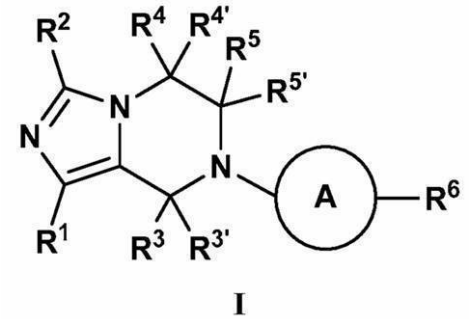
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年12月22日(2022.12.22)

【国際公開番号】WO2020/139988
【公表番号】特表2022-516469(P2022-516469A)
【公表日】令和4年2月28日(2022.2.28)
【年通号数】公開公報(特許)2022-035
【出願番号】特願2021-537781(P2021-537781)
【国際特許分類】
C07D487/04(2006.01)
A61K31/4985(2006.01)
A61K31/506(2006.01)
A61P43/00(2006.01)
A61P35/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ４８７/０４　１４４
Ｃ０７Ｄ４８７/０４　　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ　３１/４９８５
Ａ６１Ｋ　３１/５０６
Ａ６１Ｐ　４３/００　１１１
Ａ６１Ｐ　３５/００

【手続補正書】
【提出日】令和4年12月14日(2022.12.14)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式Ｉの化合物
【化７１】



Ｉ

またはその薬学的に許容される塩であって、式中、
環Ａが、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
環Ａの各シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意にハロゲン、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（

Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、および－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$からなる群から選択される１つ以上の置換基で置換され、
Ｒ^{1}が、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
Ｒ^{1}の各アリールまたはヘテロアリールが、任意に１つ以上のＲ^{1a}で置換され、
各Ｒ^{1a}が独立して、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、－Ｃ$_4$－Ｃ$_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
Ｒ^{2}が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、－Ｃ$_4$－Ｃ$_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
Ｒ^{2}の各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールで置換され、
Ｒ^3、Ｒ$^{3'}$、Ｒ^4、Ｒ$^{4'}$、Ｒ^5、およびＲ$^{5'}$がそれぞれ独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、および－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキルからなる群から選択されるか、
または（Ｒ^{3}およびＲ$^{3'}$）もしくは（Ｒ^{4}およびＲ$^{4'}$）もしくは（Ｒ^{5}およびＲ$^{5'}$）の各々が、それらが結合する原子と組み合わせて、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル環、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル環を形成することができ、
Ｒ^{6}が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、－Ｃ$_4$－Ｃ$_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
Ｒ^{6}の各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のＲ^{6a}で置換され、
各Ｒ^{6a}が独立して、ハロゲン、オキソ、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキ

ル、－Ｃ４－Ｃ１２シクロアルケニル、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ６－Ｃ１０アリール、および酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、

Ｒ６ａの各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のハロゲン、－Ｃ１－Ｃ６アルキル、または－ＯＲで置換され、

各Ｒが独立して、－Ｈ、－Ｃ１－Ｃ６アルキル、－Ｃ０－Ｃ６アルキレン－Ｃ６－Ｃ１０アリール、－Ｃ３－Ｃ１２シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、

Ｒの各アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のＲａで置換されるか、

または２個のＲ基が、それらが結合する原子と組み合わせて、任意に－Ｃ１－Ｃ６アルキルで置換される、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロシクリルを形成することができ、

各Ｒａが独立して、ハロゲン、－Ｏ（Ｃ１－Ｃ６アルキル）、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ６アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ６アルキル）２、－Ｃ３－Ｃ６シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロアリールであり、

Ｒａの各シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールが、任意に－Ｃ１－Ｃ６アルキルまたは１つ以上のハロゲンで置換される－Ｃ１－Ｃ６アルキルで置換され、

各Ｒ’が独立して、－Ｃ１－Ｃ６アルキル、－Ｃ２－Ｃ６アルケニル、－Ｃ２－Ｃ６アルキニル、－Ｃ３－Ｃ１２シクロアルキル、－Ｃ４－Ｃ１２シクロアルケニル、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ６－Ｃ１０アリール、および酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択される、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項２】

環Ａが、フェニルまたは１～３個の窒素原子を有する６員ヘテロアリールであり、環Ａの各フェニルまたはヘテロアリールが、任意にハロゲン、－Ｃ１－Ｃ６アルキル、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ２、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）２Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ２、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ２、－Ｓ（Ｏ）２Ｒ’、および－Ｓ（Ｏ）２ＮＲ２からなる群から選択される１つ以上の置換基で置換される、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

Ｒ１が、フェニルまたは１～３個の窒素原子を有する６員ヘテロアリールであり、各フェニルまたはヘテロアリールが、０、１、２、３、または４個のＲ１ａで置換される、請求項１または請求項２に記載の化合物。

