I r 4)

[式中、

k は、1 または 2 であり；

R² は、置換もしくは非置換アルキルまたはシアノであり；

50

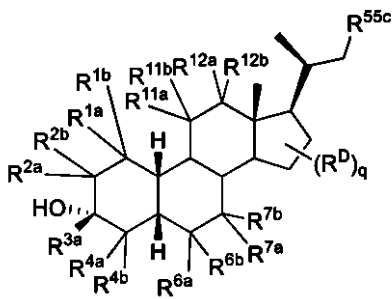
j' は、0、1、2、3、または4である]

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

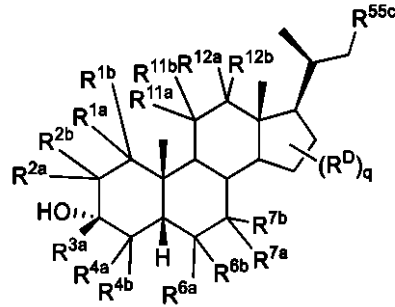
【請求項 65】

前記式 (I) の化合物が、式 (I-Iw1)、(I-Iw2)、(I-Ix1)、または (I-Ix2) :

【化 241】

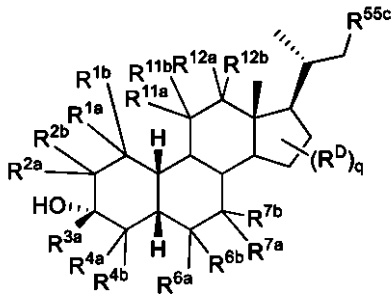


(I-Iw1)、

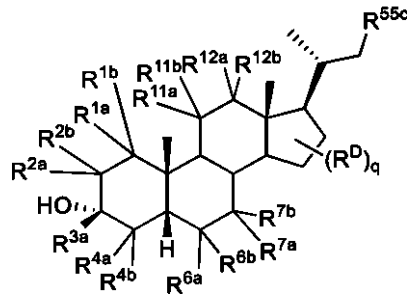


(I-Iw2)、

10



(I-Ix1)、



(I-Ix1)

20

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 に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 66】

R^{3a} が、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルである、請求項 1 ~ 65 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塩。

30

【請求項 67】

R^{3a} が、置換または非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 66 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塩。

【請求項 68】

R^{3a} が、置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 67 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塩。

【請求項 69】

R^{3a} が、非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 67 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塩。

40

【請求項 70】

R^{3a} が、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチルである、請求項 1 ~ 67 及び 69 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塩。

【請求項 71】

R^{3a} が、 $-CH_2OCH_3$ または $-CH_2OCH_2CH_3$ である、請求項 1 ~ 68 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塩。

【請求項 72】

R^{3a} が、 $-CH_2C_3H_5$ である、請求項 1 ~ 68 のいずれか 1 項に記載の化合物ま

50

たは薬学的に許容される塩。

【請求項 7 3】

R^{3a} が、置換もしくは非置換アルキル、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、請求項 1 ~ 6 5 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塩。

【請求項 7 4】

R^{3a} が、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 1 ~ 6 5 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塩。

【請求項 7 5】

R^{3a} が、置換または非置換カルボシクリルである、請求項 1 ~ 6 5、7 3 もしくは 7 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塩。 10

【請求項 7 6】

R^{3a} が、シクロプロピルである、請求項 1 ~ 6 8 及び 7 3 ~ 7 5 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塩。

【請求項 7 7】

R^{4a} 及び R^{4b} のそれぞれが、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、 $-OR^{E5}$ 、 $-OC(=O)R^{E5}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})_2$ 、 $-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})S(=O)_2R^{E5}$ 、または $-N(R^{E5})S(=O)_2OR^{E5}$ であり、式中、各 R^{E5} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは 2 つの R^{E5} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 7 6 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塩。 20

【請求項 7 8】

R^{4a} 及び R^{4b} のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^{F6}$ 、 $-OC(=O)R^{F6}$ 、 $-N(R^{F6})_2$ 、または $-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}$ であり、式中、各 R^{F6} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、あるいは 2 つの R^{F6} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 7 7 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塩。 30

【請求項 7 9】

R^{4a} 及び R^{4b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 7 7 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塩。

【請求項 8 0】

R^{4a} 及び R^{4b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、または C_{1-6} アルコキシハロである、請求項 1 ~ 7 7 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塩。 40

【請求項 8 1】

R^{4a} 及び R^{4b} のそれぞれが、独立して、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または $-CH(CH_3)_2$ である、請求項 1 ~ 7 7 もしくは 8 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塩。

【請求項 8 2】

R^{4a} 及び R^{4b} がいずれも水素である、請求項 1 ~ 7 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塩。

【請求項 8 3】

R^{4a} と R^{4b} が連結されてオキソ(=O)基を形成する、請求項 1 ~ 7 9 のいずれか 50

1 項に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項 8 4】

R^{6a} 及び R^{6b} のそれぞれが、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルである、請求項 1 ~ 8 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塩。

【請求項 8 5】

R^{6a} 及び R^{6b} のそれぞれが、独立して、水素または置換アルキルである、請求項 1 ~ 8 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塩。

【請求項 8 6】

R^{6a} 及び R^{6b} のそれぞれが、独立して、水素または非置換アルキルである、請求項 1 ~ 8 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塩。

10

【請求項 8 7】

R^{6a} 及び R^{6b} がいずれも水素である、請求項 1 ~ 8 6 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塩。

【請求項 8 8】

R^{6a} がハロゲンまたはアルキルであり、 R^{6b} が水素である、請求項 1 ~ 8 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塩。

【請求項 8 9】

R^{6a} 及び R^{6b} がいずれもハロゲンである、請求項 1 ~ 8 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塩。

20

【請求項 9 0】

R^{6a} 及び R^{6b} がいずれもアルキルである、請求項 1 ~ 8 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塩。

【請求項 9 1】

R^{7a} 及び R^{7b} のそれぞれが、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、 $-OR^{E5}$ 、 $-OC(=O)R^{E5}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})_2$ 、 $-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})S(=O)_2R^{E5}$ 、または $-N(R^{E5})S(=O)_2OR^{E5}$ であり、式中、各 R^{E5} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは 2 つの R^{E5} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 9 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塩。

30

【請求項 9 2】

R^{7a} 及び R^{7b} のそれぞれが、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^{F6}$ 、 $-OC(=O)R^{F6}$ 、 $-N(R^{F6})_2$ 、または $-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}$ であり、式中、各 R^{F6} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、あるいは 2 つの R^{F6} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 9 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塩。

40

【請求項 9 3】

R^{7a} 及び R^{7b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 9 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塩。

【請求項 9 4】

R^{7a} 及び R^{7b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、または C_{1-6} ハロアルコキシである、請求項 1 ~ 9 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塩。

50

【請求項 9 5】

R^{7a} 及び R^{7b} のそれぞれが、独立して、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または $-CH(CH_3)_2$ である、請求項 1 ~ 9 1 もしくは 9 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塩。

【請求項 9 6】

R^{7a} 及び R^{7b} がいずれも水素である、請求項 1 ~ 9 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塩。

【請求項 9 7】

R^{7a} と R^{7b} が連結されてオキソ (= O) 基を形成する、請求項 1 ~ 9 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塩。

10

【請求項 9 8】

R^{11a} 及び R^{11b} のそれぞれが、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、 $-OR^{E5}$ 、 $-OC(=O)R^{E5}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})_2$ 、 $-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})S(=O)_2R^{E5}$ 、または $-N(R^{E5})S(=O)_2OR^{E5}$ であり、式中、各 R^{E5} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは 2 つの R^{E5} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 9 7 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塩。

20

【請求項 9 9】

R^{11a} 及び R^{11b} のそれぞれが、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^{F6}$ 、 $-OC(=O)R^{F6}$ 、 $-N(R^{F6})_2$ 、または $-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}$ であり、式中、各 R^{F6} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、あるいは 2 つの R^{F6} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項 1 ~ 9 8 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塩。

30

【請求項 1 0 0】

R^{11a} 及び R^{11b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 9 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塩。

【請求項 1 0 1】

R^{11a} 及び R^{11b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、または C_{1-6} ハロアルコキシである、請求項 1 ~ 9 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塩。

【請求項 1 0 2】

R^{11a} 及び R^{11b} のそれぞれが、独立して、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または $-CH(CH_3)_2$ である、請求項 1 ~ 9 9 もしくは 1 0 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塩。

40

【請求項 1 0 3】

R^{11a} 及び R^{11b} がいずれも水素である、請求項 1 ~ 1 0 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塩。

【請求項 1 0 4】

R^{11a} と R^{11b} が連結されてオキソ (= O) 基を形成する、請求項 1 ~ 9 7 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塩。

【請求項 1 0 5】

R^{12a} 及び R^{12b} のそれぞれが、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アル

50

キニル、 $-OR^{E5}$ 、 $-OC(=O)R^{E5}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})_2$ 、 $-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}$ 、 $-N(R^{E5})S(=O)_2R^{E5}$ 、または $-N(R^{E5})S(=O)_2OR^{E5}$ であり、式中、各 R^{E5} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは2つの R^{E5} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項1~104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塩。

【請求項106】

R^{12a} 及び R^{12b} のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^{F6}$ 、 $-OC(=O)R^{F6}$ 、 $-N(R^{F6})_2$ 、または $-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}$ であり、式中、各 R^{F6} は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、あるいは2つの R^{F6} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、請求項1~105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塩。

10

【請求項107】

R^{12a} 及び R^{12b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項1~105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塩。

20

【請求項108】

R^{12a} 及び R^{12b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、または C_{1-6} アルコキシハロである、請求項1~105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塩。

【請求項109】

R^{12a} 及び R^{12b} のそれぞれが、独立して、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または $-CH(CH_3)_2$ である、請求項1~105もしくは108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塩。

【請求項110】

R^{12a} 及び R^{12b} がいずれも水素である、請求項1~108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塩。

30

【請求項111】

R^{12a} 及び R^{12b} が連結されてオキソ(=O)基を形成する、請求項1~104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塩。

【請求項112】

R^{1a} 及び R^{1b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項1~111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塩。

【請求項113】

R^{1a} 及び R^{1b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、または C_{1-6} ハロアルコキシである、請求項1~111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塩。

40

【請求項114】

R^{1a} 及び R^{1b} がいずれも水素である、請求項1~113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塩。

【請求項115】

R^{2a} 及び R^{2b} のそれぞれが、独立して、水素、 $-OH$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルである、請求項1~114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塩。

【請求項116】

50

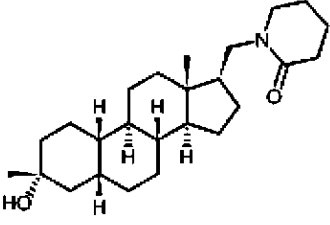
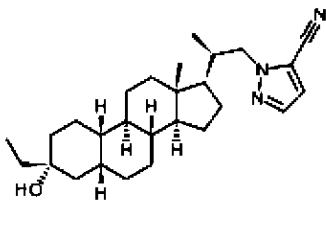
R^{2a} 及び R^{2b} のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆ハロアルコキシである、請求項1～114のいずれか1項に記載の化合物または薬学的に許容される塩。

【請求項117】

R^{2a} 及び R^{2b} がいずれも水素である、請求項1～116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塩。

【請求項118】

【化301】

化合物 番号	構造	化合物 番号	構造
1		273	

10

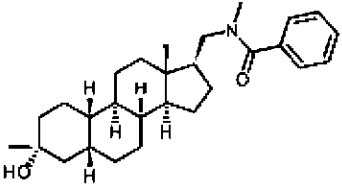
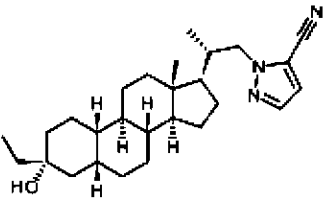
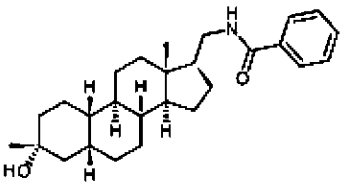
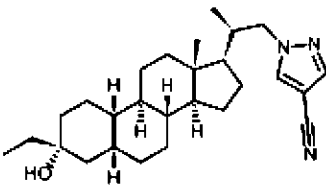
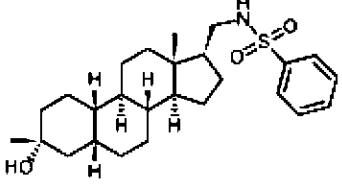
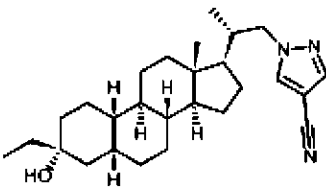
20

30

40

50

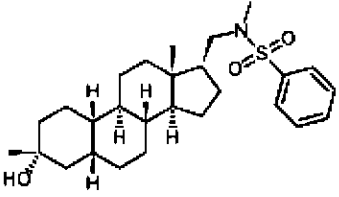
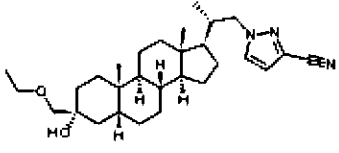
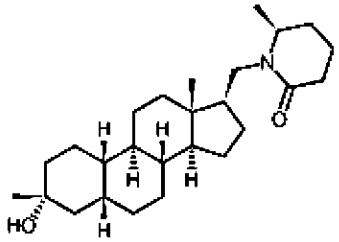
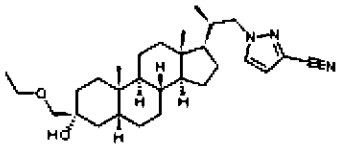
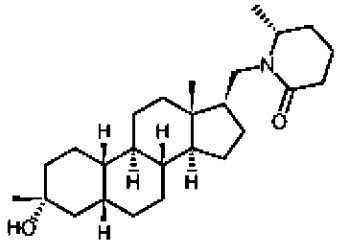
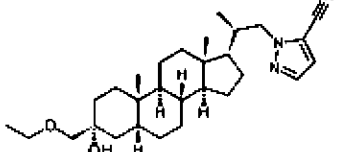
【化 3 0 2】

2		274		10
3		275		20
4		276		30

40

50

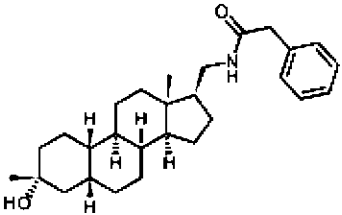
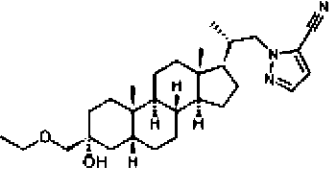
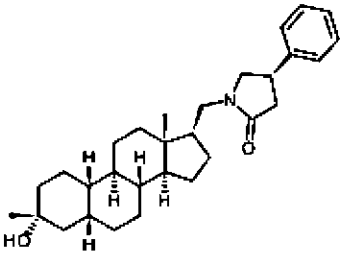
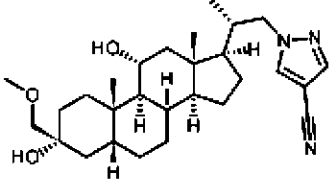
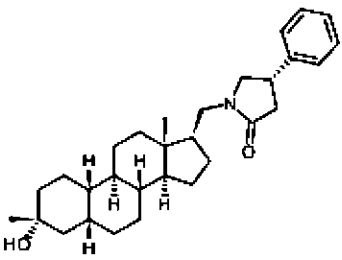
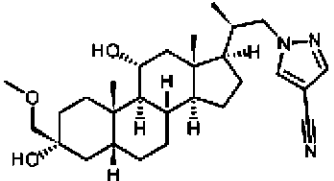
【化 3 0 3】

5	 <p>Chemical structure of a steroid with a benzothiazole derivative at C-17. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-phenyl-1,2,4-benzothiazol-5-ylmethyl group.</p>	278	 <p>Chemical structure of a steroid with a benzothiazole derivative at C-17 and an ethoxy group at C-3. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-phenyl-1,2,4-benzothiazol-5-ylmethyl group. The ethoxy group is at C-3.</p>	10
6	 <p>Chemical structure of a steroid with a piperidine-2-one derivative at C-17. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-methylpiperidin-1(2H)-one-4-ylmethyl group.</p>	279	 <p>Chemical structure of a steroid with a benzothiazole derivative at C-17 and an ethoxy group at C-3. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-phenyl-1,2,4-benzothiazol-5-ylmethyl group. The ethoxy group is at C-3.</p>	20
7	 <p>Chemical structure of a steroid with a piperidine-2-one derivative at C-17. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-methylpiperidin-1(2H)-one-4-ylmethyl group.</p>	280	 <p>Chemical structure of a steroid with a benzothiazole derivative at C-17 and an ethoxy group at C-3. The steroid core has a hydroxyl group at C-3 and a methyl group at C-10. The side chain at C-17 is a 2-phenyl-1,2,4-benzothiazol-5-ylmethyl group. The ethoxy group is at C-3.</p>	30

40

50

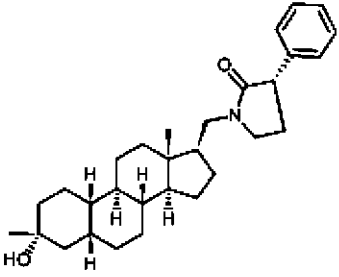
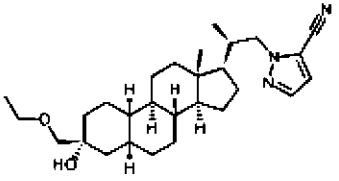
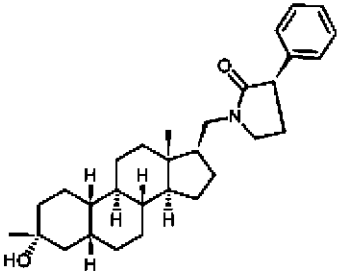
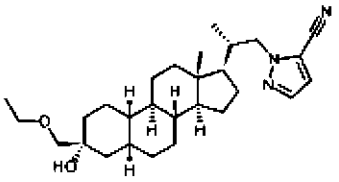
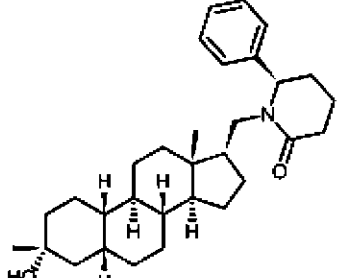
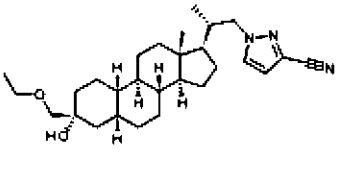
【化 3 0 4】

8	 <p>Chemical structure of a steroid with a benzamide group attached to the C-17 position.</p>	281	 <p>Chemical structure of a steroid with a 1H-imidazole-4-ylmethyl group attached to the C-17 position.</p>	10
9	 <p>Chemical structure of a steroid with a 1-phenylpyrrolidin-2-ylmethyl group attached to the C-17 position.</p>	282	 <p>Chemical structure of a steroid with a 1H-imidazole-4-ylmethyl group attached to the C-17 position and a hydroxyl group at the C-14 position.</p>	20
10	 <p>Chemical structure of a steroid with a 1-phenylpyrrolidin-2-ylmethyl group attached to the C-17 position.</p>	283	 <p>Chemical structure of a steroid with a 1H-imidazole-4-ylmethyl group attached to the C-17 position and a hydroxyl group at the C-14 position.</p>	30

40

50

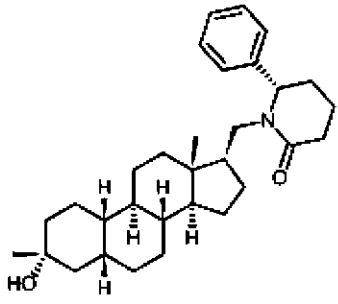
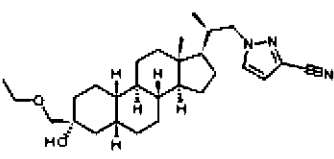
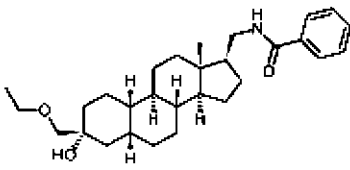
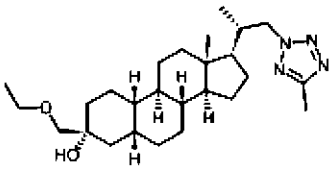
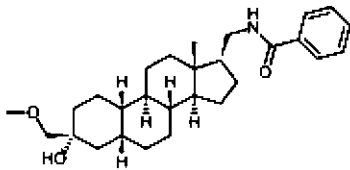
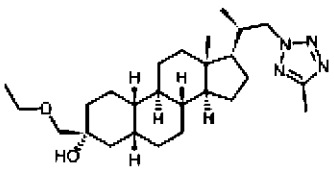
【化 3 0 5】

