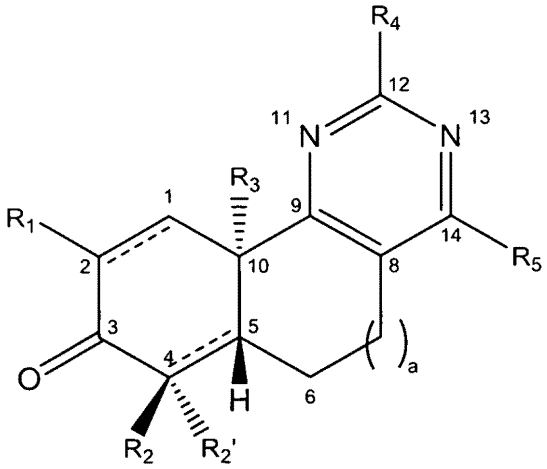
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年1月28日(2021.1.28)

【公表番号】特表2020-512289(P2020-512289A)
【公表日】令和2年4月23日(2020.4.23)
【年通号数】公開・登録公報2020-016
【出願番号】特願2019-531921(P2019-531921)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 239/70　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/14　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/517　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 491/044　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/14　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/14　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 407/14　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 239/70
Ａ６１Ｐ 43/00　１１１
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 35/00

Ａ６１Ｐ	11/06	
Ａ６１Ｐ	25/00	
Ａ６１Ｐ	29/00	
Ａ６１Ｐ	27/02	
Ａ６１Ｐ	17/06	
Ａ６１Ｐ	19/02	
Ａ６１Ｐ	29/00	１０１
Ａ６１Ｐ	17/00	
Ａ６１Ｐ	27/04	
Ａ６１Ｐ	3/10	
Ａ６１Ｐ	21/04	
Ａ６１Ｐ	1/04	
Ａ６１Ｐ	9/00	
Ａ６１Ｐ	9/10	
Ａ６１Ｐ	9/12	
Ａ６１Ｐ	25/08	
Ａ６１Ｐ	25/16	
Ａ６１Ｐ	25/28	
Ａ６１Ｐ	25/14	
Ａ６１Ｐ	21/00	
Ａ６１Ｐ	3/04	
Ａ６１Ｐ	1/16	
Ｃ０７Ｄ	401/04	ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ	31/517	
Ｃ０７Ｄ	491/044	
Ｃ０７Ｄ	401/14	
Ａ６１Ｋ	31/5377	
Ｃ０７Ｄ	471/04	１０６Ａ
Ｃ０７Ｄ	417/04	
Ｃ０７Ｄ	413/04	
Ｃ０７Ｄ	471/04	１０４Ｚ
Ｃ０７Ｄ	403/04	
Ｃ０７Ｄ	413/14	
Ｃ０７Ｄ	407/14	

【手続補正書】
【提出日】令和2年12月14日(2020.12.14)
【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】
下記式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



(I)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

aは、0、1、または2であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

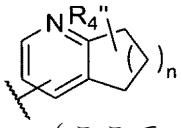
R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アルケニル$_{(C\leqq 12)}$、アルキニル$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leqq 12)}$、アシル$_{(C\leqq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、またはアルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アルケニル$_{(C\leqq 12)}$、アルキニル$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leqq 12)}$、アシル$_{(C\leqq 12)}$、もしくはこれらの基の置換型であり；但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、アルケニル$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、シクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、アリール$_{(C\leqq 18)}$、置換アリール$_{(C\leqq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、あるいは



（ここで、

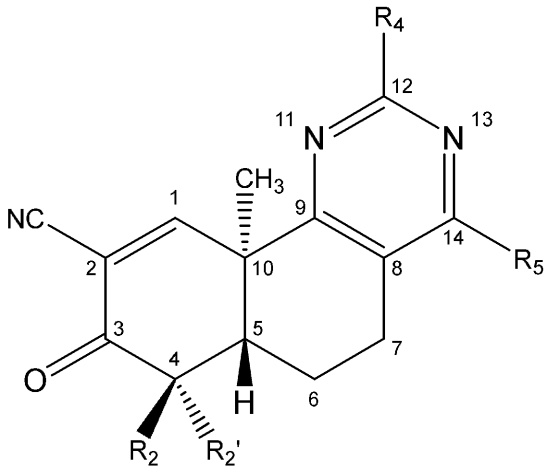
nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アシル$_{(C\leqq 8)}$、アミド$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leqq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C\leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アシル$_{(C\leqq 8)}$、アミド$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、イソプロポキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アシル$_{(C\leqq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、または最後の13個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_c-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leqq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leqq 8)}$であり；
R_cは、水素、アルキル$_{(C\leqq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leqq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leqq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leqq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leqq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leqq 12)}$または置換アシル$_{(C\leqq 12)}$である）
であり；
但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。

【請求項２】
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、請求項1記載の化合物：



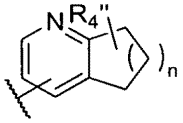
(III)

式中、

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C \leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leqq 12)}$、アルケニル$_{(C \leqq 12)}$、アルキニル$_{(C \leqq 12)}$、アリール$_{(C \leqq 12)}$、アラルキル$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leqq 12)}$、アシル$_{(C \leqq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C \leqq 8)}$-シクロアルキル$_{(C \leqq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、水素、アルキル$_{(C \leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leqq 12)}$、アルケニル$_{(C \leqq 12)}$、アルキニル$_{(C \leqq 12)}$、または最後の4つの基の置換型であり；

R_4は、シクロアルキル$_{(C \leqq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C \leqq 18)}$、アリール$_{(C \leqq 18)}$、置換アリール$_{(C \leqq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leqq 18)}$、もしくは置換ヘテロシクロアルキル$_{(C \leqq 18)}$、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C \leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アシル$_{(C \leqq 8)}$、アミド$_{(C \leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leqq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C \leqq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

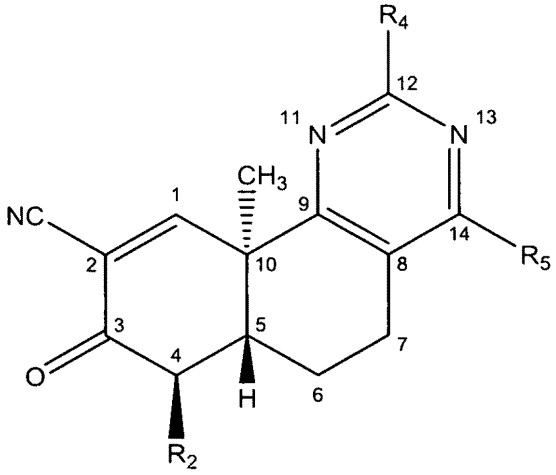
（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leqq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$であり；

pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

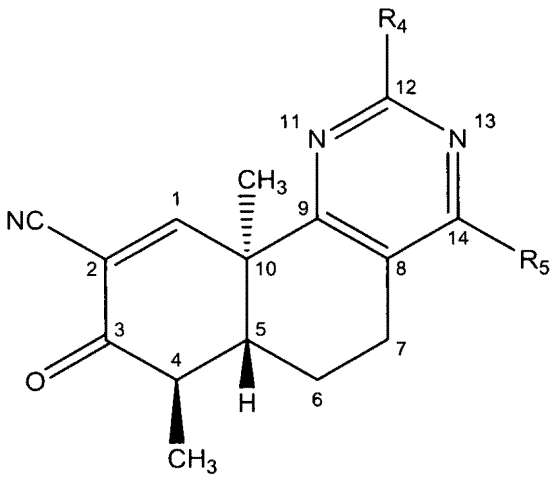
R_4'''は、アルキル$_{(C \leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アシル$_{(C \leqq 8)}$、アミド$_{(C \leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leqq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、イソプロポキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アシル$_{(C\leqq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leqq 12)}$、または最後の13個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leqq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leqq 8)}$であり；
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leqq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leqq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leqq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leqq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leqq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leqq 12)}$または置換アシル$_{(C\leqq 12)}$である）
である。
【請求項３】
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、請求項1記載の化合物：



(VII)

式中、
R_2は、水素、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、または置換アルキル$_{(C\leqq 12)}$であり；
R_4は、ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$であり；かつ
R_5は、アリール$_{(C\leqq 12)}$または置換アリール$_{(C\leqq 12)}$である。
【請求項４】
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、請求項1記載の化合物：



(IX)

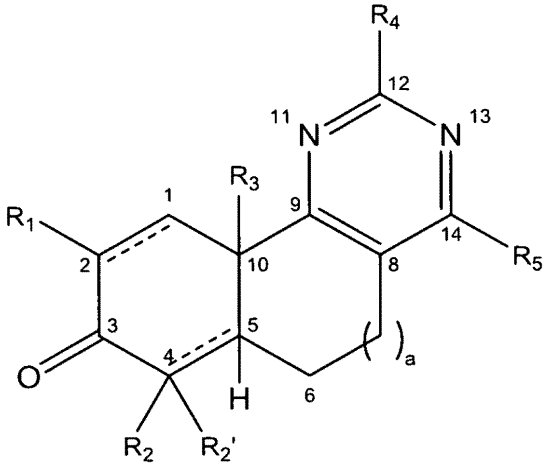
式中、

R_4は、ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$であり；かつ

R_5は、アリール$_{(C\leqq 12)}$または置換アリール$_{(C\leqq 12)}$である。

【請求項５】

下記式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



(X)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

aは、0、1、または2であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

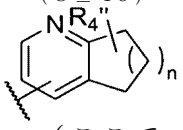
R_2は、水素、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アルケニル$_{(C\leqq 12)}$、アルキニル$_{(C\leqq 12)}$、もしくは最後の4つの基の置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 12)}$、アルケニル$_{(C\leqq 12)}$、アルキニル$_{(C\leqq 12)}$、または最後の4つの基の置換型であり、但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、アラルキル$_{(C\leqq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、シクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキ

ル$_{(C\leqq 18)}$、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH_2、-NO_2、-CN、-SH、-$S(O)_2OH$、もしくは-$S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アシル$_{(C\leqq 8)}$、アミド$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

-X_2-$(CH_2)_p$-R_4'''

（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロシクロアルキルジイル$_{(C\leqq 12)}$、置換ヘテロシクロアルキルジイル$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$であり；

pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'''は、アルキル$_{(C\leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$、アシル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ

R_5は、シクロアルコキシ$_{(C\leqq 12)}$、アリール$_{(C\leqq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$、または最後の3つの基のうちのいずれかの置換型、あるいは

-OY_1-A_1

（ここで、

Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leqq 8)}$であり；かつ

A_1は、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$である）

であり；

但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。

【請求項６】

炭素原子1と炭素原子2の間の結合が、二重結合である、請求項1または請求項5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項７】

炭素原子4と炭素原子5の間の結合が、単結合である、請求項1または請求項5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項８】

aが1である、請求項1または請求項5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項９】

R_1がシアノである、請求項1または請求項5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１０】

R_2が、アルキル$_{(C\leqq 12)}$または置換アルキル$_{(C\leqq 12)}$である、請求項1～3および5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項１１】

R_2が、メチル、エチル、プロピル、または3-ヒドロキシプロピルである、請求項10記載の化合物。

【請求項１２】
R_2'が水素、アルキル$_{(C \leqq 12)}$または置換アルキル$_{(C \leqq 12)}$である、請求項1、2および5のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１３】
R_3がアルキル$_{(C \leqq 12)}$である、請求項1または請求項5のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１４】
R_3がメチルである、請求項13記載の化合物。
【請求項１５】
R_4が、ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$である、請求項1、2、および5～14のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１６】
R_4が、ヘテロアリール$_{(C \leqq 12)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leqq 12)}$基であり、ここで、芳香環中のヘテロ原子のうちの少なくとも1つは窒素原子である、請求項1～15のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１７】
R_4が、3-ピリジニル、4-ピリジニル、4-(2-シクロプロピル)-ピリジニル、5-(2-シシロプロピル)-ピリジニル、4-(2-モルホリノ)-ピリジニル、4-(2-フェニル)-ピリジニル、3-(5-メチル)-ピリジニル、3-(6-メチル)-ピリジニル、4-(2-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、3-ピラゾロ[1,5-a]ピリジニル、3-(N-メチル)-ピロロ[2,3-b]ピリジニル、5-イソキンリニル（isoquinlinyl）、2-イソキンリニル、1-イソキノリニル、4-(2-フェニル)-ピリジニル、5-(2-フェニル)-ピリジニル、3-(5-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、4-(3,5-ジメチル)-イソオキサゾリル、4-(2-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、3-(4-メチル)-ピリジニル、4-(6-メチル)-ピリミジニル、6-(4-メチル)-ピリミジニル、4-ピリダジニル、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、2-キノリニル、3-キノリニル、4-キノリニル、5-キノリニル、6-キノリニル、8-キノリニル、4-イソキノリニル、3-(8-メチル)-キノリニル、3-(1-メチル)-キノリニル、4-(2-メチル)-キノリニル、4-(2-イソプロピル)-キノリニル、4-(6-メチル)-キノリニル、4-(7-メチル)-キノリニル、4-(8-メチル)-キノリニル、2-(N-メチル)-インドリル、5-(2,4-ジメチル)-チアゾリル、または5-(3-メチル)-オキサジアゾリルなどの、ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$である、請求項1～16のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１８】
R_4が、4-(2-トリフルオロメチル)-ピリジニル、4-(3-フルオロ)-ピリジニル、4-(2-メトキシ)-ピリジニル、4-(2-ヒドロキシメチル)-ピリジニル、4-(2-アセチルアミノ)-ピリジニル、4-(2-フルオロメチル)-ピリジニル、4-(2-アセトアミジルエチル)-ピリジニル、4-(2-フルオロメチル)-キノリニル、4-(2-アセトキシメチル)-キノリニル、4-(2-ホルミル)-キノリニル、4-(6-フルオロ)-キノリニル、4-(7-フルオロ)-キノリニル、4-(8-フルオロ)-キノリニル、4-(6,8-ジフルオロ)-キノリニル、4-(6-フルオロ-2-メチル)-キノリニル、または4-(8-フルオロ-2-メチル)-キノリニルなどの、置換ヘテロアリール$_{(C \leqq 18)}$である、請求項1～16のいずれか一項記載の化合物。
【請求項１９】
R_4が、アリール$_{(C \leqq 12)}$または置換アリール$_{(C \leqq 12)}$である、請求項1、2および6～14のいずれか一項記載の化合物。
【請求項２０】
R_4が、$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$であり；ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leqq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leqq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leqq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C \leqq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leqq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leqq 8)}$、アシル$_{(C \leqq 8)}$、アミド$_{(C \leqq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leqq}$

$_{8)}$、アシルオキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、-C(O)-ジアルキルアミノ$_{(C\leqq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leqq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である、請求項1、2、および5～14のいずれか一項記載の化合物。

【請求項２１】

X_2が、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leqq 12)}$である、請求項20記載の化合物。

【請求項２２】

R_4'''が、シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$である、請求項20記載の化合物。

【請求項２３】

R_4'''がシクロアルキル$_{(C\leqq 8)}$である、請求項22記載の化合物。

【請求項２４】

R_4'''がシクロプロピルである、請求項23記載の化合物。

【請求項２５】

R_5が、アリール$_{(C\leqq 12)}$または置換アリール$_{(C\leqq 12)}$である、請求項1、2、および5～24のいずれか一項記載の化合物。

【請求項２６】

R_5が、フェニル、4-メチルフェニル、3-イソプロピルフェニル、4-イソプロピルフェニル、1,3-ビフェニル、または1,4-ビフェニルなどの、アリール$_{(C\leqq 12)}$である、請求項25記載の化合物。

【請求項２７】

R_5が、置換アリール$_{(C\leqq 12)}$であり、該アリール$_{(C\leqq 12)}$の1つまたは複数の水素原子が独立してFよって置換されている、請求項25記載の化合物。

【請求項２８】

R_5が、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、4-ヒドロキシメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニル、4-クロロフェニル、または3,4-ジクロロフェニルなどの、置換アリール$_{(C\leqq 12)}$である、請求項25または請求項27のいずれか一項記載の化合物。

【請求項２９】

R_5が、シクロアルコキシ$_{(C\leqq 12)}$または置換シクロアルコキシ$_{(C\leqq 12)}$である、請求項1、2、および5～24のいずれか一項記載の化合物。

【請求項３０】

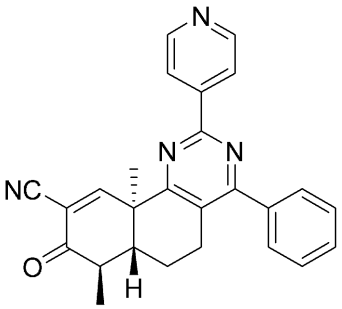
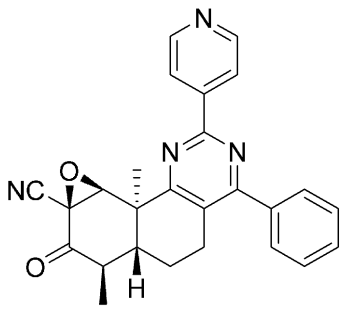
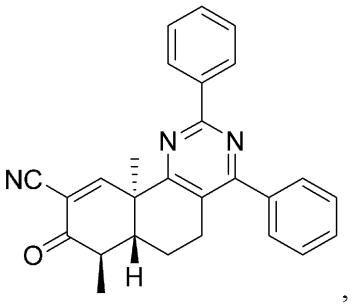
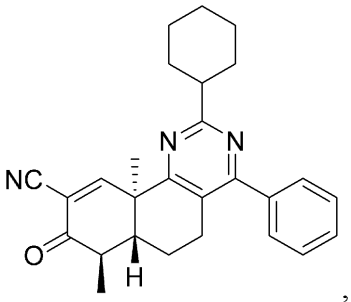
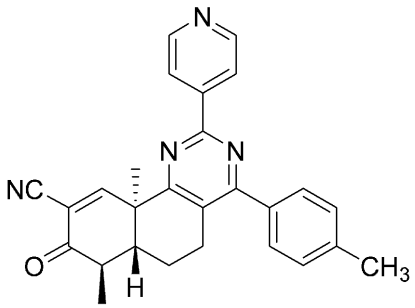
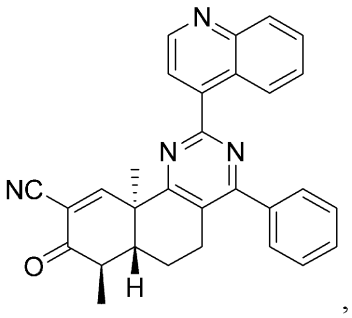
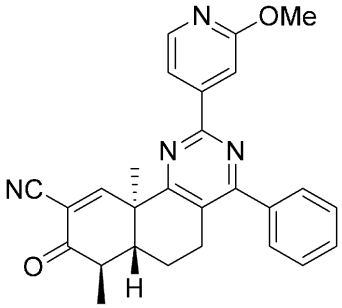
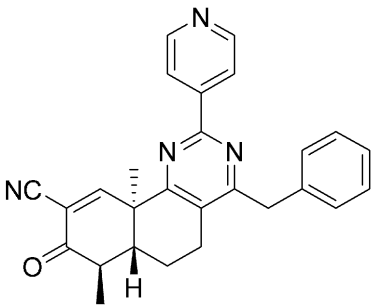
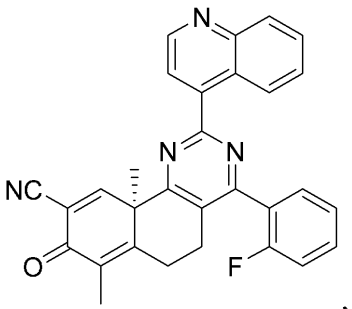
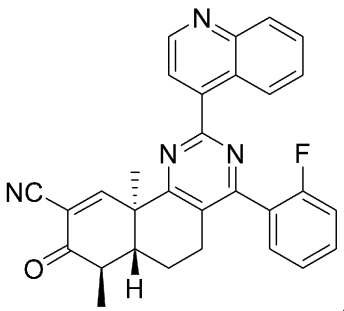
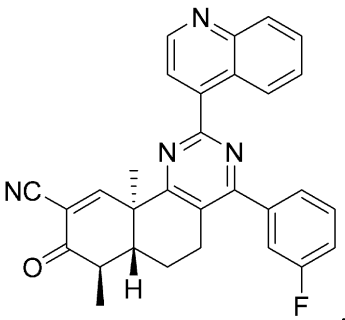
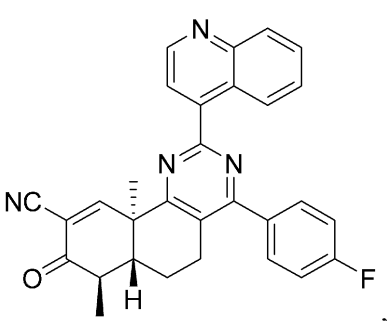
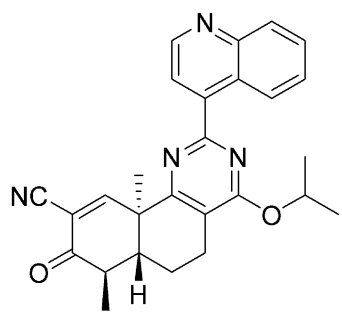
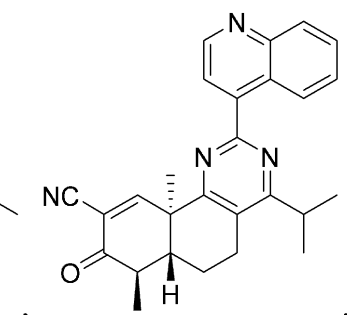
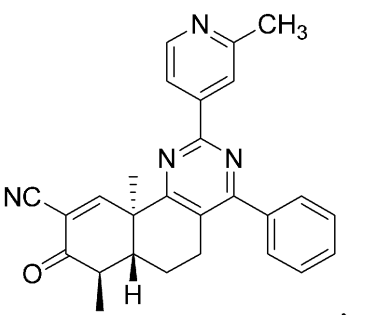
R_5が、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、またはシクロヘキシルオキシである、請求項28記載の化合物。

【請求項３１】

R_5が、ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$または置換ヘテロアリール$_{(C\leqq 12)}$である、請求項1、2、5～24のいずれか一項記載の化合物。

【請求項３２】

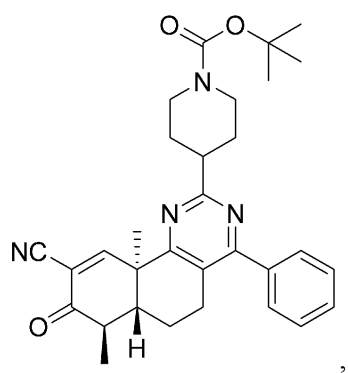
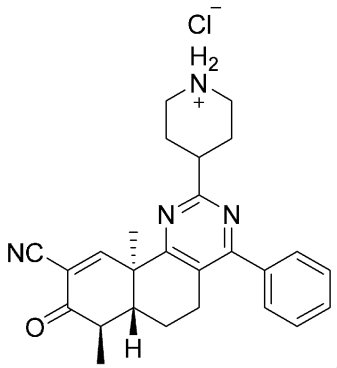
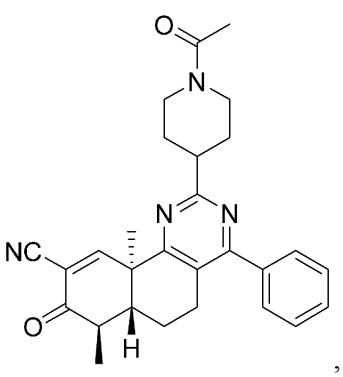
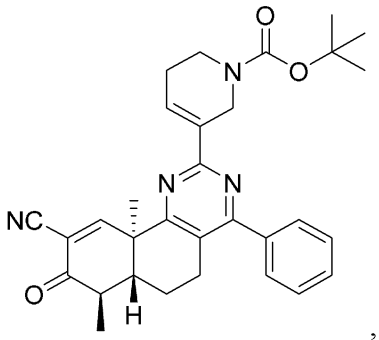
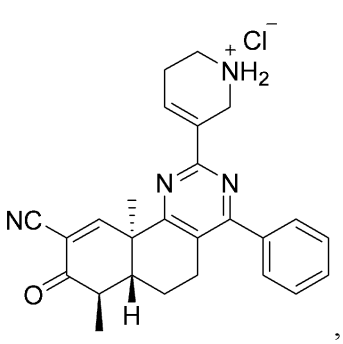
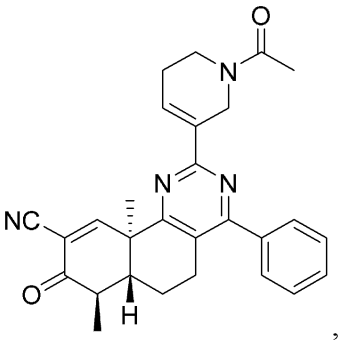
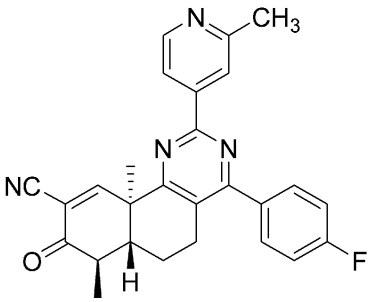
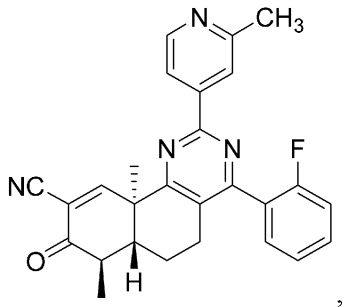
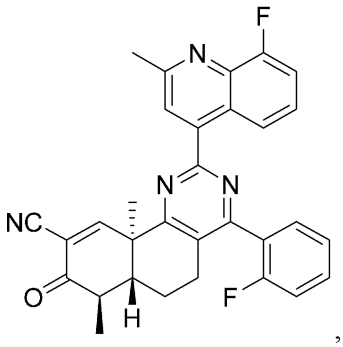
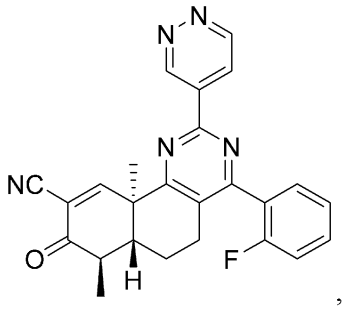
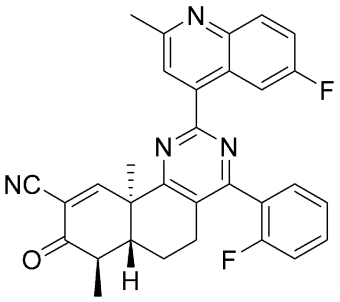
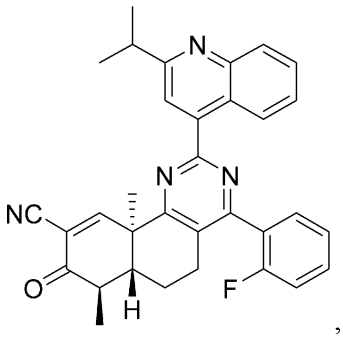
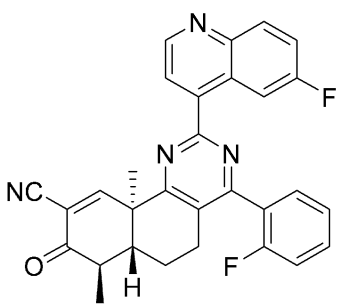
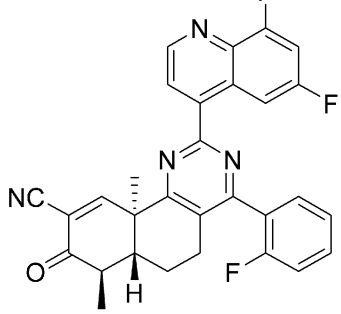
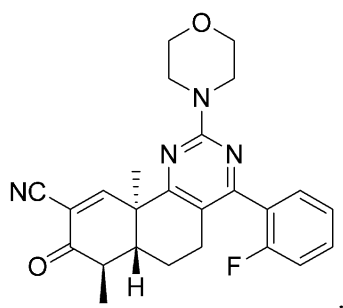
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、請求項1～31のいずれか一項記載の化合物：