【請求項４】

Ｒ１ａが、－ＯＲまたは－Ｃ１－Ｃ６アルキルである、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

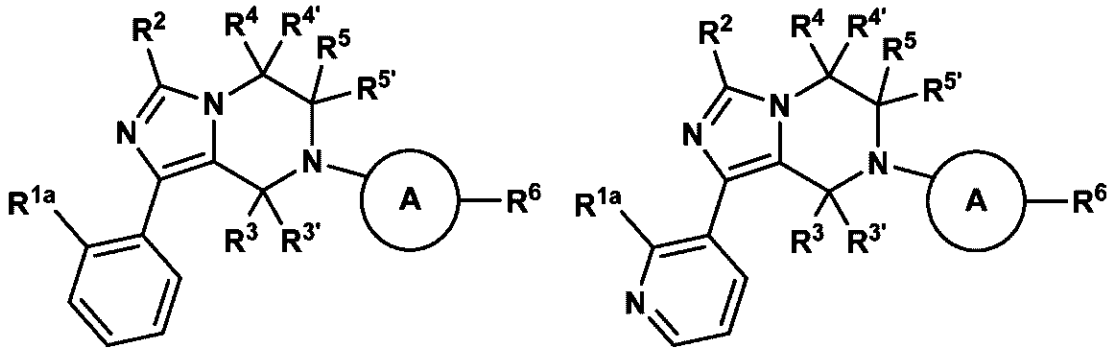
【請求項５】

Ｒ１ａが、イソプロピルまたは－ＯＣＨＦ２である、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

Ｒ２が、－Ｈ、－ＯＲ、－Ｃ１－Ｃ６アルキル、または－Ｃ３－Ｃ１２シクロアルキルであり、Ｒ２の各アルキルまたはシクロアルキルが、任意に１つ以上のハロゲンで置換さ

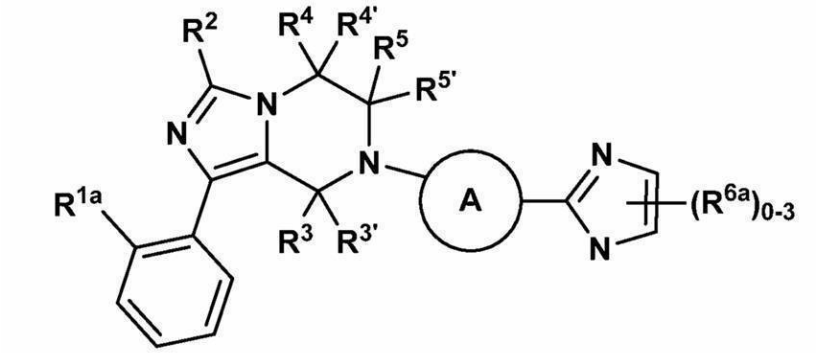
れる、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項７】
R^3、$R^{3'}$、R^4、$R^{4'}$、R^5、および$R^{5'}$がそれぞれ独立して、－Ｈおよび－C_1－C_6アルキルからなる群から選択される、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項８】
R^6が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－NR_2、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－C_1－C_6アルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、R^6の各アルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、０、１、２、３、または４個のR^{6a}で置換される、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項９】
R^6が、酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５員ヘテロアリールであり、R^6の前記ヘテロアリールが、０、１、または２個のR^{6a}で置換される、請求項１～８のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１０】
各Ｒが独立して、－Ｈおよび－C_1－C_6アルキルからなる群から選択され、Ｒの各アルキルが、０、１、２、３、または４個のR^aで置換される、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１１】
前記化合物が、式ＩＩＩａもしくはＩＩＩｂのものであるか、
【化７２】



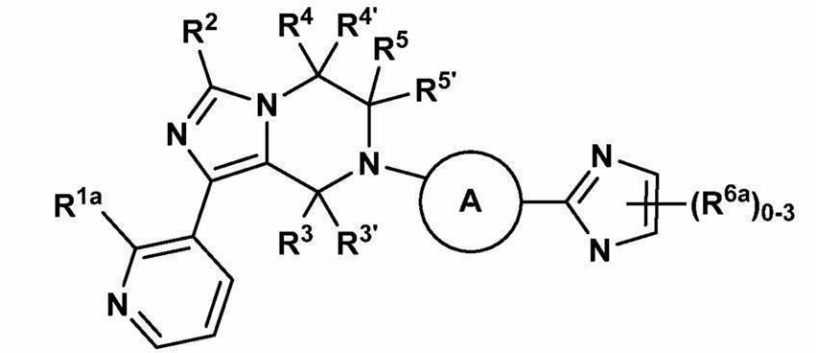
IIIa　　IIIb

またはその薬学的に許容される塩である、請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
前記化合物が、式ＩＶａもしくは式ＩＶｂのものであるか、

【化７３】



IVa



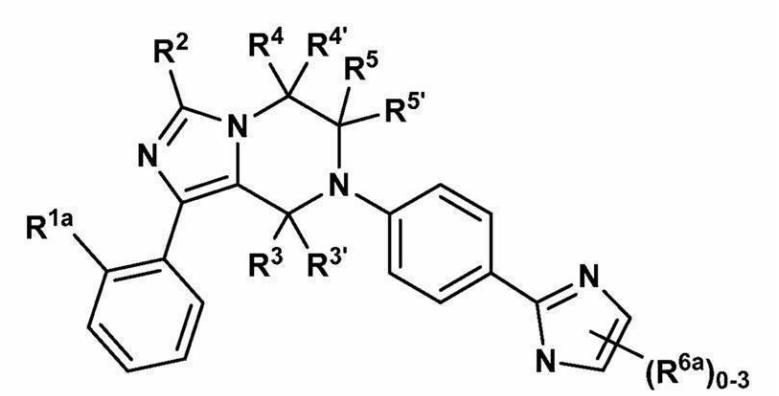
IVb

またはその薬学的に許容される塩である、請求項１～１１のいずれか一項に記載の化合物。

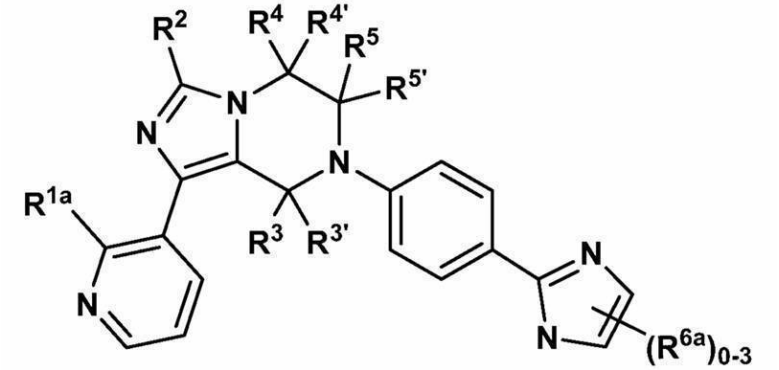
【請求項１３】

前記化合物が、式Ｖａもしくは式Ｖｂのものであるか、

【化７４】



Va

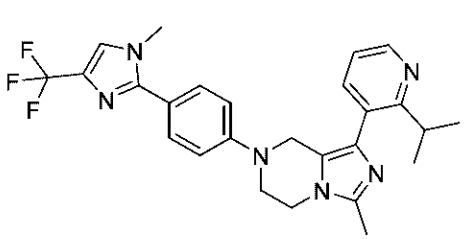


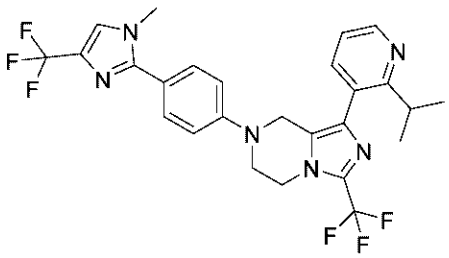
Vb

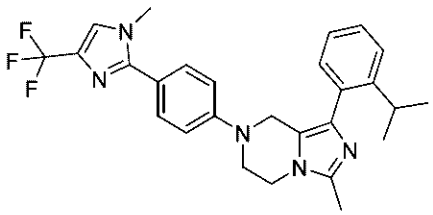
またはその薬学的に許容される塩である、請求項１～１２のいずれか一項に記載の化合物。