11		285		10
12		286		20
13		287		30

40

50

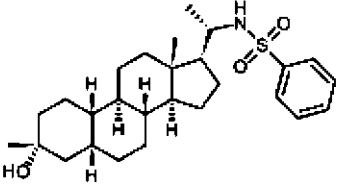
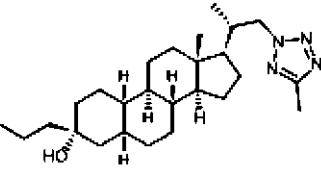
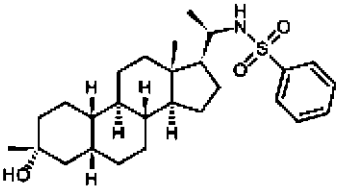
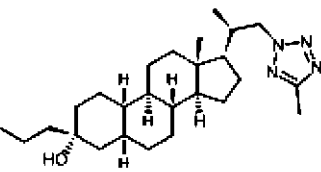
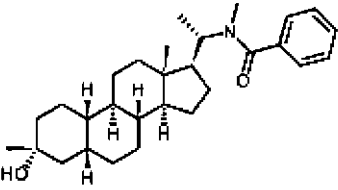
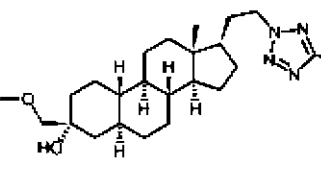
【化 3 0 6】

14		288		10
15		289		20
16		290		30

40

50

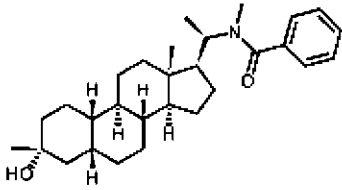
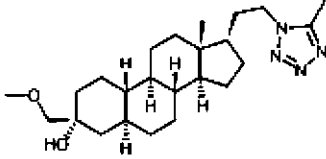
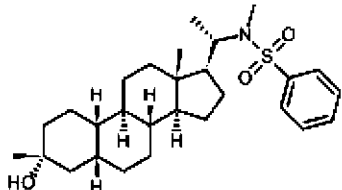
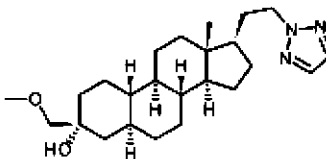
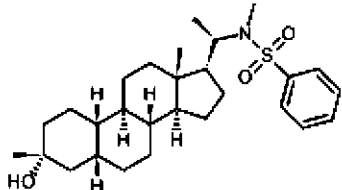
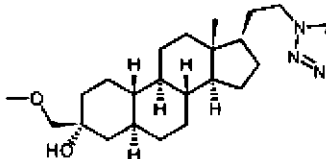
【化 3 0 7】

17		293		10
18		294		20
19		295		30

40

50

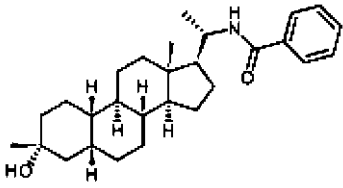
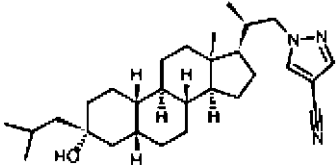
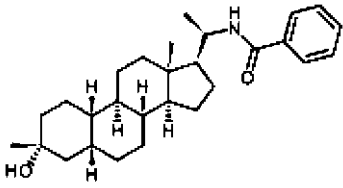
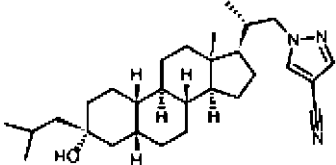
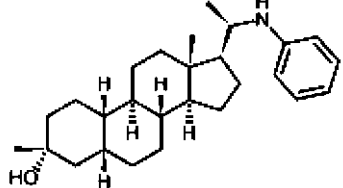
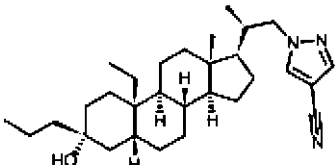
【化 3 0 8】

20		296		10
21		297		20
22		298		30

40

50

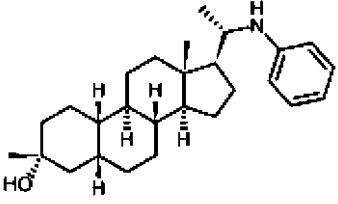
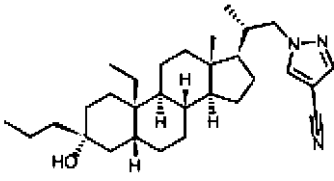
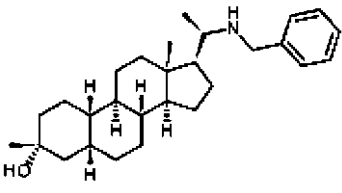
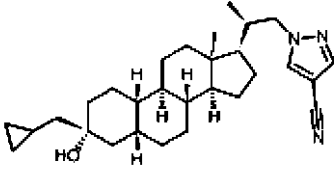
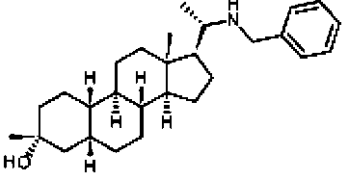
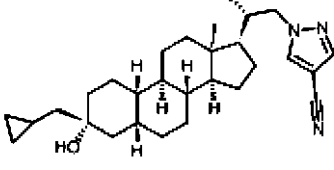
【化 3 0 9】

23		299		10
24		300		20
25		301		30

40

50

【化 3 1 0】

26		302	
27		303	
28		304	

10

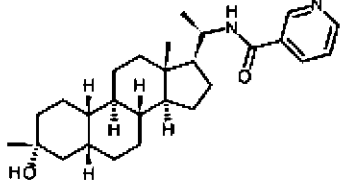
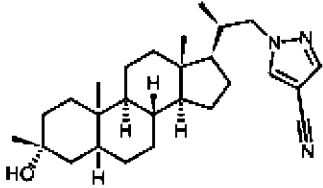
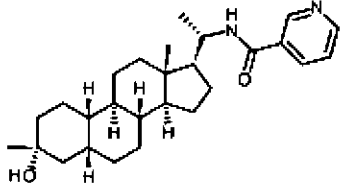
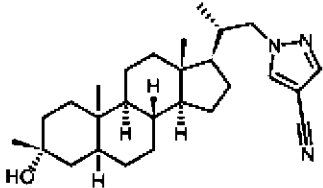
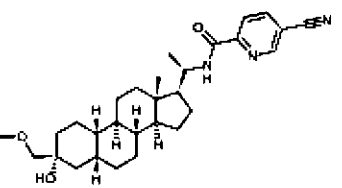
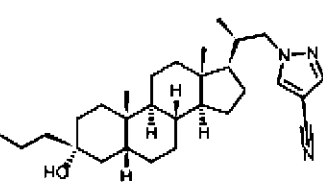
20

30

40

50

【化 3 1 1】

29		305	
30		306	
31		307	

10

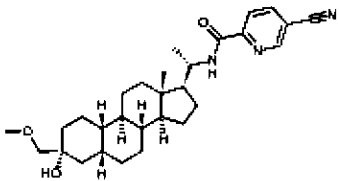
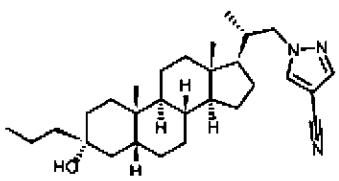
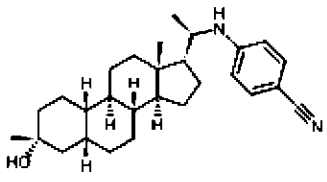
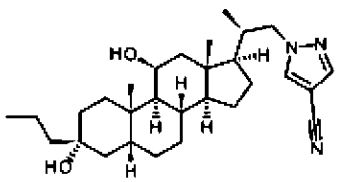
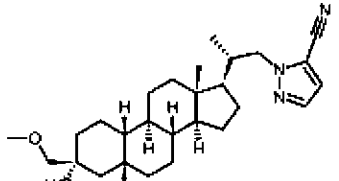
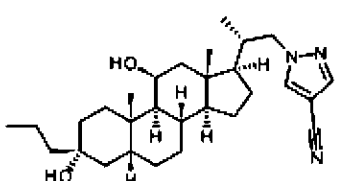
20

30

40

50

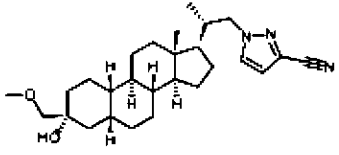
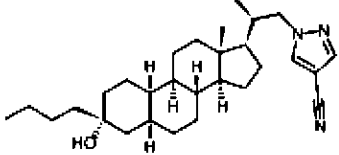
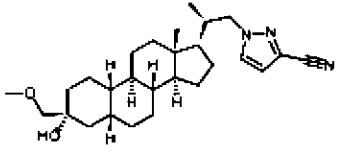
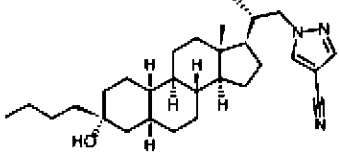
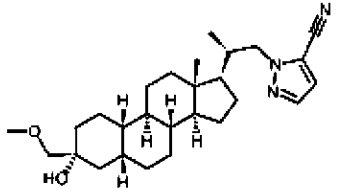
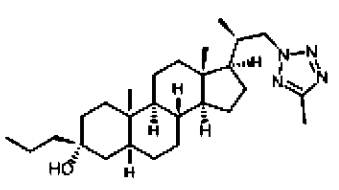
【化 3 1 2】

32		308		10
33		309		20
34		310		30

40

50

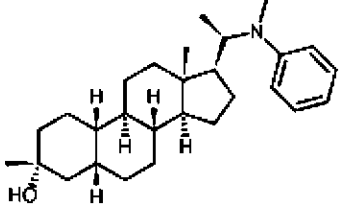
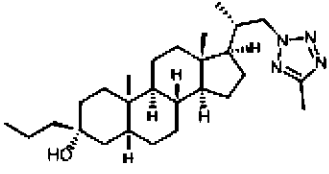
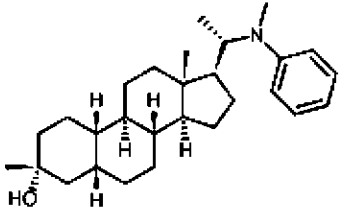
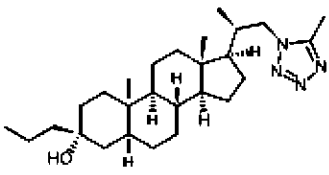
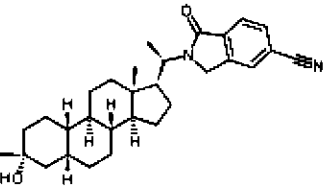
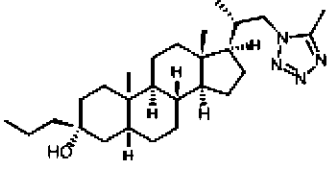
【化 3 1 3】

35		311		10
36		312		20
37		313		30

40

50

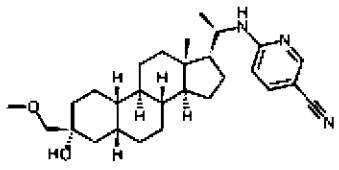
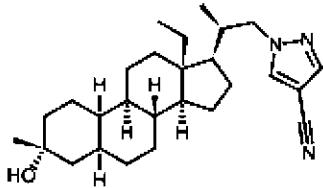
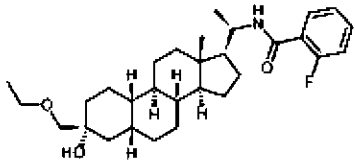
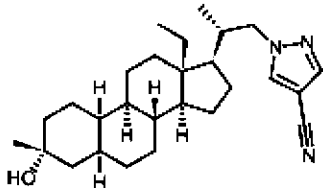
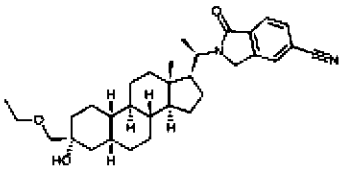
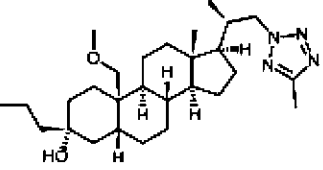
【化 3 1 4】

38		314		10
39		315		20
40		316		30

40

50

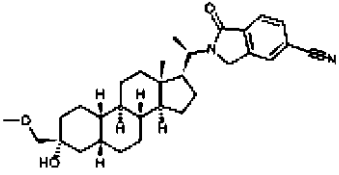
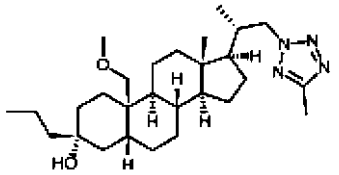
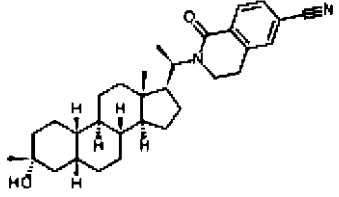
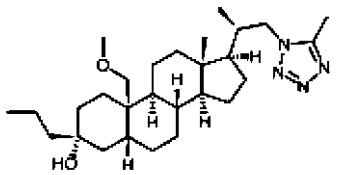
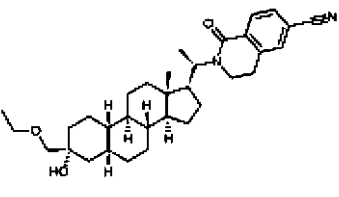
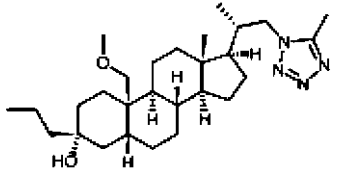
【化 3 1 5】

41		317		10
42		318		20
43		319		30

40

50

【化 3 1 6】

44	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methylene group, a carbonyl group, and a 2-cyano-1,4-benzodioxin-5-yl group.</p>	320	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methyl group, a methyl group, and a 1,2,4-triazole ring system.</p>
45	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methylene group, a carbonyl group, and a 2-cyano-1,4-benzodioxin-5-yl group.</p>	321	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methyl group, a methyl group, and a 1,2,4-triazole ring system.</p>
46	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methylene group, a carbonyl group, and a 2-cyano-1,4-benzodioxin-5-yl group.</p>	322	 <p>Chemical structure of a steroid derivative. It features a four-ring steroid nucleus with a hydroxyl group at C3, a methyl group at C10, and a methyl group at C13. At C17, there is a side chain consisting of a methyl group, a methyl group, and a 1,2,4-triazole ring system.</p>

10

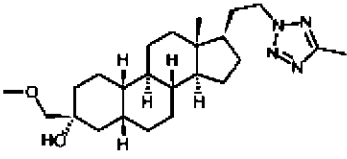
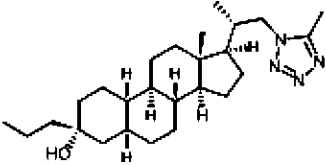
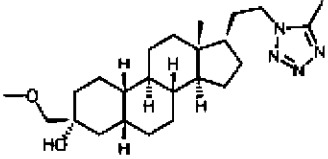
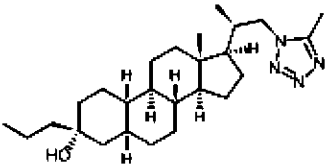
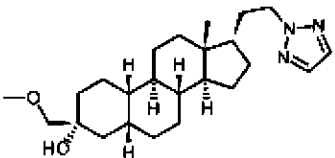
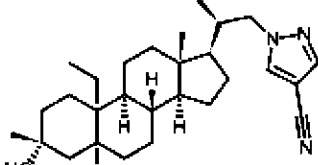
20

30

40

50

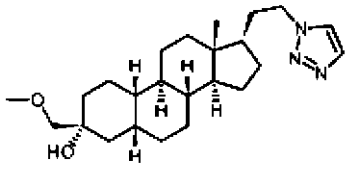
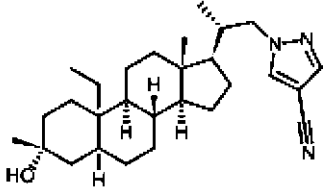
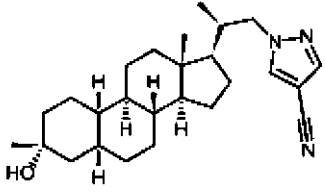
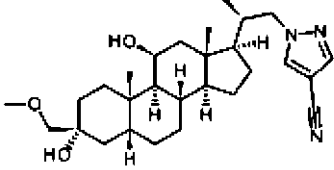
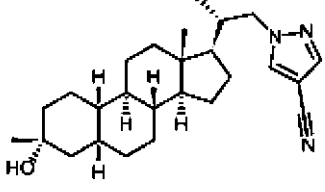
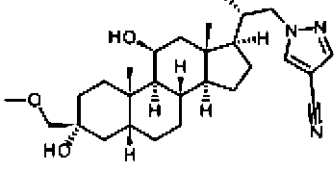
【化 3 1 7】

47		323		10
48		324		20
49		325		30

40

50

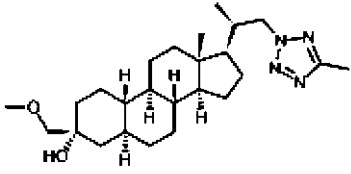
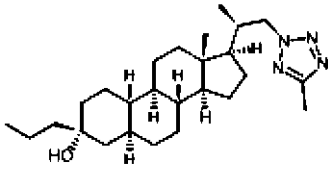
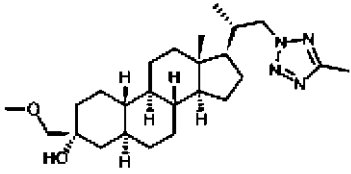
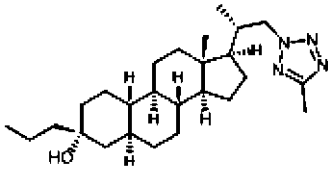
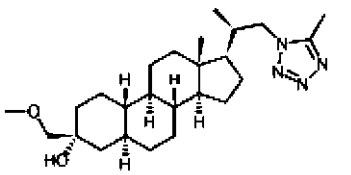
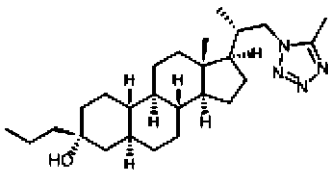
【化 3 1 8】

50		326		10
51		327		20
52		328		30

40

50

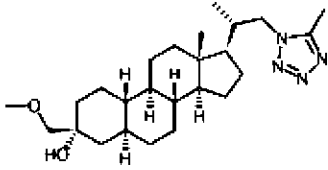
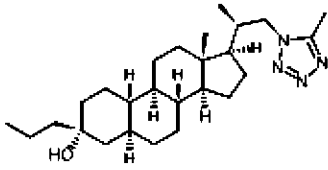
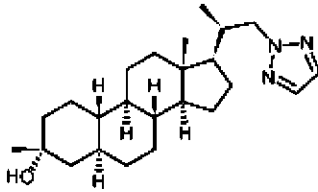
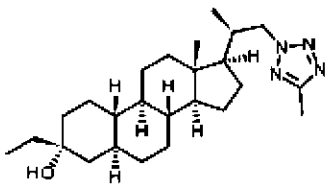
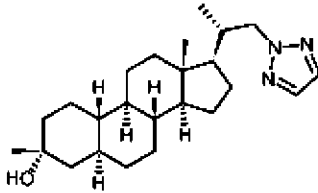
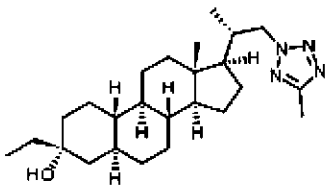
【化 3 1 9】

53		329		10
54		330		20
55		331		30

40

50

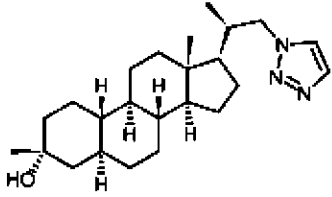
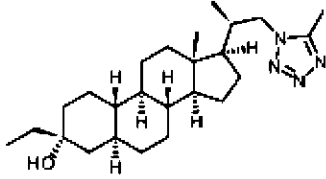
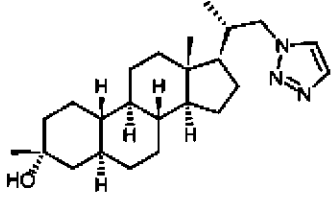
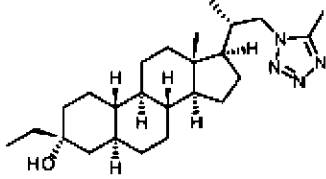
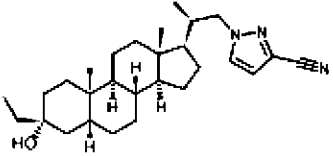
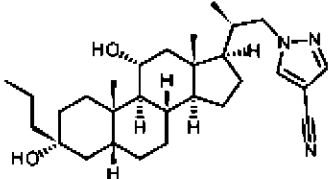
【化 3 2 0】