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

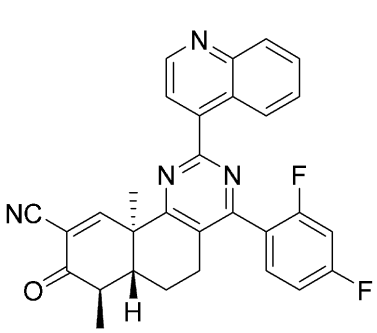
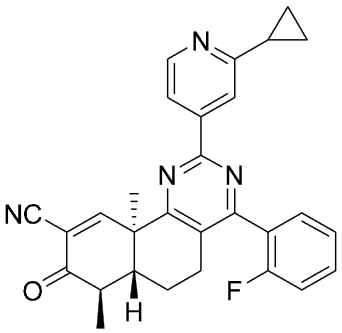
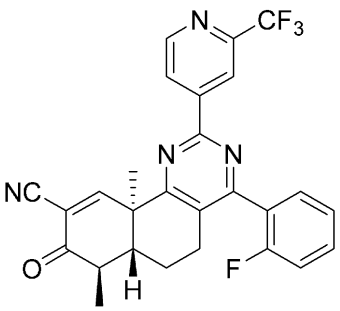
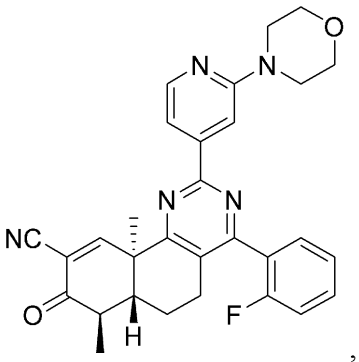
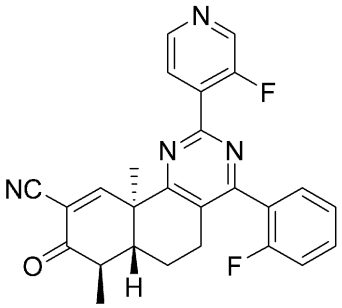
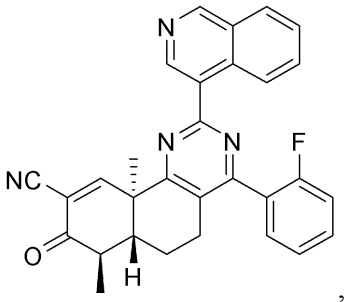
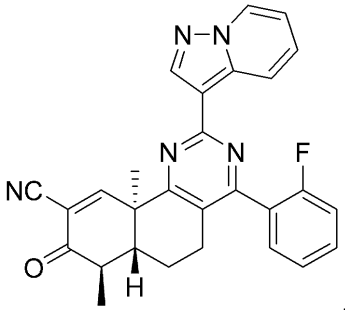
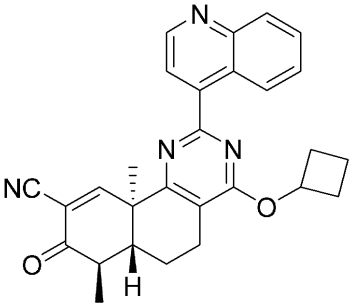
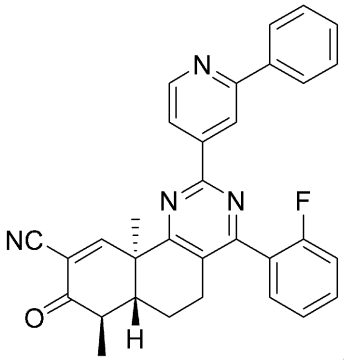
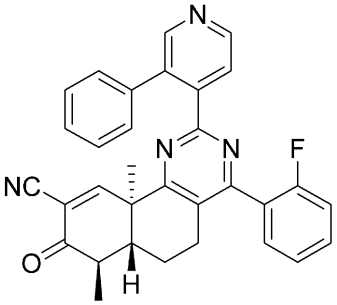
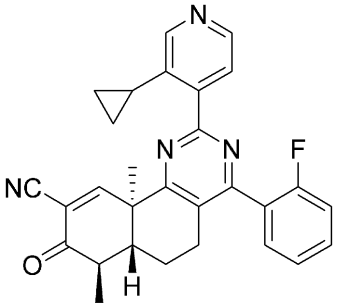
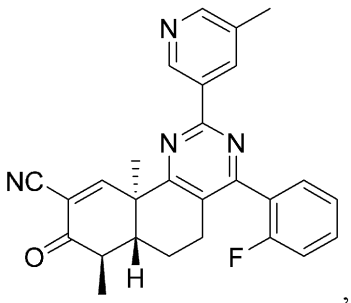
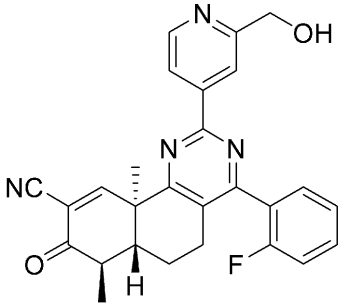
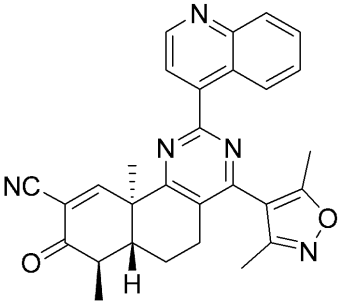
,

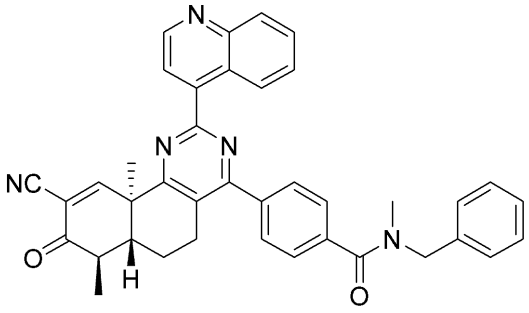
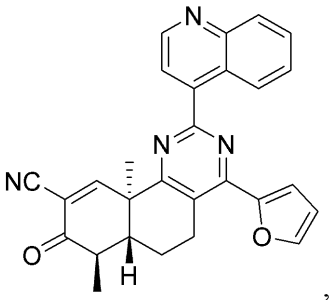
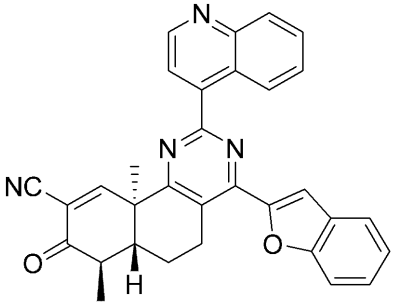
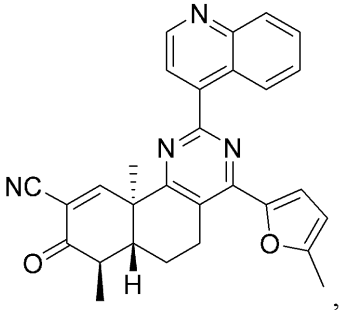
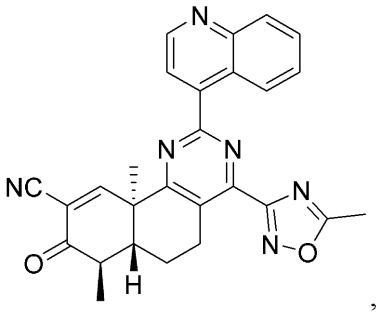
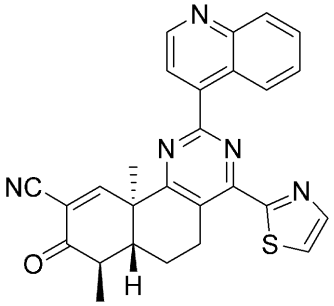
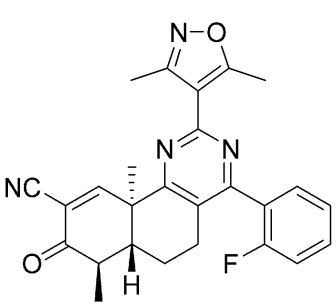
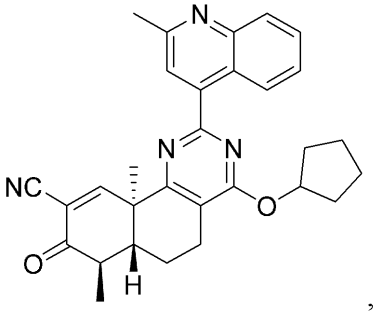
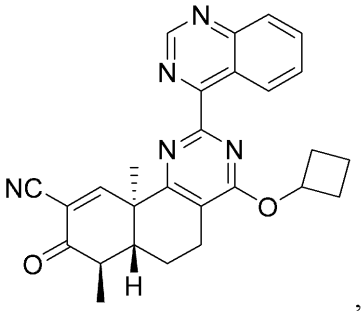
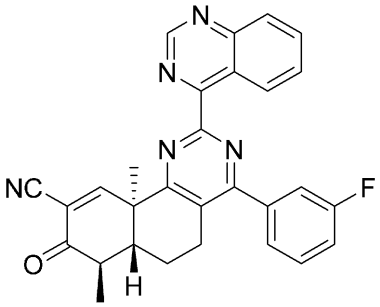
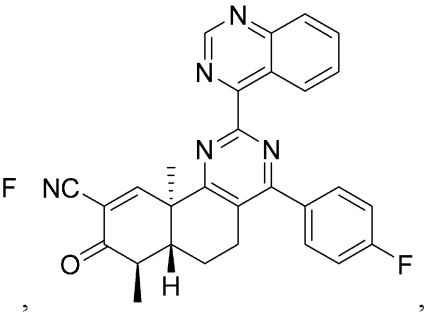
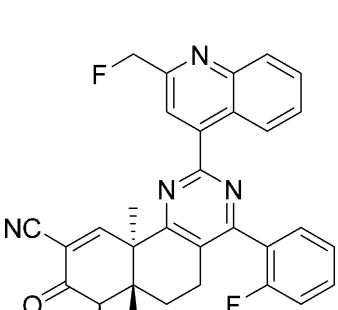

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

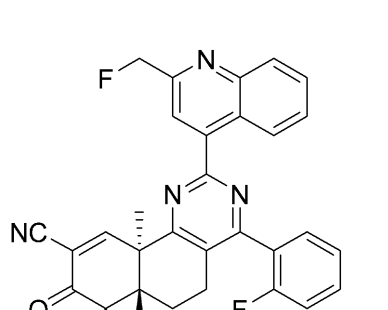
,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

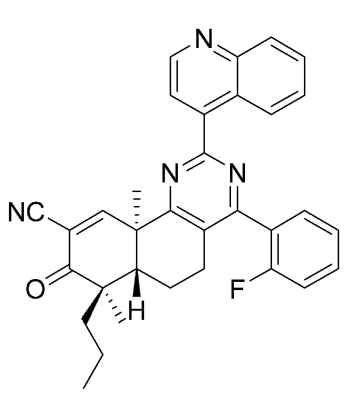
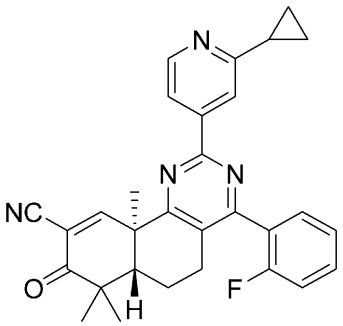
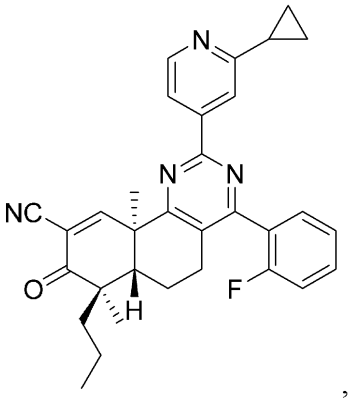
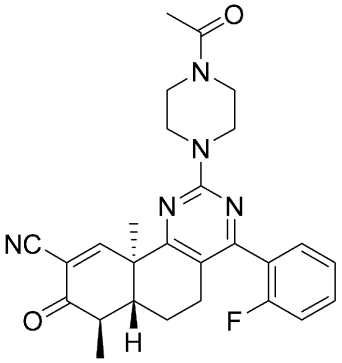
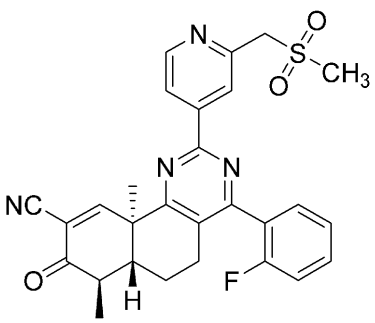
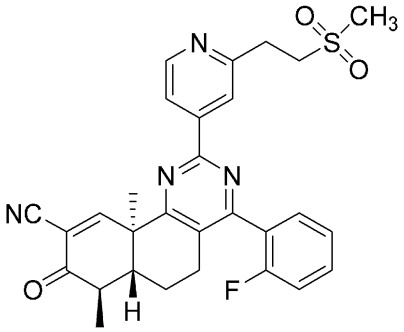
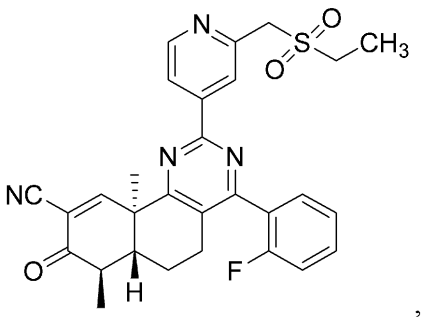
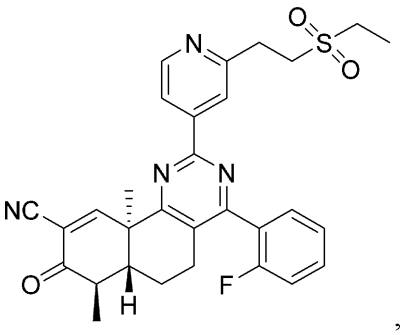
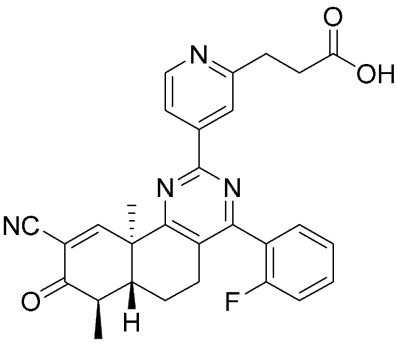
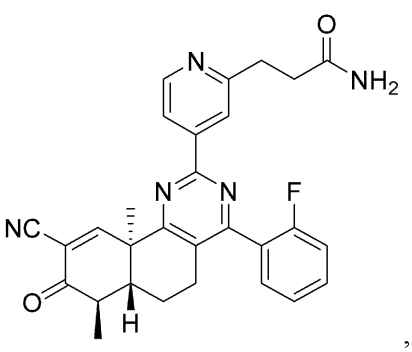
,

,

,

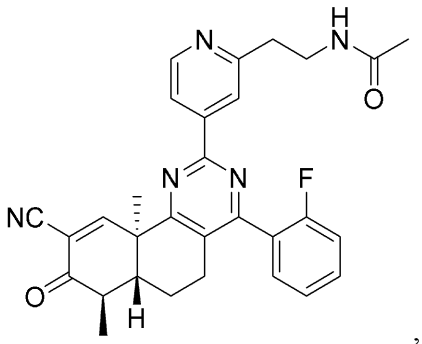
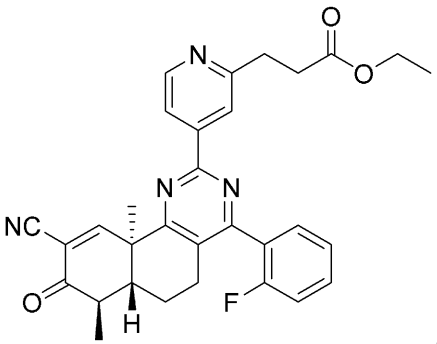
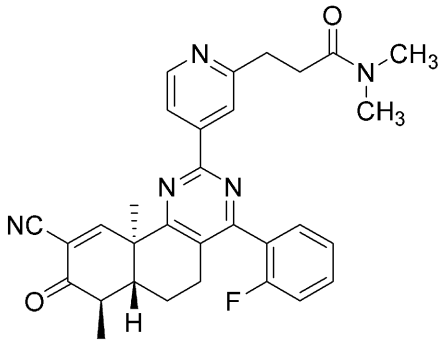
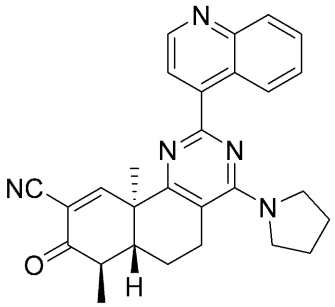
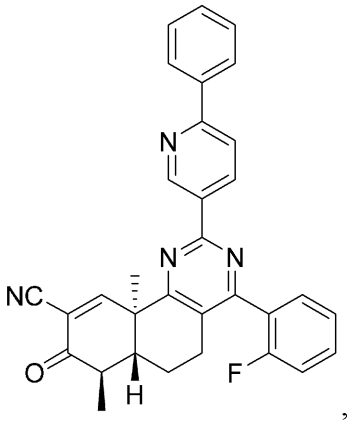
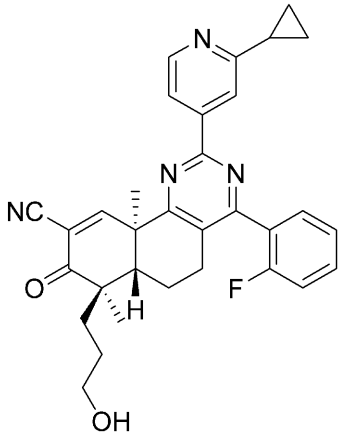
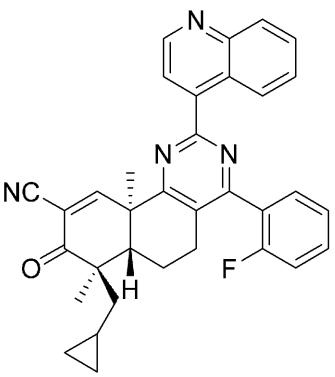
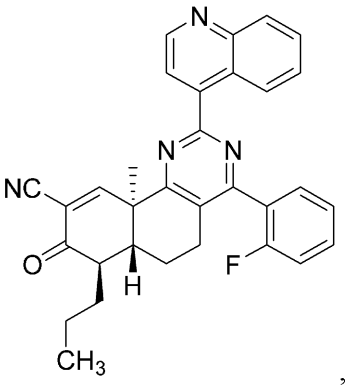
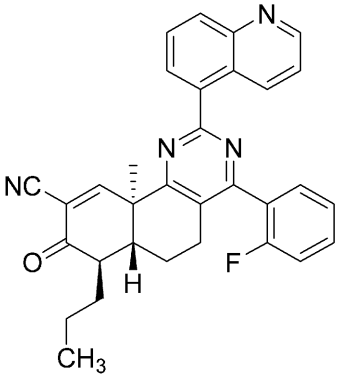
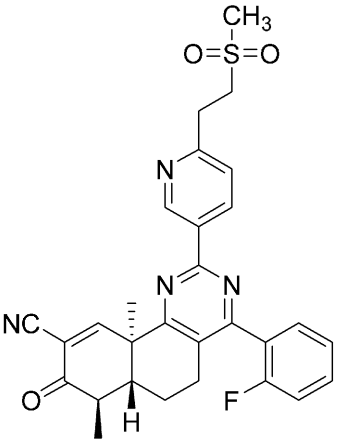
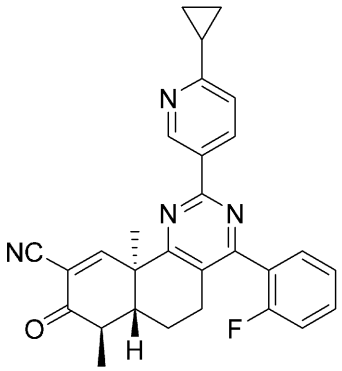
,

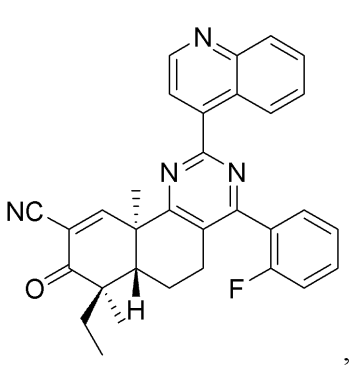
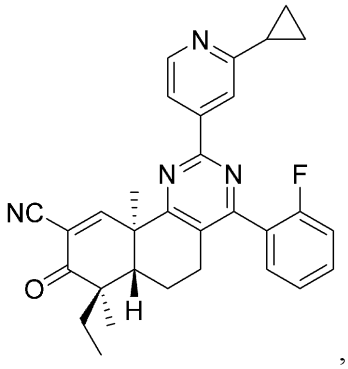
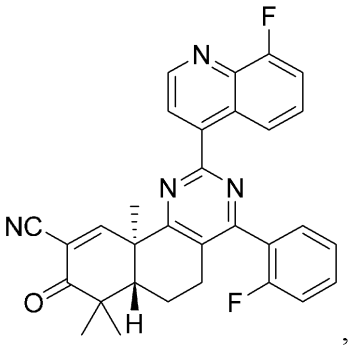
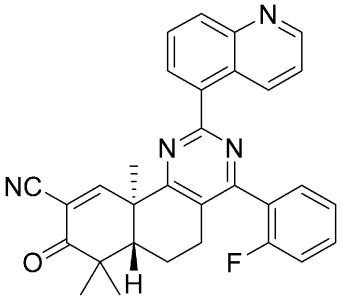
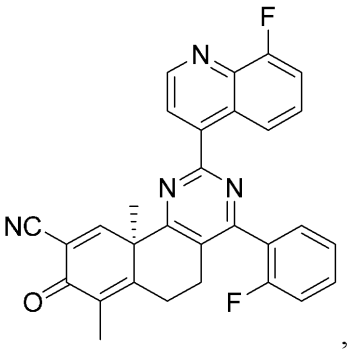
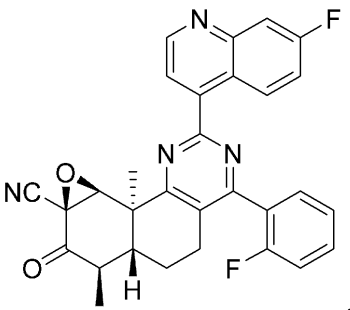
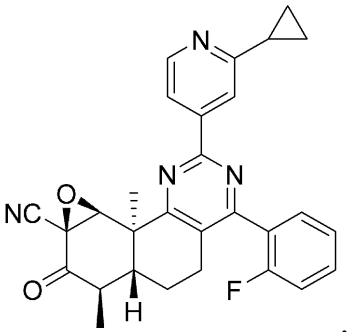
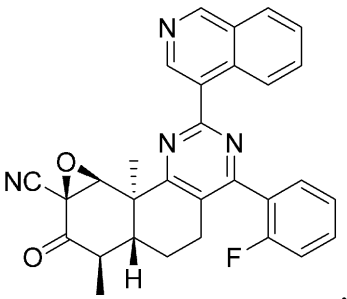
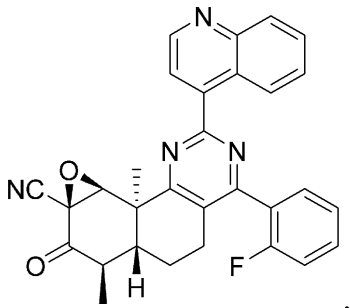
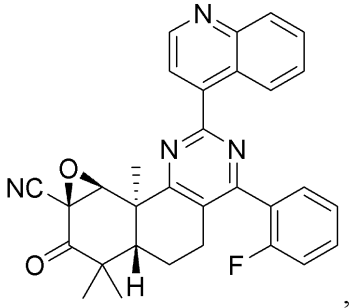
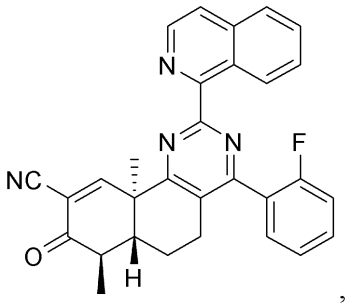
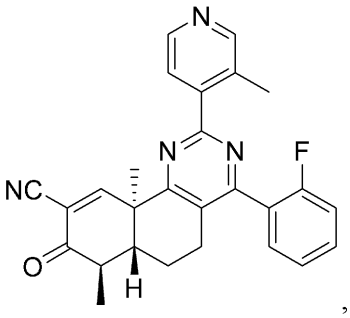
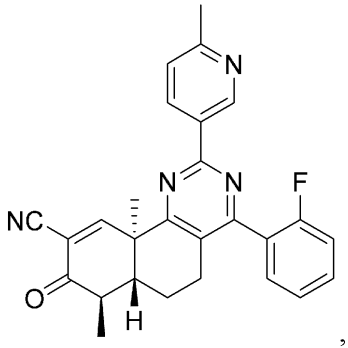
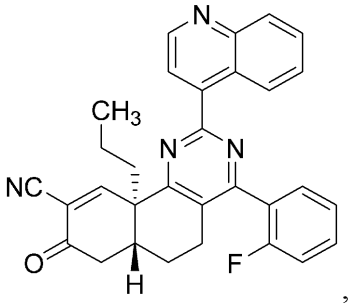
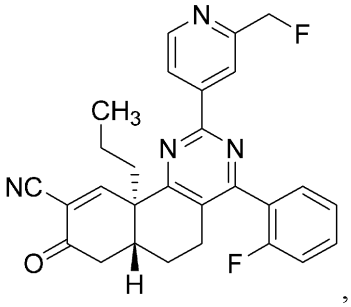
,