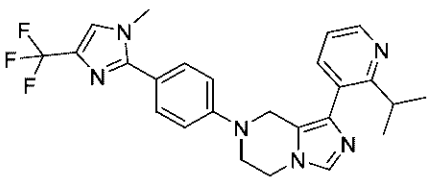
【請求項１４】

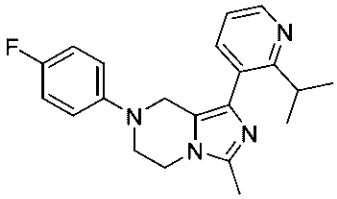
【表１－１】

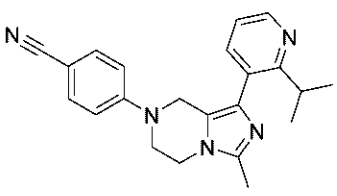




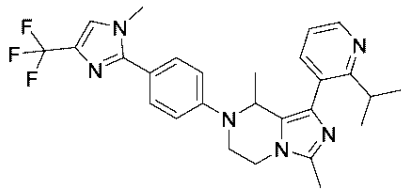
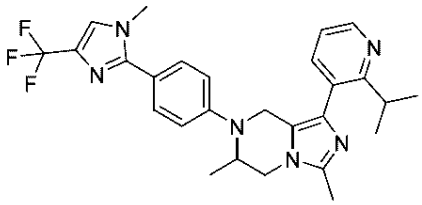
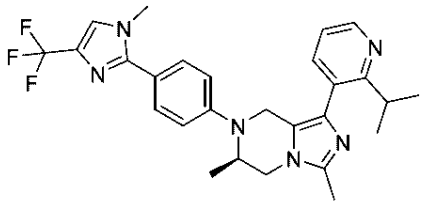
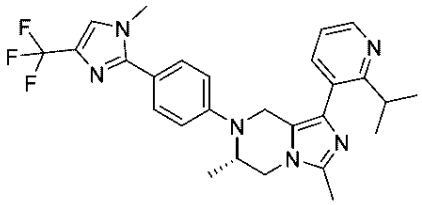
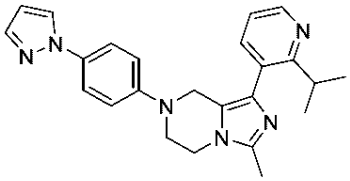
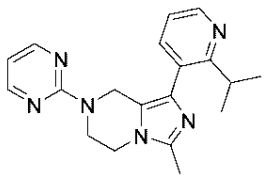
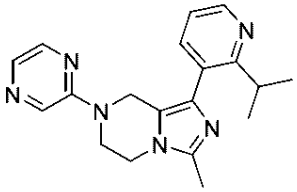
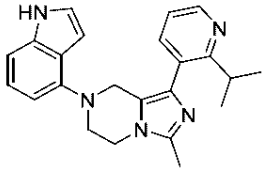
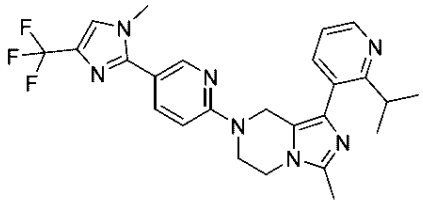
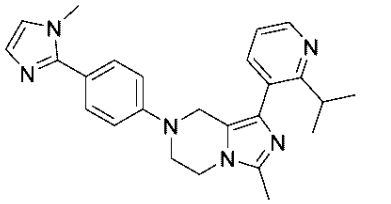
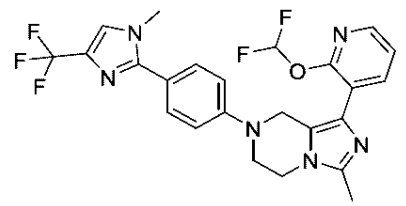
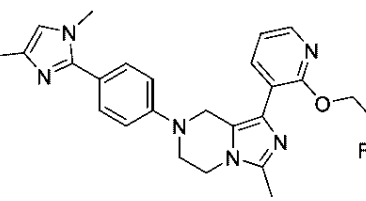
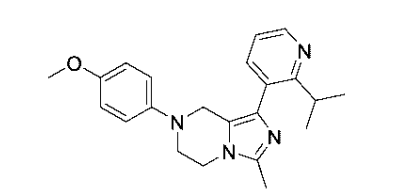
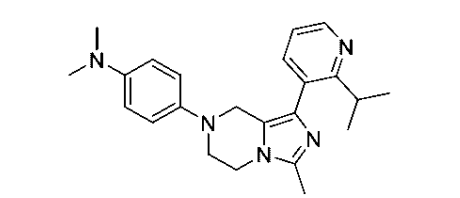




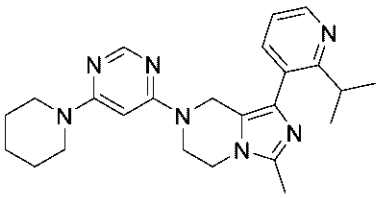
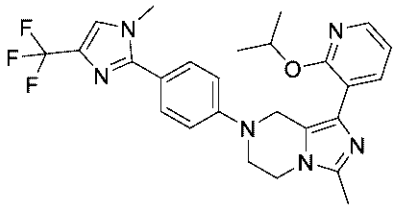
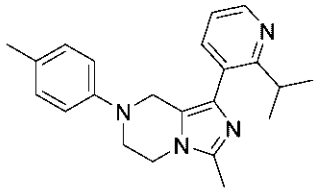
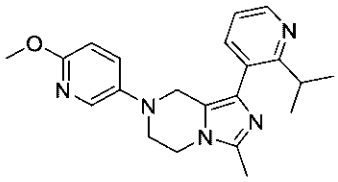
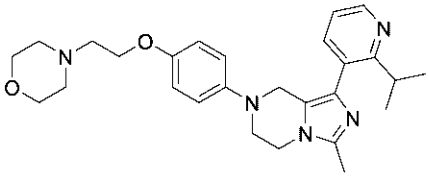
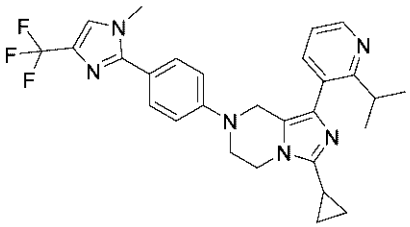
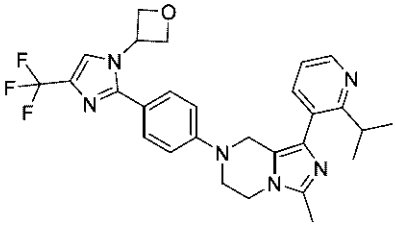
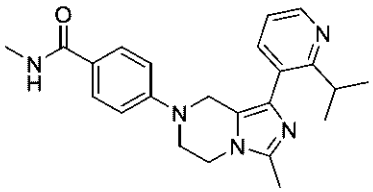
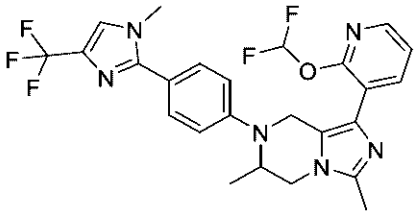
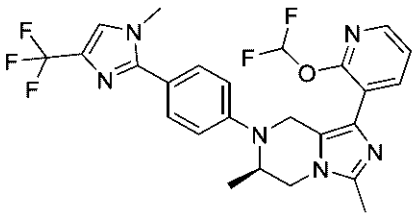
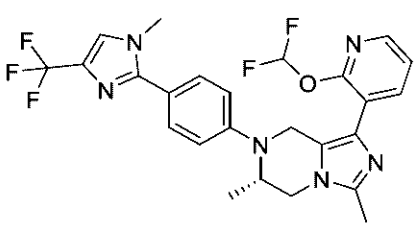
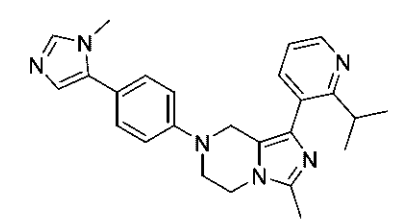