56		332		10
57		333		20
58		334		30

40

50

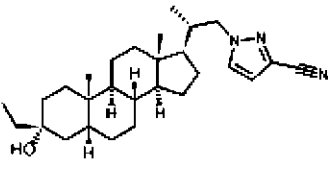
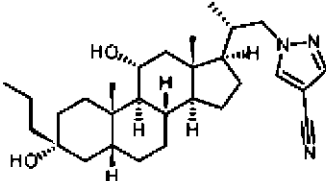
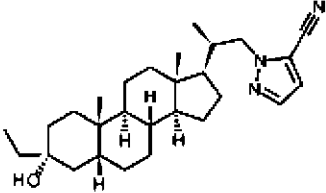
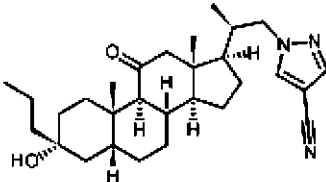
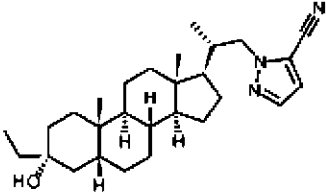
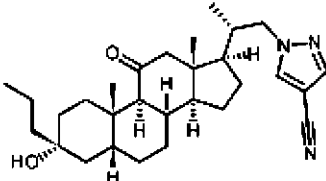
【化 3 2 1】

59		335		10
60		336		20
61		337		30

40

50

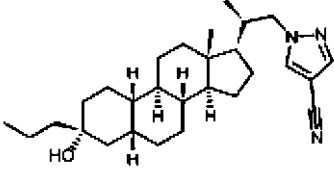
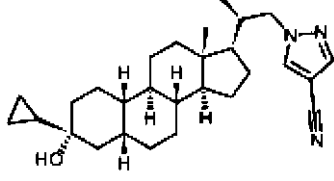
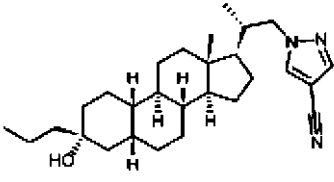
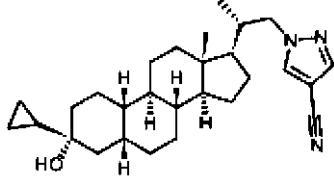
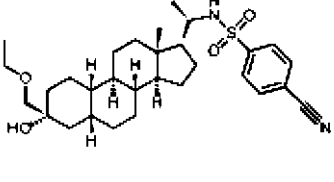
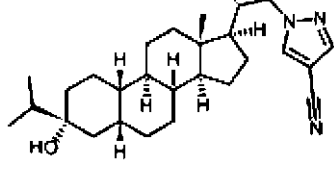
【化 3 2 2】

62		338		10
63		339		20
64		340		30

40

50

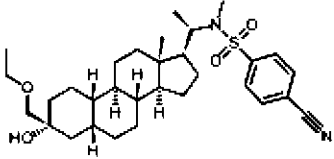
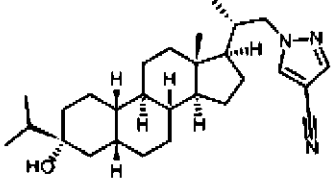
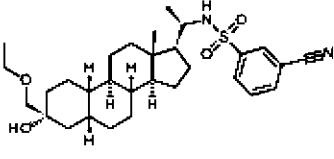
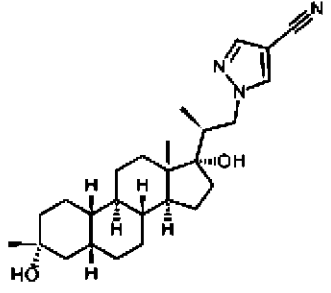
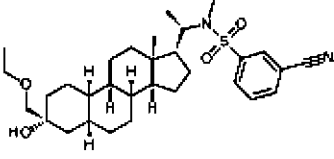
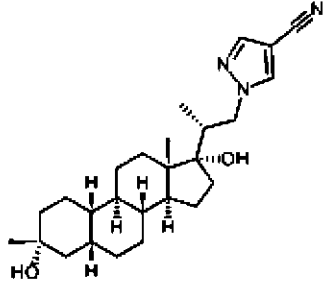
【化 3 2 3】

65		341		10
66		342		20
67		343		30

40

50

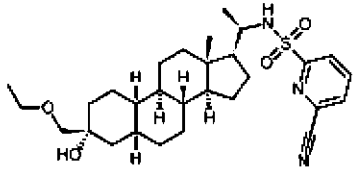
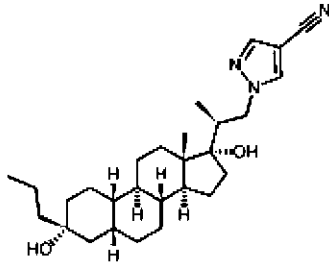
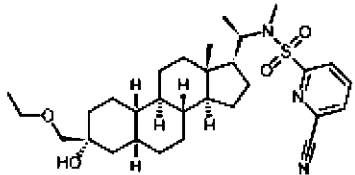
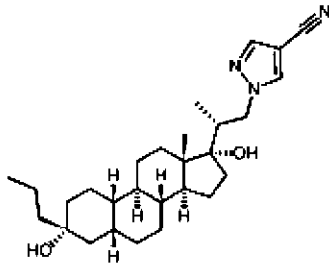
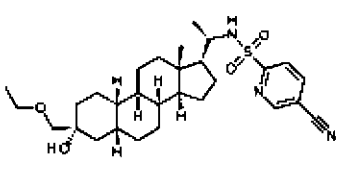
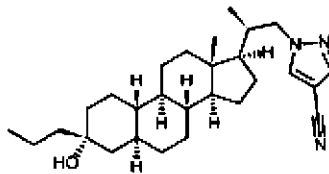
【化 3 2 4】

68		344		10
69		345		20
70		346		30

40

50

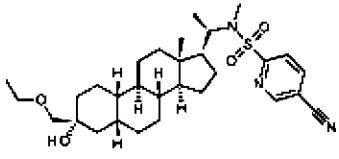
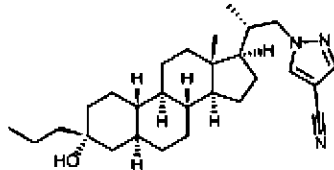
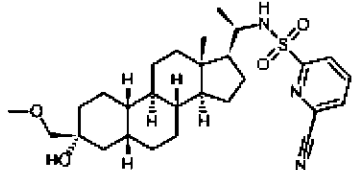
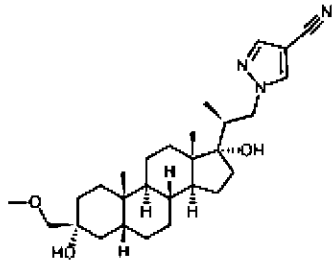
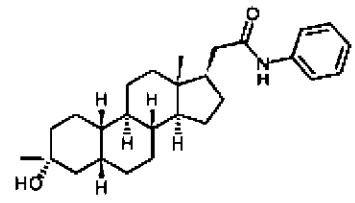
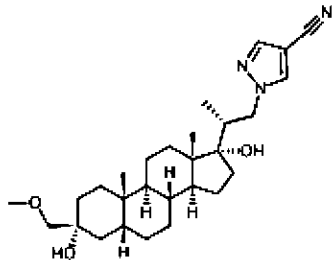
【化 3 2 5】

71		347		10
72		348		20
73		349		30

40

50

【化 3 2 6】

74		350	
75		351	
76		352	

10

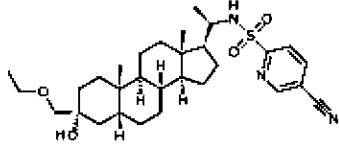
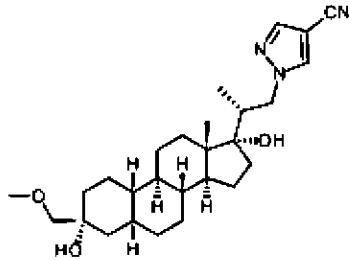
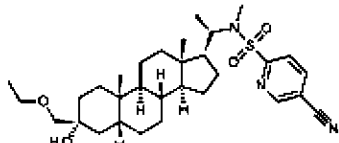
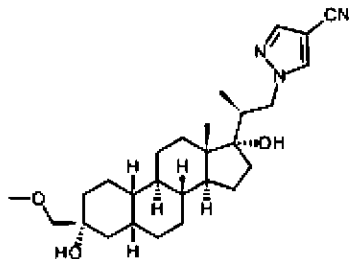
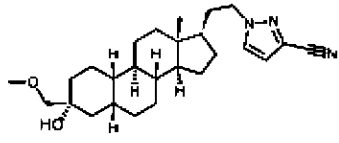
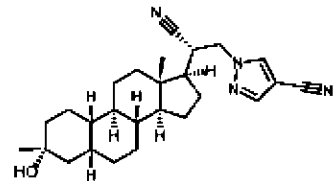
20

30

40

50

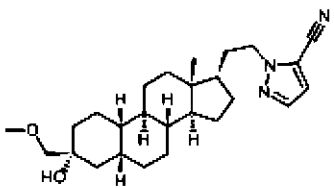
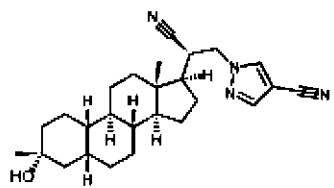
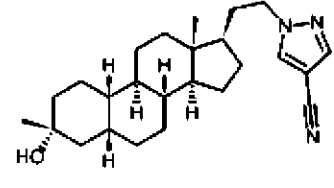
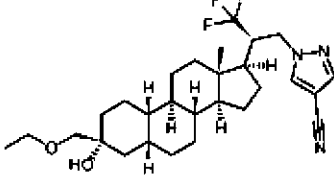
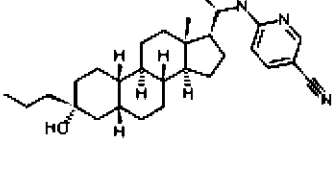
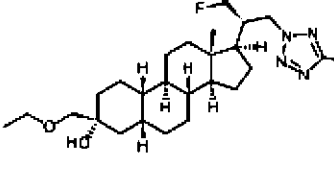
【化 3 2 7】

77		353		10
78		354		20
87		355		30

40

50

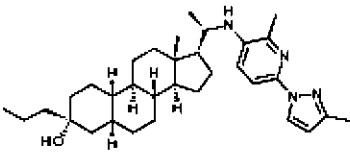
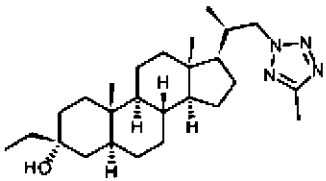
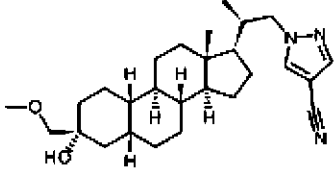
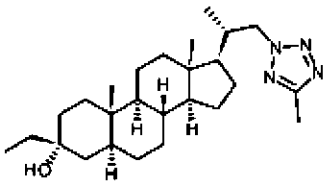
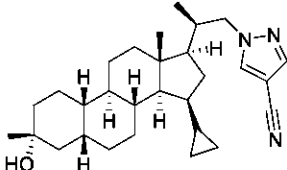
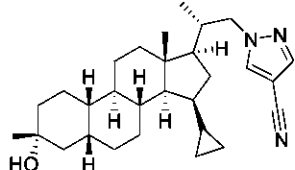
【化 3 2 8】

88		356		10
89		357		20
90		358		30

40

50

【化 3 2 9】

91		359	
92		360	
93		94	

10

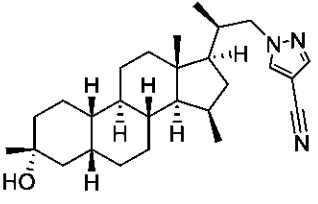
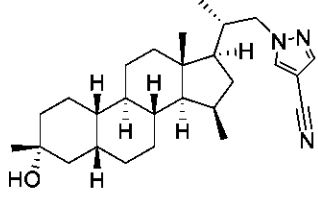
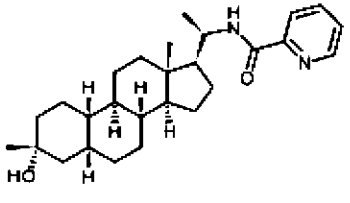
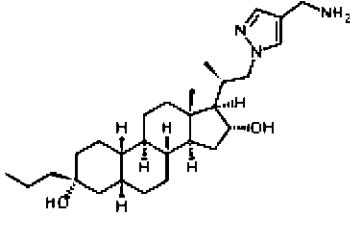
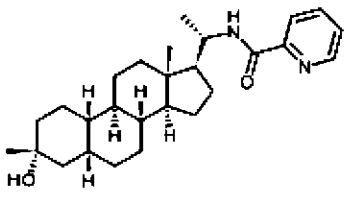
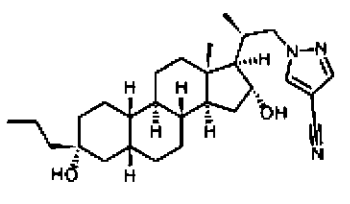
20

30

40

50

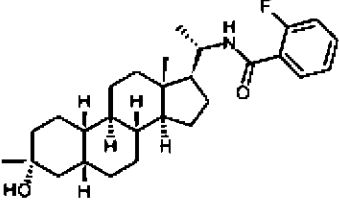
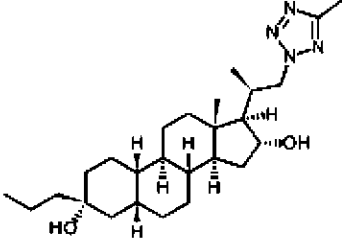
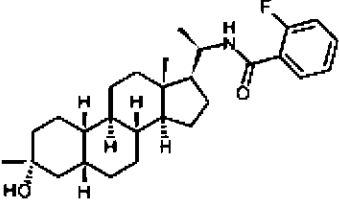
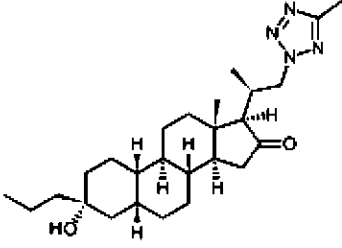
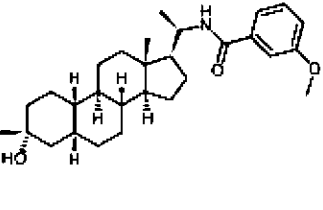
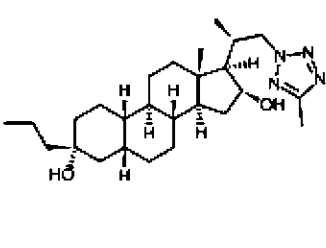
【化 3 3 0】

95		96		10
100		361		20
101		362		30

40

50

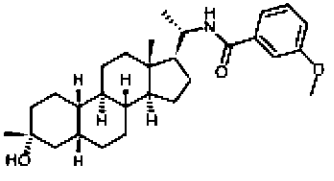
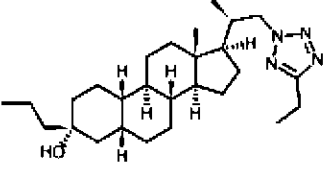
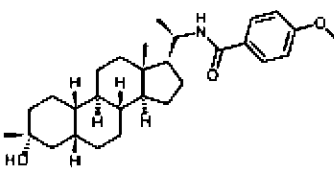
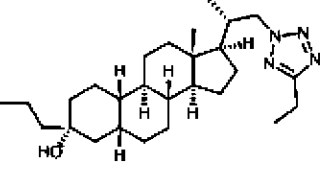
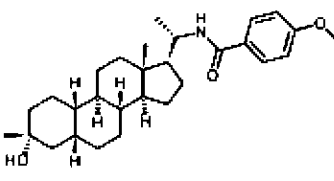
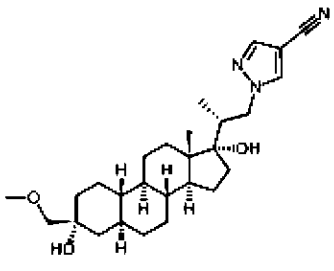
【化 3 3 1】

102		363		10
103		364		20
104		365		30

40

50

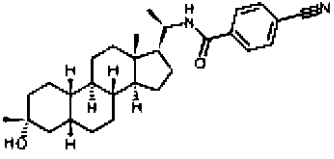
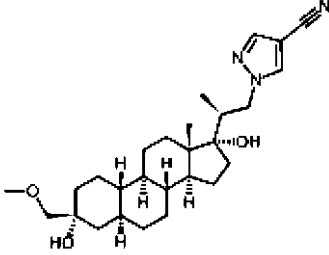
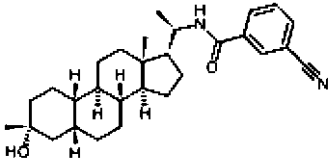
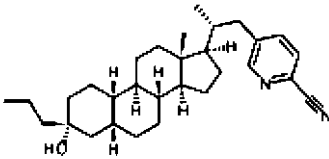
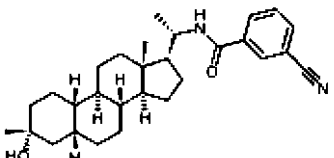
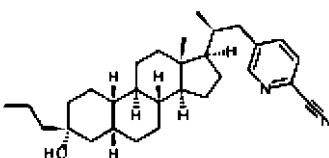
【化 3 3 2】

105		366		10
106		367		20
107		368		30

40

50

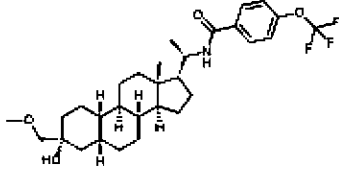
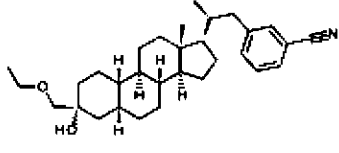
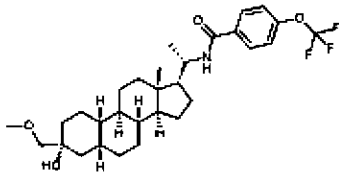
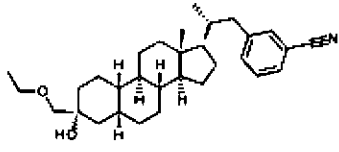
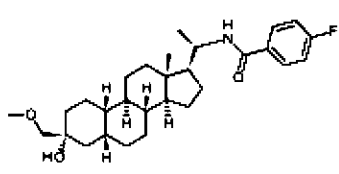
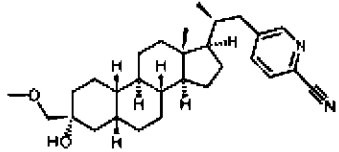
【化 3 3 3】

108		369		10
109		400		20
110		401		30

40

50

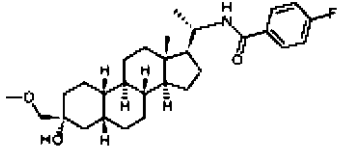
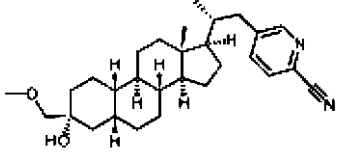
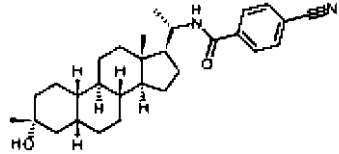
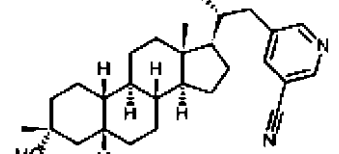
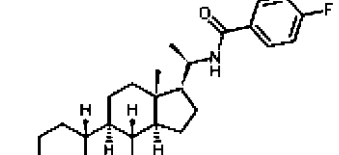
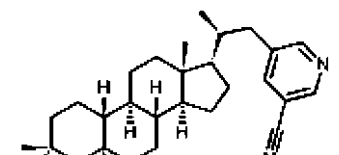
【化 3 3 4】

111		402		10
112		403		20
113		404		30

40

50

【化 3 3 5】

114		405	
115		406	
116		407	

10

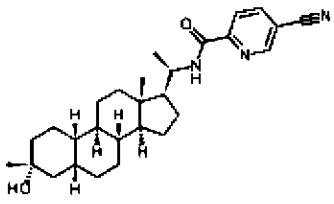
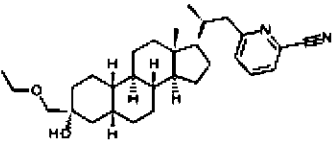
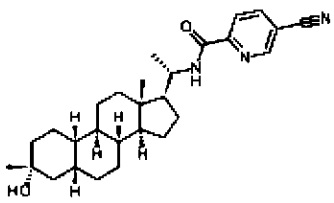
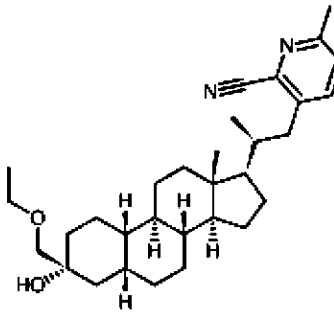
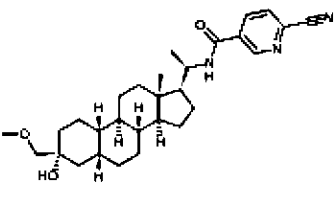
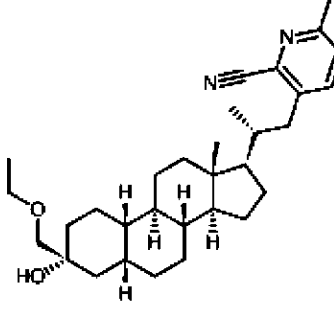
20