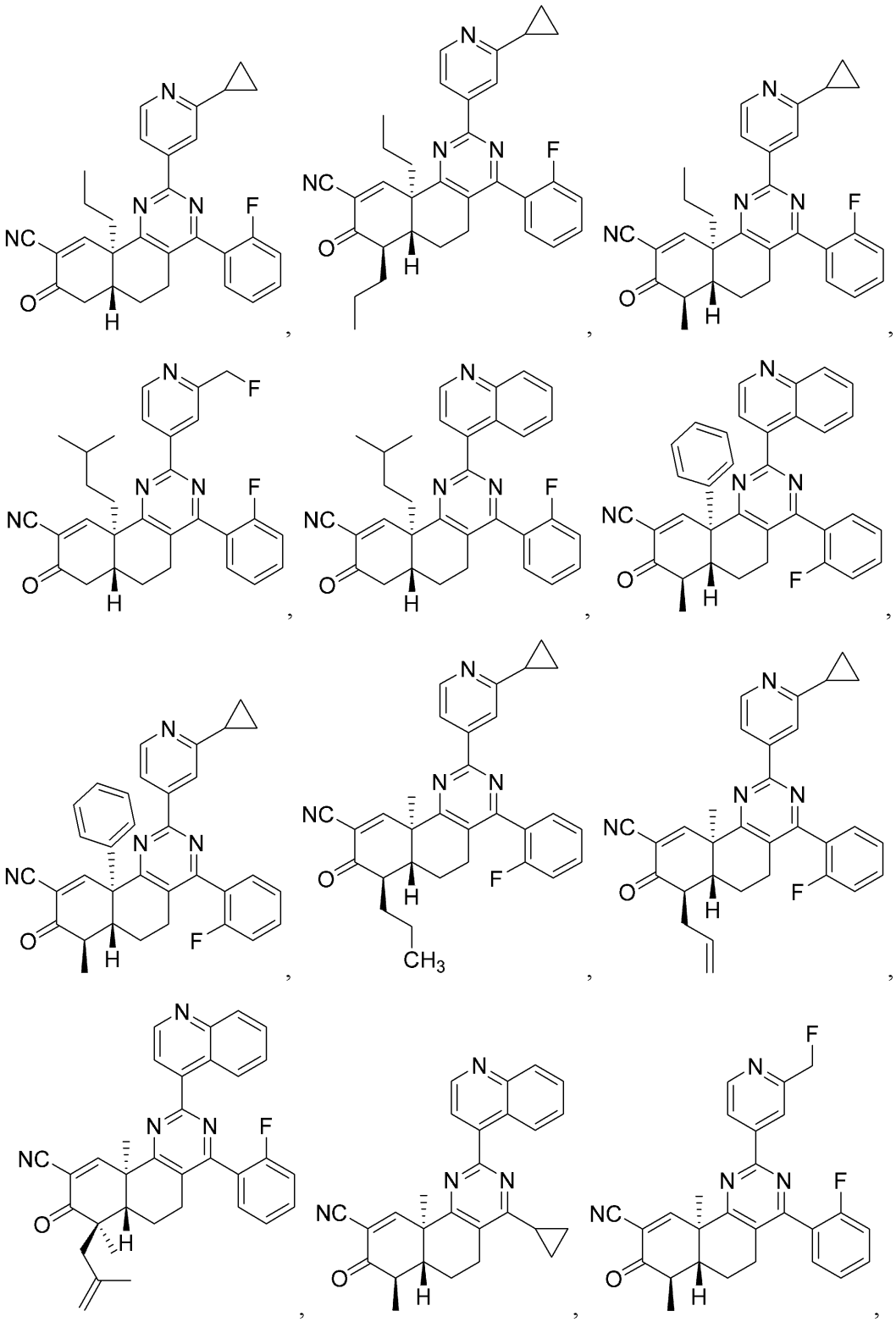

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

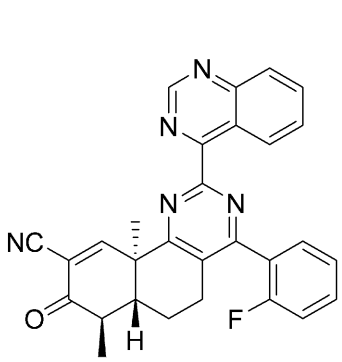
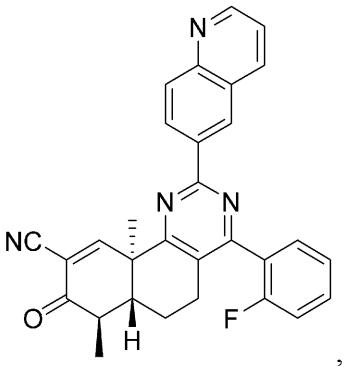
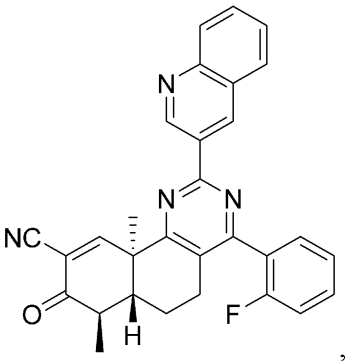
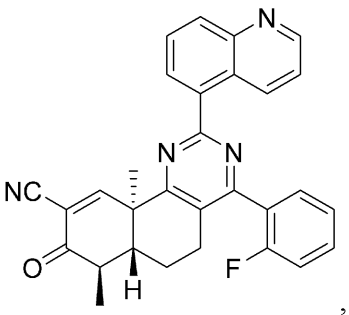
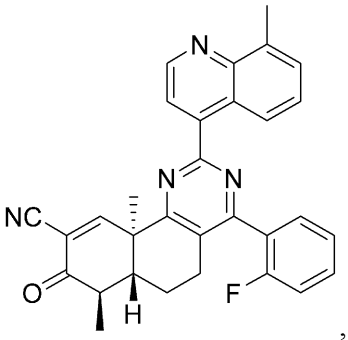
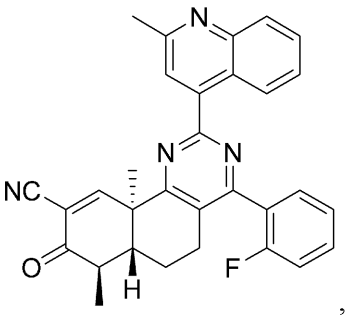
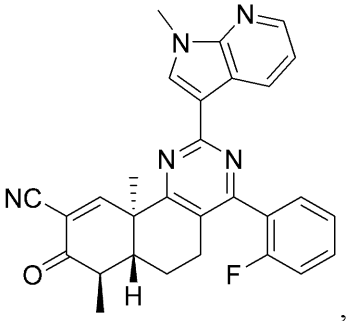
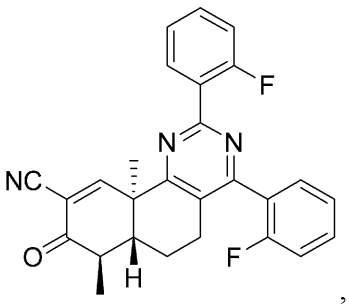
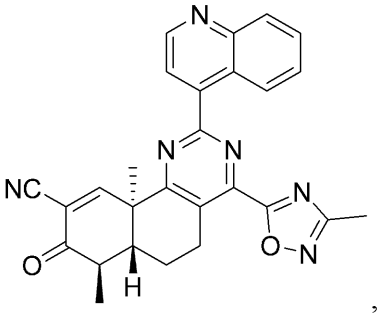
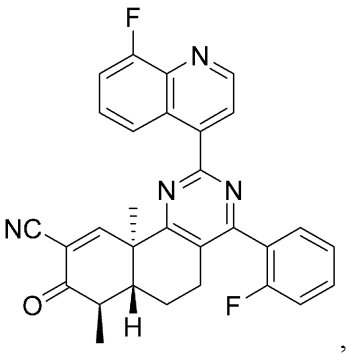
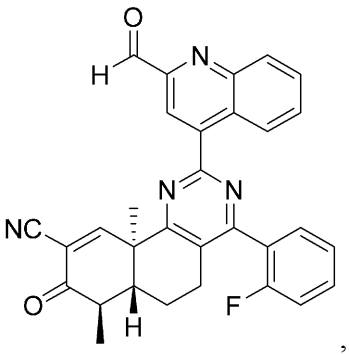
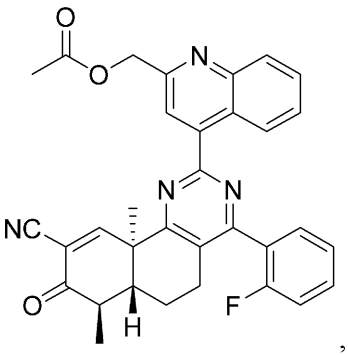
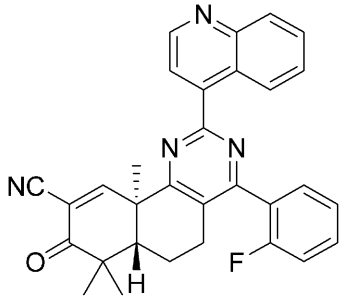
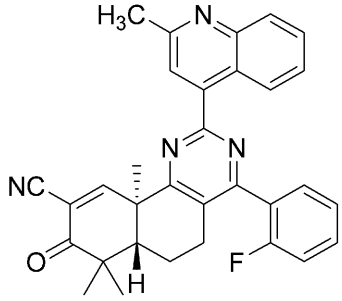
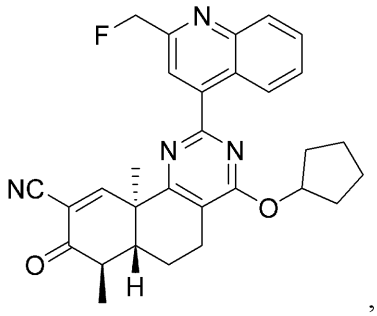
,

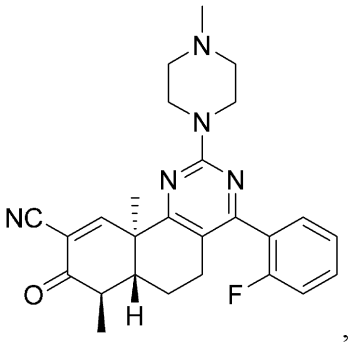
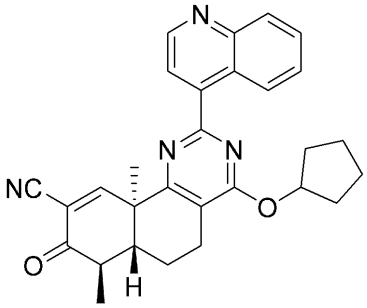
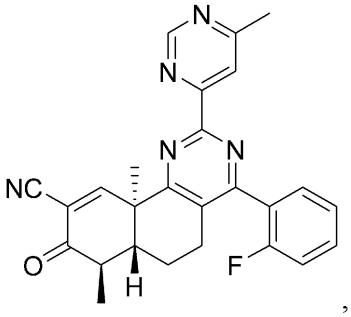
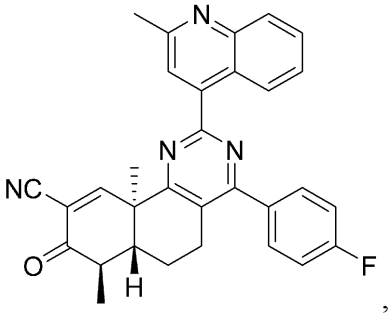
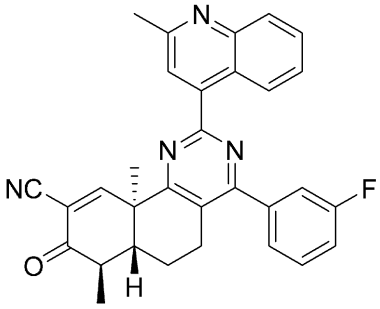
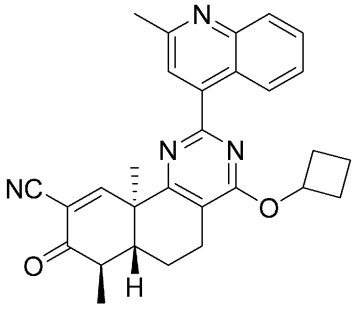
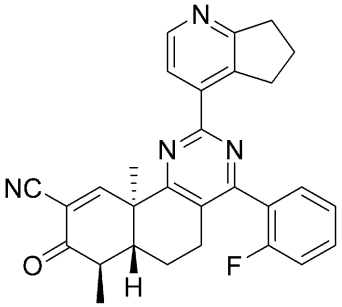
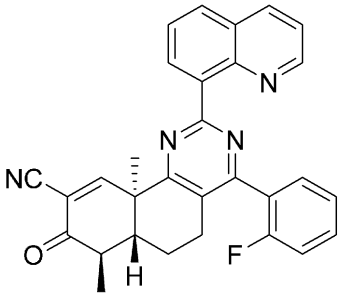
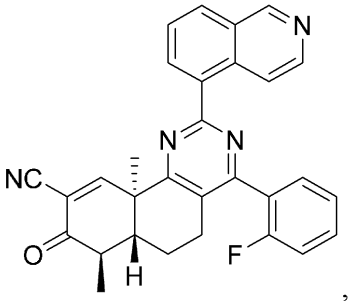
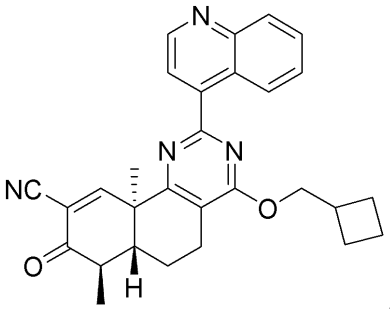
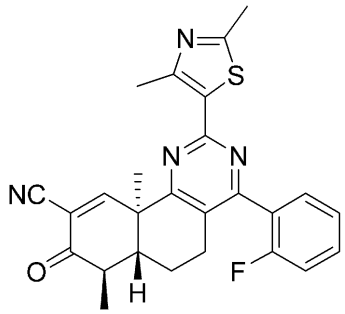
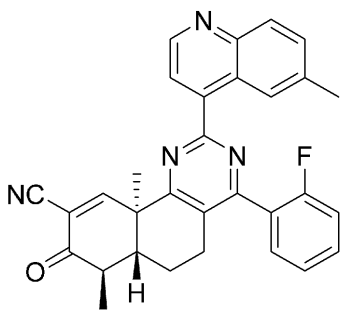
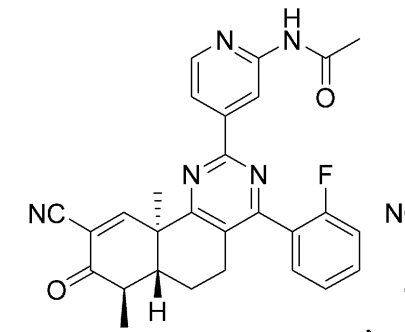
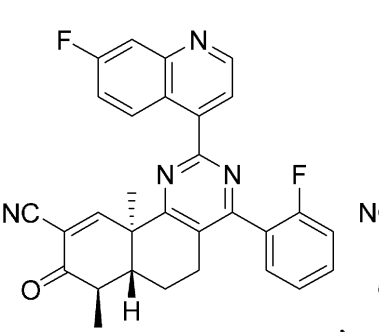
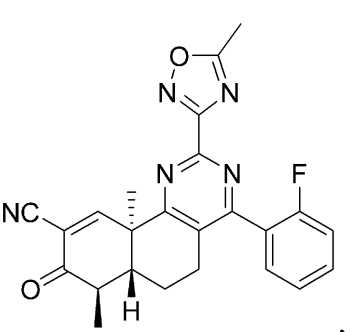
,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,



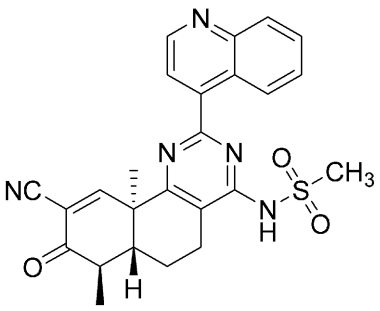
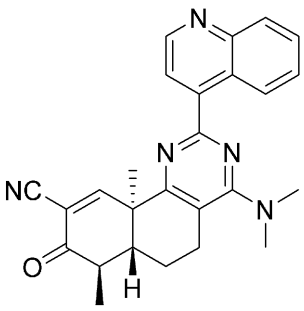
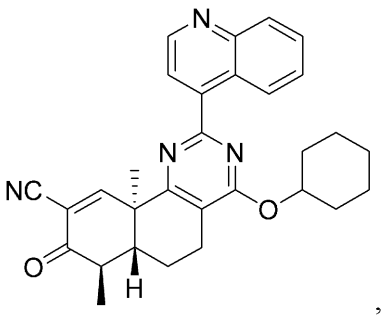
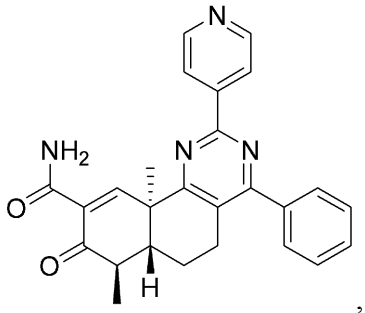
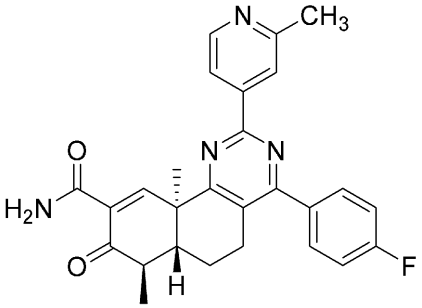
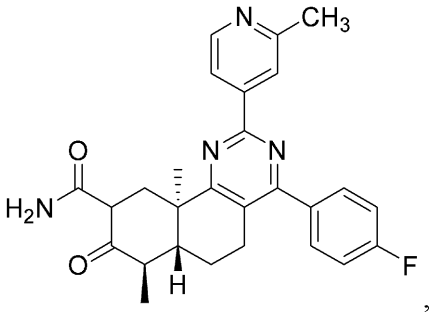
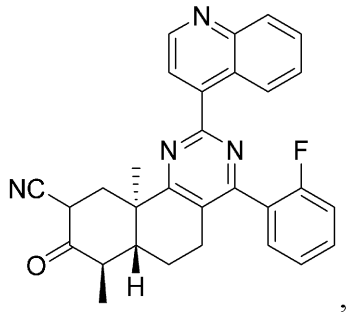
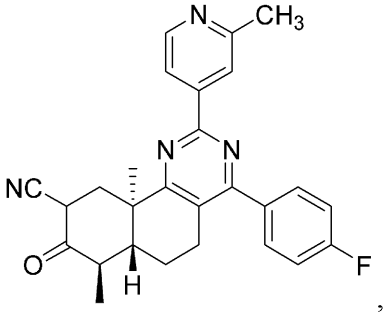
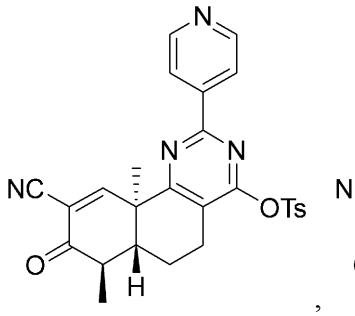
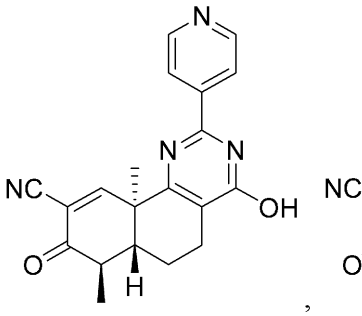
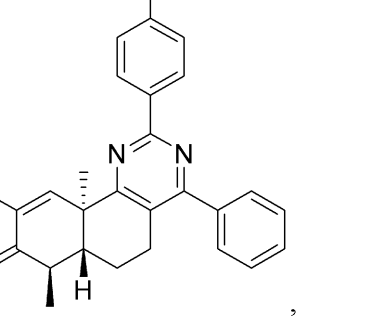
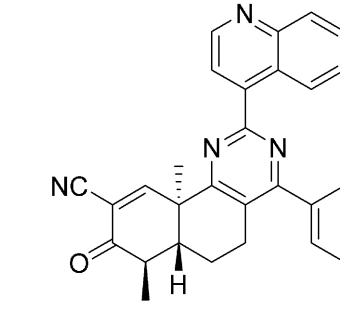
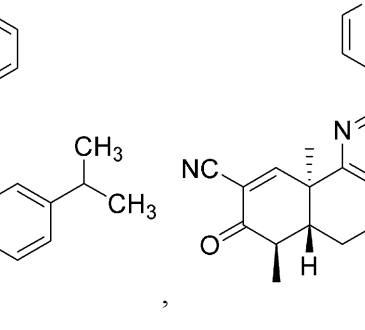
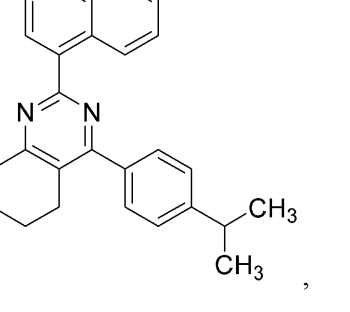

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

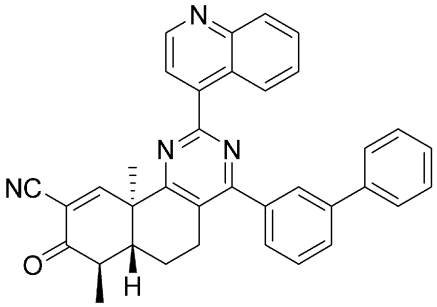
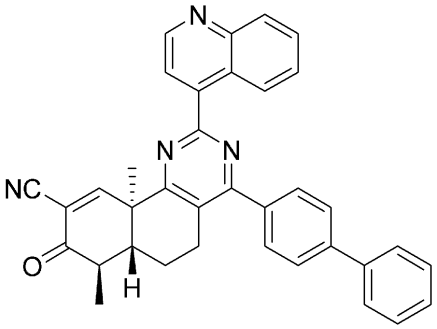
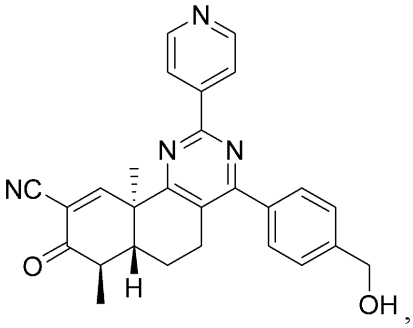
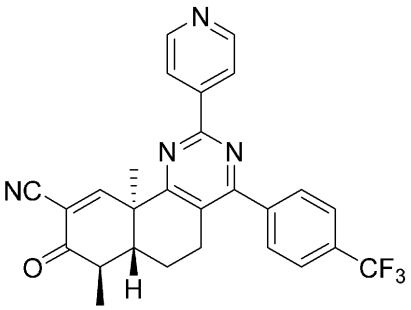
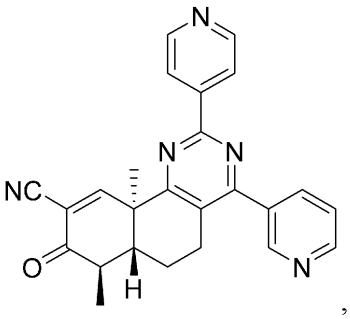
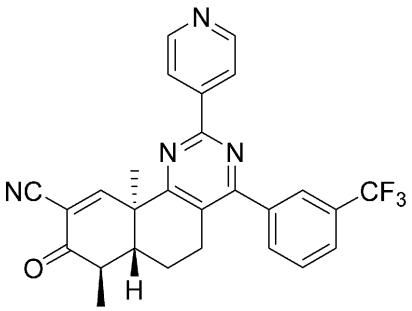
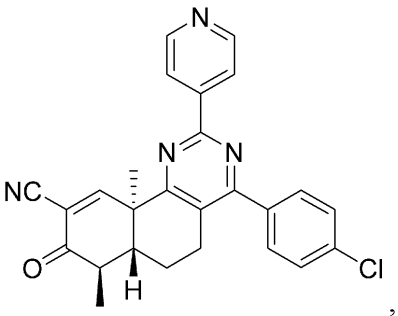
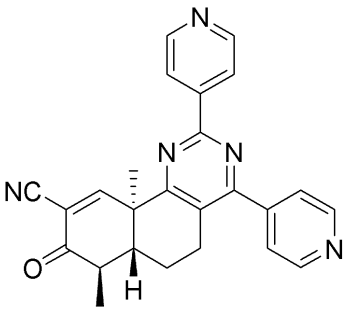
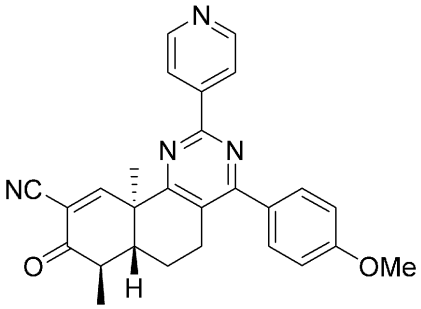
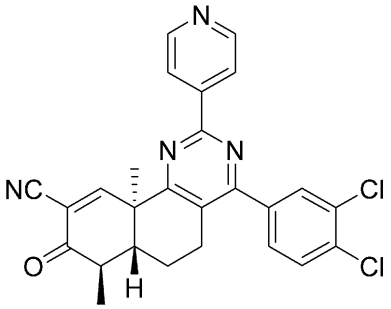
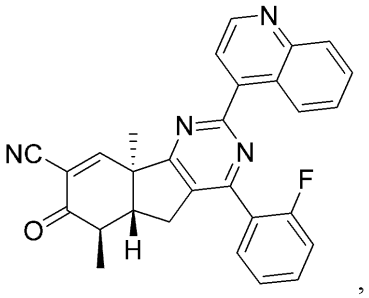
,