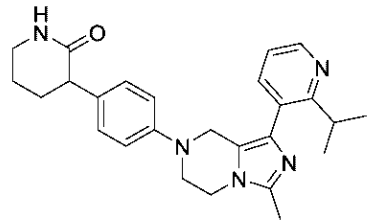
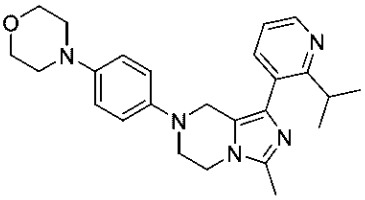
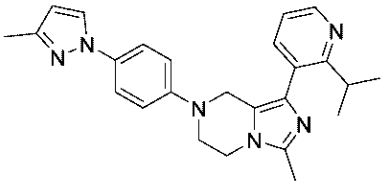
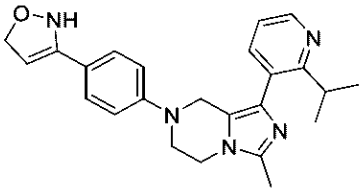
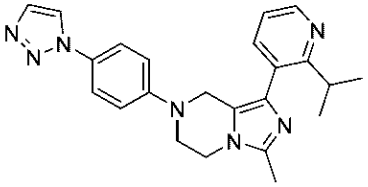
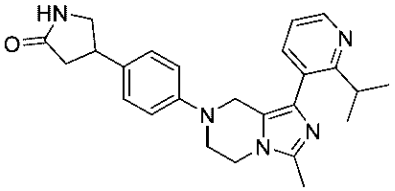
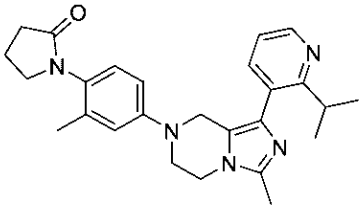
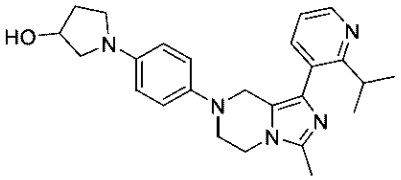
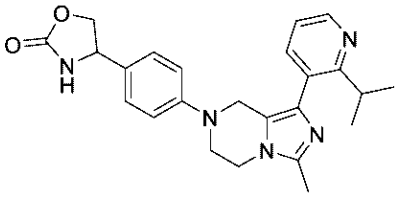
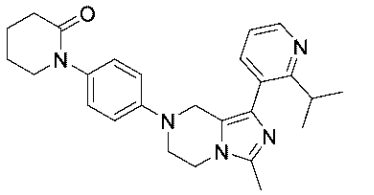
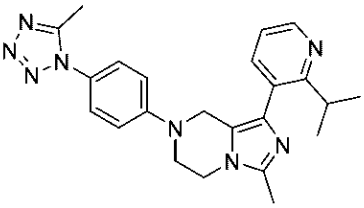
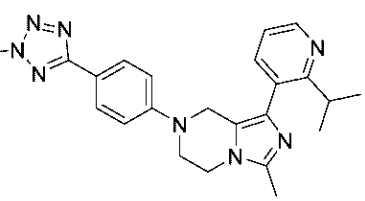
【表１－２】