30

40

50

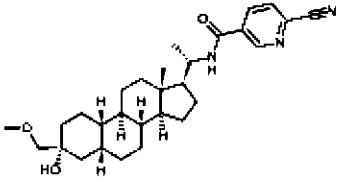
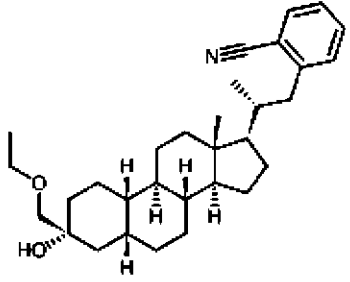
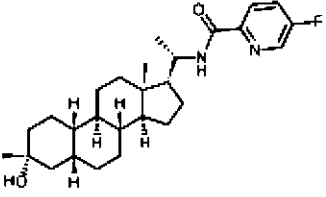
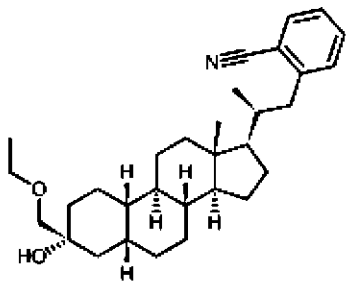
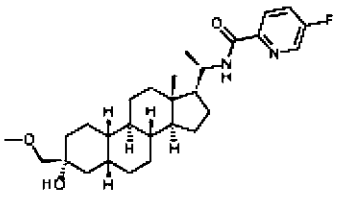
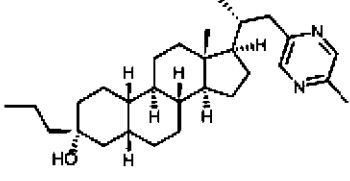
【化 3 3 7】

120		413		10
121		414		20
122		415		30

40

50

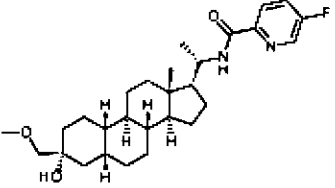
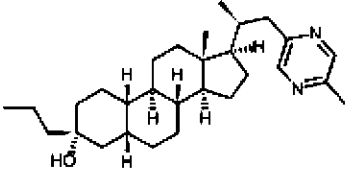
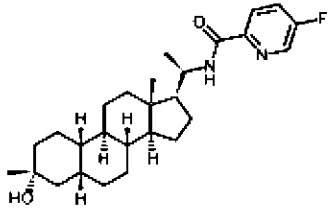
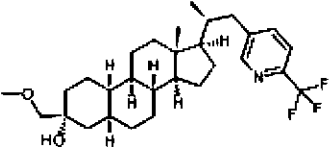
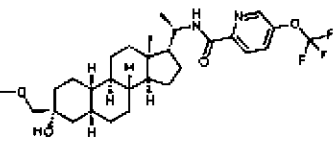
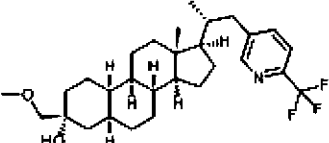
【化 3 3 8】

123		416		10
124		417		20
125		418		30

40

50

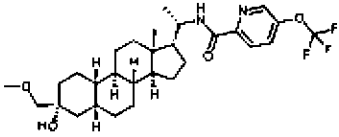
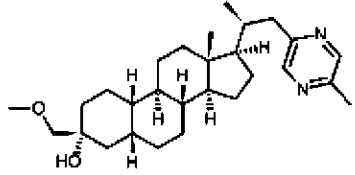
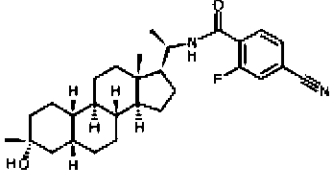
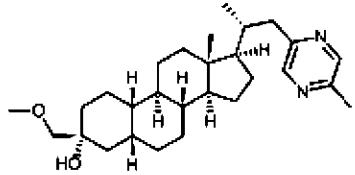
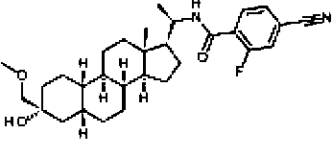
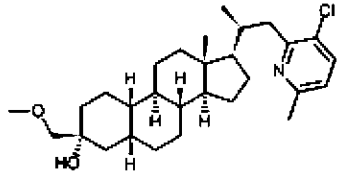
【化 3 3 9】

126		419		10
127		420		20
128		421		30

40

50

【化 3 4 0】

129		422	
130		423	
131		424	

10

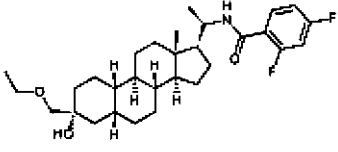
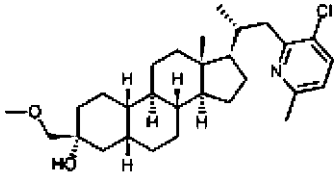
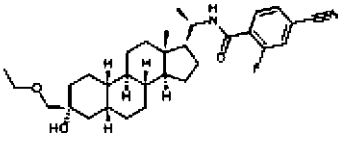
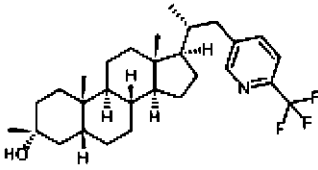
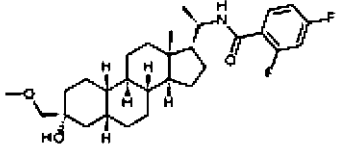
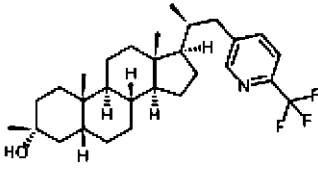
20

30

40

50

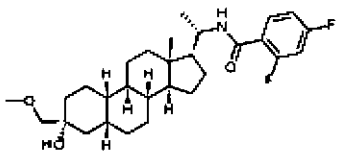
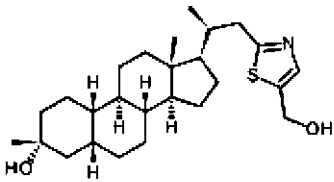
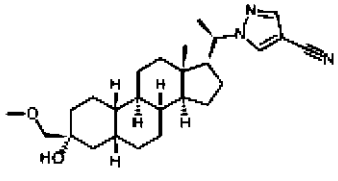
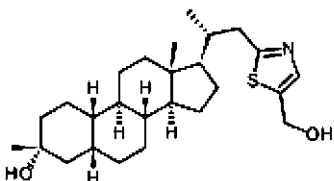
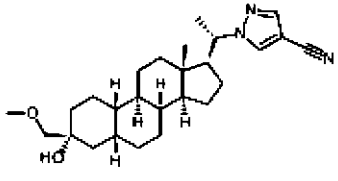
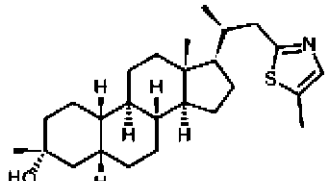
【化 3 4 1】

132		425		10
133		426		20
134		427		30

40

50

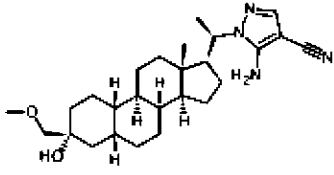
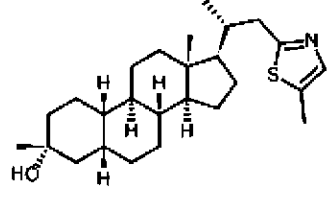
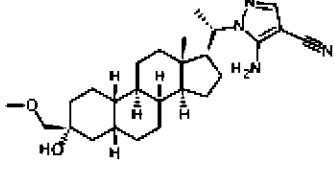
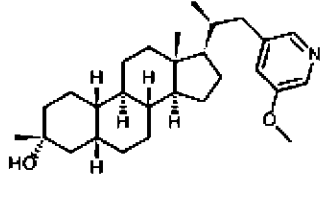
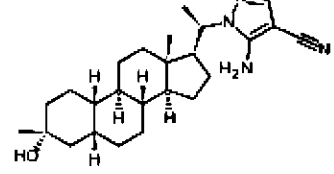
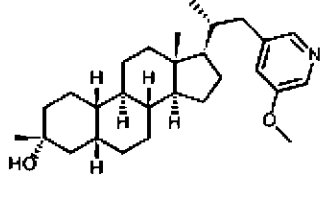
【化 3 4 2】

135		428		10
150		429		20
151		430		30

40

50

【化 3 4 3】

152		431	
153		432	
154		433	

10

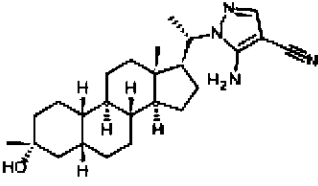
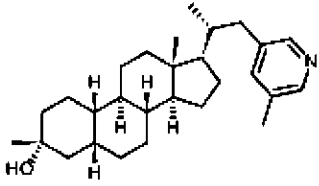
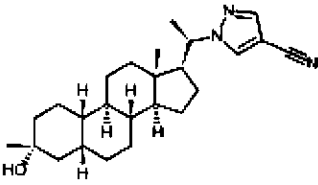
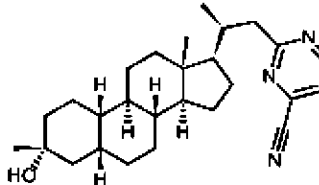
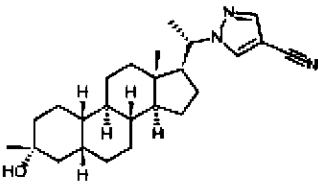
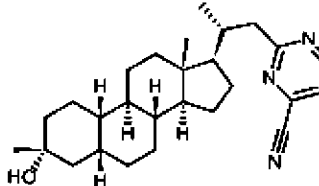
20

30

40

50

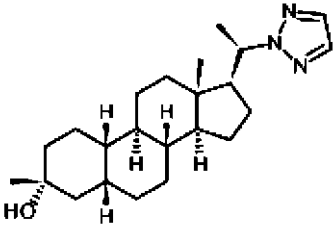
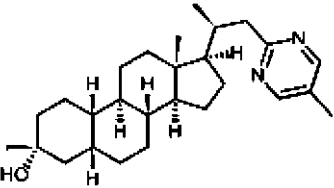
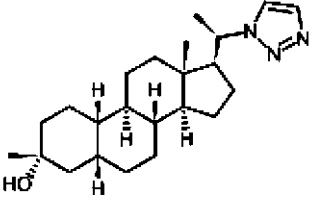
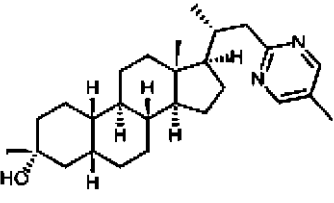
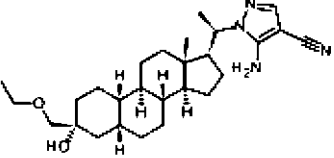
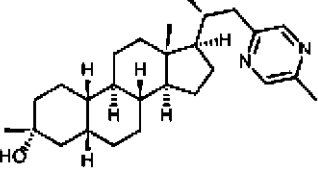
【化 3 4 4】

155		434		10
156		435		20
157		436		30

40

50

【化 3 4 5】

158		437	
159		438	
160		439	

10

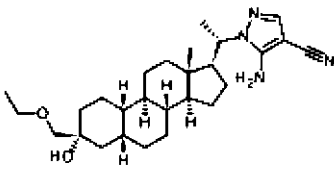
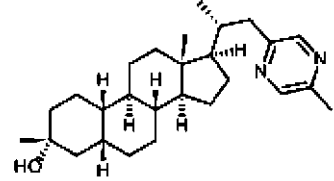
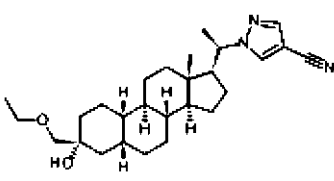
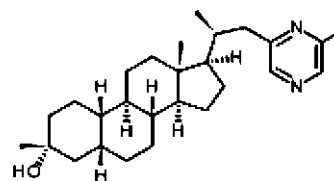
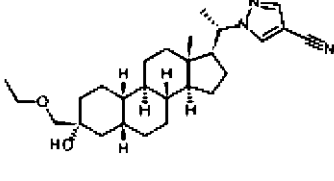
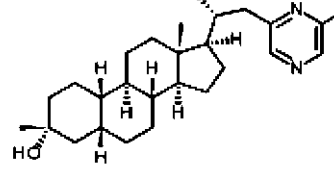
20

30

40

50

【化 3 4 6】

161		440	
162		441	
163		442	

10

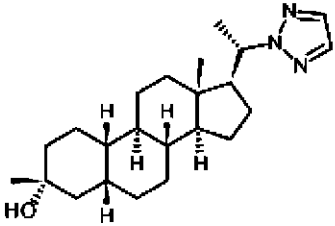
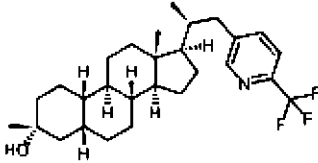
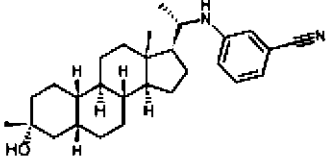
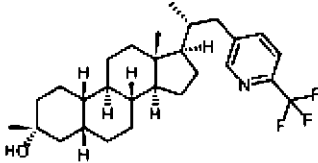
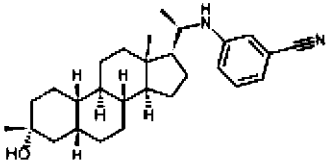
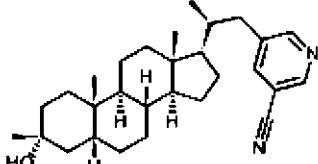
20

30

40

50

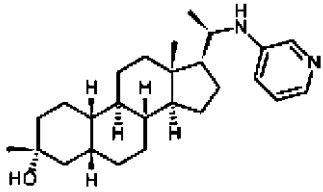
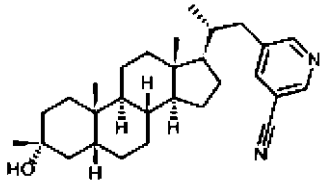
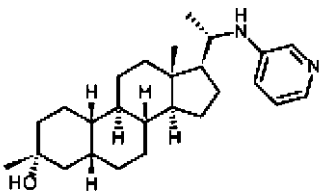
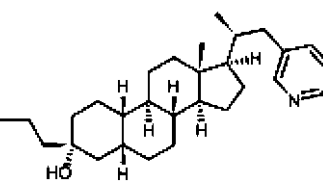
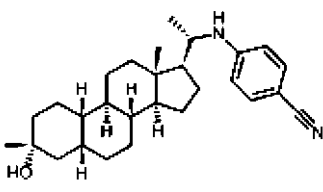
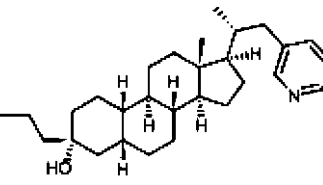
【化 3 4 7】

164		443		10
201		444		20
202		445		30

40

50

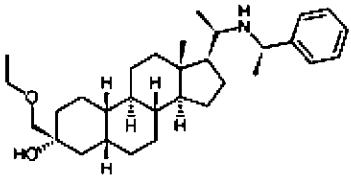
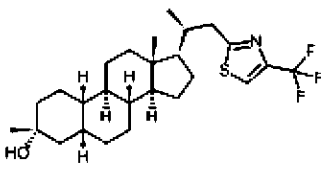
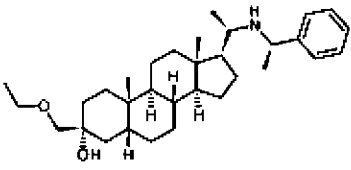
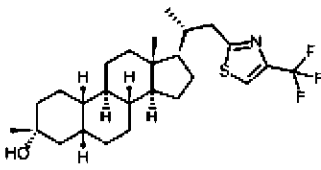
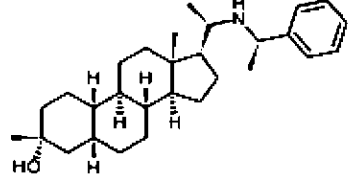
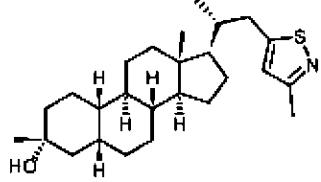
【化 3 4 8】

203		446		10
204		447		20
205		448		30

40

50

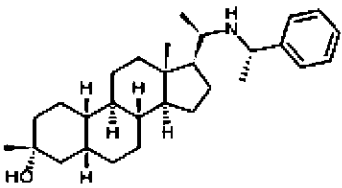
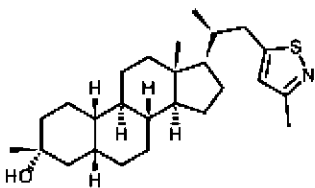
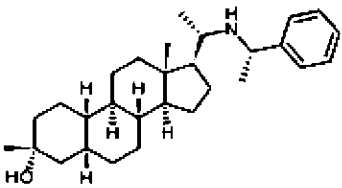
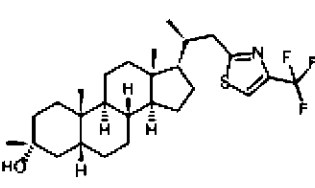
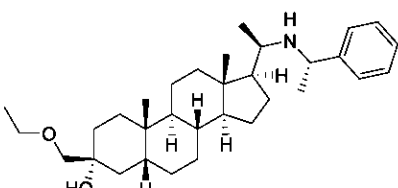
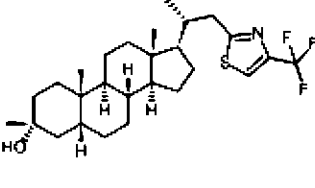
【化 3 4 9】

206		449		10
207		450		20
208		451		30

40

50

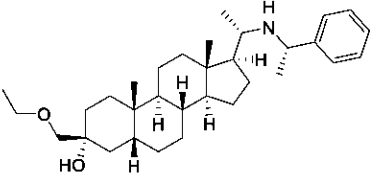
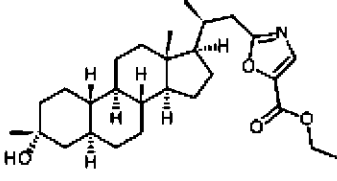
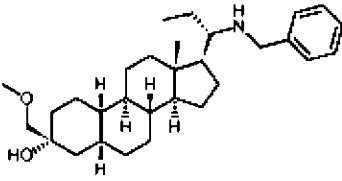
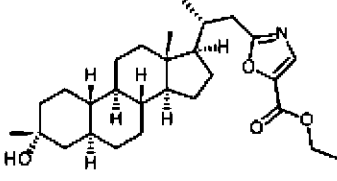
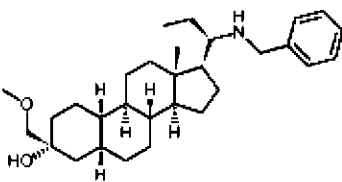
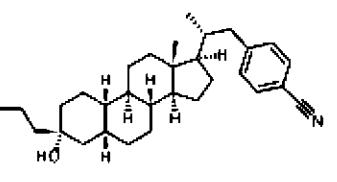
【化 3 5 0】

209		452		10
210		453		20
211		454		30

40

50

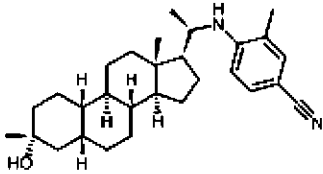
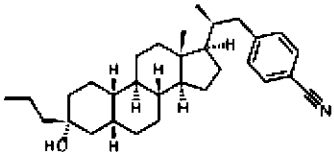
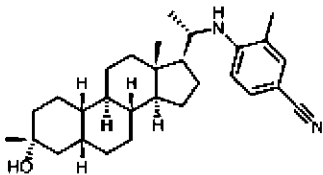
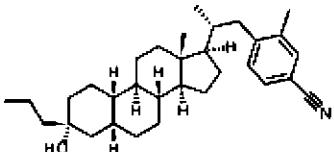
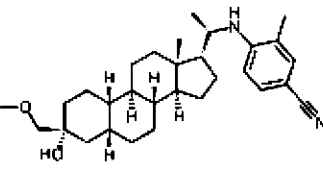
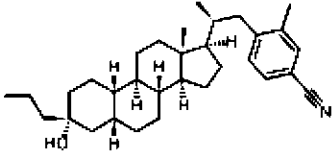
【化 3 5 1】