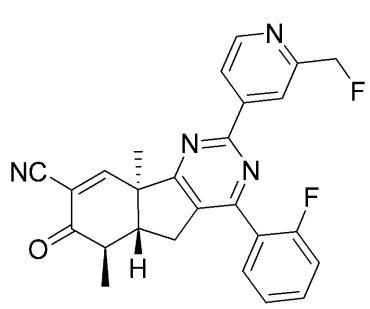
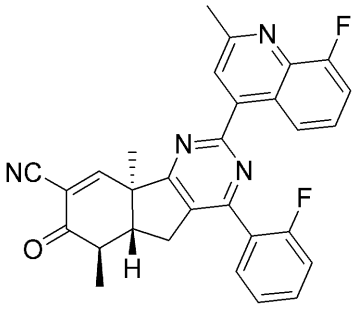
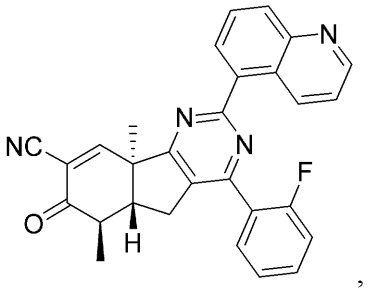
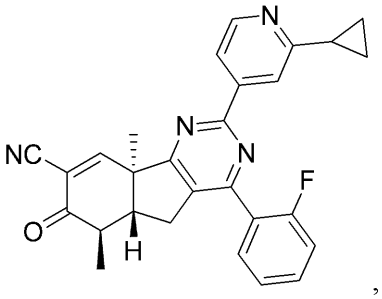
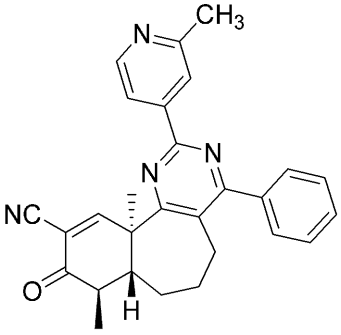
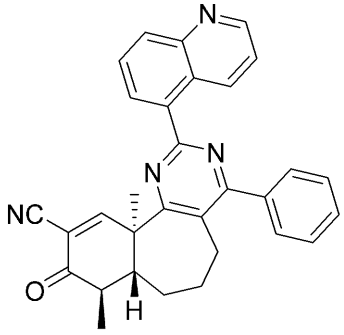
,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

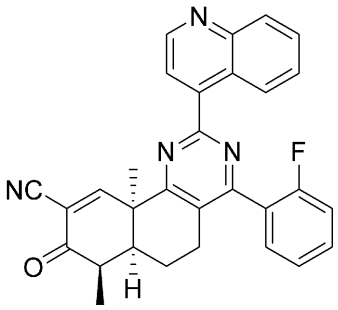
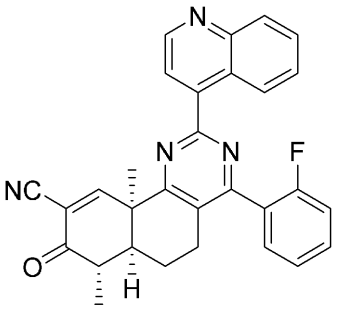
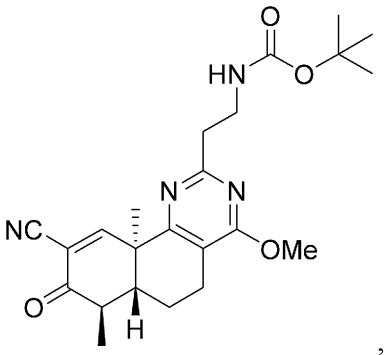
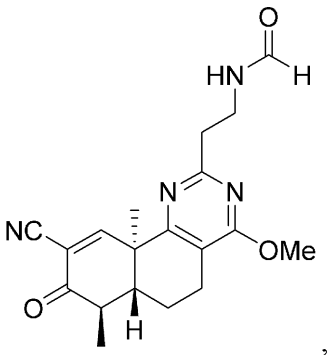
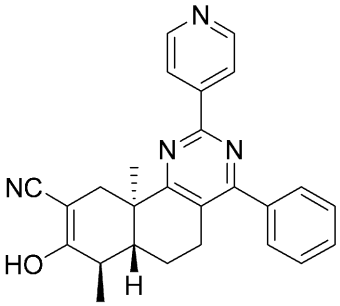
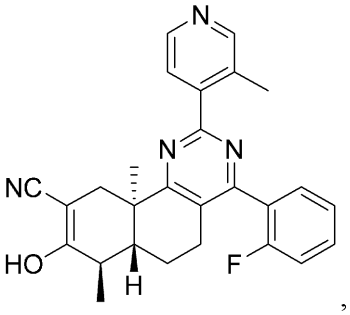
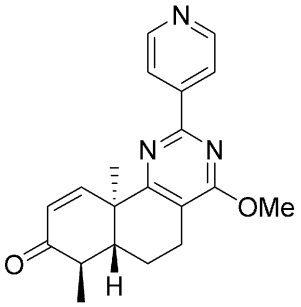
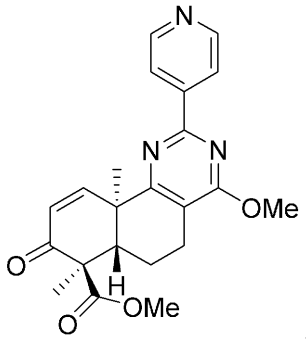
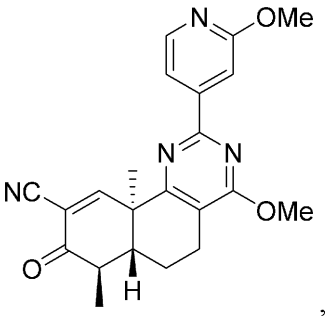
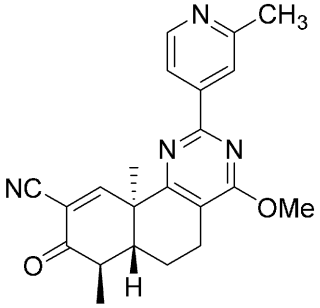
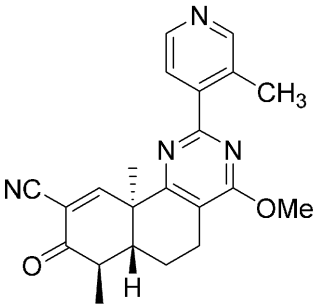
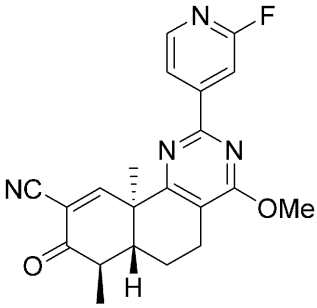

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

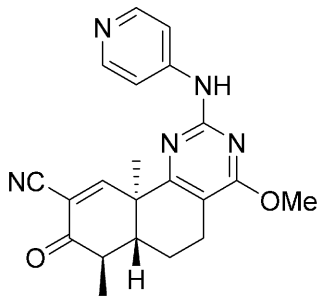







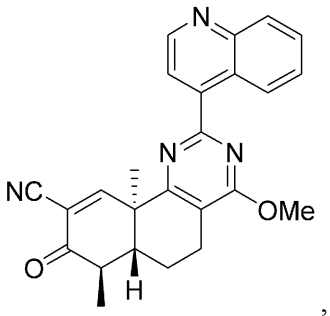
。

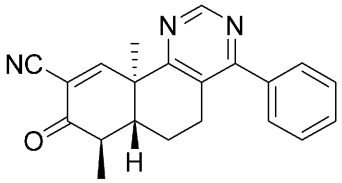
【請求項３３】

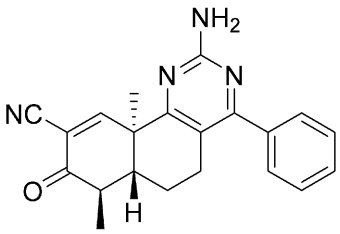
下記式

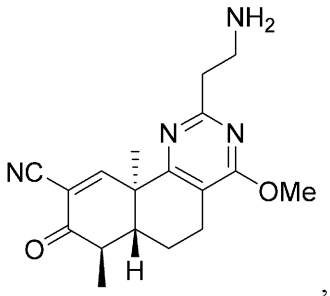

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

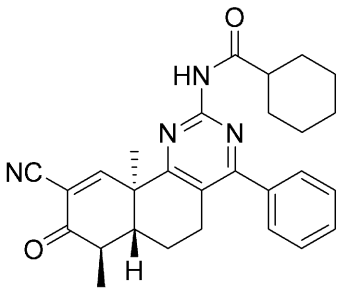


,


,


,


,


,もしくは


の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項３４】

(A)請求項1～33のいずれか一項記載の化合物；および

(B)賦形剤

を含み、任意で、経口投与用に、動脈内投与、筋肉内投与、腹腔内投与、または静脈内投与用などの注射による投与用に、皮膚または眼への局部投与用などの局部投与用に製剤化されている、薬学的組成物。

【請求項３５】

薬学的有効量の請求項1～33のいずれか一項記載の化合物を含む、患者における疾患または障害を治療または予防するための薬学的組成物であって、該疾患または障害が、自己免疫疾患、臓器拒絶反応、喘息、癌、神経障害、精神障害、神経精神障害、慢性疼痛症候群、炎症状態、網膜障害、または心血管疾患である、薬学的組成物。

【請求項３６】

自己免疫疾患が、乾癬、多発性硬化症、強皮症、関節リウマチ、ループス、乾癬性関節炎、強直性脊椎炎、シェーグレン症候群、白斑、ぶどう膜炎、ドライアイ症候群、全身性硬化症、1型糖尿病、重症筋無力症、および炎症性腸疾患である、請求項35記載の薬学的組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００６１

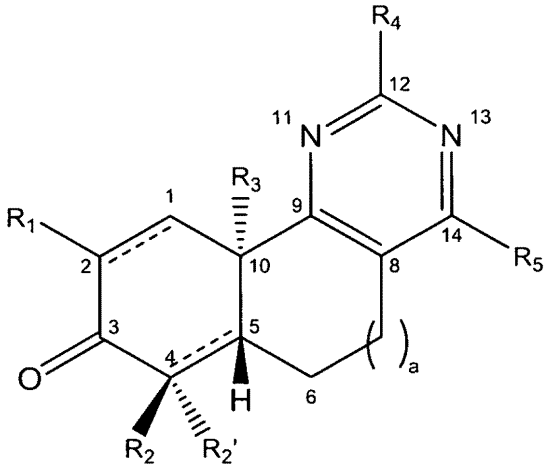
【補正方法】変更

【補正の内容】

【００６１】

[本発明1001]

下記式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



(I)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

aは、0、1、または2であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基の置換型であり；但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

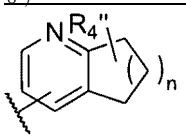
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

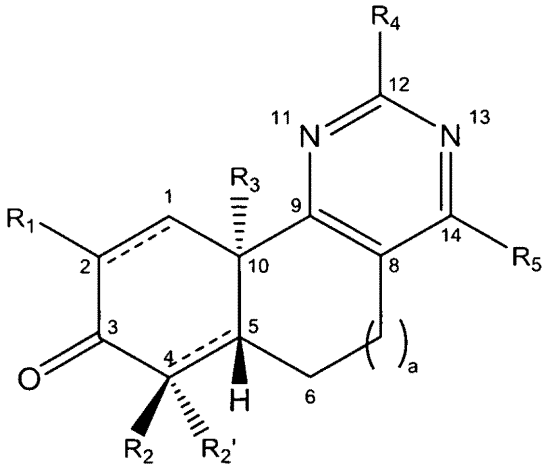
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは



（ここで、
nは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは
$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$
（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルコキシ$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_c-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；
R_cは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）
であり；
但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。
[本発明1002]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1001の化合物：



(I)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

aは、0、1、または2であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基の置換型であり；但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2\sim 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは$-X_1-(CH_2)_m-R_4$'

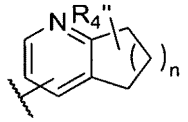
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

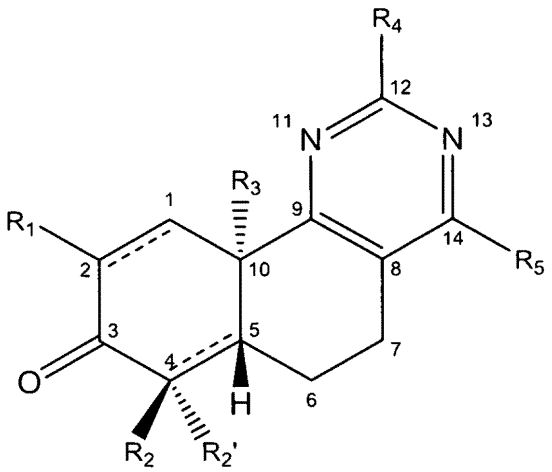
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1がOである場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、
nは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは
$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$
（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルコキシ$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_c-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；
R_cは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）
であり；
但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。
[本発明1003]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1001または本発明1002のいずれかの化合物：



(II)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、または最後の4つの基の置換型であり；但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2\sim 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

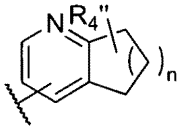
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

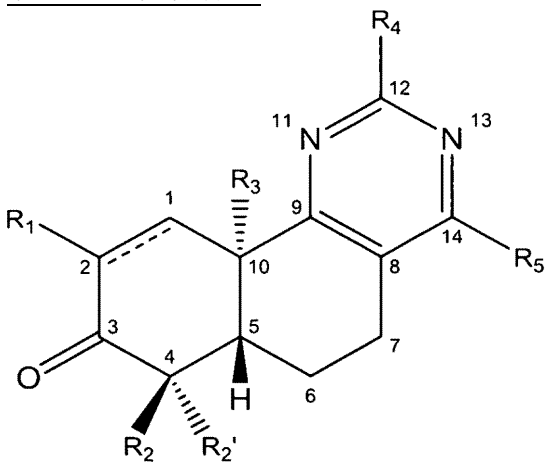
mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、
nは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは
$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$
（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルコキシ$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_c-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；
R_cは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）
であり；
但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。
[本発明1004]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1001～1003のい

ずれかの化合物：



(III)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、水素、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、または最後の4つの基の置換型であり；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2\sim 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4$'

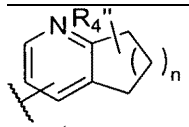
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

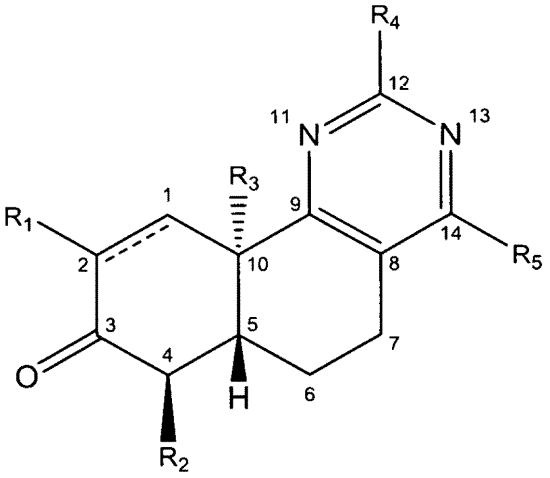
mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは
$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$
（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルコキシ$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）
である。
[本発明1005]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1001～1004のいずれかの化合物：



(IV)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2\sim 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

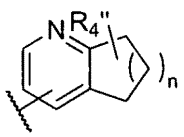
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは-

$S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C\leq 12)}$であり；

pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'''は、アルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ

R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アルコキシ$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは

$-OY_1-A_1$

（ここで、

Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ

A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは

$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$

（ここで、

Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ

A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは

$-A_3R_d$

（ここで、

A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで

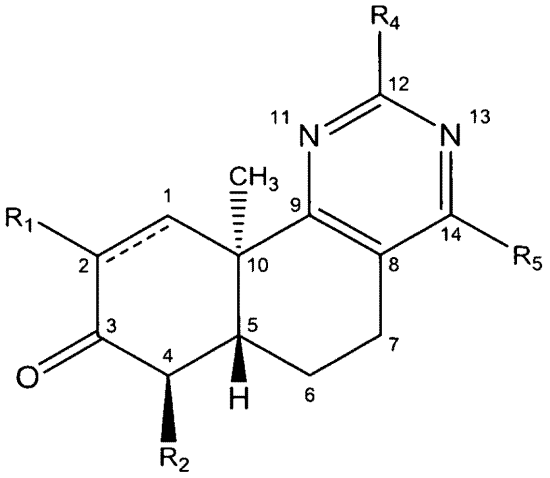
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ

R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）

である。

[本発明1006]

下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1005の化合物：



(V)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 12)}$、アシル$_{(C\leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2\sim 18)}$、置換アルキル$_{(C\leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、置換アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C\leq 18)}$、アミド$_{(C\leq 18)}$、置換アミド$_{(C\leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

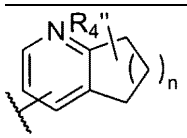
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C}$

$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$であり；

pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'''は、アルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ

R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C \leq 12)}$、アルコキシ$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、アラルキル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、アシル$_{(C \leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは

$-OY_1-A_1$

（ここで、

Y_1は、アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；かつ

A_1は、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である）、あるいは

$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$

（ここで、

Y_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；

R_bは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；かつ

A_2は、アラルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C \leq 12)}$である）、あるいは

$-A_3R_d$

（ここで、

A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで

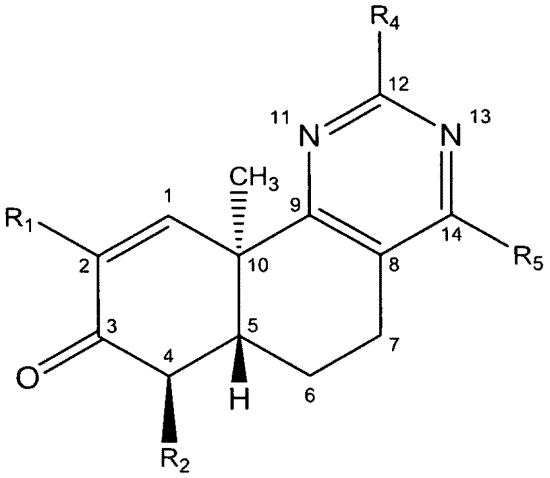
R_eは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；かつ

R_dは、アシル$_{(C \leq 12)}$または置換アシル$_{(C \leq 12)}$である）

である。

[本発明1007]

下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1006の化合物：



(VI)

式中、

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、アルケニル$_{(C \leq 12)}$、アルキニル$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、アラルキル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 12)}$、アシル$_{(C \leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2 \sim 18)}$、置換アルキル$_{(C \leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アリール$_{(C \leq 18)}$、置換アリール$_{(C \leq 18)}$、アラルキル$_{(C \leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C \leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C \leq 18)}$、アミド$_{(C \leq 18)}$、置換アミド$_{(C \leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

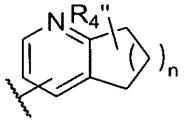
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アリール$_{(C \leq 18)}$、アラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アル

キルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$であり；

pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'''は、アルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ

R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C \leq 12)}$、アルコキシ$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、アラルキル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、アシル$_{(C \leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは

$-OY_1-A_1$

（ここで、

Y_1は、アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；かつ

A_1は、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である）、あるいは

$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$

（ここで、

Y_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；

R_bは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；かつ

A_2は、アラルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C \leq 12)}$である）、あるいは

$-A_3R_d$

（ここで、

A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで

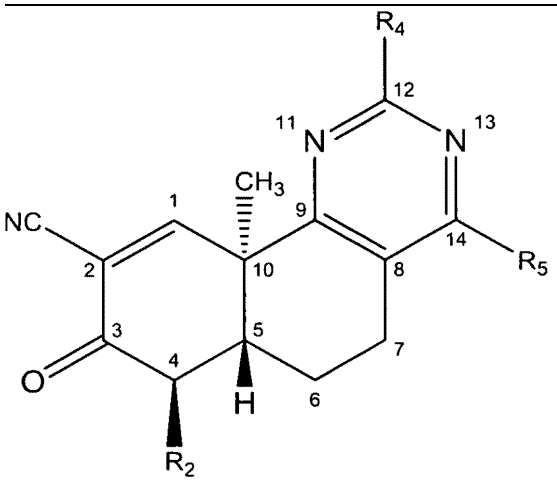
R_eは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；かつ

R_dは、アシル$_{(C \leq 12)}$または置換アシル$_{(C \leq 12)}$である）

である。

[本発明1008]

下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1007の化合物：



(VII)

式中、

R_2は、水素、またはアルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、アルケニル$_{(C \leq 12)}$、アルキニル$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、アラルキル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 12)}$、アシル$_{(C \leq 12)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型、または-アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_4は、水素、アミノ、アルキル$_{(C2 \sim 18)}$、置換アルキル$_{(C \leq 18)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アリール$_{(C \leq 18)}$、置換アリール$_{(C \leq 18)}$、アラルキル$_{(C \leq 18)}$、置換アラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、置換アルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、置換ジアルキルアミノ$_{(C \leq 18)}$、アルキルチオ$_{(C \leq 18)}$、置換アルキルチオ$_{(C \leq 18)}$、アミド$_{(C \leq 18)}$、置換アミド$_{(C \leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

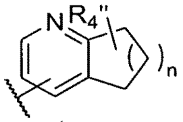
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、アルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アリール$_{(C \leq 18)}$、アラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない）、あるいは



（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは

$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$

（ここで、

X_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$であり；

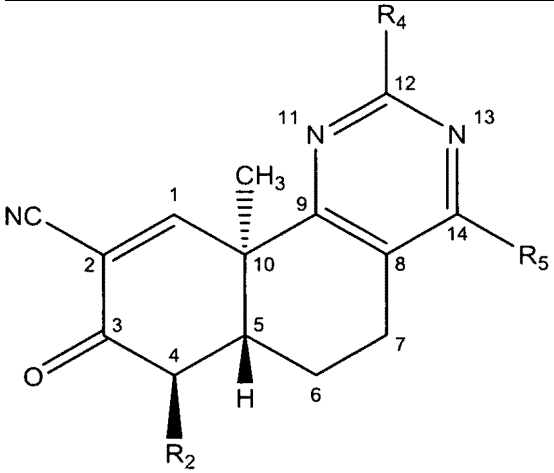
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'''は、アルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）

であり；かつ

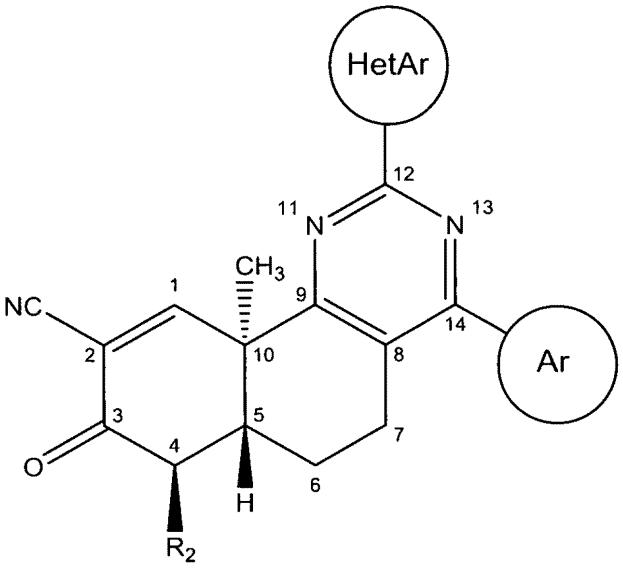
R_5は、アミノ、ヒドロキシ、$-OS(O)_2C_6H_4CH_3$、アルキル$_{(C \leq 12)}$、アルコキシ$_{(C \leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、シクロアルコキシ$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、アラルキル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$、アシル$_{(C \leq 12)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 12)}$、アルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C \leq 12)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 12)}$、または最後の14個の基のうちのいずれかの置換型、あるいは

$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$である）、あるいは
$-Y_2-C(O)NR_b-A_2$
（ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C\leq 8)}$であり；
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C\leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C\leq 12)}$である）、あるいは
$-A_3R_d$
（ここで、
A_3は、-O-または$-NR_e-$であり、ここで
R_eは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；かつ
R_dは、アシル$_{(C\leq 12)}$または置換アシル$_{(C\leq 12)}$である）
である。
[本発明1009]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1008の化合物：



(VII)

式中、
R_2は、水素、アルキル$_{(C\leq 12)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 12)}$であり；
R_4は、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$であり；かつ
R_5は、アリール$_{(C\leq 12)}$または置換アリール$_{(C\leq 12)}$である。
[本発明1010]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1008の化合物：



(VIII)

式中、

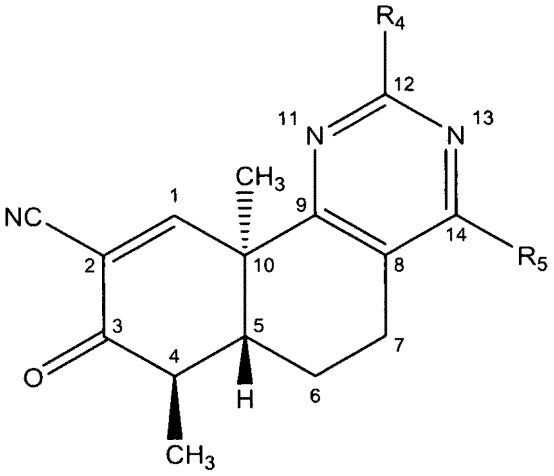
R_2は、アルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アルキル$_{(C \leq 12)}$であり；

HetArは、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$であり；かつ

Arは、アリール$_{(C \leq 12)}$または置換アリール$_{(C \leq 12)}$である。

[本発明1011]

下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1009の化合物：



(IX)