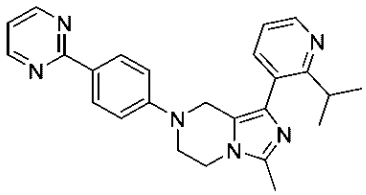
【表１－３】

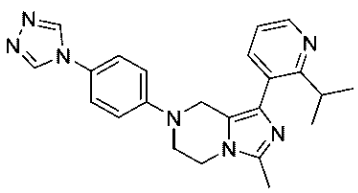













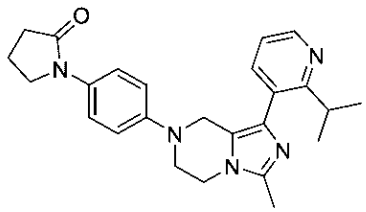
【表１－４】

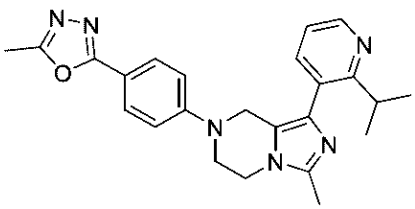













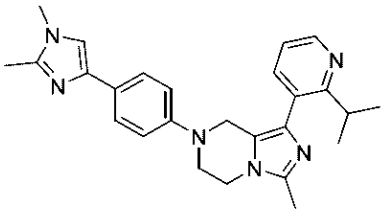
【表１－５】

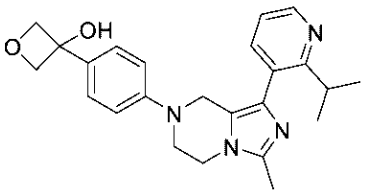


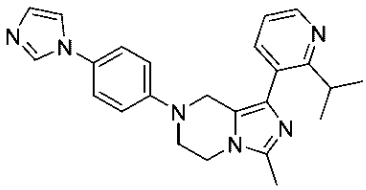


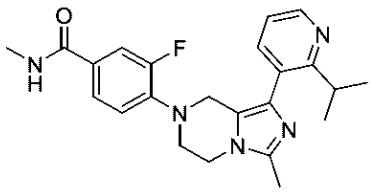


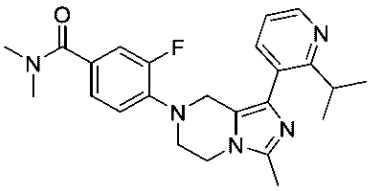


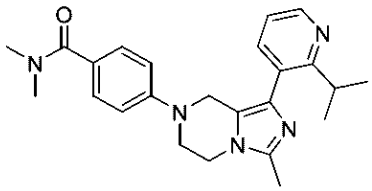


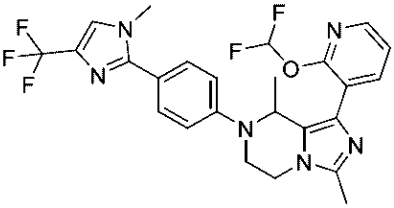


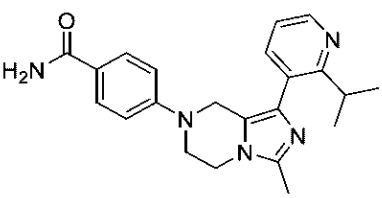




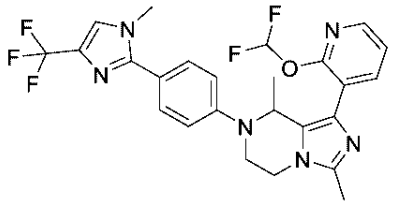
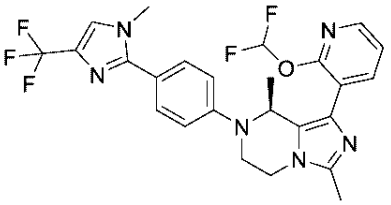
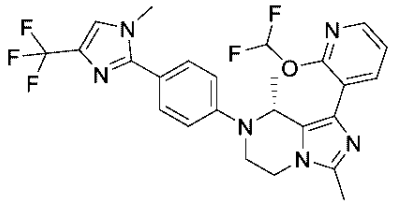
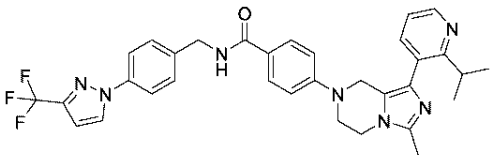
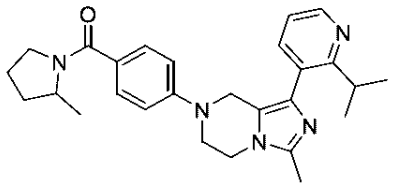
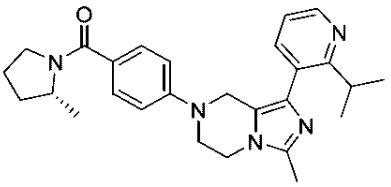
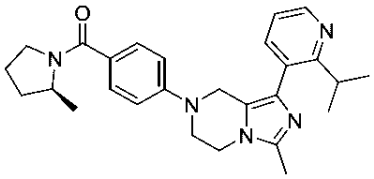
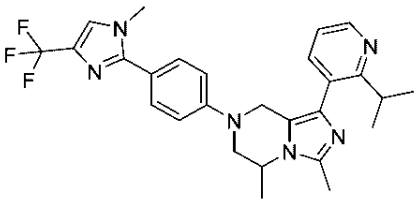
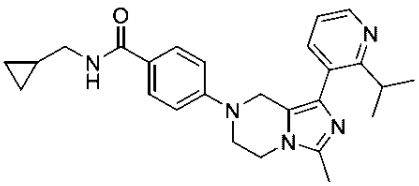
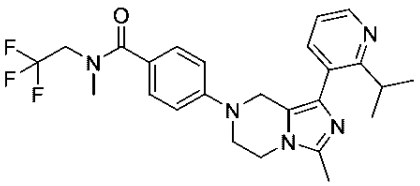
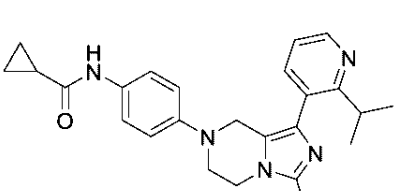
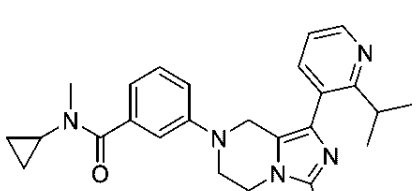


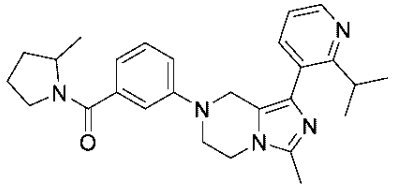
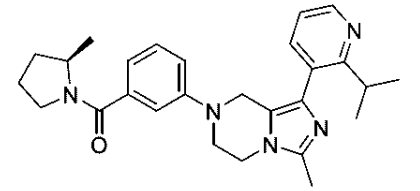






【表１－６】

10

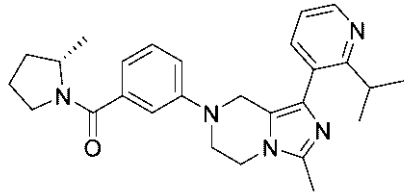
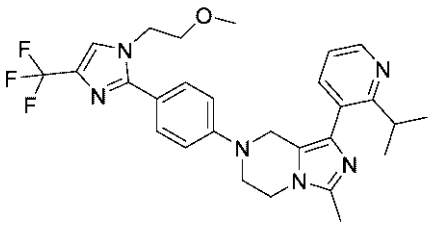
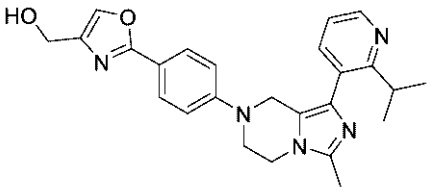
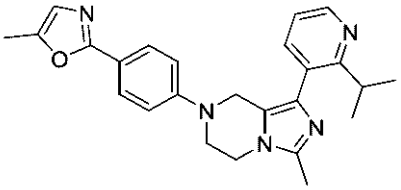
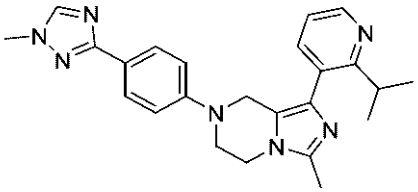
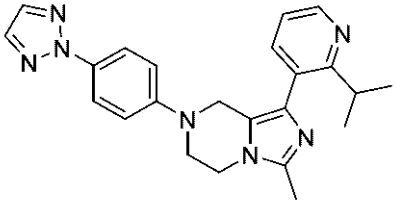
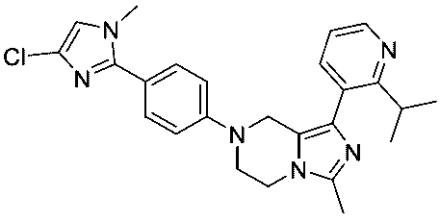
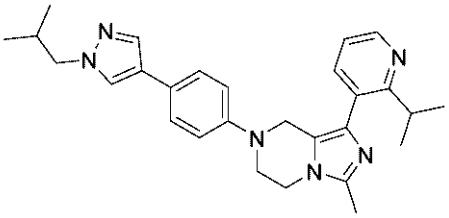
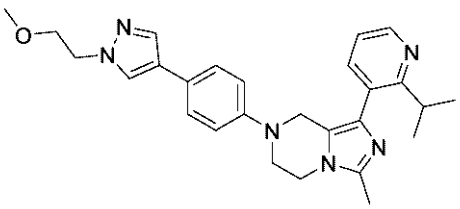
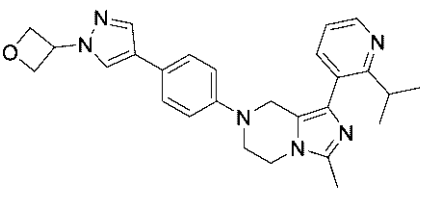
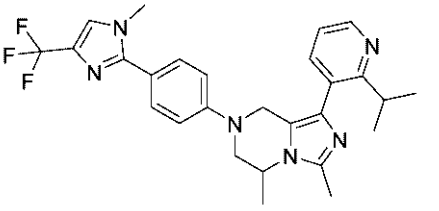
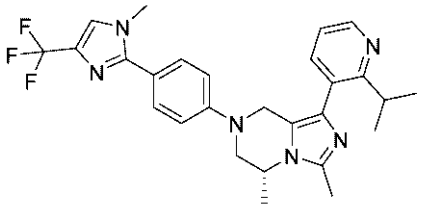
20