212		455		10
213		456		20
214		457		30

40

50

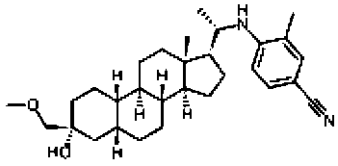
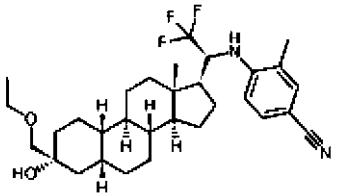
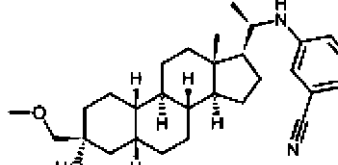
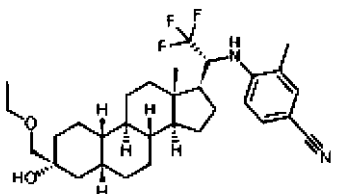
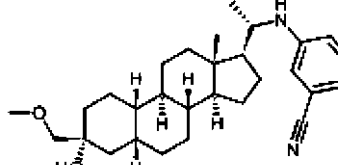
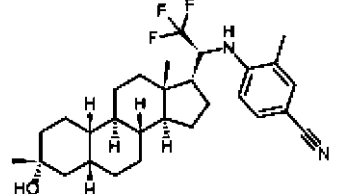
【化 3 5 2】

250		458		10
251		459		20
252		460		30

40

50

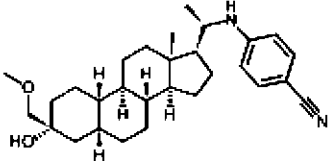
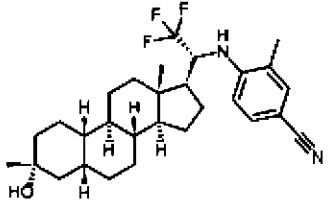
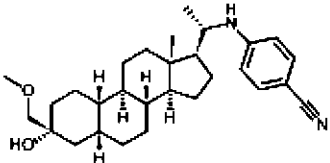
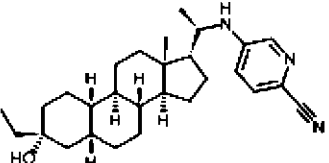
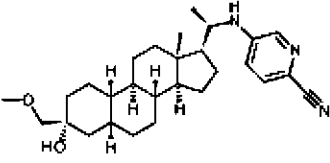
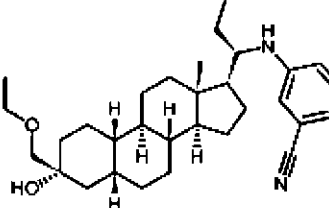
【化 3 5 3】

253		487		10
254		488		20
255		489		30

40

50

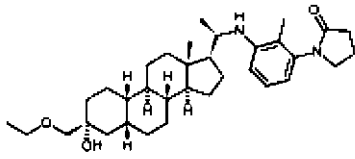
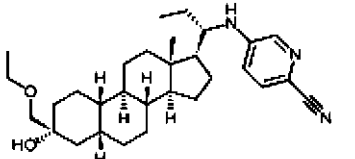
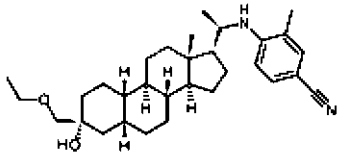
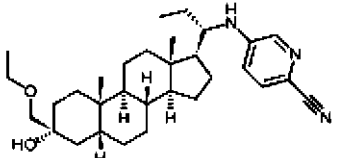
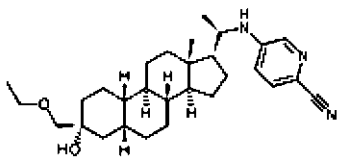
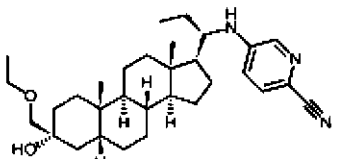
【化 3 5 4】

256		490		10
257		491		20
258		492		30

40

50

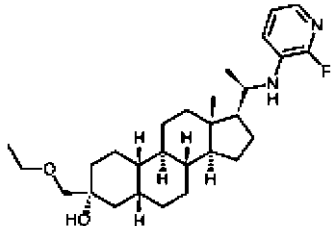
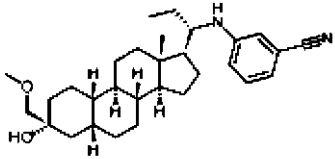
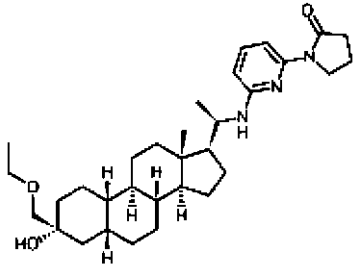
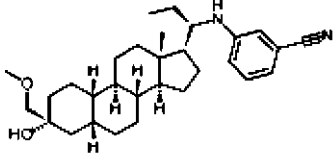
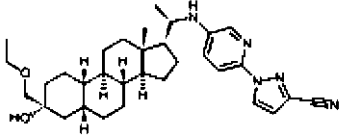
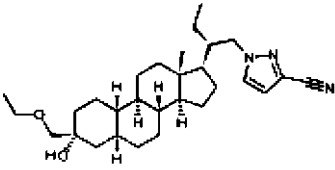
【化 3 5 5】

259		493		10
260		494		20
261		495		30

40

50

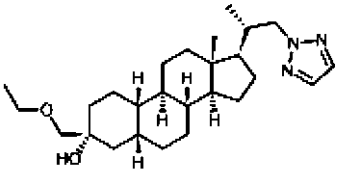
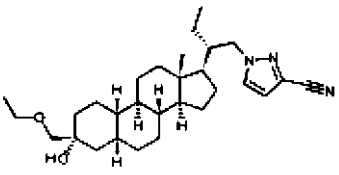
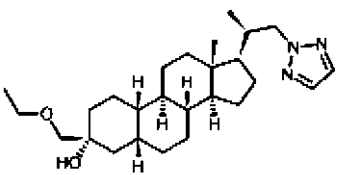
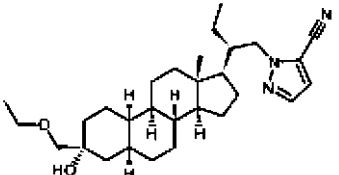
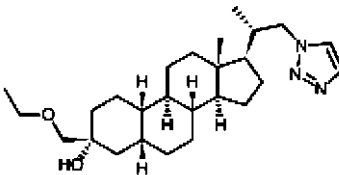
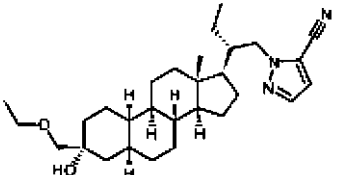
【化 3 5 6】

262		496		10
263		497		20
264		498		30

40

50

【化 3 5 7】

265		499	
266		500	
267		501	

10

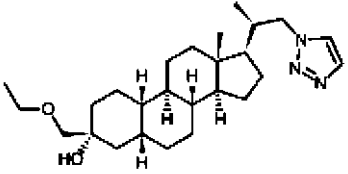
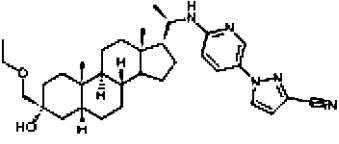
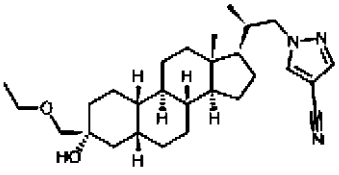
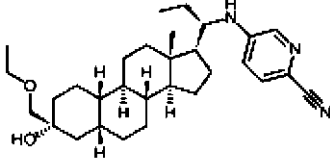
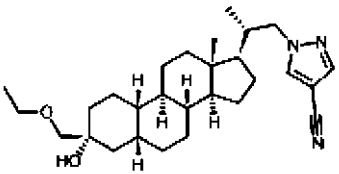
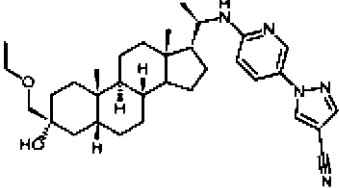
20

30

40

50

【化 3 5 8】

268		502	
269		503	
270		504	

10

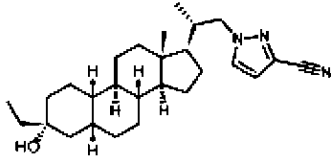
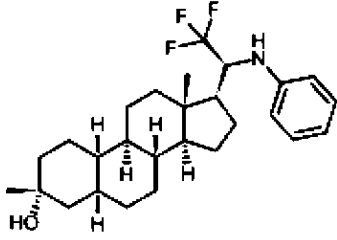
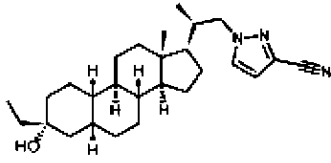
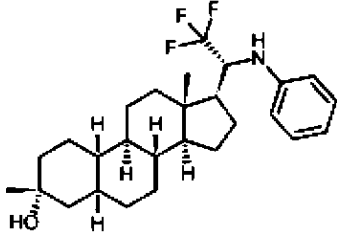
20

30

40

50

【化 3 5 9】

271		505		10
272		506		20

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。

【請求項 1 1 9】

請求項 1 ~ 1 1 8 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塩、及び薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 2 0】

C N S 関連障害の治療を必要とする対象において C N S 関連障害を治療するための、請求項 1 ~ 1 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは薬学的に許容される塩を含む、組成物または請求項 1 1 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2 1】

前記 C N S 関連障害が、睡眠障害、気分障害、統合失調症スペクトラム障害、痙攣障害、記憶及び / または認知の障害、運動障害、人格障害、自閉症スペクトラム障害、疼痛、外傷性脳損傷、血管疾患、薬物乱用障害及び / または離脱症候群、耳鳴り、またはてんかん重積状態である、請求項 1 2 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2 2】

前記 C N S 関連障害がうつ病である、請求項 1 2 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2 3】

前記うつ病が産後うつ病である、請求項 1 2 2 に記載の組成物。

【請求項 1 2 4】

前記うつ病が大うつ病性障害である、請求項 1 2 2 に記載の組成物。

【請求項 1 2 5】

前記大うつ病性障害が中等度の大うつ病性障害である、請求項 1 2 4 に記載の組成物。

【請求項 1 2 6】

前記大うつ病性障害が、重度の大うつ病性障害である、請求項 1 2 4 に記載の組成物。

【請求項 1 2 7】

前記 C N S 関連障害が発作である、請求項 1 2 0 に記載の組成物。

30

40

50

【請求項 1 2 8】

前記 C N S 関連障害が振戦である、請求項 1 2 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2 9】

前記振戦が本態性振戦である、請求項 1 2 8 に記載の組成物。

【請求項 1 3 0】

前記組成物が経口投与される、請求項 1 2 0 ~ 1 2 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 3 1】

前記組成物が長期投与される、請求項 1 2 0 ~ 1 3 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 3 2】

鎮静および/または麻酔の誘発を必要とする対象において鎮静および/または麻酔を誘発するための、請求項 1 ~ 1 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくは薬学的に許容される塩を含む、組成物または請求項 1 1 9 に記載の医薬組成物。

10

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 9 4 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 9 4 5】

当業者は、本明細書に記載の具体的な実施形態に対する多くの同等物を認識しているか、または日常的な実験のみを用いて確認することができるであろう。本明細書に記載の本実施形態の範囲は、上記の「発明を実施するための形態」に限定されることを意図されず、添付の特許請求の範囲に記載されている通りである。以下の特許請求の範囲に定義される本発明の趣旨または範囲から逸脱することなく、本記述に種々の変更及び改変がなされ得ることが当業者には明らかであろう。

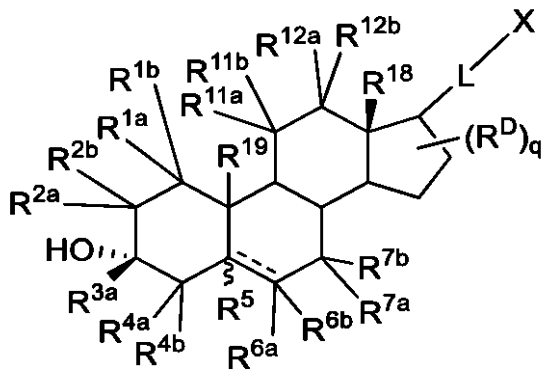
20

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (I) :

【化 1 9 7】



(I)

30

[式中 :

【化 1 9 8】

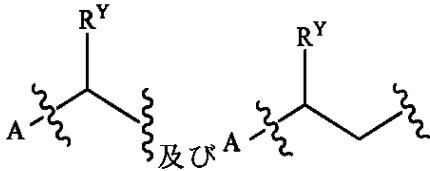
は単結合または二重結合を表し、二重結合が存在する場合、R^{6 a}またはR^{6 b}のうち一方が存在せず、R⁵は存在しない；

L は

40

50

【化199】



(式中、AはC17との結合点を表す)からなる群より選択され；

Xは、 $-C(O)N(R^{5.5a})(R^{5.5b})$ 、 $-N(R^{5.5a})(R^{5.5b})$ 、 $-N(R^{5.5b})C(O)(R^{5.5a})$ 、及び $R^{5.5c}$ からなる群より選択され；

R^Y は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロアルキル、または非置換アルキルであり；

$R^{5.5c}$ は、炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールまたは置換もしくは非置換アリールであり；

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ は、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)SR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2R^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A1}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-S(=O)_2OR^{A1}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{A1})_2$ であり、 R^{A1} の各存在が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基(酸素結合時)、窒素保護基(窒素結合時)、硫黄保護基(硫黄結合時)から選択されるが、2つの R^{A1} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

あるいは、 $R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ は、介在原子と一緒に置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく；

R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{11a} 、 R^{11b} 、 R^{12a} 、及び R^{12b} のそれぞれは独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)SR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2R^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})S(=O)_2N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A1}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{A1}$ 、 $-S(=O)_2OR^{A1}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{A1})_2$ であり、 R^{A1} の各存在が独立して、水素、置

10

20

30

40

50

換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、硫黄保護基（硫黄結合時）から選択されるか、あるいは、 $R^{1.1.a}$ と $R^{1.1.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成するか； $R^{1.2.a}$ と $R^{1.2.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成するか； $R^{4.a}$ と $R^{4.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成するか； $R^{7.a}$ と $R^{7.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成するか； $R^{2.a}$ と $R^{2.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成するか、 $R^{1.a}$ と $R^{1.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成し；

$R^{3.a}$ は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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^5 は、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

$R^{6.a}$ 及び $R^{6.b}$ のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは $R^{6.a}$ と $R^{6.b}$ が連結されてオキソ（=O）基を形成し；

R^D は独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、オキソ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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、 $-OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})_2$ 、 $-SR^{C3}$ 、 $-C(=O)R^{C3}$ 、 $-C(=O)OR^{C3}$ 、 $-C(=O)SR^{C3}$ 、 $-C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)R^{C3}$ 、 $-OC(=O)OR^{C3}$ 、 $-OC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2R^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-SC(=O)R^{C3}$ 、 $-SC(=O)OR^{C3}$ 、 $-SC(=O)SR^{C3}$ 、 $-SC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C3}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{C3})_2$ であり、 R^{C3} の各存在が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリル、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）、または硫黄保護基（硫黄結合時）から選択され；

$R^{1.8}$ は、置換または非置換アルキルであり；

$R^{1.9}$ は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルであり；

q は、0～5の整数であり；

ただし、化合物は

10

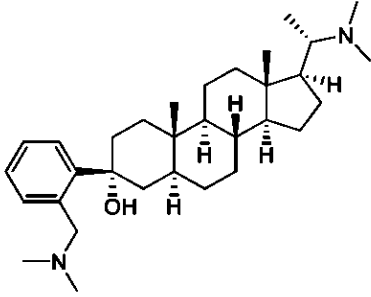
20

30

40

50

【化200】



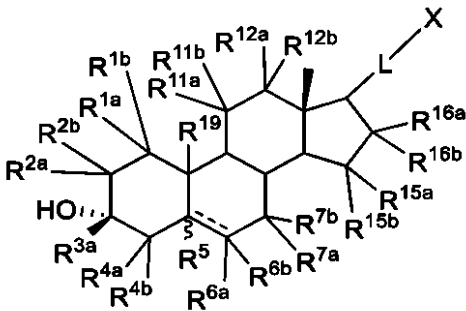
10

またはその薬学的に許容される塩ではない]の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(項目2)

前記化合物が、式(I-I)

【化201】



(I-I)

20

[式中、

R^{15a} 、 R^{15b} 、 R^{16a} 、及び R^{16b} のそれぞれは、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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、 $-OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})_2$ 、 $-SR^{C3}$ 、 $-C(=O)R^{C3}$ 、 $-C(=O)OR^{C3}$ 、 $-C(=O)SR^{C3}$ 、 $-C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)R^{C3}$ 、 $-OC(=O)OR^{C3}$ 、 $-OC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-OC(=O)SR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2R^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-OS(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})C(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})C(=NR^{C3})N(R^{C3})_2$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2OR^{C3}$ 、 $-N(R^{C3})S(=O)_2N(R^{C3})_2$ 、 $-SC(=O)R^{C3}$ 、 $-SC(=O)OR^{C3}$ 、 $-SC(=O)SR^{C3}$ 、 $-SC(=O)N(R^{C3})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C3}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C3}$ 、または $-S(=O)_2N(R^{C3})_2$ であり、 R^{C3} の各存在が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、置換もしくは非置換カルボシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロシクリル、酸素保護基(酸素結合時)、窒素保護基(窒素結合時)、硫黄保護基(硫黄結合時)から選択されるか、 R^{15a} と R^{15b} が連結されてオキソ(=O)基を形成するか、 R^{16a} と R^{16b} が連結されてオキソ(=O)基を形成する]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に記載の化合物。

30

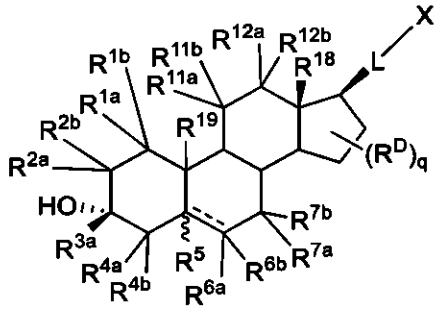
40

(項目3)

前記化合物が、式(I-a)：

50

【化 2 0 2】



(I - a)

10

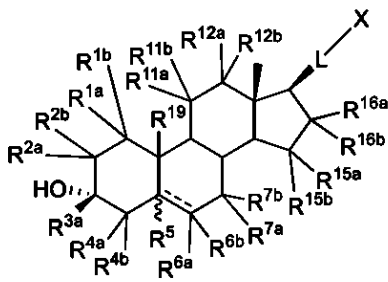
[式中、変数は項目 1 に定義される通りである]

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 に記載の化合物。

(項目 4)

前記化合物が、式 (I - I a) :

【化 2 0 3】



(I - I a)

20

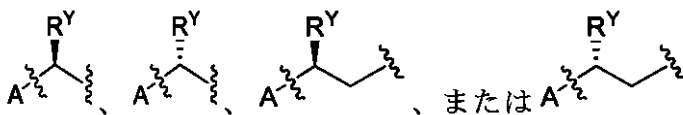
[式中、変数は項目 1 または 2 に定義される通りである]

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 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5)

L が、

【化 2 0 4】



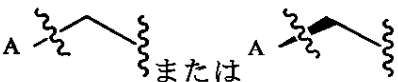
30

である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6)

L が、

【化 2 0 5】



40

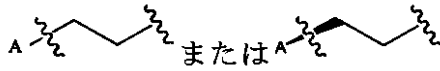
である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

L が、

50

【化 2 0 6】

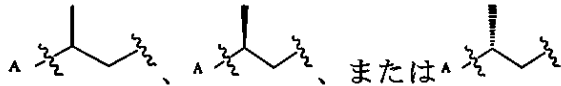


である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8)

L が、

【化 2 0 7】



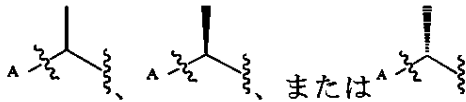
10

である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

L が、

【化 2 0 8】



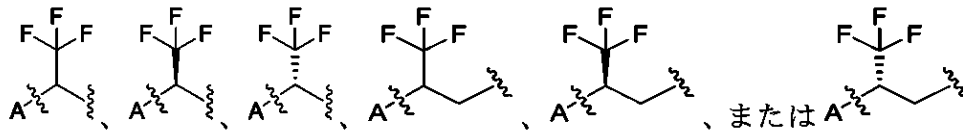
20

である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

L が、

【化 2 0 9】



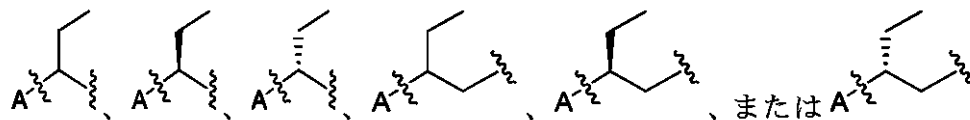
30

である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 11)

L が、

【化 2 1 0】



40

である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 12)

X が、 $-N(R^{5.5b})C(O)(R^{5.5a})$ である、項目 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 13)

X が、 $-N(R^{5.5a})(R^{5.5b})$ である、項目 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 14)

X が、 $-C(O)N(R^{5.5a})(R^{5.5b})$ である、項目 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 15)