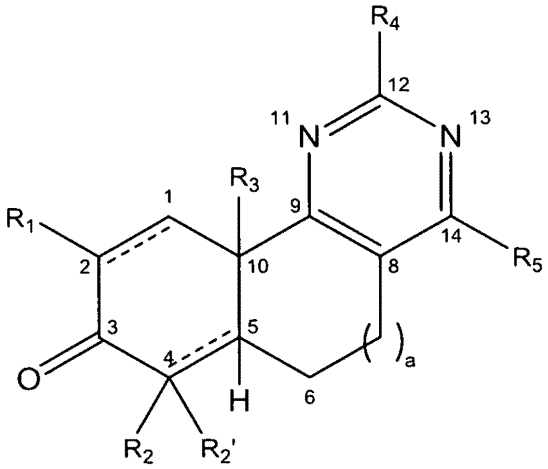
式中、

R_4は、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$であり；かつ

R_5は、アリール$_{(C \leq 12)}$または置換アリール$_{(C \leq 12)}$である。

[本発明1012]

下記式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



(X)

式中、

炭素原子1と2の間の結合は、単結合、エポキシ化二重結合、または二重結合であり；

炭素原子4と5の間の結合は、単結合または二重結合であり；

aは、0、1、または2であり；

R_1は、シアノ、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、$-CF_3$、または$-C(O)R_a$であり；ここで、

R_aは、ヒドロキシ、アミノ、またはアルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニルアミノ$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_2は、水素、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、もしくは最後の4つの基の置換型、または-アルカンジイル$_{(C\leq 8)}$-シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$もしくはこの基の置換型であり；

R_2'は、非存在、水素、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$、アルケニル$_{(C\leq 12)}$、アルキニル$_{(C\leq 12)}$、または最後の4つの基の置換型であり、但し、炭素原子4と5の間の結合が二重結合である場合、R_2'は存在せず；

R_3は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、アリール$_{(C\leq 12)}$、アラルキル$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり；

R_4は、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、あるいは

$-X_1-(CH_2)_m-R_4'$

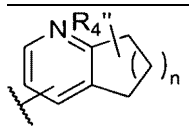
（ここで、

X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、

R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；

mは、0、1、2、3、または4であり；かつ

R_4'は、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは



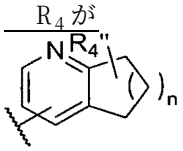
（ここで、

nは、0、1、2、3、または4であり；かつ

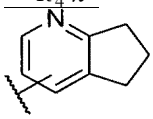
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、$-NH_2$、$-NO_2$、-CN、-SH、$-S(O)_2OH$、もしくは$-S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ア

ルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）、あるいは
$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$
（ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルキルジイル$_{(C \leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルキルジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である）
であり；かつ
R_5は、シクロアルコキシ$_{(C \leq 12)}$、アリール$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$、または最後の3つの基のうちのいずれかの置換型、あるいは
$-OY_1-A_1$
（ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である）
であり；
但し、炭素原子4および5が二重結合によって連結される場合、R_2'および炭素原子5における水素原子は存在しない。
[本発明1013]
炭素原子1と炭素原子2の間の結合が、エポキシ化二重結合である、本発明1001～1006および1012のいずれかの化合物。
[本発明1014]
炭素原子1と炭素原子2の間の結合が、二重結合である、本発明1001～1006および1012のいずれかの化合物。
[本発明1015]
炭素原子4と炭素原子5の間の結合が、単結合である、本発明1001～1003および1012～1014のいずれかの化合物。
[本発明1016]
炭素原子4と炭素原子5の間の結合が、二重結合である、本発明1001～1003および1012～1014のいずれかの化合物。
[本発明1017]
aが1である、本発明1001、1002、および1012～1016のいずれかの化合物。
[本発明1018]
aが0である、本発明1001、1002、および1012～1016のいずれかの化合物。
[本発明1019]
aが2である、本発明1001、1002、および1012～1016のいずれかの化合物。
[本発明1020]
R_1がシアノである、本発明1001～1007および1012～1019のいずれかの化合物。
[本発明1021]
R_2が、アルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1010および1012～1020のいずれかの化合物。
[本発明1022]
R_2がアルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1021の化合物。
[本発明1023]

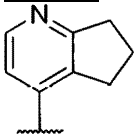
R_2が、メチル、エチル、またはプロピルである、本発明1022の化合物。
[本発明1024]
R_2がメチルである、本発明1023の化合物。
[本発明1025]
R_2が置換アルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1021の化合物。
[本発明1026]
R_2が3-ヒドロキシプロピルである、本発明1025の化合物。
[本発明1027]
R_2が、アルケニル$_{(C \leq 12)}$または置換アルケニル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1010および1012～1020のいずれかの化合物。
[本発明1028]
R_2がアルケニル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1027の化合物。
[本発明1029]
R_2が、2-プロペニルまたは2-メチル-プロパ-2-エニルである、本発明1028の化合物。
[本発明1030]
R_2'が水素である、本発明1001～1004および1012～1029のいずれかの化合物。
[本発明1031]
R_2'が、アルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1004および1012～1029のいずれかの化合物。
[本発明1032]
R_2'がアルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1031の化合物。
[本発明1033]
R_2'がメチルである、本発明1032の化合物。
[本発明1034]
R_3が、アルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1005および1012～1033のいずれかの化合物。
[本発明1035]
R_3がアルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1034の化合物。
[本発明1036]
R_3が、メチル、プロピル、またはイソペンチルである、本発明1035の化合物。
[本発明1037]
R_3がメチルである、本発明1036の化合物。
[本発明1038]
R_3が、アリール$_{(C \leq 12)}$または置換アリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1005および1012～1033のいずれかの化合物。
[本発明1039]
R_3がアリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1038の化合物。
[本発明1040]
R_3がフェニルである、本発明1039の化合物。
[本発明1041]
R_4が、アルキル$_{(C2 \sim 18)}$または置換アルキル$_{(C2 \sim 18)}$である、本発明1001～1008および1013～1040のいずれかの化合物。
[本発明1042]
R_4が、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$である、本発明1001～1040のいずれかの化合物。
[本発明1043]
R_4が、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$基であり、ここで、芳香環中のヘテロ原子のうちの少なくとも1つは窒素原子である、本発明1042の化合物。
[本発明1044]
R_4がヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$である、本発明1042の化合物。

[本発明1045]
R_4が、3-ピリジニル、4-ピリジニル、4-(2-シシロプロピル（cyclopropyl）)-ピリジニル、5-(2-シシロプロピル)-ピリジニル、4-(2-モルホリノ)-ピリジニル、4-(2-フェニル)-ピリジニル、3-(5-メチル)-ピリジニル、3-(6-メチル)-ピリジニル、4-(2-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、3-ピラゾロ[1,5-a]ピリジニル、3-(N-メチル)-ピロロ[2,3-b]ピリジニル、5-イソキンリニル（isoquinlinyl）、2-イソキンリニル、1-イソキノリニル、4-(2-フェニル)-ピリジニル、5-(2-フェニル)-ピリジニル、3-(5-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、4-(3,5-ジメチル)-イソオキサゾリル、4-(2-メチル)-ピリジニル、4-(3-メチル)-ピリジニル、3-(4-メチル)-ピリジニル、4-(6-メチル)-ピリミジニル、6-(4-メチル)-ピリミジニル、4-ピリダジニル、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、2-キノリニル、3-キノリニル、4-キノリニル、5-キノリニル、6-キノリニル、8-キノリニル、4-イソキノリニル、3-(8-メチル)-キノリニル、3-(1-メチル)-キノリニル、4-(2-メチル)-キノリニル、4-(2-イソプロピル)-キノリニル、4-(6-メチル)-キノリニル、4-(7-メチル)-キノリニル、4-(8-メチル)-キノリニル、2-(N-メチル)-インドリル、5-(2,4-ジメチル)-チアゾリル、または5-(3-メチル)-オキサジゾリル（oxadizolyl）である、本発明1044の化合物。
[本発明1046]
R_4が置換ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$である、本発明1042の化合物。
[本発明1047]
R_4が、4-(2-トリフルオロメチル)-ピリジニル、4-(3-フルオロ)-ピリジニル、4-(2-メトキシ)-ピリジニル、4-(2-ヒドロキシメチル)-ピリジニル、4-(2-アセチルアミノ)-ピリジニル、4-(2-フルオロメチル)-ピリジニル、4-(2-アセトアミジルエチル)-ピリジニル、4-(2-フルオロメチル)-キノリニル、4-(2-アセトキシメチル)-キノリニル、4-(2-ホルミル)-キノリニル、4-(6-フルオロ)-キノリニル、4-(7-フルオロ)-キノリニル、4-(8-フルオロ)-キノリニル、4-(6,8-ジフルオロ)-キノリニル、4-(6-フルオロ-2-メチル)-キノリニル、または4-(8-フルオロ-2-メチル)-キノリニルである、本発明1046の化合物。
[本発明1048]
R_4が、アリール$_{(C\leq 12)}$または置換アリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1040のいずれかの化合物。
[本発明1049]
R_4がアリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1048の化合物。
[本発明1050]
R_4がフェニルである、本発明1049の化合物。
[本発明1051]
R_4が置換アリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1048の化合物。
[本発明1052]
R_4が、2-フルオロフェニルまたは4-トリフルオロメチルフェニルである、本発明1051の化合物。
[本発明1053]
R_4が、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$である、本発明1001～1008および1012～1040のいずれかの化合物。
[本発明1054]
R_4がシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$である、本発明1053の化合物。
[本発明1055]
R_4がシクロヘキシルである、本発明1054の化合物。
[本発明1056]
R_4が


であり；
ここで、
nは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4''は、-H、-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-NH_2、-NO_2、-CN、-SH、-$S(O)_2OH$、もしくは-$S(O)_2NH_2$、またはアルキル$_{(C\leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 8)}$、アシル$_{(C\leq 8)}$、アミド$_{(C\leq 8)}$、アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C\leq 8)}$、アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$、-C(O)-ジアルキル-アミノ$_{(C\leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C\leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C\leq 8)}$、もしくはこれらの基のうちのいずれかの置換型である、
本発明1001～1008および1012～1040のいずれかの化合物。
[本発明1057]
R_4が

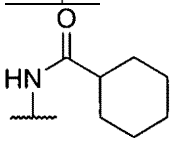


である、本発明1056の化合物。
[本発明1058]
R_4が



である、本発明1056の化合物。
[本発明1059]
R_4が、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$または置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$である、本発明1001～1008および1012～1040のいずれかの化合物。
[本発明1060]
R_4がヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$である、本発明1059の化合物。
[本発明1061]
R_4が、モルホリニル、4-ピペリジニル、3-(5-メチル-)1,2,3,6-テトラヒドロピリジニル、または4-N-メチルピペラジニルである、本発明1060の化合物。
[本発明1062]
R_4が置換ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 12)}$である、本発明1059の化合物。
[本発明1063]
R_4が、N-t-ブチルオキシカルボニル-4-ピペリジニル、N-アセチル-4-ピペリジニル、N-t-ブチルオキシカルボニル-5-メチル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジニル、N-アセチル-5-メチル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジニル、または4-N-アセチルピペラジニルである、本発明1062の化合物。
[本発明1064]
R_4が水素である、本発明1001～1008および1013～1040のいずれかの化合物。
[本発明1065]
R_4が、-X_1-$(CH_2)_m$-R_4'であり；ここで、
X_1は、NR_b、O、またはSであり；ここで、
R_bは、水素、アルキル$_{(C\leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C\leq 6)}$であり；
mは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'は、アルキル$_{(C\leq 12)}$、シクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、アリール$_{(C\leq 18)}$、アラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C\leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C\leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C\leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型であり、但し、X_1が0である場合、R_4'はメチルではない、

本発明1001～1008および1012～1040のいずれかの化合物。
[本発明1066]
X_1がNR_bであり、ここで、R_bは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$である、本発明1065の化合物。
[本発明1067]
R_bが水素である、本発明1065または本発明1066のいずれかの化合物。
[本発明1068]
mが0または1である、本発明1065～1067のいずれかの化合物。
[本発明1069]
mが0である、本発明1068の化合物。
[本発明1070]
R_4'が、シクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、アリール$_{(C \leq 18)}$、アラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 18)}$、ヘテロアラルキル$_{(C \leq 18)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 18)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である、本発明1065～1069のいずれかの化合物。
[本発明1071]
R_4'が、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1065～1070のいずれかの化合物。
[本発明1072]
R_4'がヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1071の化合物。
[本発明1073]
R_4'が4-ピリジニルである、本発明1072の化合物。
[本発明1074]
R_4がアミノである、本発明1001～1008および1013～1040のいずれかの化合物。
[本発明1075]
R_4がアミド$_{(C \leq 12)}$または置換アミド$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1040のいずれかの化合物。
[本発明1076]
R_4がアミド$_{(C \leq 12)}$である、本発明1075の化合物。
[本発明1077]
R_4が

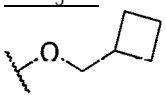


である、本発明1076の化合物。
[本発明1078]
R_4が、$-X_2-(CH_2)_p-R_4'''$であり；ここで、
X_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換アレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$、または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$であり；
pは、0、1、2、3、または4であり；かつ
R_4'''は、アルキル$_{(C \leq 8)}$、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロアリール$_{(C \leq 8)}$、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$、アシル$_{(C \leq 8)}$、アミド$_{(C \leq 8)}$、アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、アシルオキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルコキシ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-アルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、-C(O)-ジアルキルアミノ$_{(C \leq 8)}$、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アリールスルホニル$_{(C \leq 8)}$、アルコキシスルホニル$_{(C \leq 8)}$、またはこれらの基のうちのいずれかの置換型である、
本発明1001～1008および1012～1040のいずれかの化合物。
[本発明1079]
X_2が、ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1078の化合物。

[本発明1080]
X_2がヘテロアレーンジイル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1079の化合物。
[本発明1081]
X_2が、ピリジン-2,4-ジイルまたはピリジン-2,5-ジイルである、本発明1080の化合物。
[本発明1082]
X_2が、ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1078の化合物。
[本発明1083]
X_2がヘテロシクロアルカンジイル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1082の化合物。
[本発明1084]
X_2が、ピペリジン-1,4-ジイル、ピペラジン-1,4-ジイル、または1,2,3,6-テトラヒドロピペリジン-1,5-ジイルである、本発明1083の化合物。
[本発明1085]
pが、0、1、または2である、本発明1078～1084のいずれかの化合物。
[本発明1086]
pが0である、本発明1085の化合物。
[本発明1087]
pが1である、本発明1085の化合物。
[本発明1088]
pが2である、本発明1085の化合物。
[本発明1089]
R_4'''が、アシル$_{(C \leq 8)}$または置換アシル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1090]
R_4'''がアシル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1089の化合物。
[本発明1091]
R_4'''がアセチルである、本発明1090の化合物。
[本発明1092]
R_4'''が置換アシル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1089の化合物。
[本発明1093]
R_4'''がカルボキシである、本発明1092の化合物。
[本発明1094]
R_4'''が、アミド$_{(C \leq 8)}$または置換アミド$_{(C \leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1095]
R_4'''がアミド$_{(C \leq 8)}$である、本発明1094の化合物。
[本発明1096]
R_4'''がアセトアミジルである、本発明1095の化合物。
[本発明1097]
R_4'''が、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1098]
R_4'''がシクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1097の化合物。
[本発明1099]
R_4'''がシクロプロピルである、本発明1098の化合物。
[本発明1100]
R_4'''が、アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$または置換アルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1101]
R_4'''がアルキルスルホニル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1100の化合物。

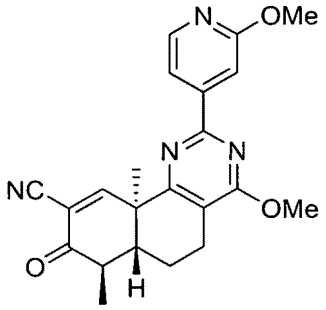
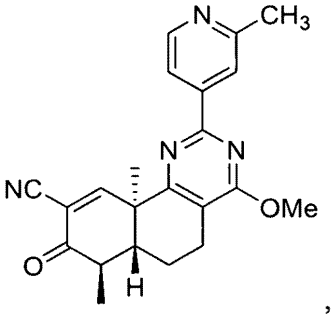
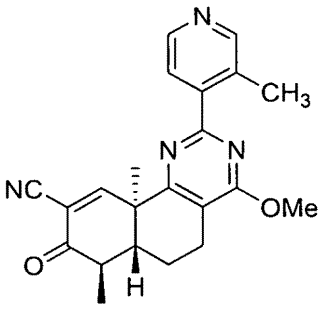
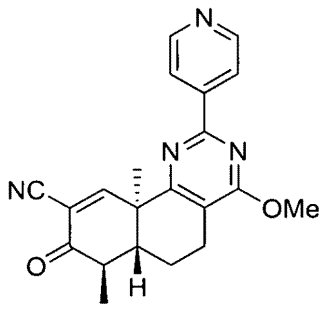
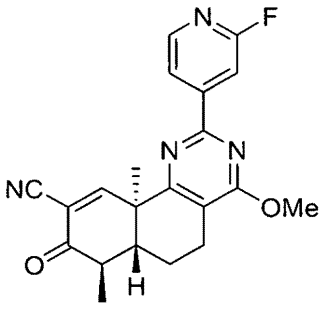
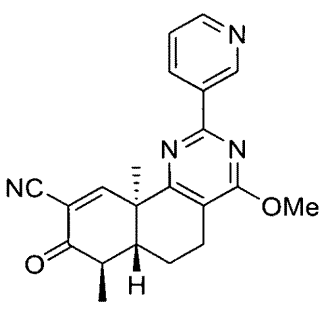
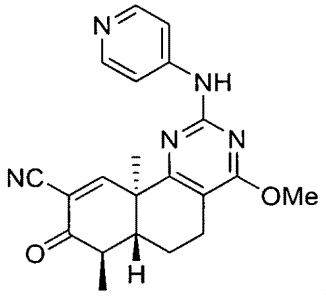
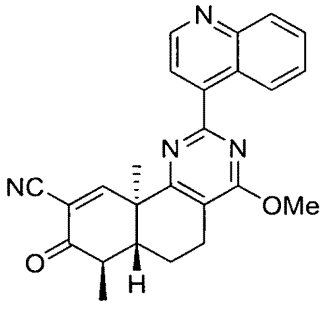
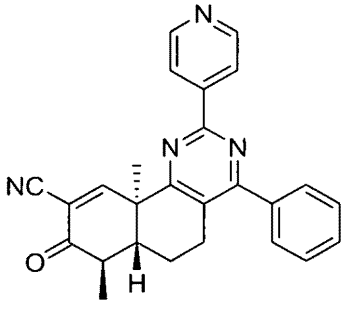
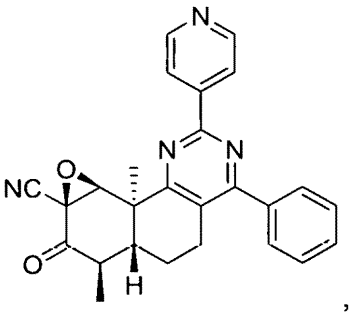
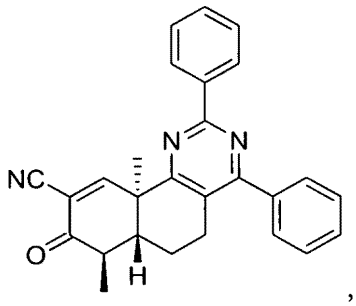
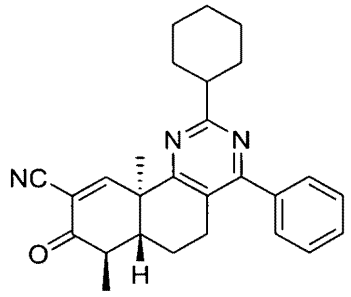
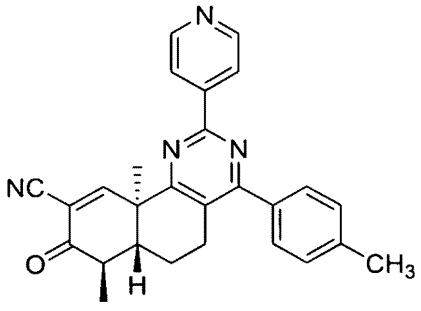
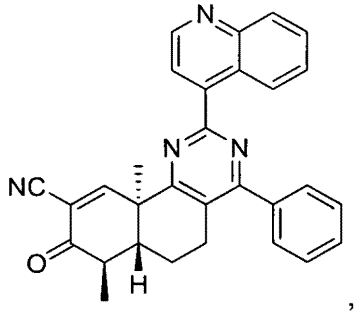
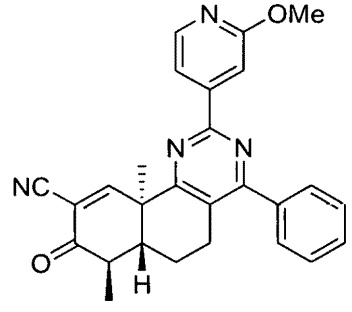
[本発明1102]
R_4'''が、$-S(O)_2CH_3$または$-S(O)_2CH_2CH_3$である、本発明1101の化合物。
[本発明1103]
R_4'''が-C(O)-アルコキシ$_{(C\leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1104]
R_4'''が-C(O)OEtである、本発明1103の化合物。
[本発明1105]
R_4'''が-C(O)-ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$である、本発明1078～1088のいずれかの化合物。
[本発明1106]
R_4'''が$-C(O)NMe_2$である、本発明1105の化合物。
[本発明1107]
R_5が、アリール$_{(C\leq 12)}$または置換アリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1001～1077のいずれかの化合物。
[本発明1108]
R_5がアリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1107の化合物。
[本発明1109]
R_5が、フェニル、4-メチルフェニル、3-イソプロピルフェニル、4-イソプロピルフェニル、1,3-ビフェニル、または1,4-ビフェニルである、本発明1108の化合物。
[本発明1110]
R_5が、1つまたは複数のフッ素原子をさらに含む、本発明1107の化合物。
[本発明1111]
R_5が置換アリール$_{(C\leq 12)}$である、本発明1107または本発明1110のいずれかの化合物。
[本発明1112]
R_5が、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、4-ヒドロキシメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-メトキシフェニル、4-クロロフェニル、または3,4-ジクロロフェニルである、本発明1111の化合物。
[本発明1113]
R_5が、シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$または置換シクロアルキル$_{(C\leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1114]
R_5がシクロプロピルである、本発明1113の化合物。
[本発明1115]
R_5が、シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$または置換シクロアルコキシ$_{(C\leq 12)}$である、本発明1001～1008および1012～1077のいずれかの化合物。
[本発明1116]
R_5が、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、またはシクロヘキシルオキシである、本発明1113の化合物。
[本発明1117]
R_5が、アルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$、またはこれらの基のどちらかの置換型である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1118]
R_5が、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$または置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 12)}$である、本発明1117の化合物。
[本発明1119]
R_5が、ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$または置換ジアルキルアミノ$_{(C\leq 8)}$である、本発明1118の化合物。
[本発明1120]
R_5がジメチルアミノである、本発明1119の化合物。

[本発明1121]
R_5が、アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 12)}$または置換アルキルスルホニルアミノ$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1122]
R_6がメチルスルホニルアミノである、本発明1121の化合物。
[本発明1123]
R_5が-OY_1-Aであり；ここで、
Y_1は、アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アルカンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；かつ
A_1は、シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$または置換シクロアルキル$_{(C \leq 8)}$である、
本発明1001～1008および1012～1077のいずれかの化合物。
[本発明1124]
Y_1がメチレンである、本発明1123の化合物。
[本発明1125]
A_1がシクロブチルである、本発明1123または本発明1124のいずれかの化合物。
[本発明1126]
R_5が



である、本発明1123の化合物。
[本発明1127]
R_5が、-Y_2-C(O)NR_c-A_2であり；ここで、
Y_2は、アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$または置換アレーンジイル$_{(C \leq 8)}$であり；
R_cは、水素、アルキル$_{(C \leq 6)}$、または置換アルキル$_{(C \leq 6)}$であり；かつ
A_2は、アラルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C \leq 12)}$である、
本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1128]
Y_2がアレーンジイル$_{(C \leq 8)}$である、本発明1127の化合物。
[本発明1129]
Y_2がベンゼンジイルである、本発明1128の化合物。
[本発明1130]
R_cがアルキル$_{(C \leq 6)}$である、本発明1127～1129のいずれかの化合物。
[本発明1131]
R_cがメチルである、本発明1130の化合物。
[本発明1132]
A_2がアラルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1127～1131のいずれかの化合物。
[本発明1133]
A_2がベンジルである、本発明1132の化合物。
[本発明1134]
R_5が、ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1012～1077のいずれかの化合物。
[本発明1135]
R_5がヘテロアリール$_{(C \leq 12)}$である、本発明1134の化合物。
[本発明1136]
R_5が、5-(3-メチル)-オキサジアゾリル、4-(3,5-ジメチル)-イソオキサゾリル、フラニル、ベンゾフラニル、2-チアゾリル、5-(2-メチル)-フラニル、3-ピリジニル、または4-ピリジニルである、本発明1135の化合物。
[本発明1137]
R_5がヒドロキシである、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1138]