30

40

50

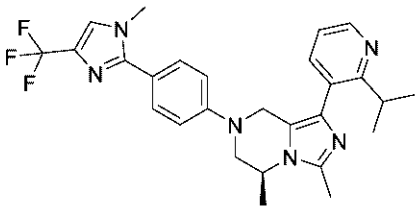
【表１－７】

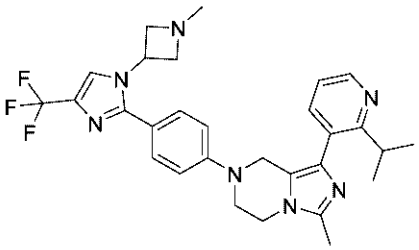













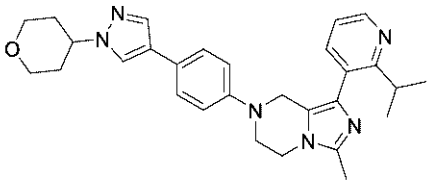
40

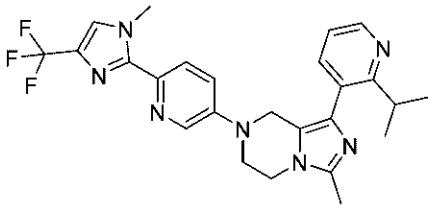
50

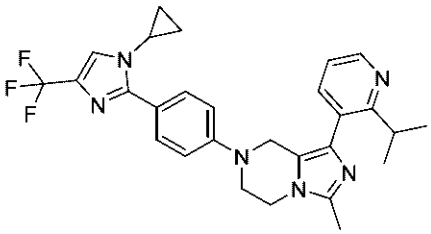
【表１－８】

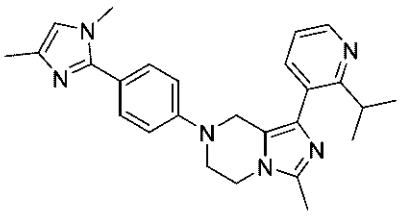


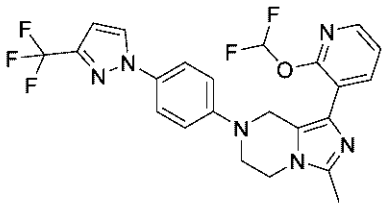


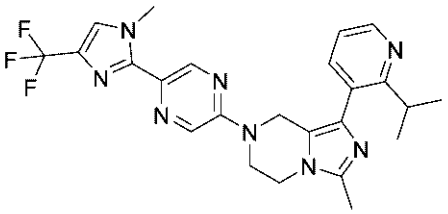


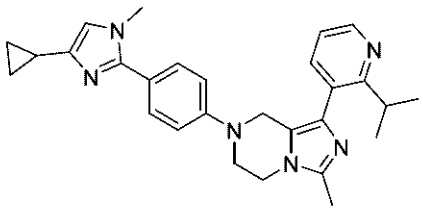


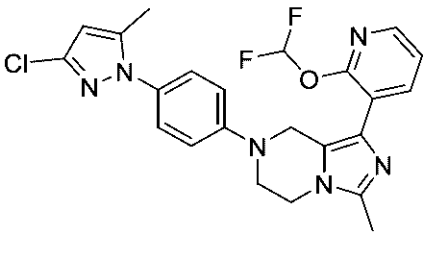


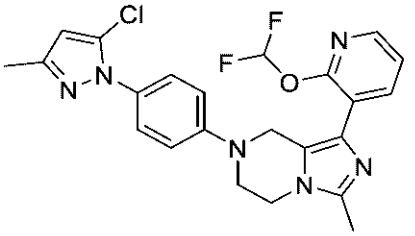


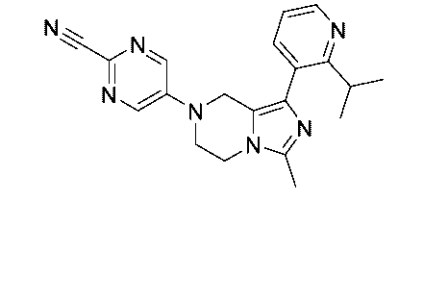




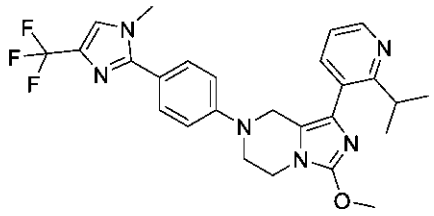
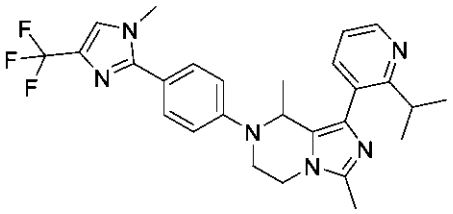
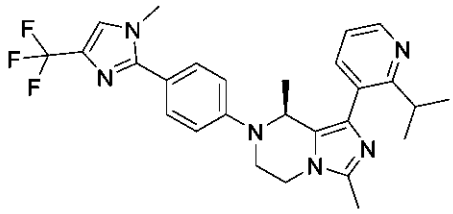
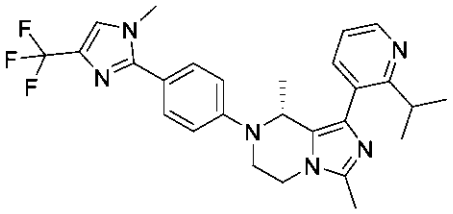
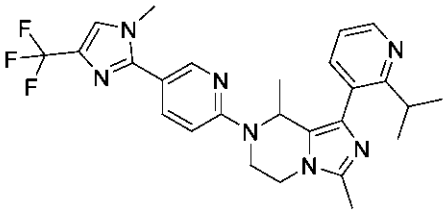
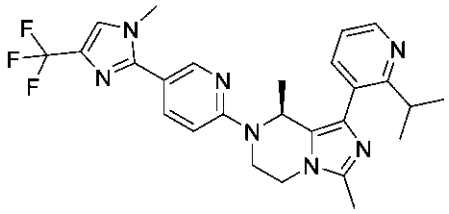
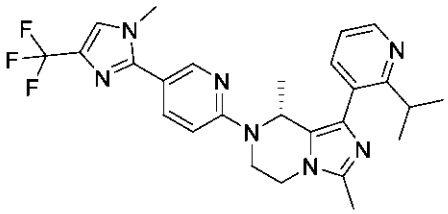