$R^{5.5a}$ が、水素またはメチルであり、 $R^{5.5b}$ が、置換もしくは非置換アルキル、置

50

置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物

(項目 16)

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物

10

(項目 17)

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 18)

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ が、それぞれ独立して、置換カルボシクリル、置換ヘテロシクリル、置換アリール、または置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 19)

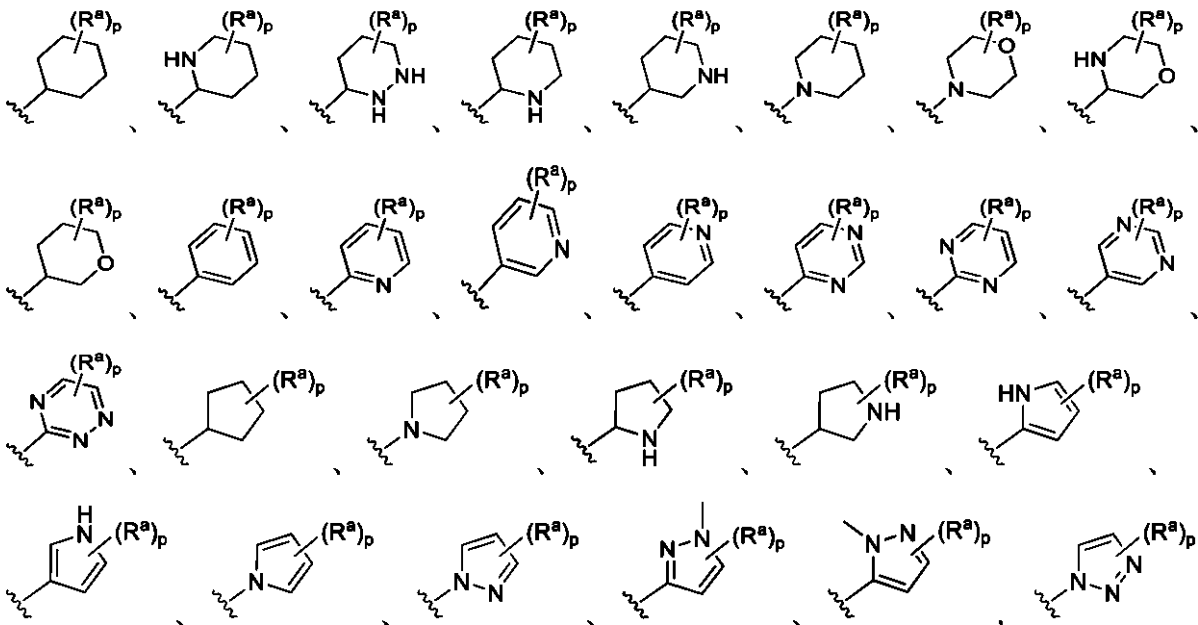
少なくとも $R^{5.5a}$ または $R^{5.5b}$ が、水素以外である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

(項目 20)

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、

【化 2 1 1】

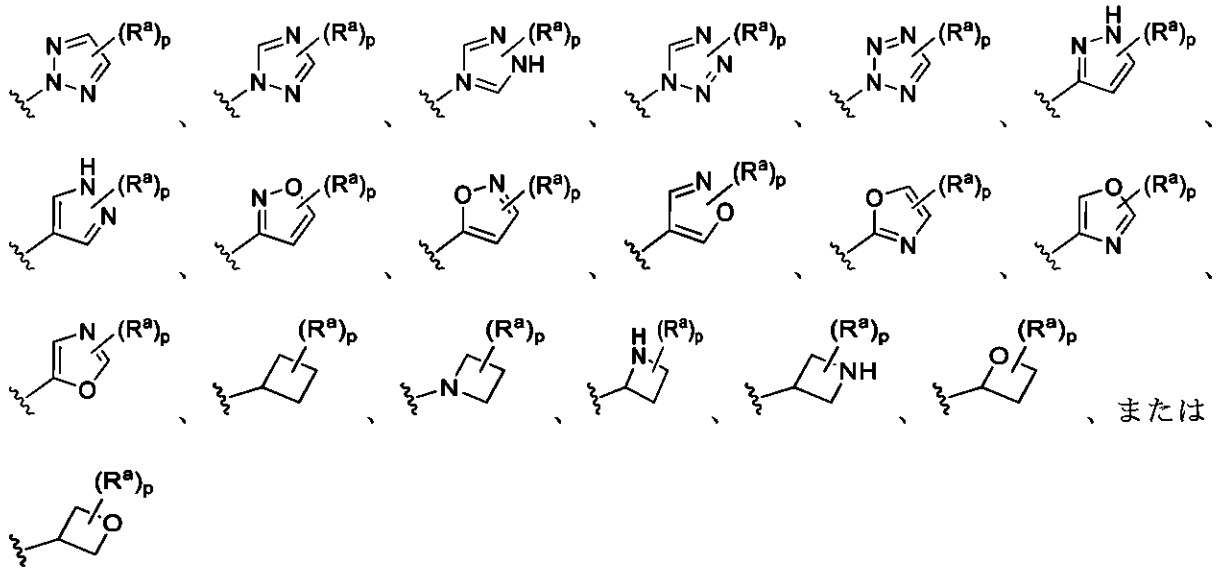


30

40

50

【化 2 1 2】



10

であり；

式中；

R^a の各存在は、独立して、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{5-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

20

R^{D4} の各存在は、独立して、水素、置換または非置換 C_{1-6} アルキル、置換または非置換 C_{2-6} アルケニル、置換または非置換 C_{2-6} アルキニル、置換または非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換または非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換または非置換 C_{5-10} アリール、置換または非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

30

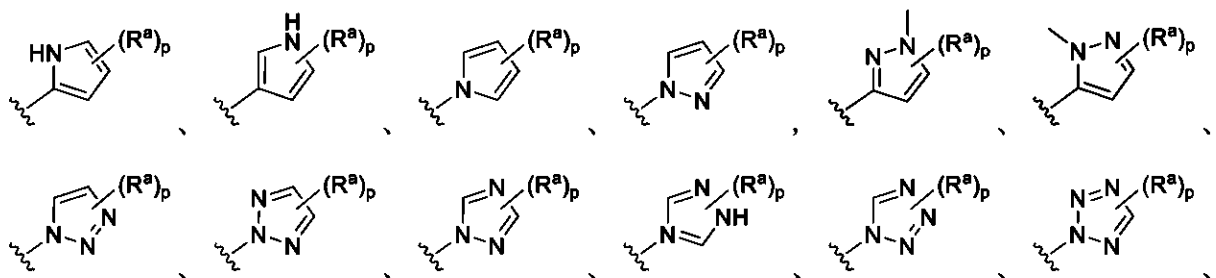
p は、0 ~ 11 から選択される整数である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 1)

$R^{5.5a}$ 及び $R^{5.5b}$ が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、

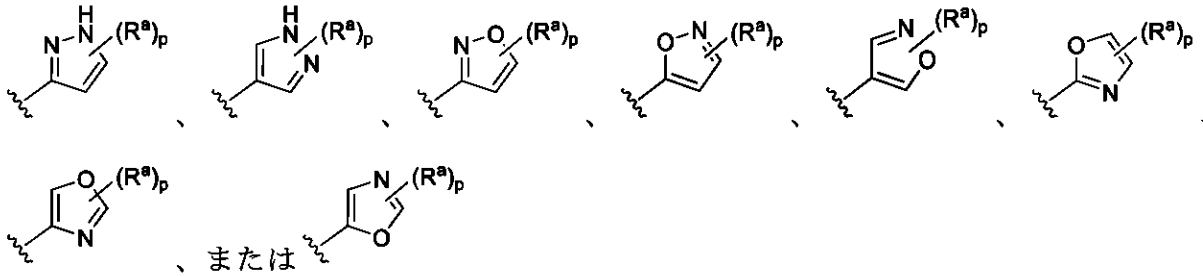
40

【化 2 1 3】



50

【化 2 1 4】



10

であり；

式中；

R^a の各存在は、独立して、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{5-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

20

R^{D4} の各存在は、独立して、水素、置換または非置換 C_{1-6} アルキル、置換または非置換 C_{2-6} アルケニル、置換または非置換 C_{2-6} アルキニル、置換または非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換または非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換または非置換 C_{5-10} アリール、置換または非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D4} 基が介在原子と一緒に置換または非置換複素環を形成し；

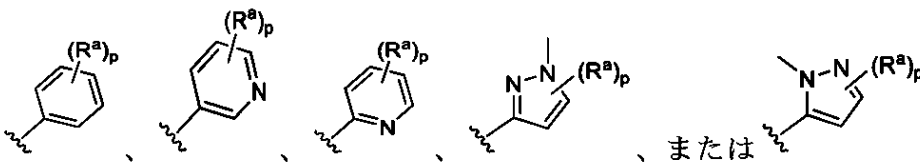
p は、0 ~ 3 から選択される整数である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 2)

R^{55a} 及び R^{55b} が、それぞれ独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、

30

【化 2 1 5】



であり；

式中；

R^a の各存在は、独立して、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、 $-C(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-OC(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{D4})_2$ 、 $-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}$ 、 $-S(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2OR^{D4}$ 、 $-OS(=O)_2R^{D4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{D4})_2$ 、または $-N(R^{D4})S(=O)_2R^{D4}$ 、置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルケニル、置換もしくは非置換 C_{2-6} アルキニル、置換もしくは非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{5-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

40

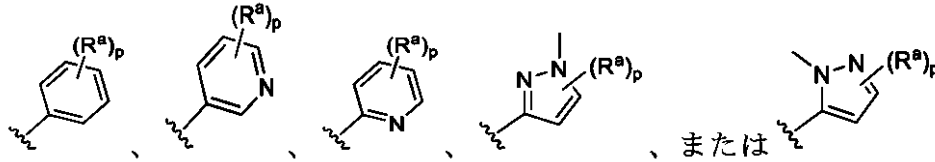
R^{D4} の各存在は、独立して、水素、置換または非置換 C_{1-6} アルキル、置換または非置換 C_{2-6} アルケニル、置換または非置換 C_{2-6} アルキニル、置換または非置換 C_{3-6} カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C_{5-10} アリール、置換もしくは非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

50

3 - 6 カルボシクリル、置換または非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換または非置換 C₅ - 10 アリール、置換または非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは 2 つの R^{D 4} 基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成し；

p は、0 ~ 5 から選択される整数である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。
 (項目 23)

R^{5 5 a} 及び R^{5 5 b} が、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、
 【化 2 1 6】



10

であり；

式中；

R^a の各存在は、独立して、水素、ハロゲン、-CN、-OR^{D 4}、-N(R^{D 4})₂、置換または非置換 C₁ - 6 アルキル、置換または非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置換または非置換 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり；

R^{D 4} の各存在は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C₁ - 6 アルキルであ
 り；

20

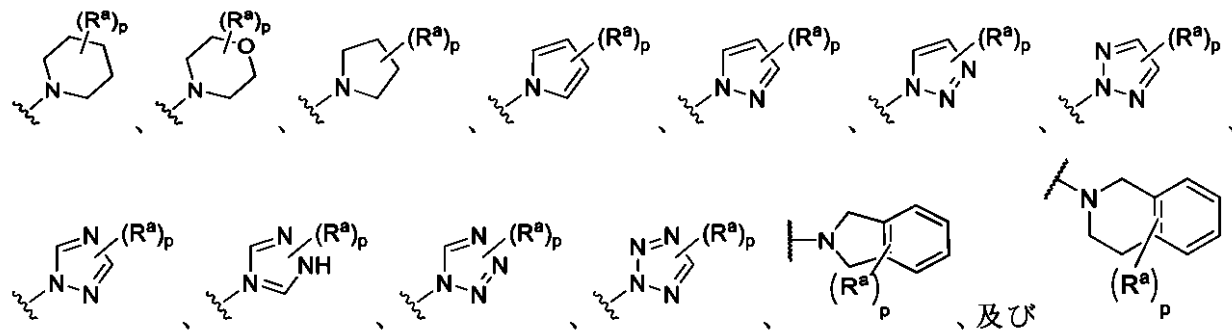
p は、0 ~ 2 から選択される整数である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。
 (項目 24)

R^{5 5 a} 及び R^{5 5 b} が、介在原子と一緒にあって、置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成する、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 25)

R^{5 5 a} 及び R^{5 5 b} が、介在原子と一緒にあって、

【化 2 1 7】



30

からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、

40

式中；

R^a の各存在は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR^{D 4}、-N(R^{D 4})₂、-C(=O)R^{D 4}、-C(=O)OR^{D 4}、-C(=O)N(R^{D 4})₂、-OC(=O)R^{D 4}、-OC(=O)OR^{D 4}、-N(R^{D 4})C(=O)R^{D 4}、-OC(=O)N(R^{D 4})₂、-N(R^{D 4})C(=O)OR^{D 4}、-S(=O)₂R^{D 4}、-S(=O)₂OR^{D 4}、-OS(=O)₂R^{D 4}、-S(=O)₂N(R^{D 4})₂、または -N(R^{D 4})S(=O)₂R^{D 4}、置換もしくは非置換 C₁ - 6 アルキル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルケニル、置換もしくは非置換 C₂ - 6 アルキニル、置換もしくは非置換 C₃ - 6 カルボシクリル、置換もしくは非置換 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、置

50

換もしくは非置換 C₅₋₁₀アリール、置換もしくは非置換 5～10員ヘテロアリールであり；

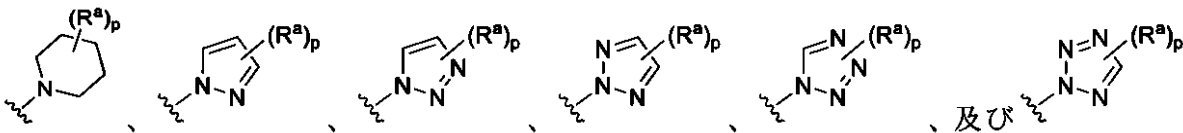
R^{D4}の各存在は、独立して、水素、置換または非置換 C₁₋₆アルキル、置換または非置換 C₂₋₆アルケニル、置換または非置換 C₂₋₆アルキニル、置換または非置換 C₃₋₆カルボシクリル、置換または非置換 3～6員ヘテロシクリル、置換または非置換 C₅₋₁₀アリール、置換または非置換 5～10員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）であるか、あるいは2つの R^{D4}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成し；

pは、0～10から選択される整数である、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目26）

R^{5.5a}及びR^{5.5b}が、介在原子と一緒にあって、

【化218】



からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、

式中；

R^aの各存在は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR^{D4}、-N(R^{D4})₂、-C(=O)R^{D4}、-C(=O)OR^{D4}、-C(=O)N(R^{D4})₂、-OC(=O)R^{D4}、-OC(=O)OR^{D4}、-N(R^{D4})C(=O)R^{D4}、-OC(=O)N(R^{D4})₂、-N(R^{D4})C(=O)OR^{D4}、-S(=O)₂R^{D4}、-S(=O)₂OR^{D4}、-OS(=O)₂R^{D4}、-S(=O)₂N(R^{D4})₂、または-N(R^{D4})S(=O)₂R^{D4}、置換もしくは非置換 C₁₋₆アルキル、置換もしくは非置換 C₂₋₆アルケニル、置換もしくは非置換 C₂₋₆アルキニル、置換もしくは非置換 C₃₋₆カルボシクリル、置換もしくは非置換 3～6員ヘテロシクリル、置換もしくは非置換 C₅₋₁₀アリール、置換もしくは非置換 5～10員ヘテロアリールで

あり；

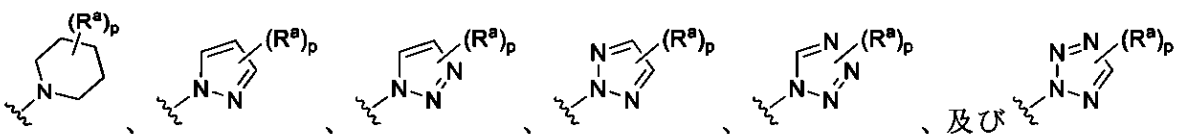
R^{D4}の各存在は、独立して、水素、置換または非置換 C₁₋₆アルキル、置換または非置換 C₂₋₆アルケニル、置換または非置換 C₂₋₆アルキニル、置換または非置換 C₃₋₆カルボシクリル、置換または非置換 3～6員ヘテロシクリル、置換または非置換 C₅₋₁₀アリール、置換または非置換 5～10員ヘテロアリール、酸素保護基（酸素結合時）、窒素保護基（窒素結合時）窒素保護基であるか、あるいは2つの R^{D4}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成し；

pは、0～10から選択される整数である、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目27）

R^{5.5a}及びR^{5.5b}が、介在原子と一緒にあって、

【化219】



からなる群より選択される、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、

式中；

10

20

30

40

50

R^a の各存在は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

R^{D4} の各存在は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

p は、0 ~ 2 から選択される整数である、項目 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。
(項目 28)

X が、 R^{55c} である、項目 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。
(項目 29)

R^{55c} が、置換もしくは非置換フェニル、またはヘテロアリール環に少なくとも 1 個の窒素を含む炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 11 及び 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

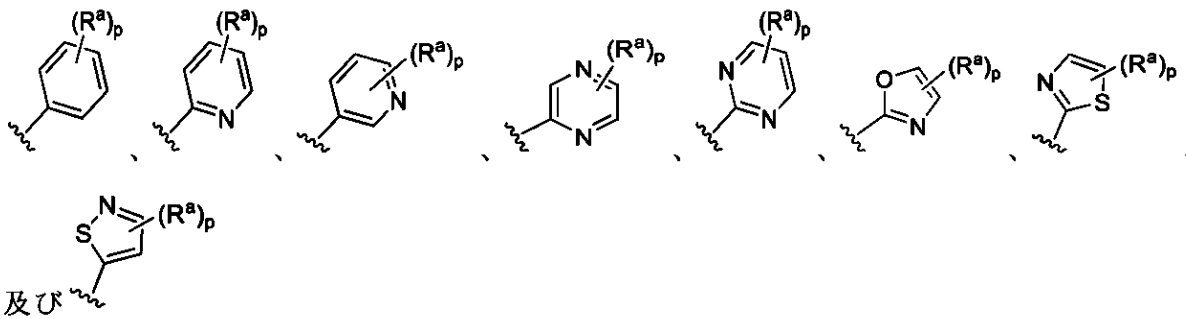
(項目 30)

R^{55c} が、置換もしくは非置換フェニル、またはピリジル、イソチアゾリル、チアゾリル、ピリミジル、ピラジニル、及びオキサゾリルからなる群より選択される炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 1 ~ 11 及び 28 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 31)

R^{55c} が、

【化 220】



20

からなる群より選択され、

30

式中：

R^a の各存在は、独立して、水素、オキソ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^{D4}$ 、 $-N(R^{D4})_2$ 、 $-C(=O)R^{D4}$ 、 $-C(=O)OR^{D4}$ 、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

R^{D4} の各存在は、独立して、水素、または置換もしくは非置換 C_{1-6} アルキルであり；

p は、0 ~ 2 から選択される整数である、項目 1 ~ 11 及び 28 ~ 30 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 32)

R^5 が、 R^{19} に対してシス位置にある水素である、項目 1 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

(項目 33)

R^5 が、 R^{19} に対してトランス位置にある水素である、項目 1 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 34)

R^5 が、 R^{19} に対してシス位置にあるメチルである、項目 1 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 35)

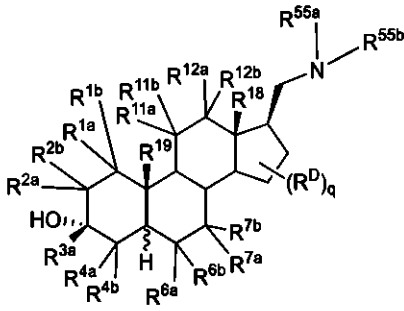
R^5 が、 R^{19} に対してトランス位置にあるメチルである、項目 1 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の化合物。

50

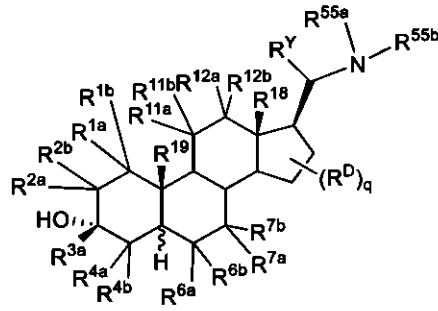
(項目 3 6)

前記化合物が、式 (I - b)、(I - c)、(I - d)、(I - e)、(I - l)、(I - m)、(I - n)、または (I - p) :