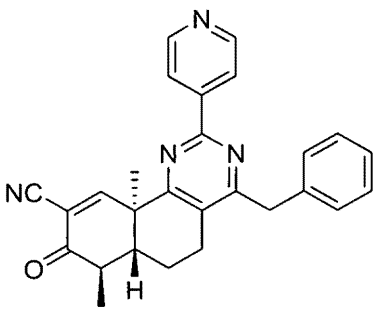
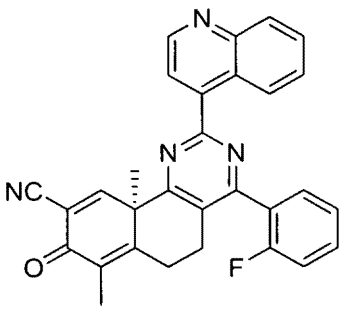
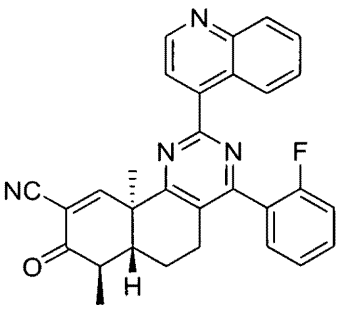
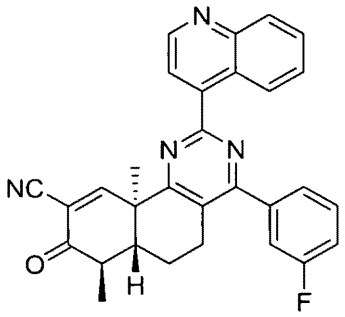
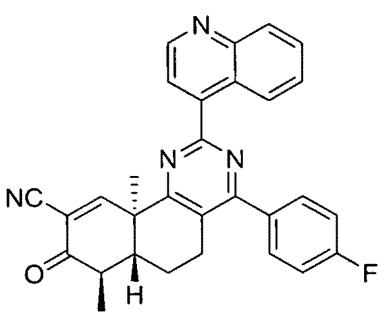
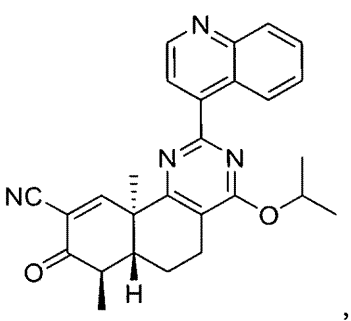
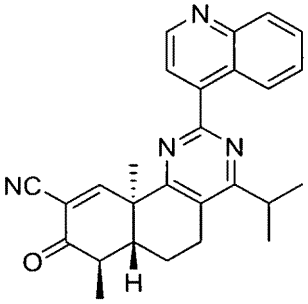
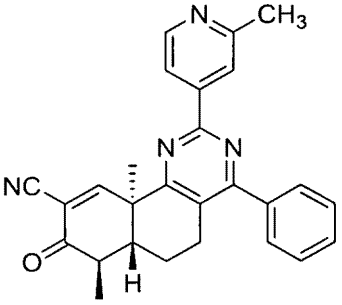
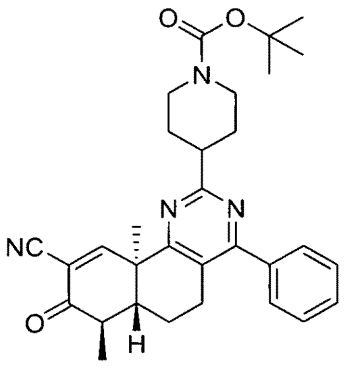
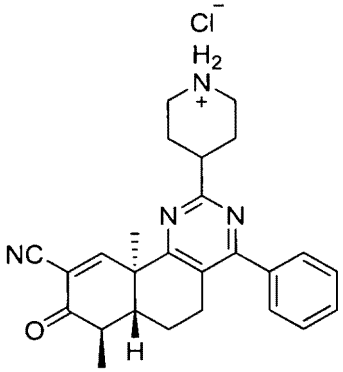
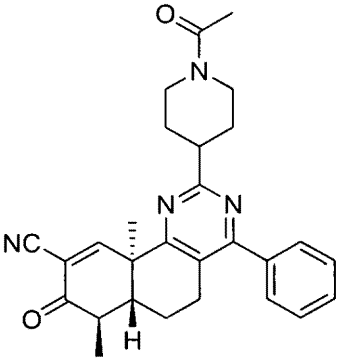
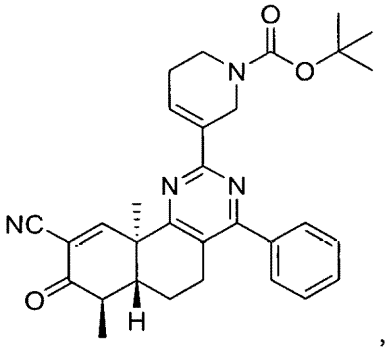
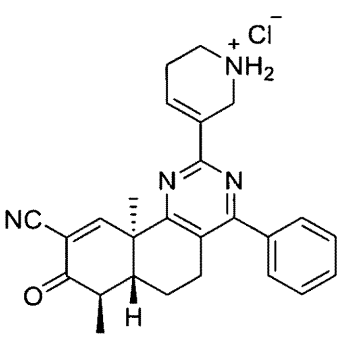
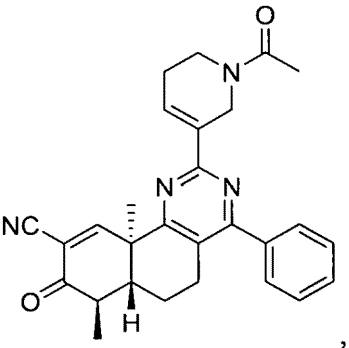
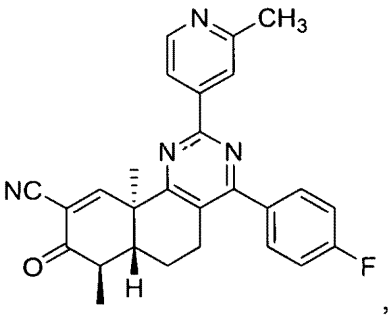
R_5が-$OS(O)_2C_6H_4CH_3$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1139]
R_5が、ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$または置換ヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1140]
R_5がヘテロシクロアルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1139の化合物。
[本発明1141]
R_5がピロリジニルである、本発明1140の化合物。
[本発明1142]
R_5が、アルコキシ$_{(C \leq 12)}$または置換アルコキシ$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1143]
R_5がアルコキシ$_{(C \leq 12)}$である、本発明1142の化合物。
[本発明1144]
R_5が、メトキシまたはイソプロポキシである、本発明1143の化合物。
[本発明1145]
R_5が、アラルキル$_{(C \leq 12)}$または置換アラルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1001～1008および1013～1077のいずれかの化合物。
[本発明1146]
R_5がアラルキル$_{(C \leq 12)}$である、本発明1145の化合物。
[本発明1147]
R_5がベンジルである、本発明1146の化合物。
[本発明1148]
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに定義される、本発明1001～1012のいずれかの化合物：


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

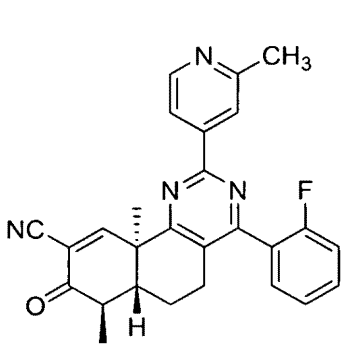
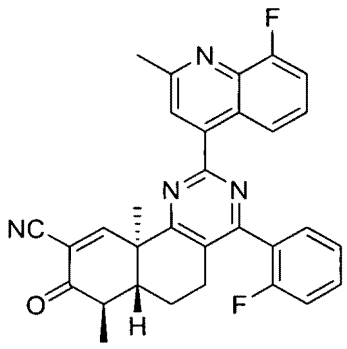
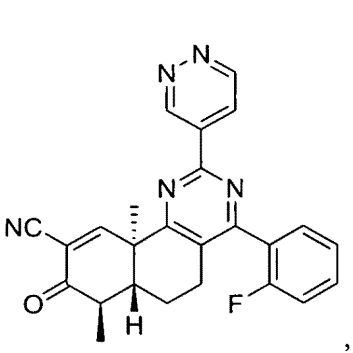
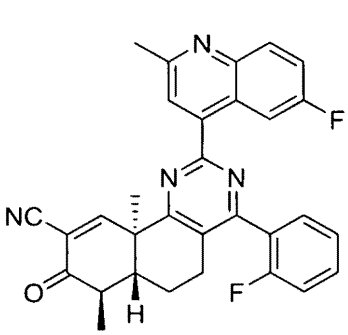
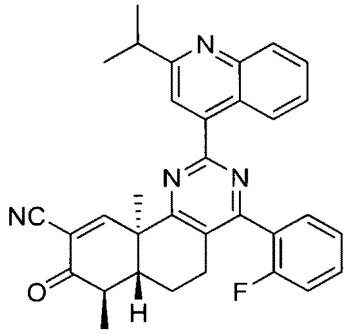
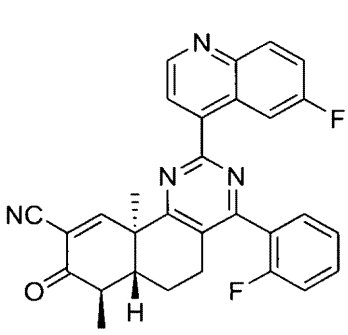
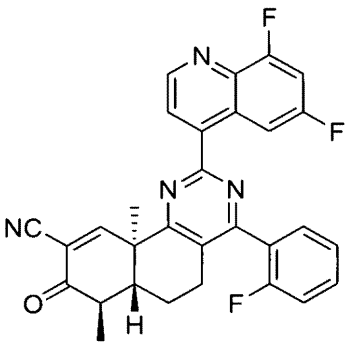
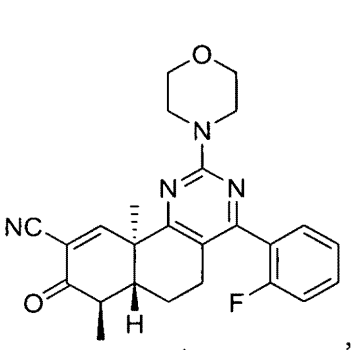
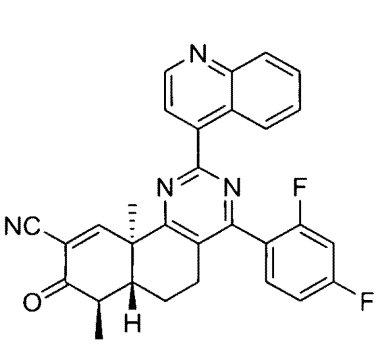
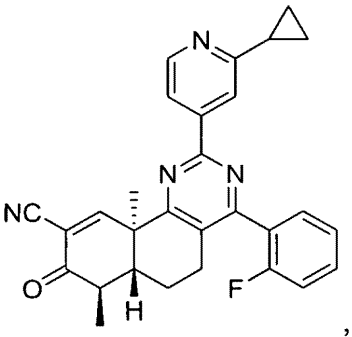
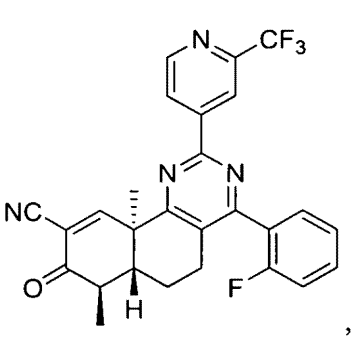
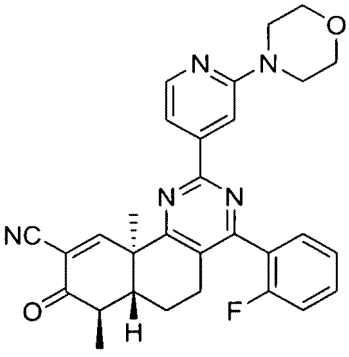
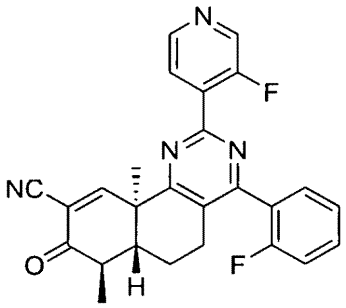
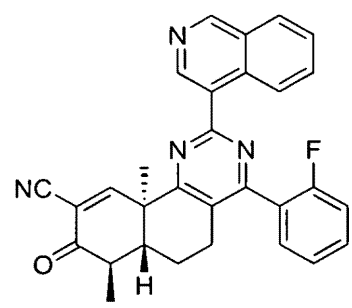
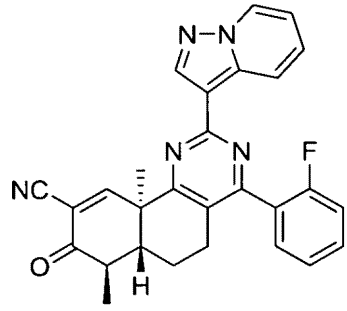
,

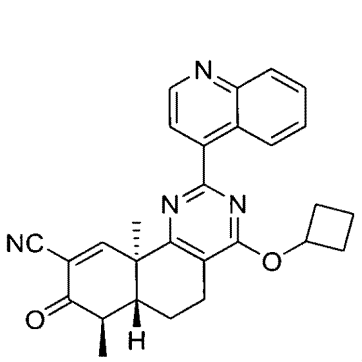
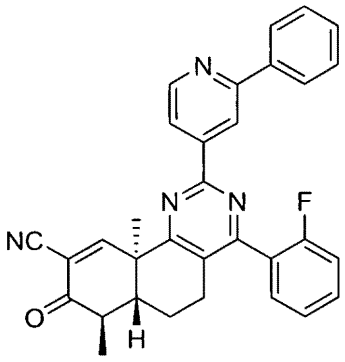
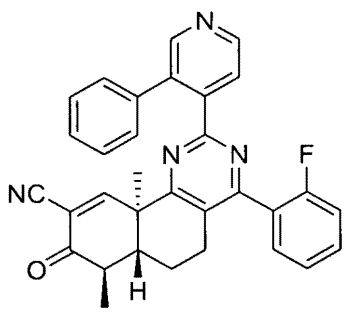
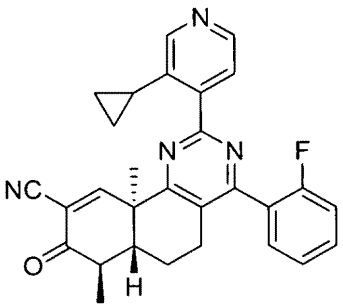
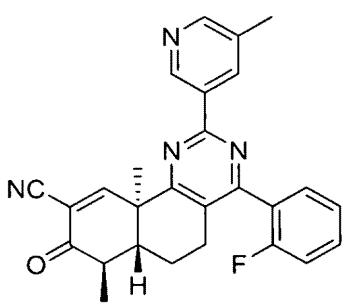
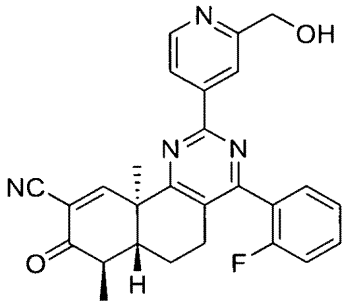
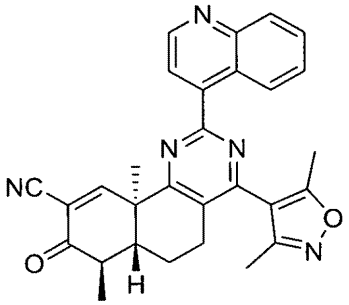
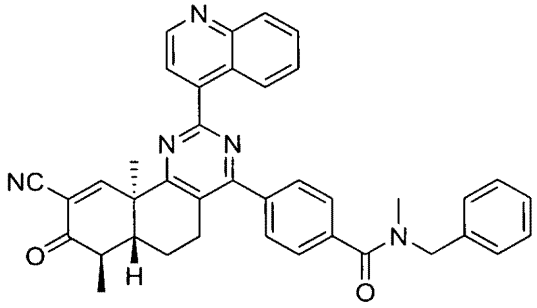
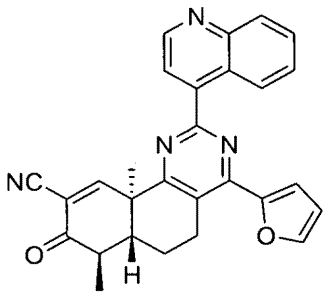
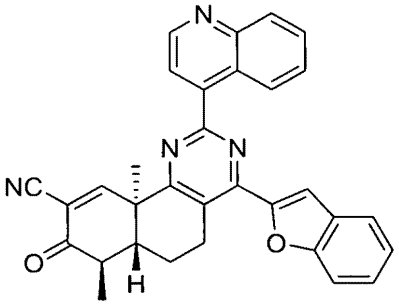
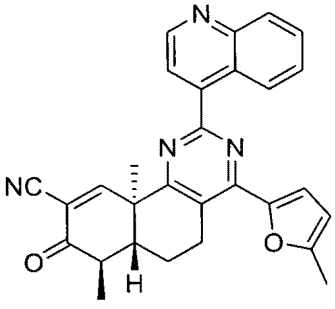
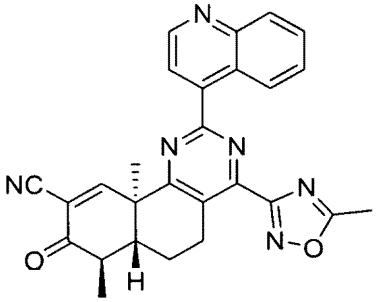
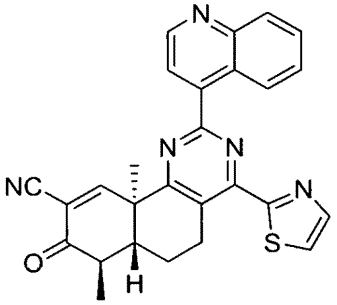
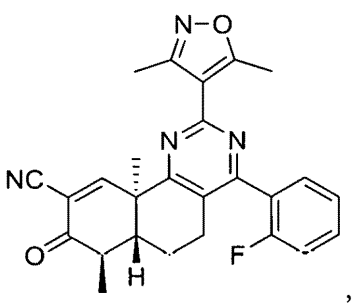

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

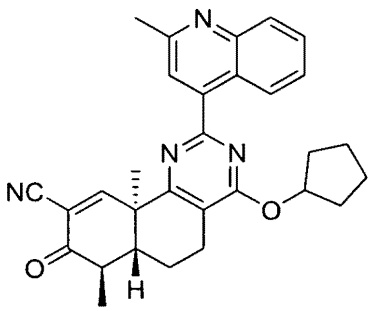
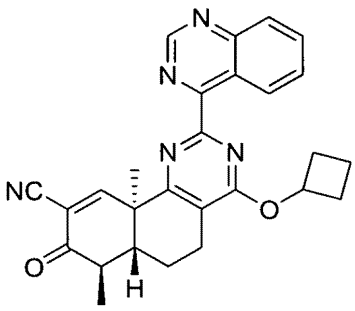
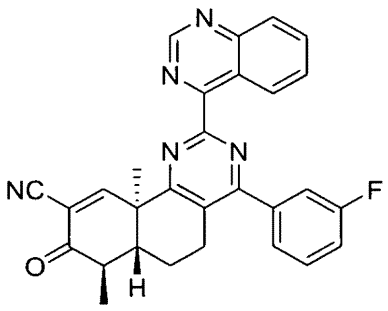
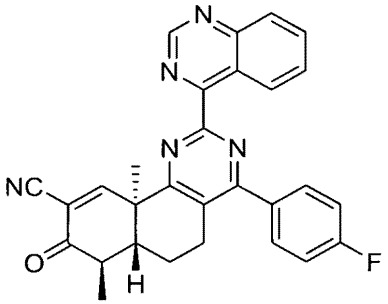
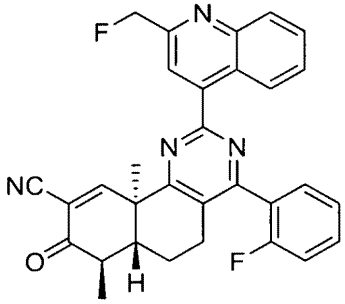
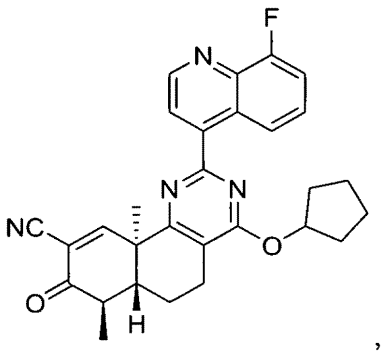
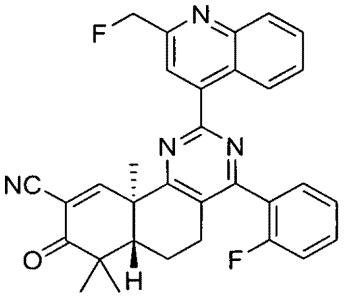
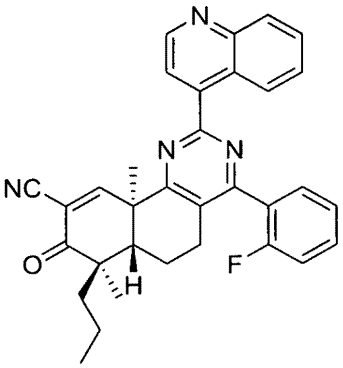
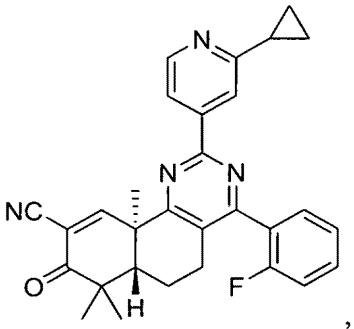
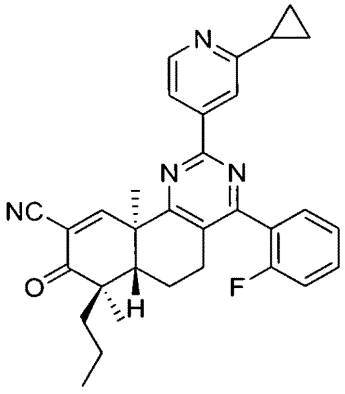
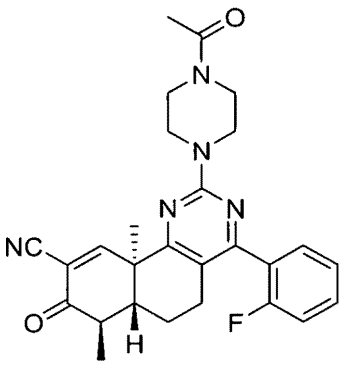
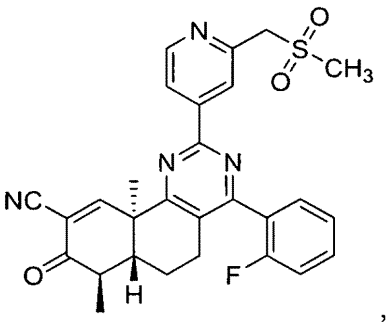
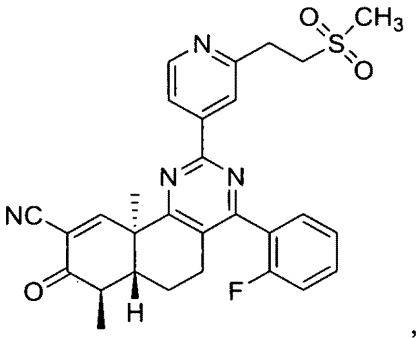
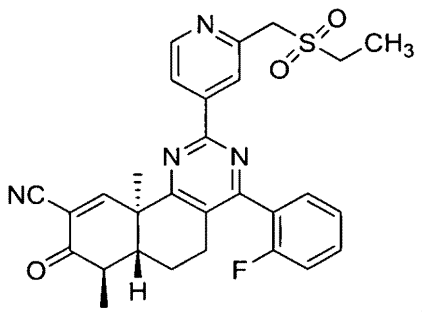
,

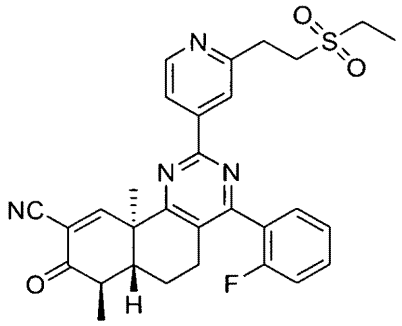
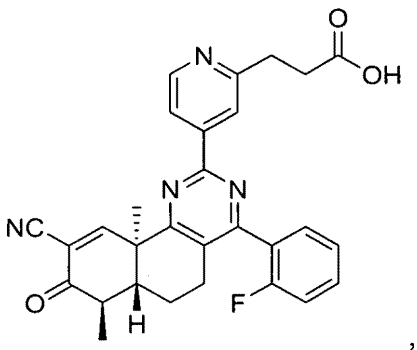
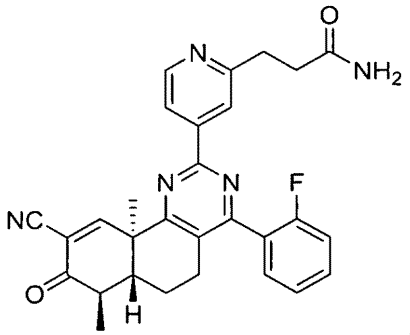
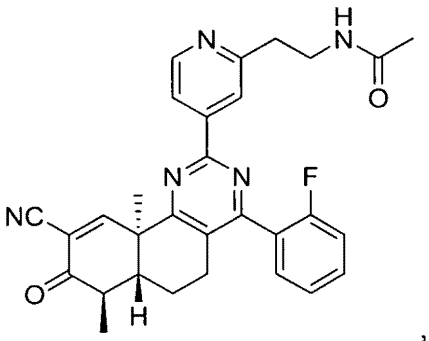
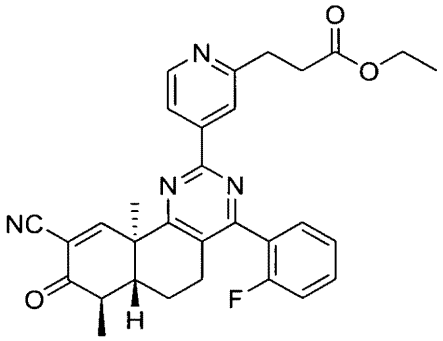
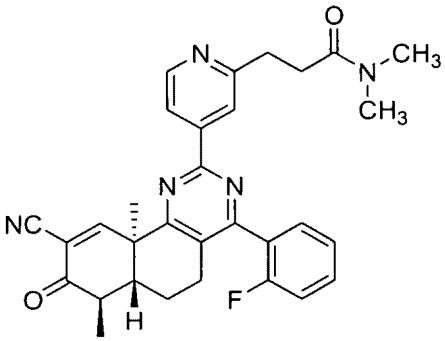
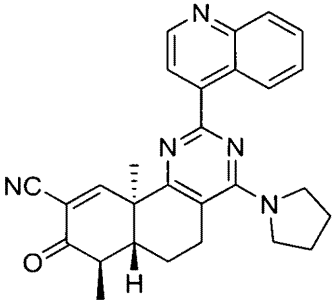
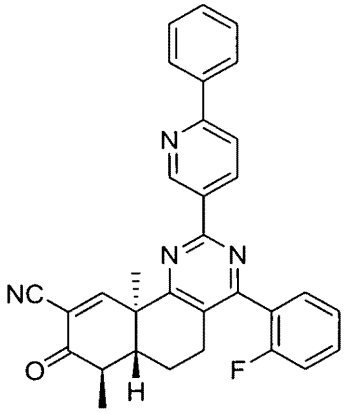
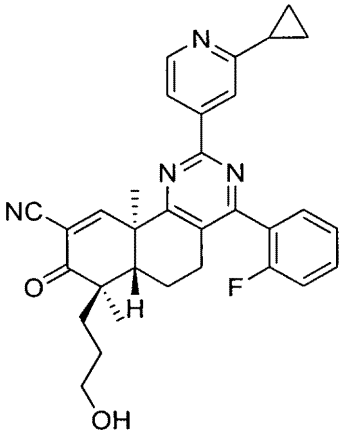
,