【表１－９】

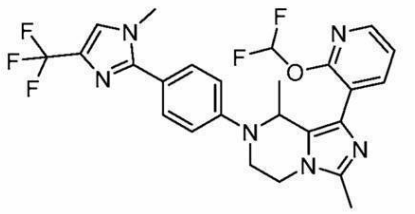








から選択される、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項１５】

前記化合物が、以下のものであるか、

【化７５】

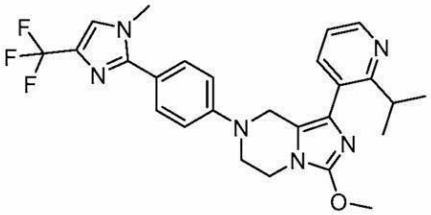


またはその薬学的に許容される塩である、請求項１４に記載の化合物。

【請求項１６】

前記化合物が、以下のものであるか、

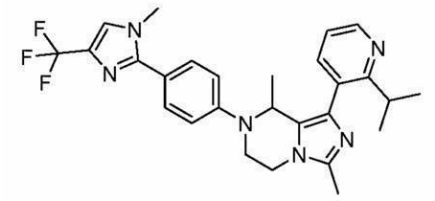
【化７６】



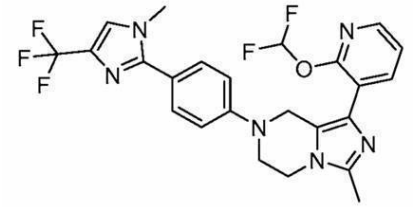
またはその薬学的に許容される塩である、請求項１４に記載の化合物。

【請求項１７】

前記化合物が、以下のものであるか、
【化７７】



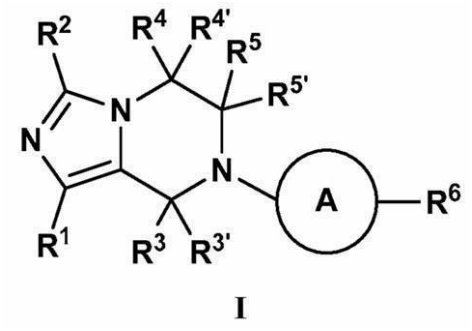
またはその薬学的に許容される塩である、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１８】
前記化合物が、以下のものであるか、
【化７８】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１９】
請求項１～１８のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体と、を含む、薬学的組成物。
【請求項２０】
医薬としての使用のための組成物であって、請求項１～１８のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩とを含む、組成物。
【請求項２１】
ＵＳＰ１に関連する疾患または障害を治療する方法における使用のための組成物であって、請求項１～１８のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩とを含む、組成物。
【請求項２２】
前記組成物ががんを治療するためのものであることを特徴とする、請求項２０または２１に記載の組成物。
【請求項２３】
生物学的試料におけるＵＳＰ１を阻害する方法であって、前記生物学的試料を、請求項１～１８のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と接触させることを含む、方法。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０２１９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０２１９】
等価物
当業者であれば、単にルーチン実験を使用して、本明細書において具体的に記載されている特定の実施形態に対する多くの等価物を認識するか、または確認することができるであろう。そのような等価物は、以下の特許請求の範囲に包含されることが意図される。
特定の実施形態では、例えば、以下が提供される：
（項目１）

式Ｉの化合物

【化７１】



Ｉ

またはその薬学的に許容される塩であって、式中、

環Ａが、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、

環Ａの各シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意にハロゲン、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、および－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$からなる群から選択される１つ以上の置換基で置換され、

Ｒ^{1}が、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、

Ｒ^{1}の各アリールまたはヘテロアリールが、任意に１つ以上のＲ^{1a}で置換され、

各Ｒ^{1a}が独立して、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、－Ｃ$_4$－Ｃ$_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、

Ｒ^{2}が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、－Ｃ$_4$－Ｃ$_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、

Ｒ^{2}の各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－Ｃ$_6$－Ｃ$_{10}$アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールで置換され、

Ｒ^3、Ｒ$^{3’}$、Ｒ^4、Ｒ$^{4’}$、Ｒ^5、およびＲ$^{5’}$がそれぞれ独立して、－Ｈ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルケニル、－Ｃ$_2$－Ｃ$_6$アルキニル、および－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シク

ロアルキルからなる群から選択されるか、
または（R^3および$R^{3'}$）もしくは（R^4および$R^{4'}$）もしくは（R^5および$R^{5'}$）の各々が、それらが結合する原子と組み合わせて、－C_3－C_{12}シクロアルキル環、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル環を形成することができ、
R^6が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－NR_2、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－NO_2、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－$C_1$－$C_6$アルキル、－$C_2$－$C_6$アルケニル、－$C_2$－$C_6$アルキニル、－$C_3$－$C_{12}$シクロアルキル、－$C_4$－$C_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－C_6－C_{10}アリール、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールであり、
R^6の各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のR^{6a}で置換され、
各R^{6a}が独立して、ハロゲン、オキソ、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－NR_2、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－NO_2、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－$C_1$－$C_6$アルキル、－$C_2$－$C_6$アルケニル、－$C_2$－$C_6$アルキニル、－$C_3$－$C_{12}$シクロアルキル、－$C_4$－$C_{12}$シクロアルケニル、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－C_6－C_{10}アリール、および酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、
R^{6a}の各アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のハロゲン、－C_1－C_6アルキル、または－ＯＲで置換され、
各Ｒが独立して、－Ｈ、－C_1－C_6アルキル、－C_0－C_6アルキレン－C_6－C_{10}アリール、－C_3－C_{12}シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、
Ｒの各アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールが、任意に１つ以上のR^aで置換されるか、
または２個のＲ基が、それらが結合する原子と組み合わせて、任意に－C_1－C_6アルキルで置換される、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロシクリルを形成することができ、
各R^aが独立して、ハロゲン、－Ｏ（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）$_2$、－C_3－C_6シクロアルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員ヘテロアリールであり、
R^aの各シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールが、任意に－C_1－C_6アルキルまたは１つ以上のハロゲンで置換される－C_1－C_6アルキルで置換され、
各Ｒ’が独立して、－C_1－C_6アルキル、－C_2－C_6アルケニル、－C_2－C_6アルキニル、－C_3－C_{12}シクロアルキル、－C_4－C_{12}シクロアルケニル、酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、－C_6－C_{10}アリール、および酸素、窒素、または硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択される、化合物またはその薬学的に許容される塩。
（項目２）

環Ａが、フェニルまたは１～３個の窒素原子を有する６員ヘテロアリールであり、環Ａの各フェニルまたはヘテロアリールが、任意にハロゲン、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＮＲＳ（Ｏ）$_2$Ｒ’、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＳＲ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ’、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ’、および－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$からなる群から選択される１つ以上の置換基で置換される、項目１に記載の化合物。

（項目３）

Ｒ^{1}が、フェニルまたは１～３個の窒素原子を有する６員ヘテロアリールであり、各フェニルまたはヘテロアリールが、０、１、２、３、または４個のＲ^{1a}で置換される、項目１または項目２に記載の化合物。

（項目４）

Ｒ^{1a}が、－ＯＲまたは－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルである、項目１～３のいずれか一項に記載の化合物。

（項目５）

Ｒ^{1a}が、イソプロピルまたは－ＯＣＨＦ$_2$である、項目１～４のいずれか一項に記載の化合物。

（項目６）

Ｒ^{2}が、－Ｈ、－ＯＲ、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、または－Ｃ$_3$－Ｃ$_{12}$シクロアルキルであり、Ｒ^{2}の各アルキルまたはシクロアルキルが、任意に１つ以上のハロゲンで置換される、項目１～５のいずれか一項に記載の化合物。

（項目７）

Ｒ^3、Ｒ$^{3'}$、Ｒ^4、Ｒ$^{4'}$、Ｒ^5、およびＲ$^{5'}$がそれぞれ独立して、－Ｈおよび－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から選択される、項目１～６のいずれか一項に記載の化合物。

（項目８）

Ｒ^{6}が、－Ｈ、ハロゲン、－ＯＲ、－ＮＲ$_2$、－ＮＲＣ（Ｏ）Ｒ’、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキル、酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する３～１４員ヘテロシクリル、または酸素、窒素、もしくは硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～１４員ヘテロアリールからなる群から選択され、Ｒ^{6}の各アルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールが、０、１、２、３、または４個のＲ^{6a}で置換される、項目１～７のいずれか一項に記載の化合物。

（項目９）

Ｒ^{6}が、酸素、窒素、および硫黄から選択される１～４個のヘテロ原子を有する５員ヘテロアリールであり、Ｒ^{6}の前記ヘテロアリールが、０、１、または２個のＲ^{6a}で置換される、項目１～８のいずれか一項に記載の化合物。