【化 2 2 1】

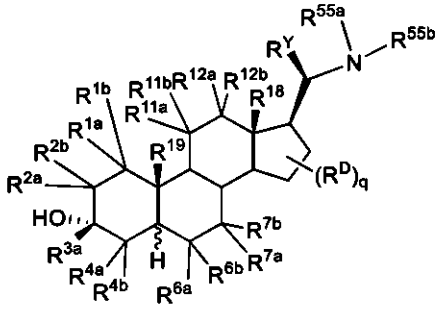


(I - b)、

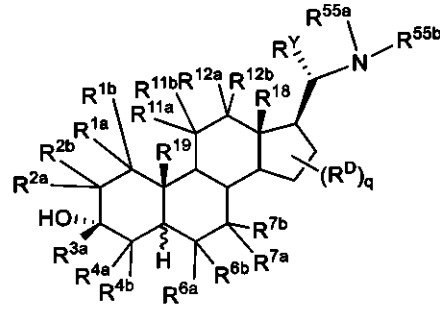


(I - c)、

10

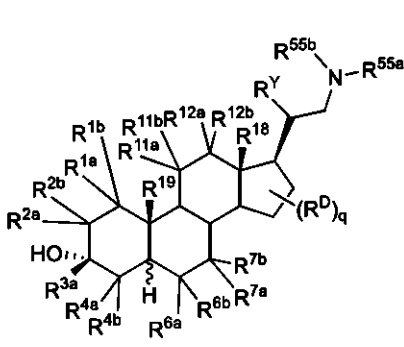


(I - d)、

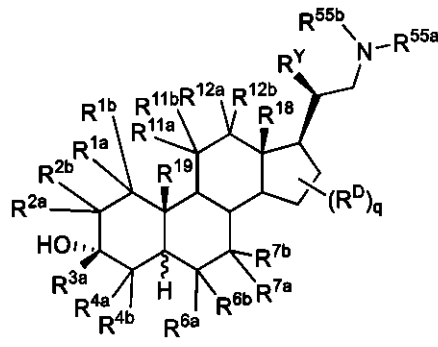


(I - e)、

20



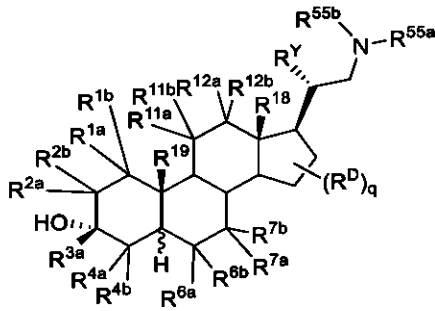
(I - l)、



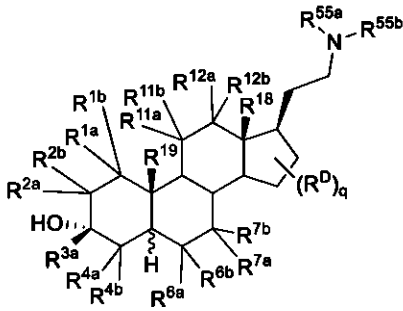
(I - m)、

30

【化 2 2 2】



(I - n)、



(I - p)

40

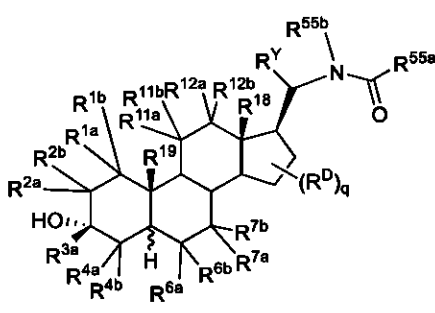
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 7)

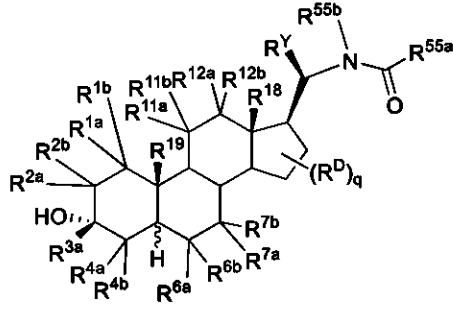
前記化合物が、式 (I - f)、(I - g)、または (I - h) :

50

【化 2 2 3】

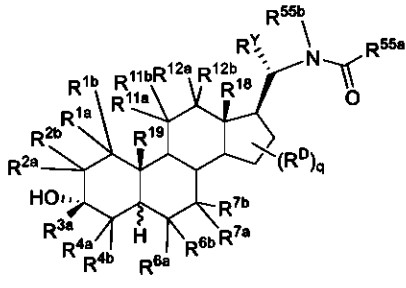


(I - f)、



(I - g)、

10



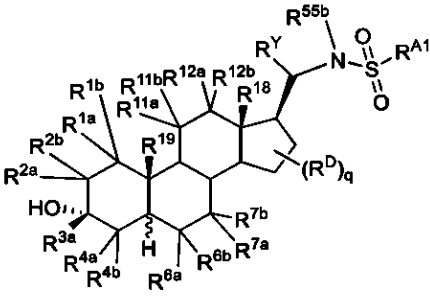
(I - h)

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 に記載の化合物。
(項目 3 8)

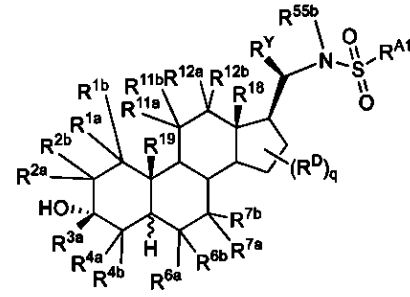
20

前記化合物が、式 (I - i) 、 (I - j) 、 または (I - k) :

【化 2 2 4】



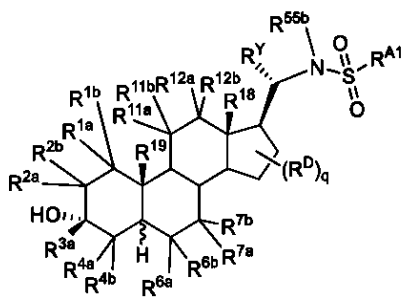
(I - i)、



(I - j)、

30

【化 2 2 5】



(I - k)

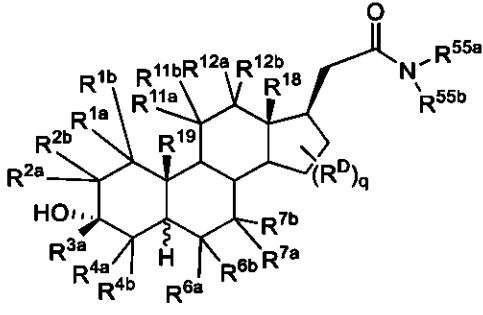
40

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 に記載の化合物。
(項目 3 9)

前記化合物が、式 (I - o) :

50

【化 2 2 6】



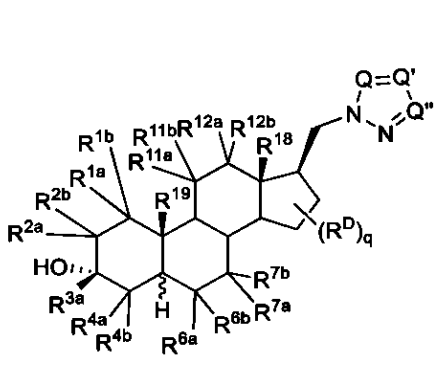
10

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 に記載の化合物。

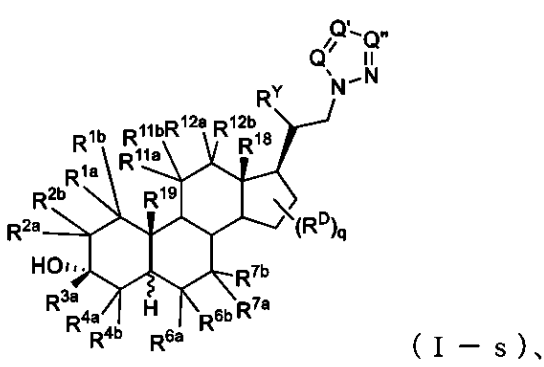
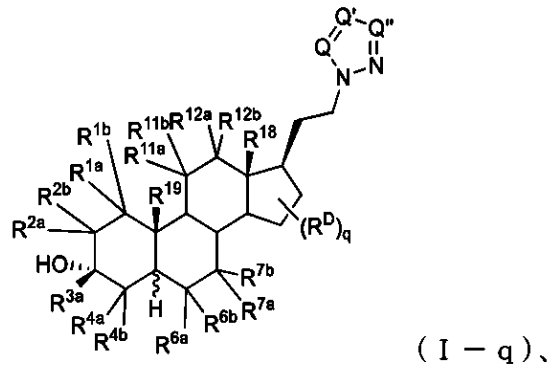
(項目 4 0)

前記化合物が、式 (I - q q)、(I - q)、(I - s)、(I - t)、または (I - u) :

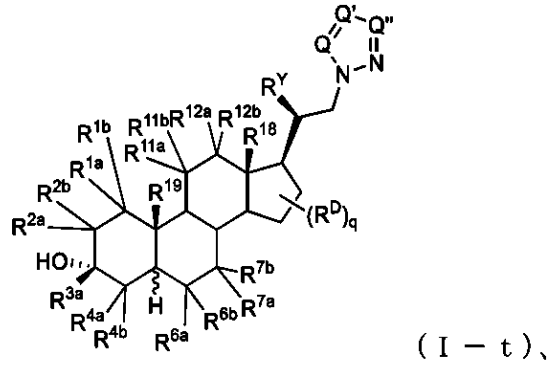
【化 2 2 7】



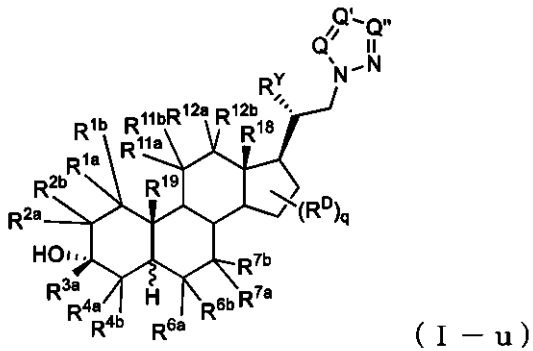
20



30



【化 2 2 8】



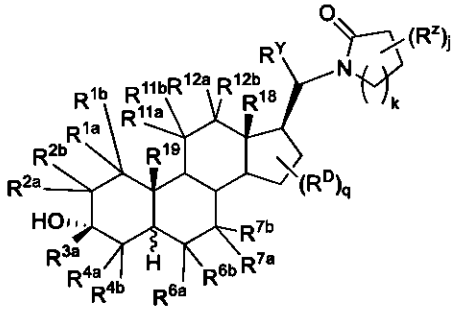
40

[式中、

50

Q、Q'、及びQ''はそれぞれ独立して、またはNであり；
R^wは、水素、シアノ、-NH₂、または置換もしくは非置換アルキルであり；
Q、Q'、及びQ''の少なくとも1つがNである]
 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に記載の化合物。
 (項目41)

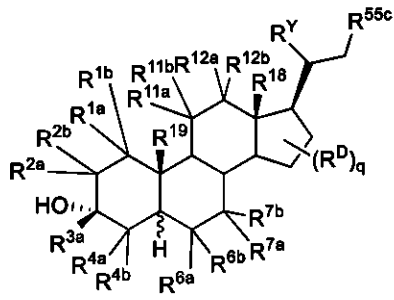
前記化合物が、式(I-r)：
 【化229】



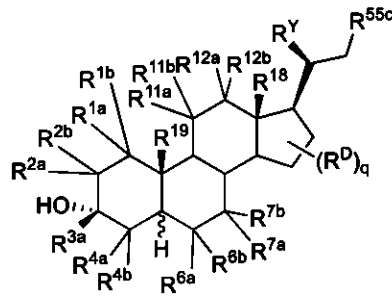
(I-r)

[式中、
kは、1または2の整数であり；
R^zは、置換もしくは非置換アルキルまたは置換もしくは非置換アリールであるか、あるいは隣接する炭素上の2つのR^zが介在原子と結合して置換または非置換アリールを形成し；
jは、0~6の整数である]
 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に記載の化合物。
 (項目42)

前記化合物が、式(I-v)、(I-w)、または(I-x)：
 【化230】

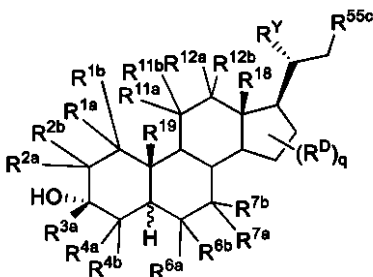


(I-v)、



(I-w)、

【化231】



(I-x)

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に記載の化合物。
 (項目43)

R^{55c}が、置換もしくは非置換フェニル、またはヘテロアリール環に少なくとも

10

20

30

40

50

1 個の窒素を含む炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 4 2 に記載の化合物。

(項目 4 4)

R^{55c}が、置換もしくは非置換フェニル、またはピリジル、イソチアゾリル、チアゾリル、ピリミジル、ピラジニル、及びオキサゾリルからなる群より選択される炭素結合置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目 4 2 または 4 3 に記載の化合物。

(項目 4 5)

R¹⁹が、水素または置換もしくは非置換アルキルである、項目 1 ~ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 6)

R¹⁹が、水素または置換 C₁₋₆ アルキルである、項目 1 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 7)

R¹⁹が、-CH₂OCH₃である、項目 1 ~ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 8)

R¹⁹が、水素または非置換 C₁₋₆ アルキルである、項目 1 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 9)

R¹⁹が、非置換 C₁₋₆ アルキルである、項目 1 ~ 4 5 及び 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 0)

R¹⁹が、メチルである、項目 1 ~ 4 5 及び 4 8 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 1)

R¹⁹が、エチルである、項目 1 ~ 4 5 及び 4 8 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 2)

R¹⁸が、非置換アルキルである、項目 1 ~ 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 3)

R¹⁸が、非置換 C₁₋₆ アルキルである、項目 1 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 4)

R¹⁸が、メチルである、項目 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 5)

R¹⁸が、エチルである、項目 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 6)

R¹⁸が、置換アルキルである、項目 1 ~ 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 7)

R^Dが、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、オキソ、ヒドロキシ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、項目 1 ~ 5 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 8)

R^Dが、それぞれ独立して、水素、オキソ、置換もしくは非置換アルキル、ヒドロキシ、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、項目 1 ~ 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5 9)

R^Dが、独立して、水素、オキソ、メチル、エチル、ヒドロキシ、またはシクロプロピルである、項目 1 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6 0)

前記化合物が、式 (I - I b)、(I - I c)、(I - I d)、(I - I e)、(I - I l)、(I - I m)、(I - I n)、(I - I p 1)、または (I - I p 2) :

10

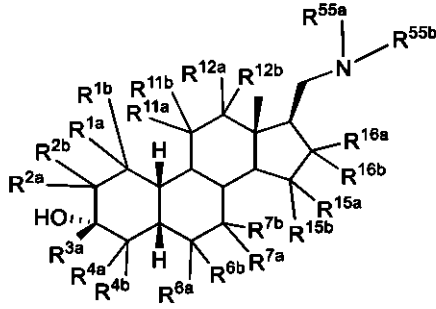
20

30

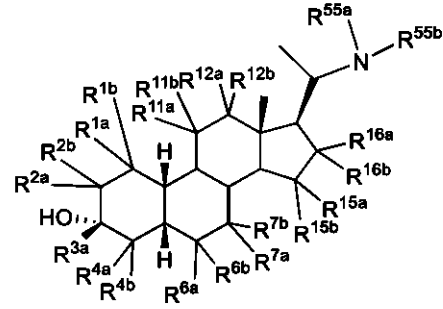
40

50

【化 2 3 2】

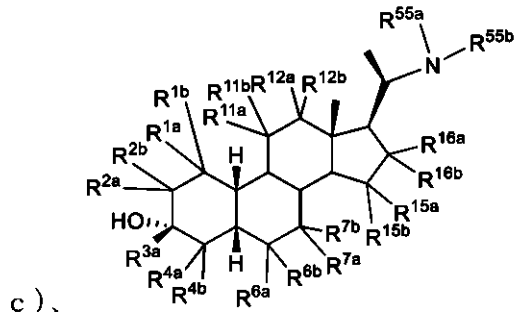


(I - I b),



(I - I

10



c),

(I - I d),

(I

- I e),

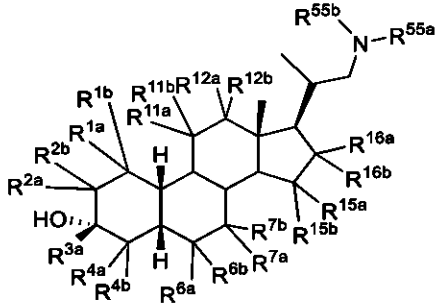
20

30

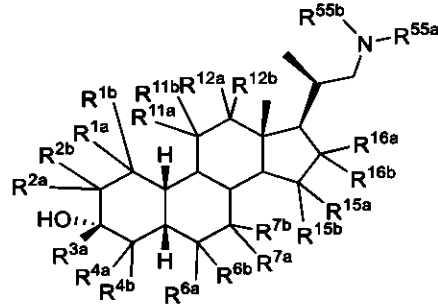
40

50

【化 2 3 3】

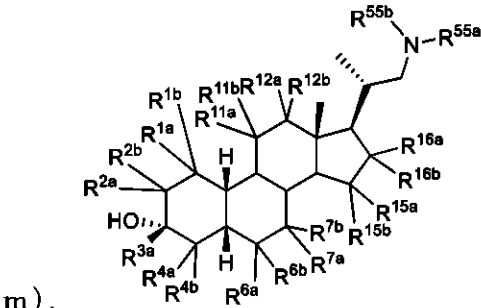


(I - I l)、

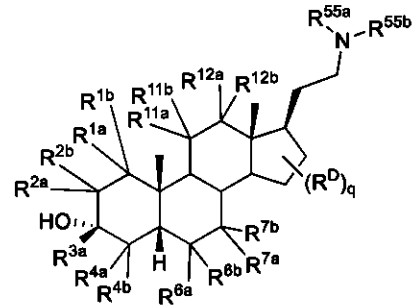


(I - I

10



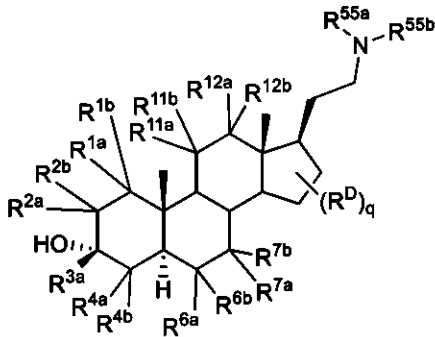
(I - I n)、



(I - I

20

m)、
p 1)、



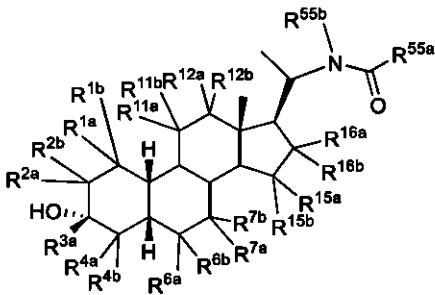
(I - I p 2)

30

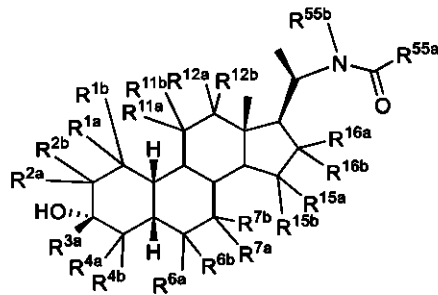
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、項目 1 に記載の化合物。
(項目 6 1)

前記化合物が、式 (I - I f)、(I - I g)、または (I - I h) :

【化 2 3 4】



(I - I f)、

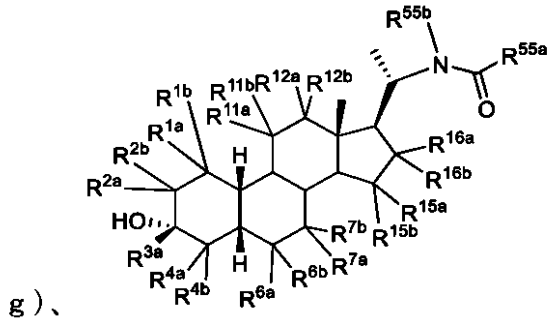


(I - I

40

50

【化 2 3 5】



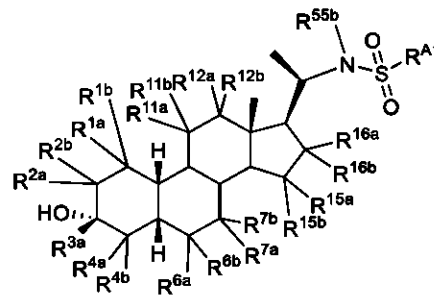
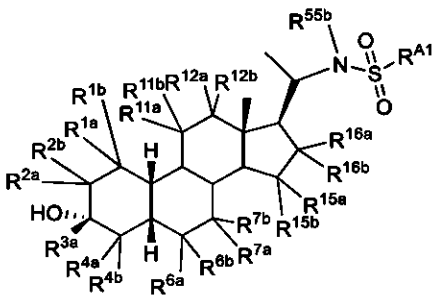
10

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 に記載の化合物。

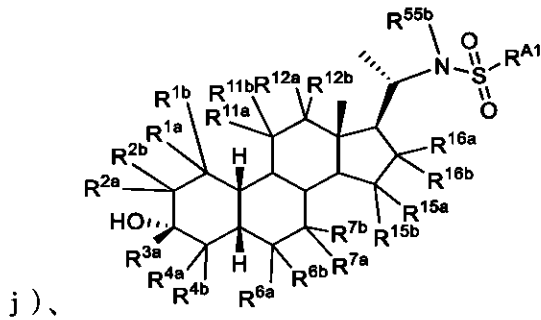
(項目 6 2)