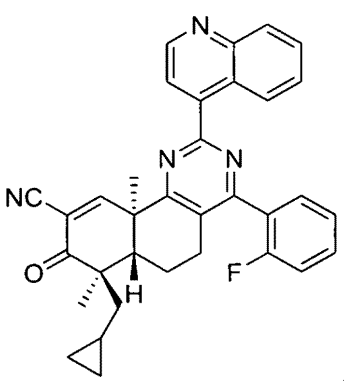
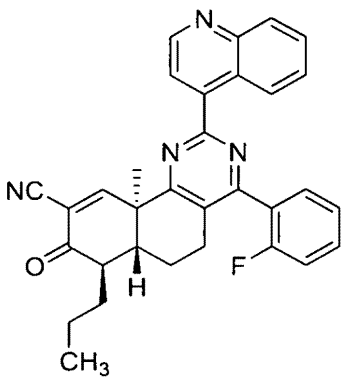
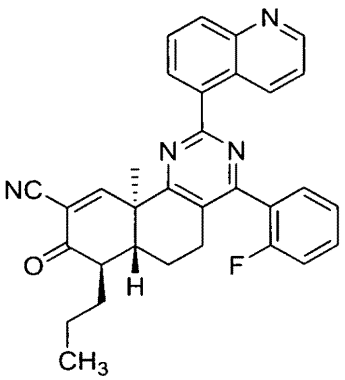
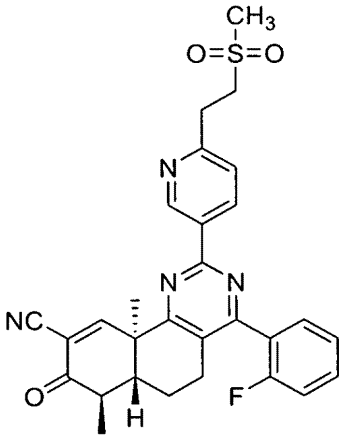
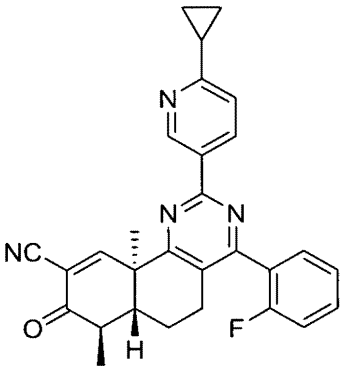
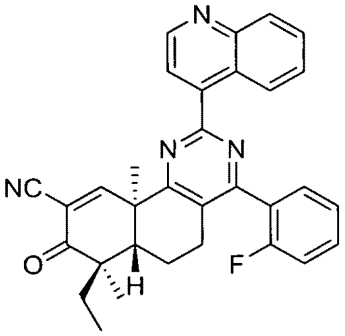
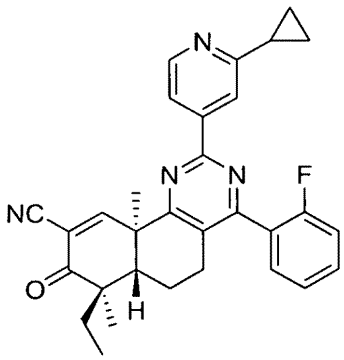
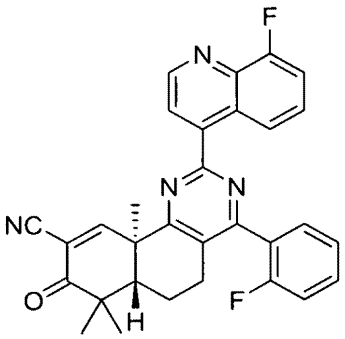
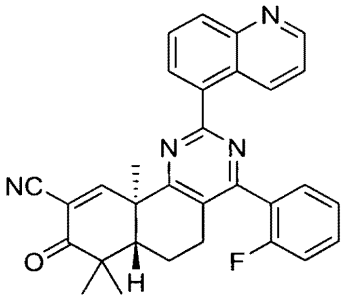
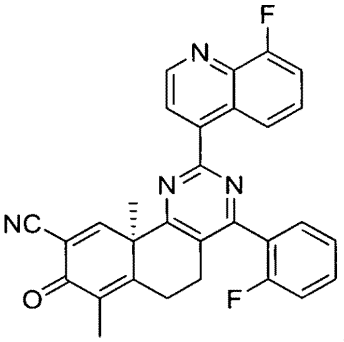
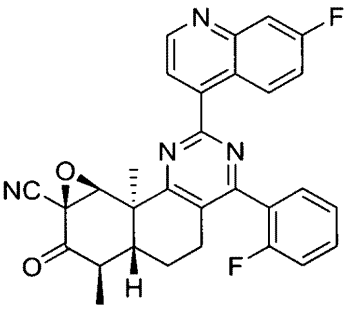
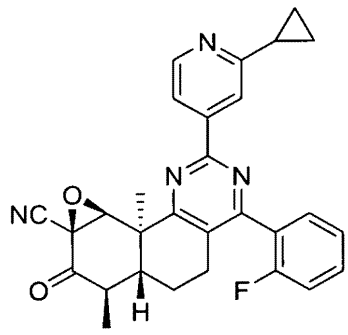
,

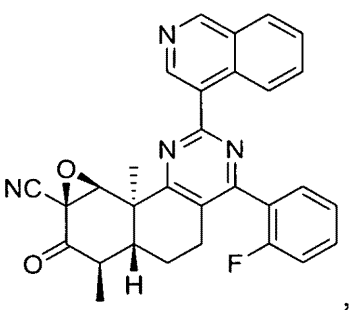
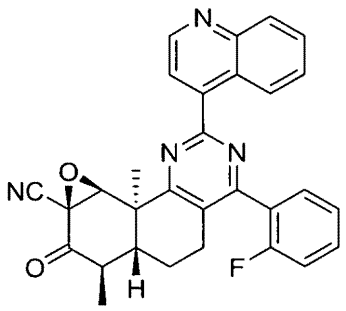
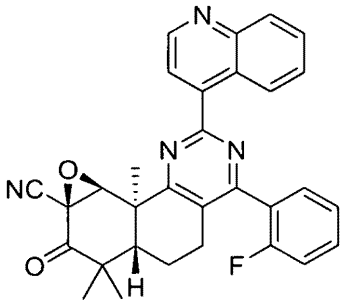
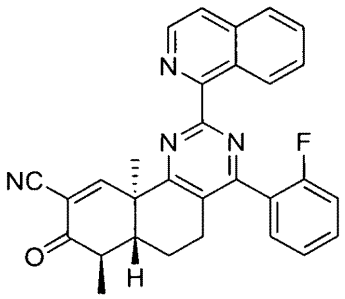
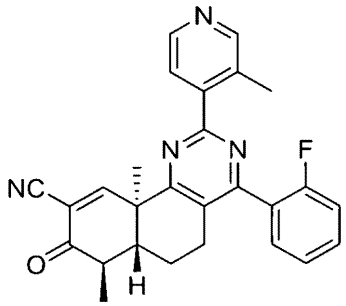
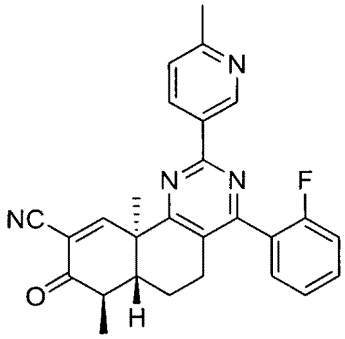
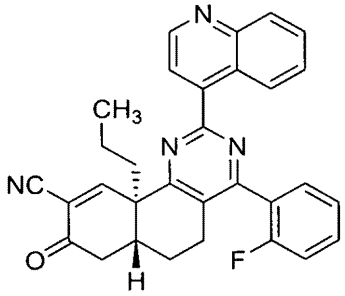
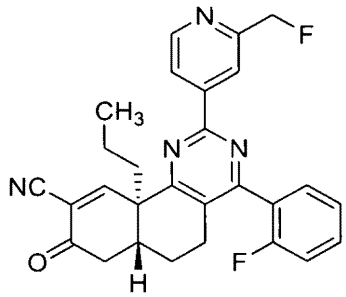
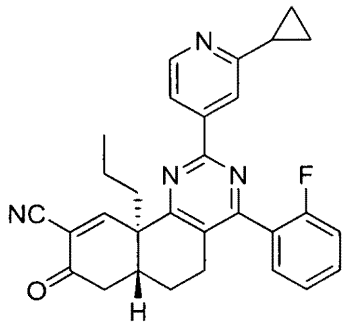
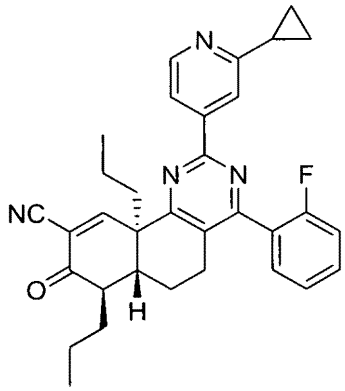
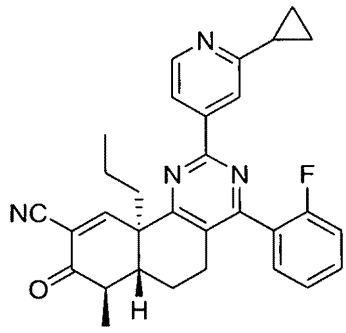
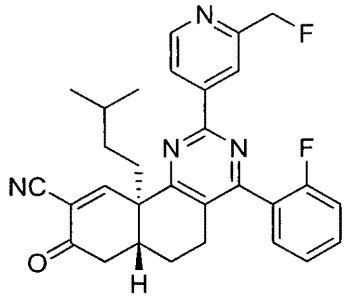
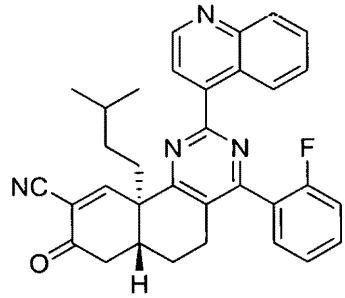
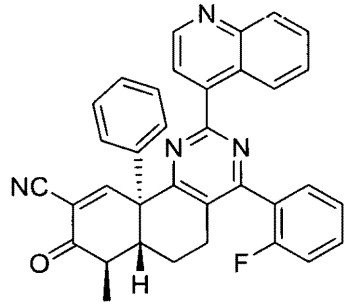
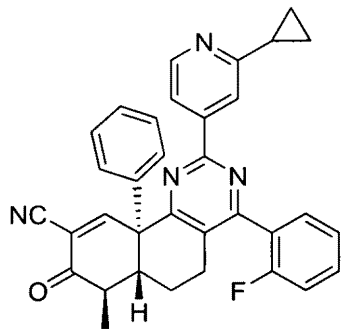

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

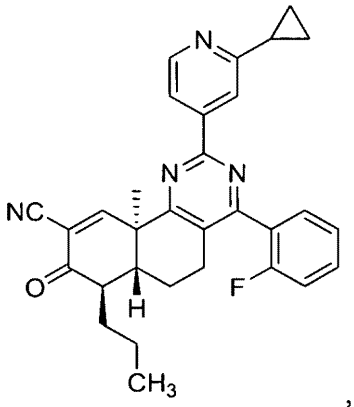
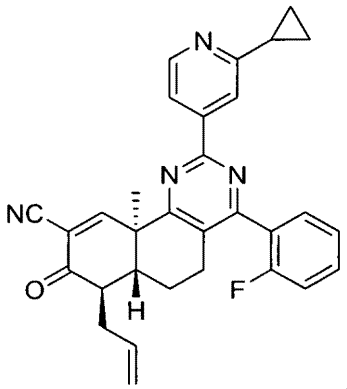
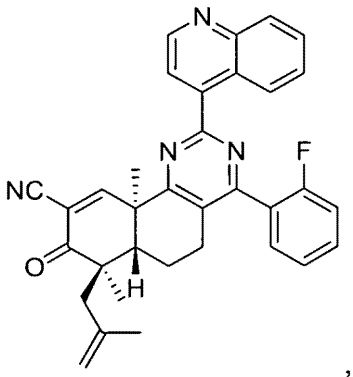
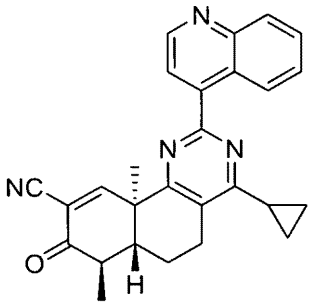
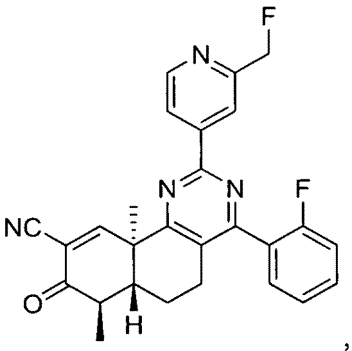
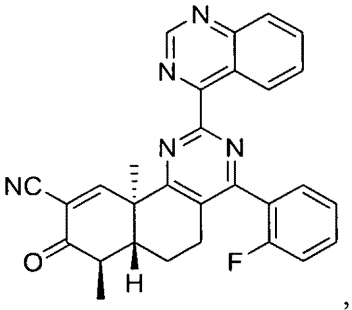
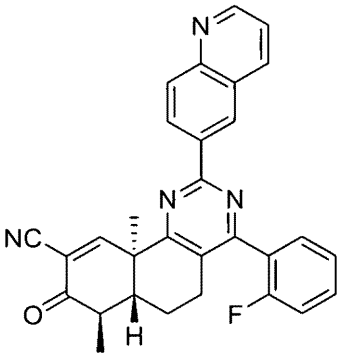
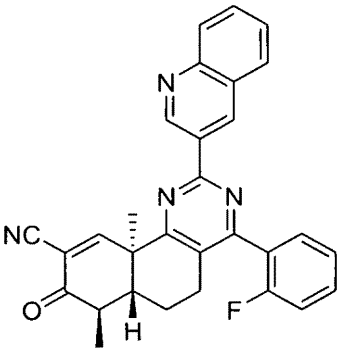
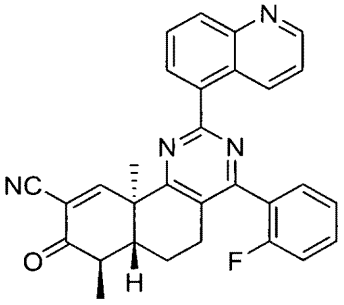
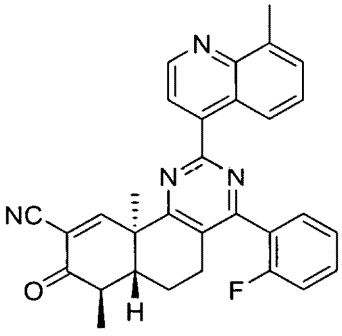
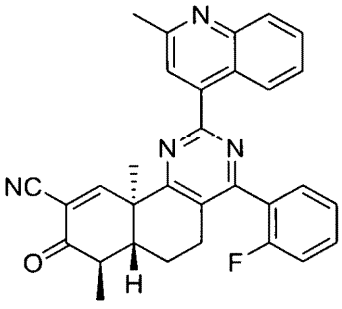
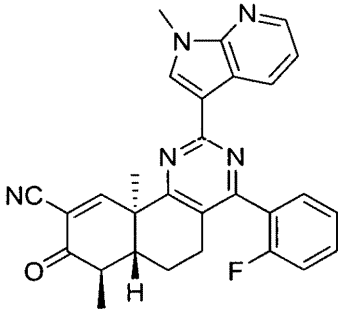

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

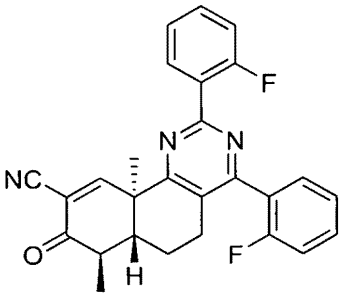
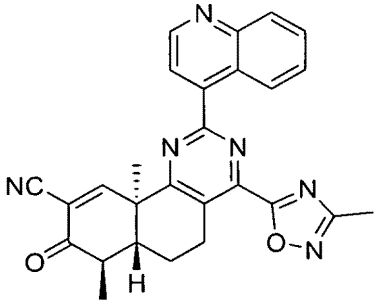
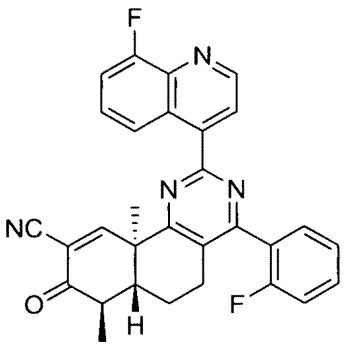
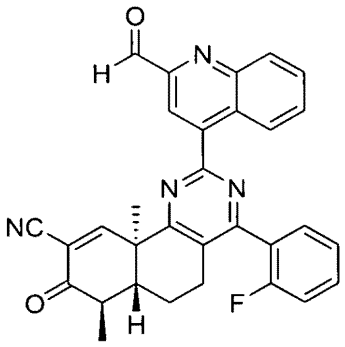
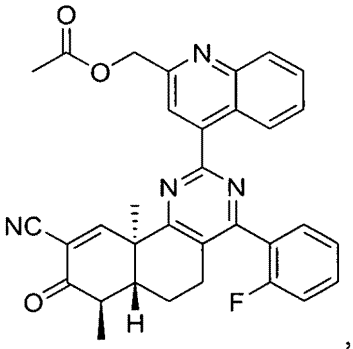
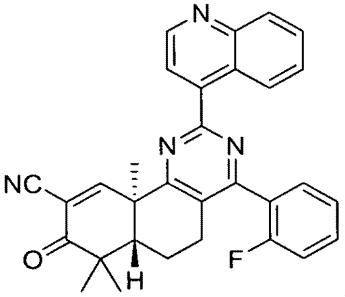
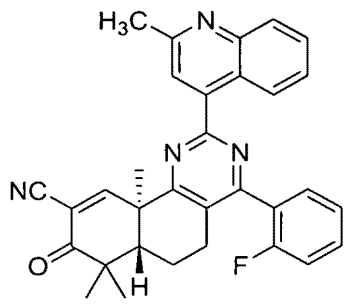
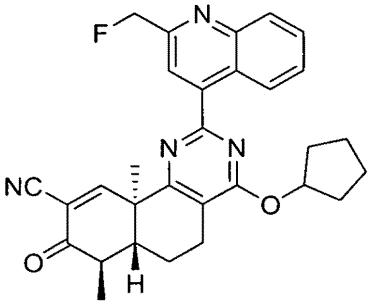
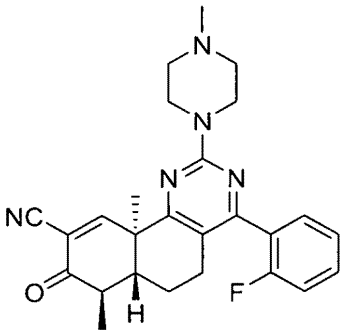
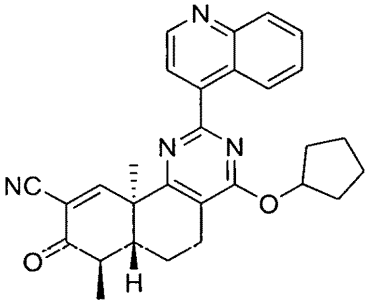
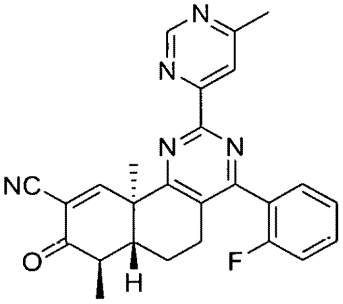
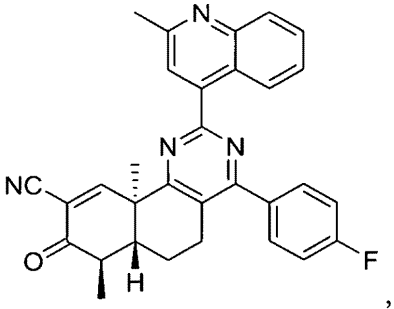
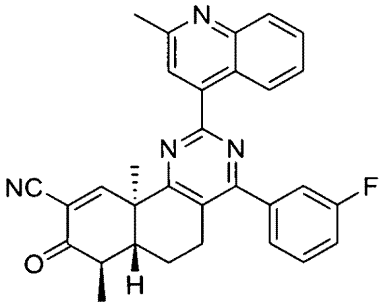
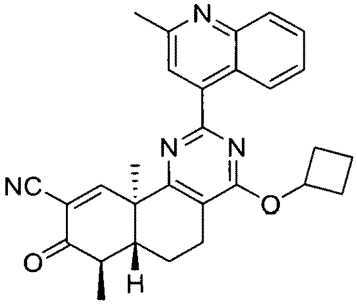
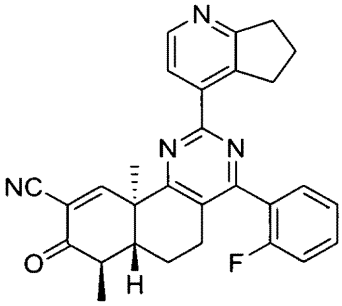

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

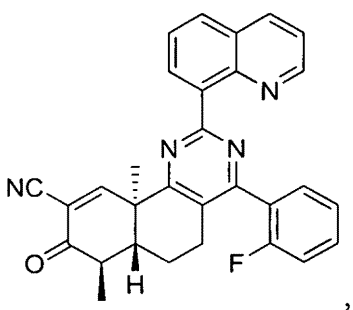
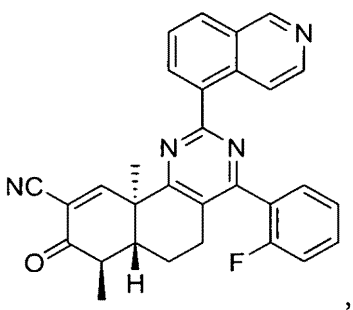
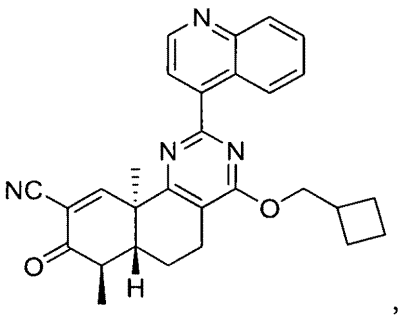
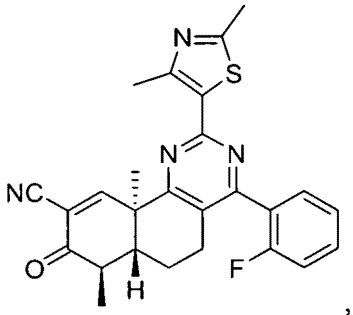
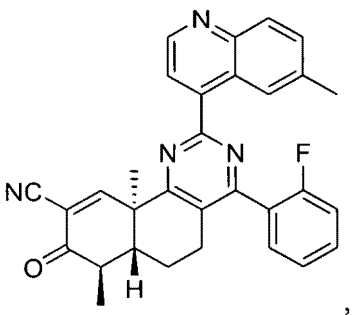
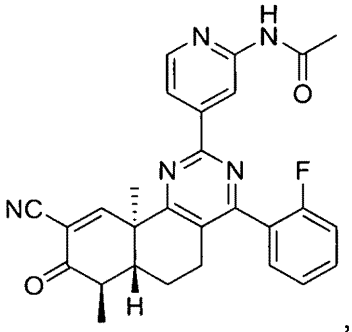
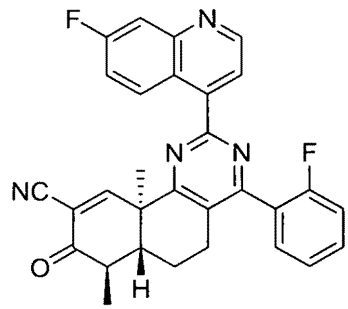
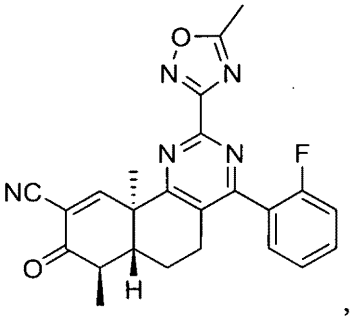
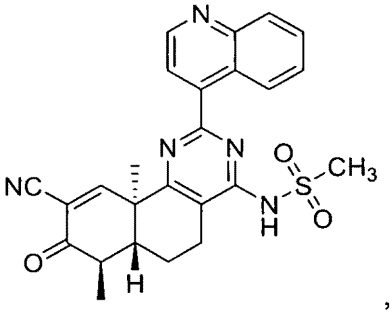
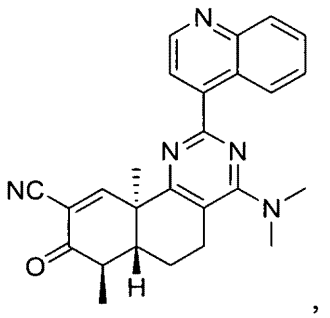
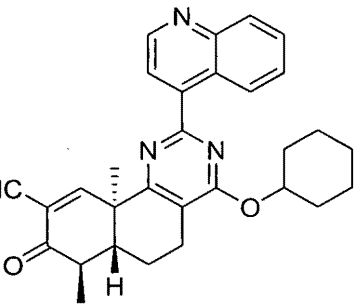
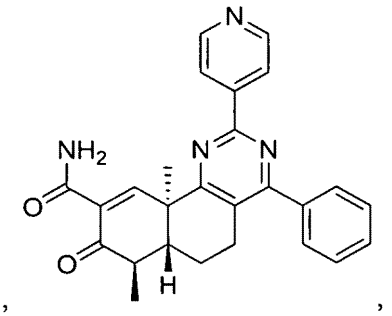
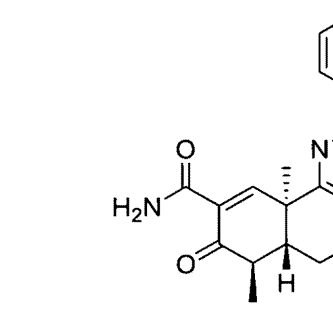
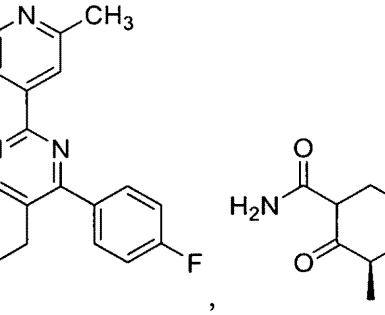
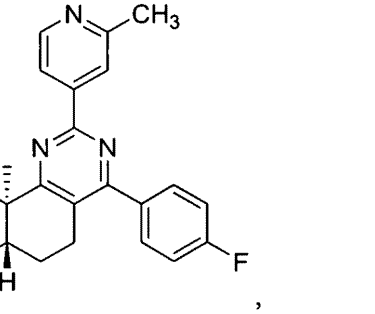