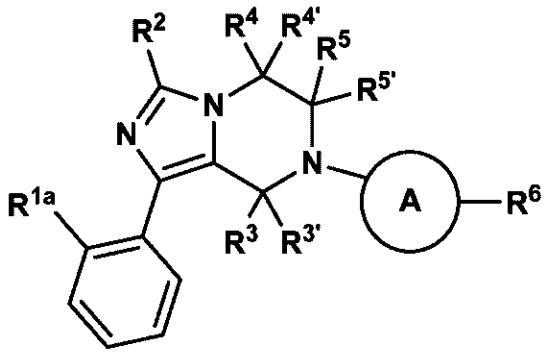
（項目１０）

各Ｒが独立して、－Ｈおよび－Ｃ$_1$－Ｃ$_6$アルキルからなる群から選択され、Ｒの各アルキルが、０、１、２、３、または４個のＲ^{a}で置換される、項目１～９のいずれか一項に記載の化合物。

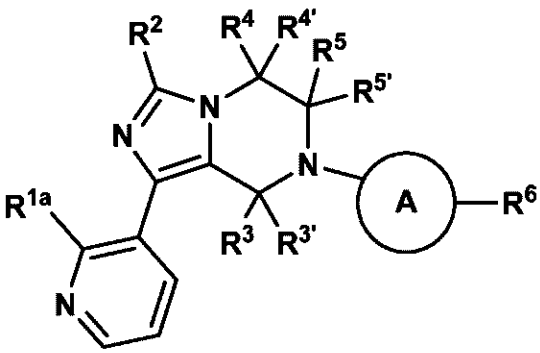
（項目１１）

前記化合物が、式ＩＩＩａもしくはＩＩＩｂのものであるか、

【化７２】



IIIa



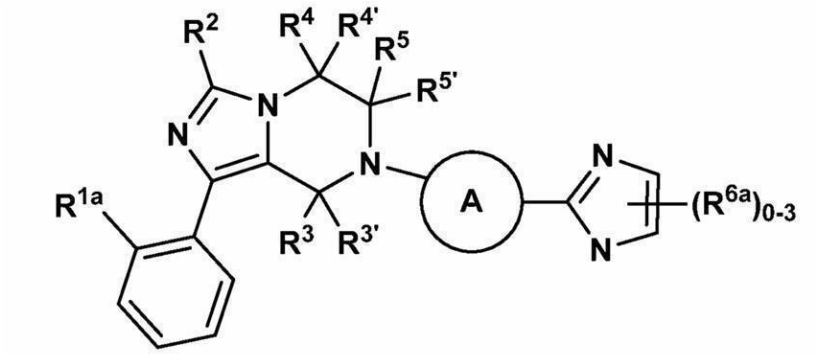
IIIb

またはその薬学的に許容される塩である、項目１～１０のいずれか一項に記載の化合物。

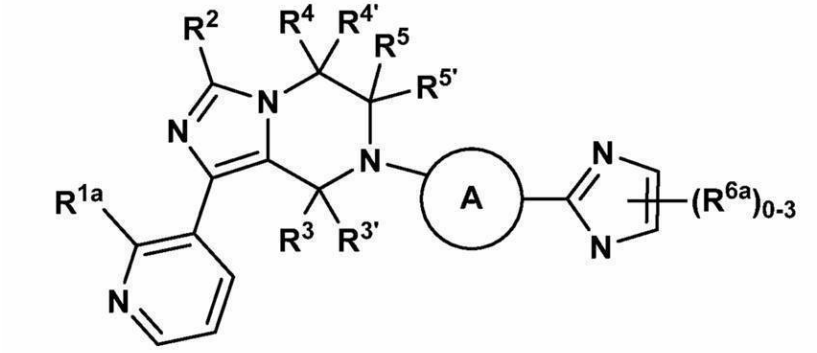
（項目１２）

前記化合物が、式ＩＶａもしくは式ＩＶｂのものであるか、

【化７３】



IVa



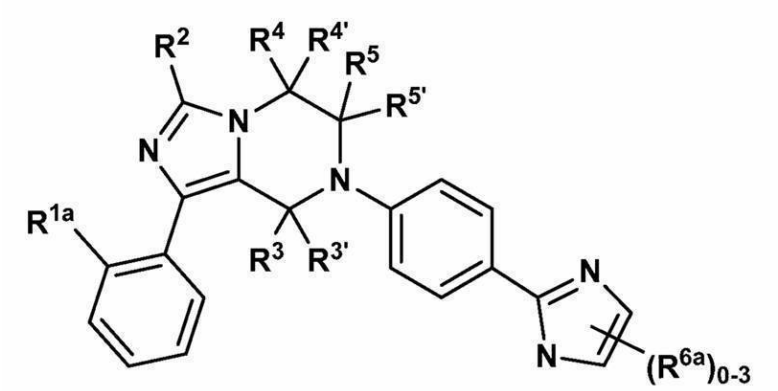
IVb

またはその薬学的に許容される塩である、項目１～１１のいずれか一項に記載の化合物。

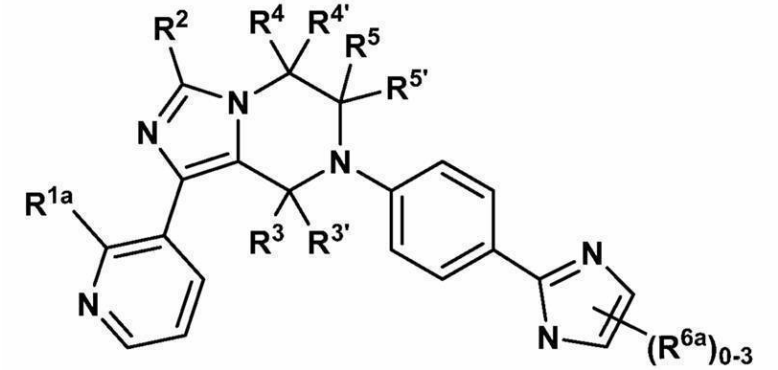
（項目１３）

前記化合物が、式Ｖａもしくは式Ｖｂのものであるか、

【化７４】



Va



Vb

または その薬学的に許容される塩である、実施形態１～１２のいずれか一項に記載の化合物。

（項目１４）

表１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。

（項目１５）

前記化合物が、以下のものであるか、

【化７５】



40

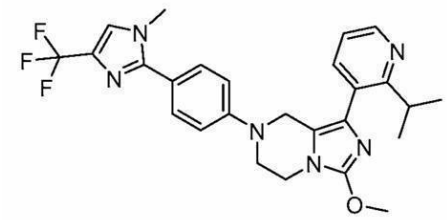
またはその薬学的に許容される塩である、項目１４に記載の化合物。

（項目１６）

前記化合物が、以下のものであるか、

50

【化７６】

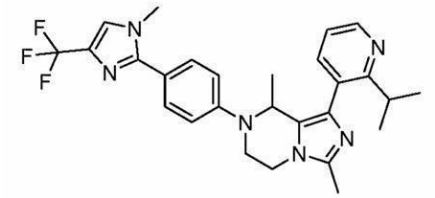


またはその薬学的に許容される塩である、項目１４に記載の化合物。

（項目１７）

前記化合物が、以下のものであるか、

【化７７】



またはその薬学的に許容される塩である、項目１４に記載の化合物。

（項目１８）

前記化合物が、以下のものであるか、

【化７８】



またはその薬学的に許容される塩である、項目１４に記載の化合物。

（項目１９）

項目１～１８のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体と、を含む、薬学的組成物。