前記化合物が、式 (I-Ii)、(I-Ij)、または (I-Ik) :

【化 2 3 6】



20



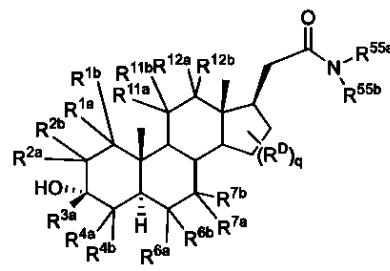
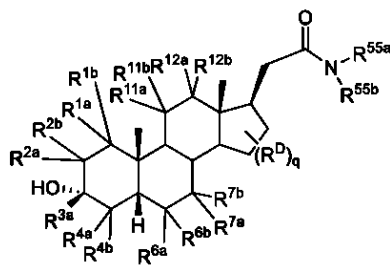
30

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 に記載の化合物。

(項目 6 3)

前記化合物が、式 (I-Io1) または (I-Io2) :

【化 2 3 7】



40

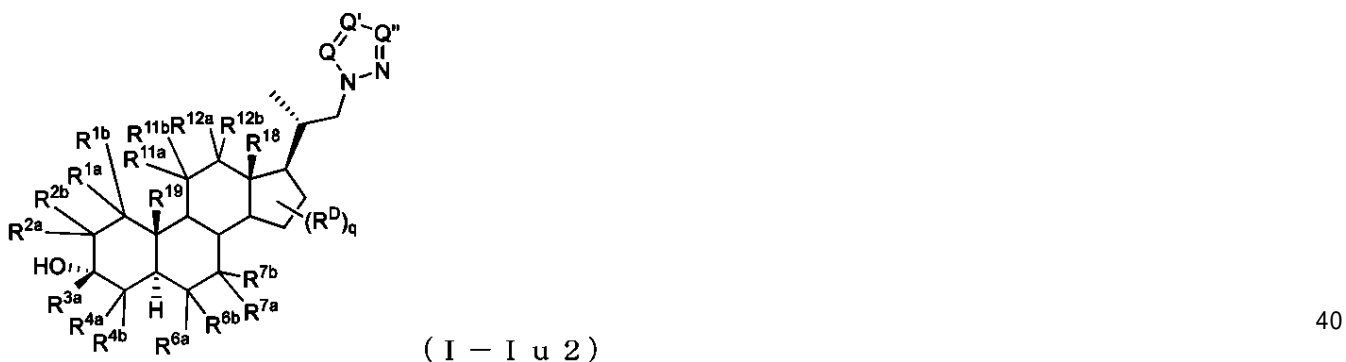
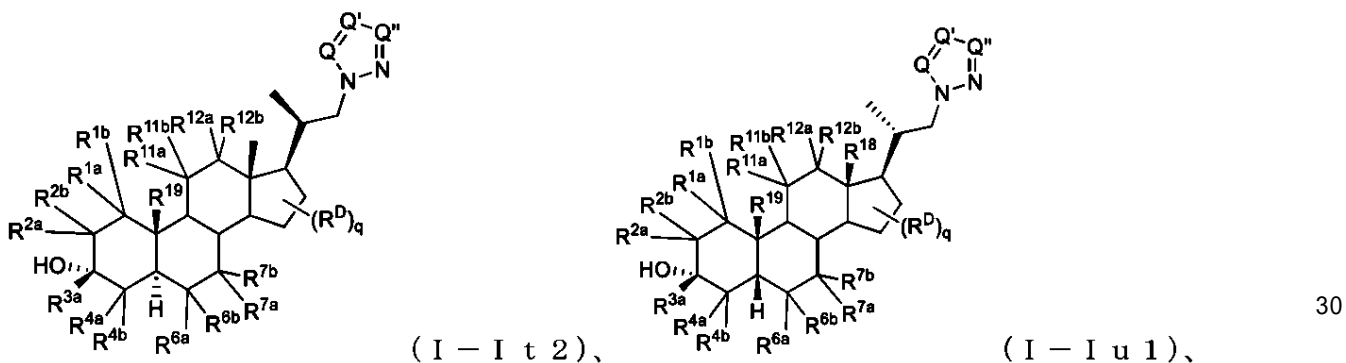
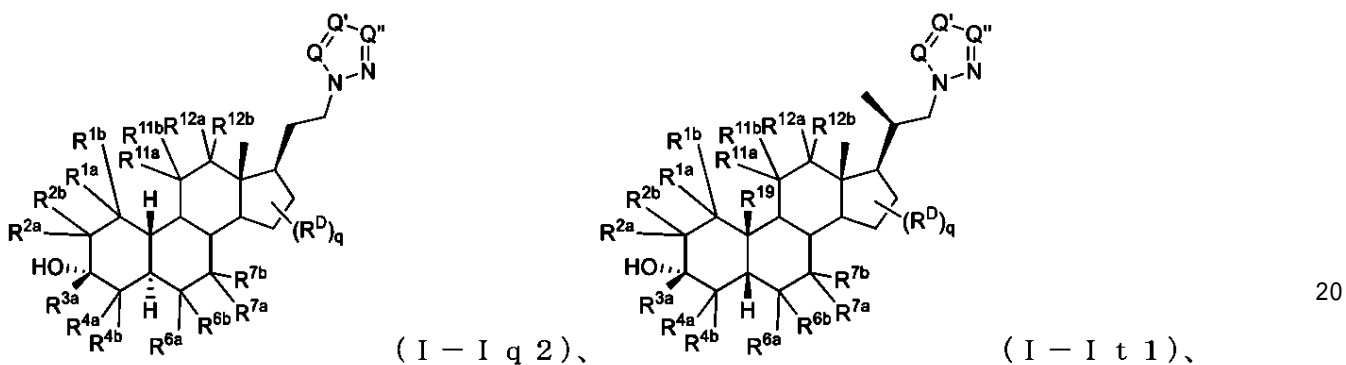
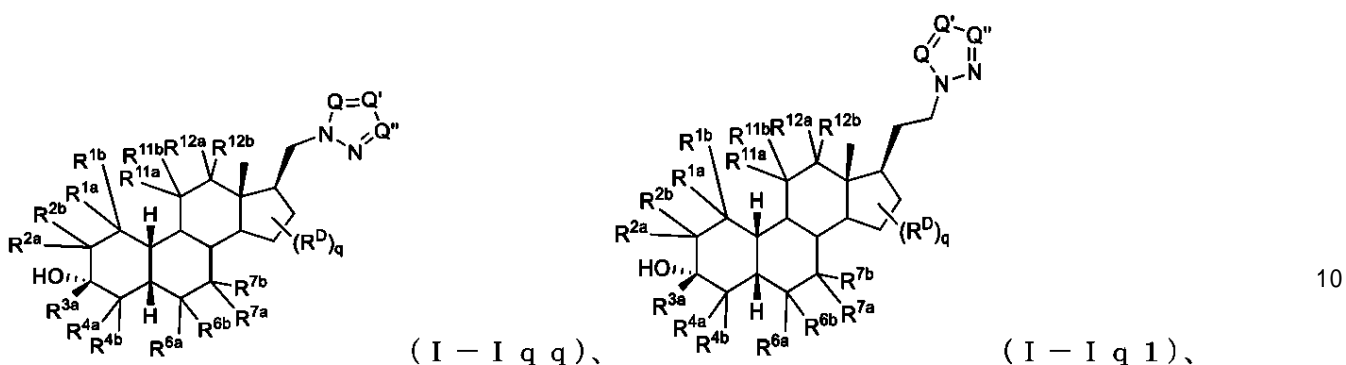
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6 4)

前記化合物が、式 (I-Iqq)、(I-Iq1)、(I-Iq2)、(I-It1)

50

(I - I t 2)、(I - I u 1)、または(I - I u 2)：
【化 2 3 8】



[式中、

Q、Q'、及びQ''はそれぞれ独立して、またはNであり；

R^wは、水素、シアノ、-NH₂、または置換もしくは非置換アルキルであり；

Q、Q'、及びQ''の少なくとも1つが異なる]

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に記載の化合物。

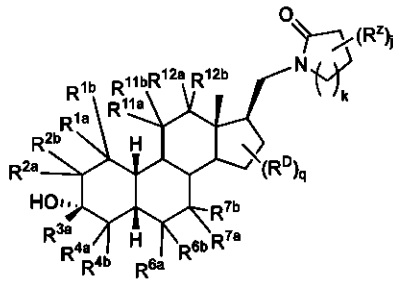
(項目 6 5)

R¹⁻⁹が、水素、メチル、エチル、またはメトキシメチルである、項目64に記載の化合物。

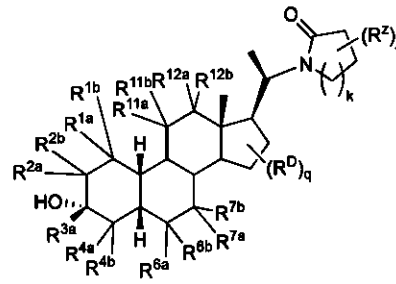
(項目66)

前記化合物が、式(I-Irr)、(I-Ir1)、または(I-Ir2)：

【化239】

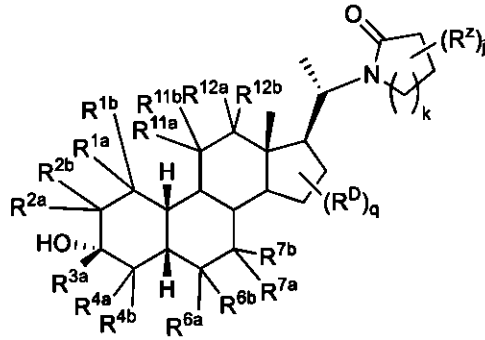


(I-Irr)、



(I-Ir1)、

10



(I-Ir2)

20

[式中、

kは、1または2の整数であり；

R^zは、置換もしくは非置換アルキルまたは置換もしくは非置換アリールであるか、あるいは隣接する炭素上の2つのR^zが介在原子と結合して置換または非置換アリールを形成し；

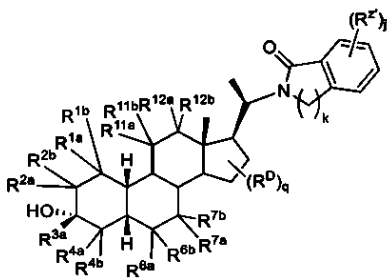
jは、0～6の整数である]

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に記載の化合物。

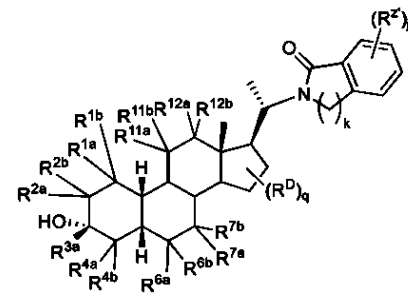
(項目67)

前記化合物が、式(I-Ir3)または(I-Ir4)：

【化240】



(I-Ir3)、



(I-Ir4)

40

[式中、

kは、1または2の整数であり；

R^{z'}は、置換もしくは非置換アルキルまたはシアノであり；

j'は、0～4の整数である]

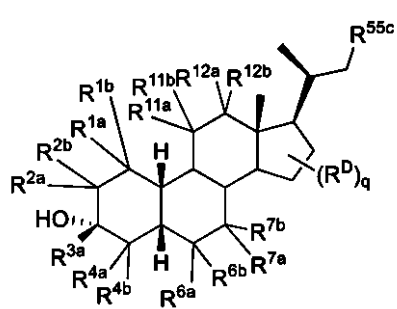
の化合物またはその薬学的に許容される塩である、項目66に記載の化合物。

(項目68)

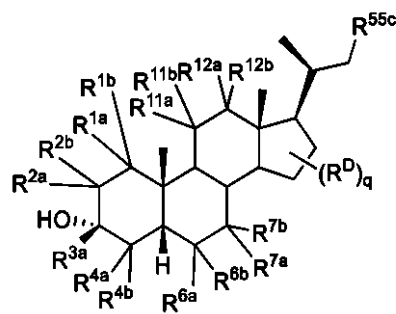
前記化合物が、式(I-Iw1)、(I-Iw2)、(I-Ix1)、または(I-Ix2)：

50

【化 2 4 1】

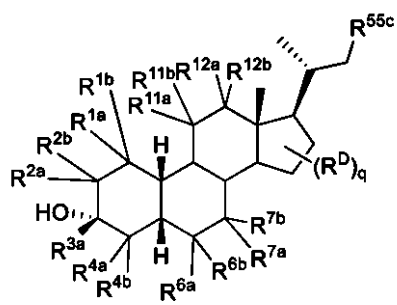


(I-Iw1)、

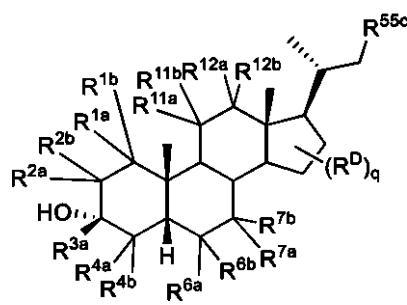


(I-Iw2)、

10



(I-Ix1)、



(I-Ix1)

20

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 記載の方法。

(項目 6 9)

R^{3a} が、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルである、項目 1 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 7 0)

R^{3a} が、置換または非置換 C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 1)

R^{3a} が、置換 C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 2)

R^{3a} が、非置換 C_{1-6} アルキルである、項目 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 3)

R^{3a} が、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチルである、項目 1 ~ 7 0 及び 7 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 4)

R^{3a} が、メチルである、項目 1 ~ 7 0 及び 7 2 ~ 7 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 5)

R^{3a} が、 $-CH_2OCH_3$ または $CH_2OCH_2CH_3$ である、項目 1 ~ 7 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 6)

R^{3a} が、 $-CH_2C_3H_5$ である、項目 1 ~ 7 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 7)

R^{3a} が、置換もしくは非置換アルキル、または置換もしくは非置換カルボシクリルである、項目 1 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 8)

R^{3a} が、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 9)

50

R^{3 a}が、置換または非置換カルボシクリルである、項目1～68及び77～78のいずれか1項に記載の化合物。

(項目80)

R^{3 a}が、シクロプロピルである、項目1～68及び77～79のいずれか1項に記載の化合物。

(項目81)

R^{4 a}及びR^{4 b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OR^{E5}、-OC(=O)R^{E5}、-OS(=O)₂OR^{E5}、-N(R^{E5})₂、または-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂OR^{E5}であり、式中、R^{E5}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは2つのR^{E5}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

10

(項目82)

R^{4 a}及びR^{4 b}は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、-OR^{F6}、-OC(=O)R^{F6}、-N(R^{F6})₂、または-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}であり、式中、R^{F6}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、または2つのR^{F6}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

20

(項目83)

R^{4 a}及びR^{4 b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆アルキルである、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

(項目84)

R^{4 a}及びR^{4 b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

30

(項目85)

R^{4 a}及びR^{4 b}が、独立して、-CH₃、-CH₂CH₃、-OH、-OCH₃、または-CH(CH₃)₂である、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

(項目86)

R^{4 a}及びR^{4 b}がいずれも水素である、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

(項目87)

R^{4 a}とR^{4 b}が連結されてオキソ(=O)基を形成する、項目1～80のいずれか1項に記載の化合物。

(項目88)

R^{6 a}及びR^{6 b}が、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、または置換もしくは非置換アルキニルである、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

40

(項目89)

R^{6 a}及びR^{6 b}が、独立して、水素または置換アルキルである、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目90)

R^{6 a}及びR^{6 b}が、独立して、水素または非置換アルキルである、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目91)

50

R^{6a}及びR^{6b}がいずれも水素である、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。
(項目92)

R^{6a}がハロゲンまたはアルキルであり、R^{6b}が水素である、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目93)

R^{6a}及びR^{6b}がいずれもハロゲンである、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目94)

R^{6a}及びR^{6b}がいずれもアルキルである、項目1～87のいずれか1項に記載の化合物。

(項目95)

R^{7a}及びR^{7b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OR^{E5}、-OC(=O)R^{E5}、-OS(=O)₂OR^{E5}、-N(R^{E5})₂、または-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂OR^{E5}であり、式中、R^{E5}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは2つのR^{E5}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目96)

R^{7a}及びR^{7b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、-OR^{F6}、-OC(=O)R^{F6}、-N(R^{F6})₂、または-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}であり、式中、R^{F6}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、または2つのR^{F6}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目97)

R^{7a}及びR^{7b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆アルキルである、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目98)

R^{7a}及びR^{7b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目99)

R^{7a}及びR^{7b}が、独立して、-CH₃、-CH₂CH₃、-OH、-OCH₃、または-CH(CH₃)₂である、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目100)

R^{7a}及びR^{7b}がいずれも水素である、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目101)

R^{7a}とR^{7b}が連結されてオキソ(=O)基を形成する、項目1～94のいずれか1項に記載の化合物。

(項目102)

R^{11a}及びR^{11b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OR^{E5}、-OC(=O)R^{E5}、-OS(=O)₂OR^{E5}、-N(R^{E5})₂、または-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂OR^{E5}であり、式中、R^{E5}の各存在は、独立して、水素、置換もし

10

20

30

40

50

くは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは2つのR^{E5}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目103)

R^{1.1.a}及びR^{1.1.b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、-OR^{F6}、-OC(=O)R^{F6}、-N(R^{F6})₂、または-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}であり、式中、R^{F6}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、または2つのR^{F6}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目104)

R^{1.1.a}及びR^{1.1.b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆アルキルである、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目105)

R^{1.1.a}及びR^{1.1.b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目106)

R^{1.1.a}及びR^{1.1.b}が、独立して、-CH₃、-CH₂CH₃、-OH、-OCH₃、または-CH(CH₃)₂である、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目107)

R^{1.1.a}及びR^{1.1.b}がいずれも水素である、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目108)

R^{1.1.a}とR^{1.1.b}が連結されてオキソ(=O)基を形成する、項目1～101のいずれか1項に記載の化合物。

(項目109)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}が、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OR^{E5}、-OC(=O)R^{E5}、-OS(=O)₂OR^{E5}、-N(R^{E5})₂、または-N(R^{E5})C(=O)R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂R^{E5}、-N(R^{E5})S(=O)₂OR^{E5}であり、式中、R^{E5}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、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か、あるいは2つのR^{E5}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～108のいずれか1項に記載の化合物。

(項目110)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、-CN、-NO₂、-OR^{F6}、-OC(=O)R^{F6}、-N(R^{F6})₂、または-N(R^{F6})C(=O)R^{F6}であり、式中、R^{F6}の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリルであるか、または2つのR^{F6}基が介在原子と一緒にあって置換または非置換複素環を形成する、項目1～108のいずれか1項に記載の化合物。

(項目111)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆

10

20

30

40

50

アルキルである、項目 1 ~ 108 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 112)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目 1 ~ 108 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 113)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}が、独立して、-CH₃、-CH₂CH₃、-OH、-OCH₃、または-CH(CH₃)₂である、項目 1 ~ 108 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 114)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}がいずれも水素である、項目 1 ~ 108 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

(項目 115)

R^{1.2.a}及びR^{1.2.b}が連結されてオキソ(=O)基を形成する、項目 1 ~ 108 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 116)

R^{1.a}及びR^{1.b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆アルキルである、項目 1 ~ 115 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 117)

R^{1.a}及びR^{1.b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目 1 ~ 115 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

(項目 118)

R^{1.a}及びR^{1.b}がいずれも水素である、項目 1 ~ 117 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 119)

R^{2.a}及びR^{2.b}が、独立して、水素、-OH、または置換もしくは非置換C₁₋₆アルキルである、項目 1 ~ 118 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 120)

R^{2.a}及びR^{2.b}のそれぞれが、独立して、水素、-OH、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、またはC₁₋₆アルコキシハロである、項目 1 ~ 118 のいずれか 1 項に記載の化合物。

30

(項目 121)

R^{2.a}及びR^{2.b}がいずれも水素である、項目 1 ~ 120 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 122)

項目 1 ~ 121 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、及び薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

(項目 123)

CNS関連障害の治療を必要とする対象に項目 1 ~ 121 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を有効量で投与することを含む、前記対象のCNS関連障害を治療する方法。

40

(項目 124)

前記CNS関連障害が、睡眠障害、気分障害、統合失調症スペクトラム障害、痙攣障害、記憶及び/または認知の障害、運動障害、人格障害、自閉症スペクトラム障害、疼痛、外傷性脳損傷、血管疾患、薬物乱用障害及び/または離脱症候群、耳鳴り、またはてんかん重積状態である、項目 123 に記載の方法。

(項目 125)

前記CNS関連障害がうつ病である、項目 123 に記載の方法。

(項目 126)

前記CNS関連障害が産後うつ病である、項目 123 に記載の方法。

50

(項目 1 2 7)

前記 C N S 関連障害が大うつ病性障害である、項目 1 2 3 に記載の方法。

(項目 1 2 8)

前記大うつ病性障害が中等度の大うつ病性障害である、項目 1 2 7 に記載の方法。

(項目 1 2 9)

前記大うつ病性障害が、重度の大うつ病性障害である、項目 1 2 7 に記載の方法。

10

20

30

40

50