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

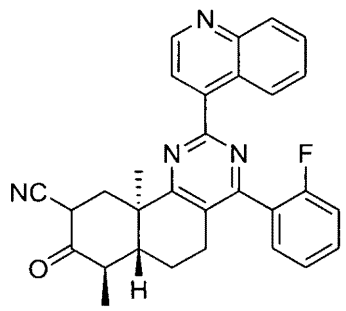
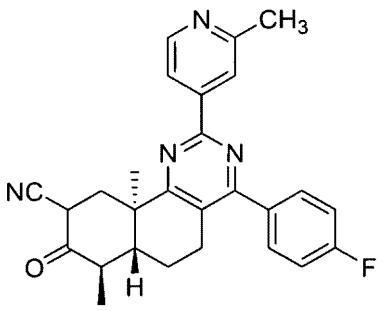
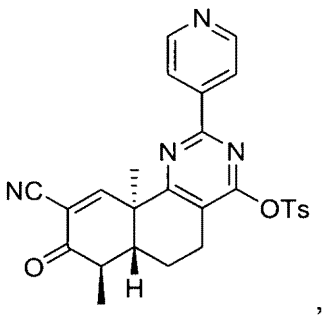
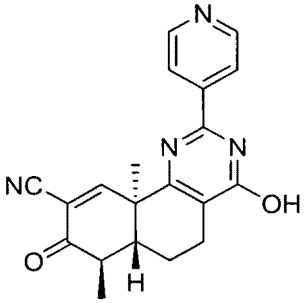
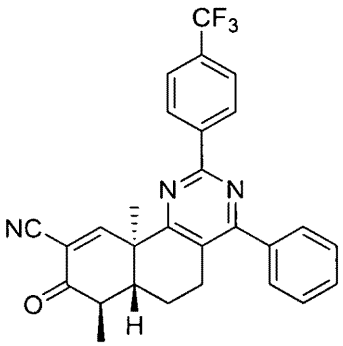
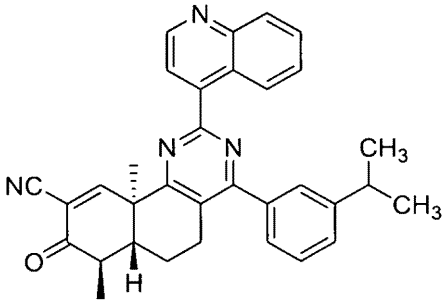
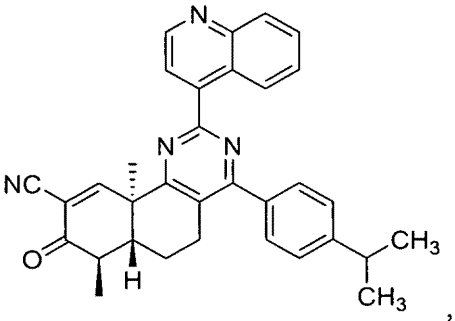
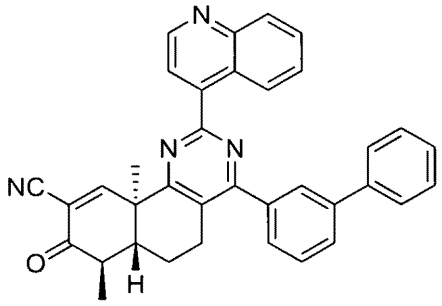
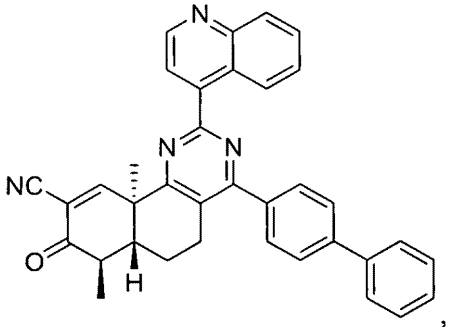
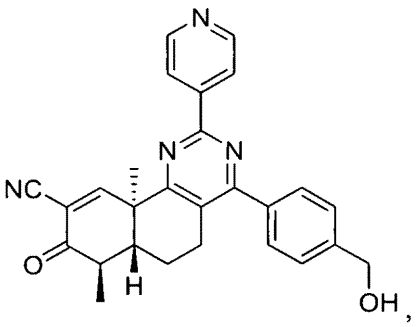
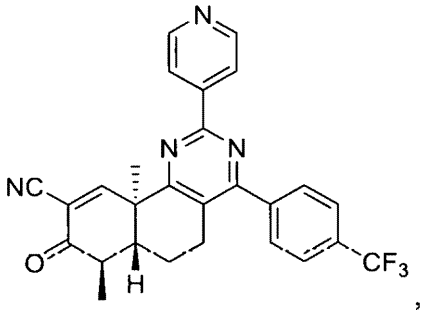
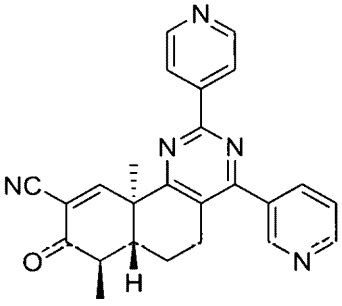
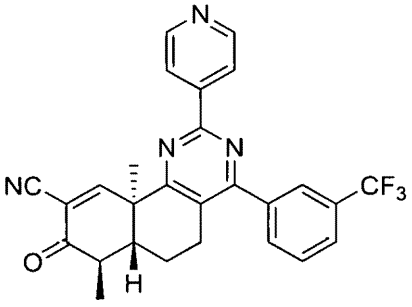

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

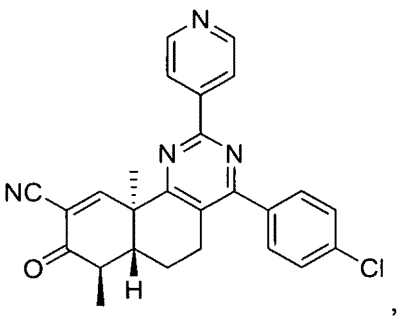
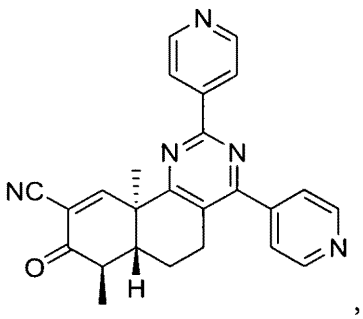
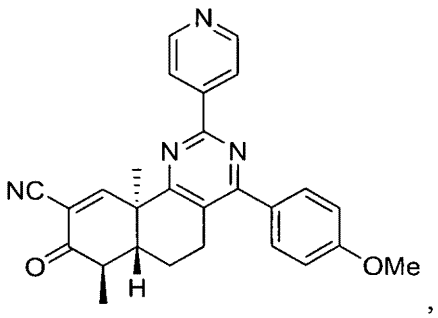
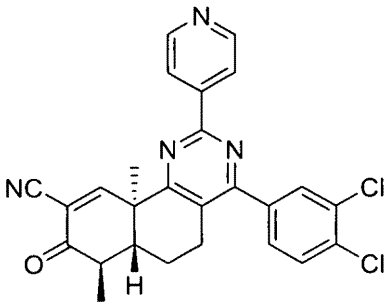
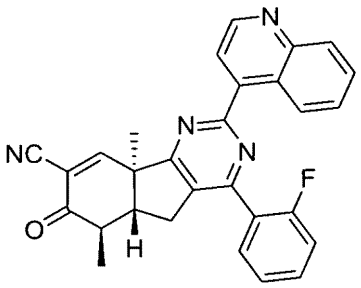
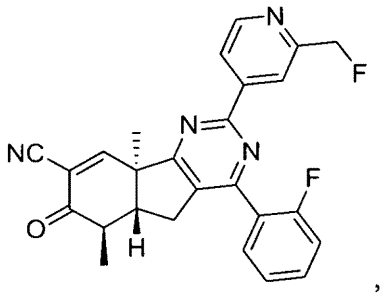
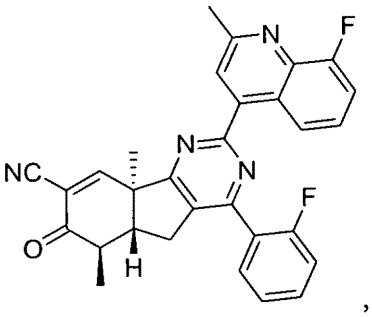
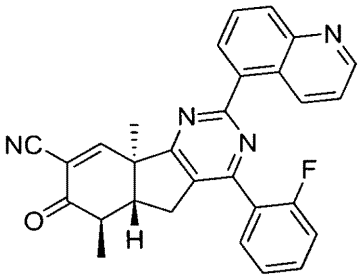
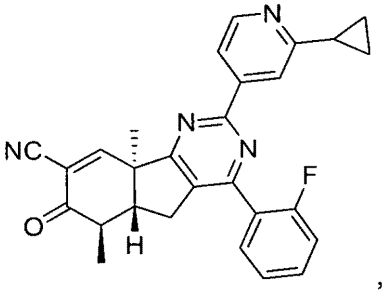
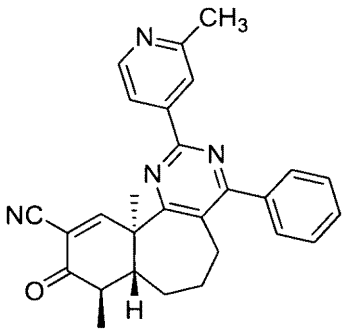
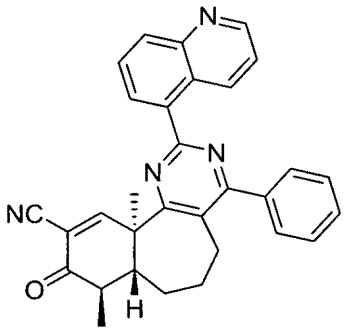
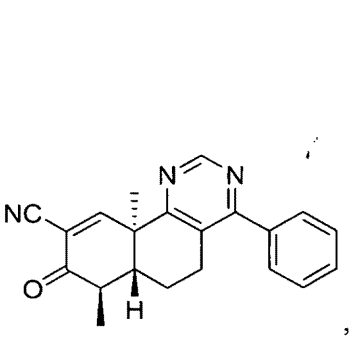
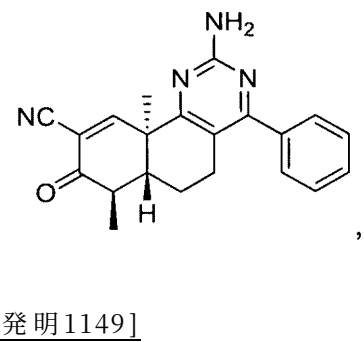
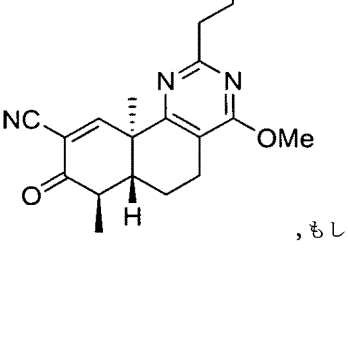
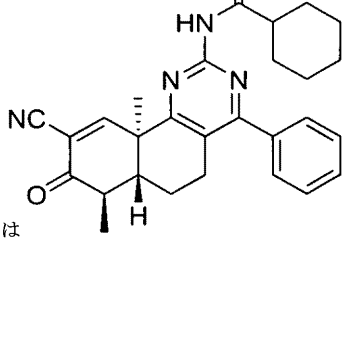
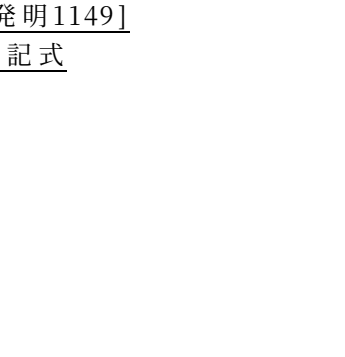

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

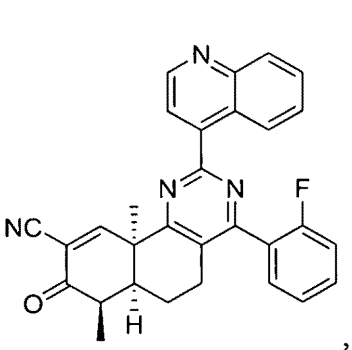
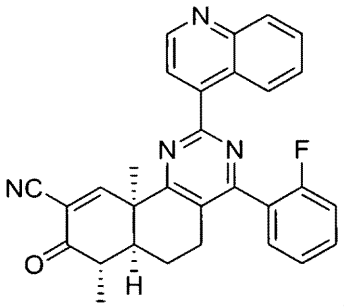
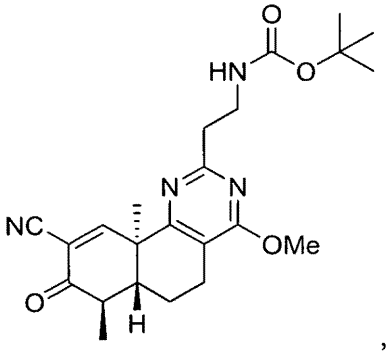
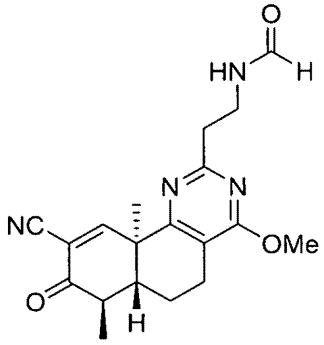
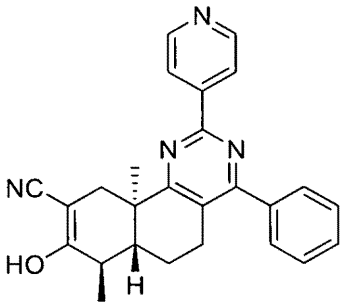
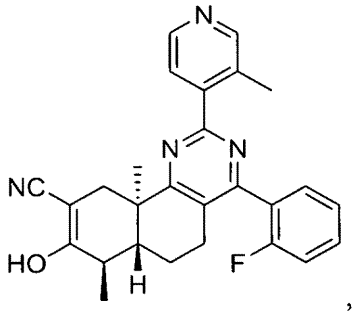
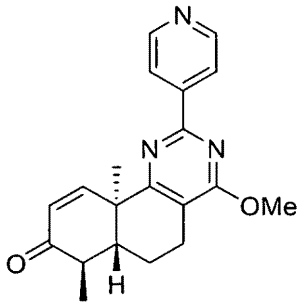
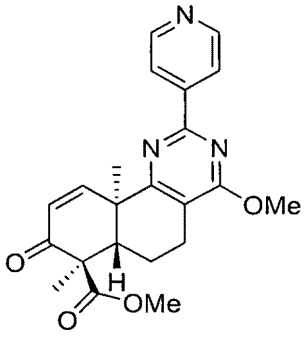

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,もしくは

。

[本発明1149]

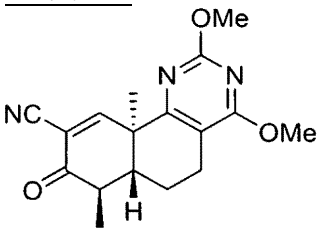
下記式


,

,

,

,

,

,


,もしくは

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

[本発明1150]

下記式



の化合物またはその薬学的に許容される塩。

[本発明1151]

下記としてさらに定義される化合物またはその薬学的に許容される塩：

(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-2,4-ジメトキシ-7,10a-ジメチル-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；

(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-2-(2-メトキシピリジン-4-イル)-7,10a-ジメチル-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；

(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；

(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(3-メチルピリジン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；

(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(ピリジン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；

(6aR,7R,10aS)-2-(2-フルオロピリジン-4-イル)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(ピリジン-3-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(ピリジン-4-イルアミノ)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(キノリン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
tert-ブチル (2-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)エチル)カルバマート；
N-(2-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)エチル)ホルムアミド；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-アミノエチル)-9-シアノ-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aR)-8-ヒドロキシ-7,10a-ジメチル-4-フェニル-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,10,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,8aS,9aS,9bR)-7,9b-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-2-(ピリジン-4-イル)-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボキサミド；
(6aR,7R,10aS)-4-ヒドロキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-4-イル 4-メチルベンゼンスルホナート；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2,4-ジフェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-2-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-(ヒドロキシメチル)フェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-シクロヘキシル-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-(ピリジン-3-イル)-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-4-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-4-(p-トリル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-クロロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS))-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2,4-ジ(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-メトキシフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イ

ル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3,4-ジクロロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-メトキシピリジン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-アミノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
N-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)シクロヘキサンカルボキサミド；
(6aR,7R,10aS)-4-ベンジル-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(R)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,8,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-イソプロポキシ-7,10a-ジメチル-2-(キノリン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-イソプロピル-7,10a-ジメチル-2-(キノリン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
tert-ブチル 4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピペリジン-1-カルボキシラート；
4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピペリジン-1-イウムクロリド；
(6aR,7R,10aS)-2-(1-アセチルピペリジン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
tert-ブチル 5-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)-3,6-ジヒドロピリジン-1(2H)-カルボキシラート；
5-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イウムクロリド；
(6aR,7R,10aS)-2-(1-アセチル-1,2,5,6-テトラヒドロピリジン-3-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリ

ル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-8-ヒドロキシ-7,10a-ジメチル-2-(3-メチルピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,10,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(3-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(3-フルオロピリジン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(5-メチルピリジン-3-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-3-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-6-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
N-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)アセトアミド；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-8-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(8-フルオロ-2-メチルキノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-モルホリノピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(2-フェニルピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(イソキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(8-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2,4-ジメチルチアゾール-5-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(6-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キナゾリン-4-

イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(イソキノリン-1-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(7-フルオロキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(8-フルオロキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(6-メチルピリミジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリダジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2,4-ビス(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(2-(ヒドロキシメチル)ピリジン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-(フルオロメチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-5-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(6-フルオロ-2-メチルキノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(イソキノリン-5-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(6-メチルピリジン-3-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(6-フルオロキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(6,8-ジフルオロキノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-モルホリノ-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-シクロプロピル-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-シクロブトキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロブチルメトキシ)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロヘキシルオキシ)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-

イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロペンチルオキシ)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
N-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-4-イル)メタンスルホンアミド；
(6aR,7R,10aS)-4-(ジメチルアミノ)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
N-ベンジル-4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-4-イル)-N-メチルベンズアミド；
(6aR,7R,10aS)-4-(フラン-2-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(ベンゾフラン-2-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-4-(5-メチルフラン-2-イル)-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-4-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-4-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-4-(チアゾール-2-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-シクロブトキシ-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロペンチルオキシ)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-シクロブトキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キナゾリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キナゾリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キナゾリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-(フルオロメチル)キノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(2-ホルミルキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)キノリン-2-イル)メチルアセタート；
(6aS,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,10a-トリメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イ

ル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,10a-トリメチル-2-(2-メチルキノリン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロペンチルオキシ)-2-(2-(フルオロメチル)キノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(シクロペンチルオキシ)-2-(8-フルオロキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-2-(2-(フルオロメチル)キノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,10a-トリメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(2-イソプロピルキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-7-プロピル-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,10a-トリメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aR)-7-エチル-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(8-フルオロキノリン-4-イル)-7,7,10a-トリメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(R)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(8-フルオロキノリン-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,8,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,8aS,9aS,9bR)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(7-フルオロキノリン-4-イル)-7,9b-ジメチル-8-オキソ-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aR,7R,8aS,9aS,9bR)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,9b-ジメチル-8-オキソ-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aR,7R,8aS,9aS,9bR)-4-(2-フルオロフェニル)-2-(イソキノリン-4-イル)-7,9b-ジメチル-8-オキソ-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aR,7R,8aS,9aS,9bR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,9b-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aS,8aS,9aS,9bR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,9b-トリメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-6,6a,7,8,9a,9b-ヘキサヒドロオキシレノ[2',3':3,4]ベンゾ[1,2-h]キナゾリン-8a(5H)-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aR)-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-2-(ピリジン-4-イル)-5,6a,7,10a-テトラヒドロベンゾ[h]キナゾリン-8(6H)-オン；
メチル (6aS,7R,10aR)-4-メトキシ-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(ピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-7-カルボキシラート；
(6aS,7R,10aR)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7-(3-ヒドロキシプロピル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aR)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-7-プロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-

カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-4-(ピロリジン-1-イル)-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(6-シクロプロピルピリジン-3-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(6-フェニルピリジン-3-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(6-(2-(メチルスルホニル)エチル)ピリジン-3-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-((メチルスルホニル)メチル)ピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-(2-(メチルスルホニル)エチル)ピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-7-アリル-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-メチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-メチル-8-オキソ-7-プロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7-メチル-8-オキソ-10a-フェニル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7-メチル-8-オキソ-10a-フェニル-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,7,10a-トリメチル-8-オキソ-2-(キノリン-5-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
3-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)プロパン酸；
エチル 3-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)プロパノアート；
3-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)-N,N-ジメチルプロパンアミド；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-(2-(エチルスルホニル)エチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-((エチルスルホニル)メチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,10aS)-2-(2-(フルオロメチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-8-オキソ-10a-プロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；

(6aR,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-8-オキソ-10a-プロピル-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,10aR)-7-(シクロプロピルメチル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-メチル-8-オキソ-7-プロピル-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-メチル-8-オキソ-7-プロピル-2-(キノリン-5-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(3-イソプロピルフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-イソプロピルフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-([1,1'-ビフェニル]-3-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-([1,1'-ビフェニル]-4-イル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-イソペンチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,10aS)-2-(2-(フルオロメチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-10a-イソペンチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aR)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-7-(2-メチルアリル)-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-8-オキソ-10a-プロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-8-オキソ-7,10a-ジプロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7-メチル-8-オキソ-10a-プロピル-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(5aR,6R,9aS)-4-(2-フルオロフェニル)-6,9a-ジメチル-7-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5a,6,7,9a-テトラヒドロ-5H-インデノ[1,2-d]ピリミジン-8-カルボニトリル；
(5aR,6R,9aS)-2-(2-(フルオロメチル)ピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-6,9a-ジメチル-7-オキソ-5a,6,7,9a-テトラヒドロ-5H-インデノ[1,2-d]ピリミジン-8-カルボニトリル；
(5aR,6R,9aS)-2-(8-フルオロ-2-メチルキノリン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-6,9a-ジメチル-7-オキソ-5a,6,7,9a-テトラヒドロ-5H-インデノ[1,2-d]ピリミジン-8-カルボニトリル；
(5aR,6R,9aS)-4-(2-フルオロフェニル)-6,9a-ジメチル-7-オキソ-2-(キノリン-5-イル)-5a,6,7,9a-テトラヒドロ-5H-インデノ[1,2-d]ピリミジン-8-カルボニトリル；
(5aR,6R,9aS)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-6,9a-ジメチル-7-オキソ-5a,6,7,9a-テトラヒドロ-5H-インデノ[1,2-d]ピリミジン-8-カルボニトリル；
(6aS,7S,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(キノリン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；

3-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)プロパンアミド；
N-(2-(4-((6aR,7R,10aS)-9-シアノ-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-2-イル)ピリジン-2-イル)エチル)アセトアミド；
(6aR,7R,10aS)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-2-(3-フェニルピリジン-4-イル)-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-2-(3-シクロプロピルピリジン-4-イル)-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(6aS,7R,10aR)-2-(2-シクロプロピルピリジン-4-イル)-7-エチル-4-(2-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル；
(7aR,8R,11aS)-8,11a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-9-オキソ-4-フェニル-6,7,7a,8,9,11a-ヘキサヒドロ-5H-ベンゾ[6,7]シクロヘプタ[1,2-d]ピリミジン-10-カルボニトリル；
(7aR,8R,11aS)-8,11a-ジメチル-9-オキソ-4-フェニル-2-(キノリン-5-イル)-6,7,7a,8,9,11a-ヘキサヒドロ-5H-ベンゾ[6,7]シクロヘプタ[1,2-d]ピリミジン-10-カルボニトリル；
(6aR,7R,10aS)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,10a-ヘキサヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボキサミド；
(6aR,7R,10aR)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,9,10,10a-オクタヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボキサミド；および
(6aR,7R,10aR)-4-(4-フルオロフェニル)-7,10a-ジメチル-2-(2-メチルピリジン-4-イル)-8-オキソ-5,6,6a,7,8,9,10,10a-オクタヒドロベンゾ[h]キナゾリン-9-カルボニトリル
。

[本発明1152]
(A)本発明1001～1151のいずれかの化合物；および
(B)賦形剤
を含む、薬学的組成物。

[本発明1153]
経口投与、脂肪内（intraadiposally）投与、動脈内投与、関節内投与、頭蓋内投与、皮内投与、病巣内投与、筋肉内投与、鼻腔内投与、眼内投与、心膜内投与、腹腔内投与、胸膜腔内投与、前立腺内（intraprostatically）投与、直腸内投与、くも膜下腔内投与、気管内投与、腫瘍内投与、臍帯内投与、膣内投与、静脈内投与、小胞内投与、硝子体内投与、リポソームでの投与、局所投与、粘膜投与、非経口投与、直腸投与、結膜下投与、皮下投与、舌下投与、局部投与、経頬投与、経皮投与、経膣投与、クリームでの投与、脂質組成物での投与、カテーテルによる投与、洗浄処理（lavage）による投与、持続注入による投与、注入による投与、吸入による投与、注射による投与、局所送達による投与、または局所灌流による投与用に製剤化されている、本発明1152の薬学的組成物。

[本発明1154]
経口投与用に製剤化されている、本発明1153の薬学的組成物。

[本発明1155]
注射による投与用に製剤化されている、本発明1153の薬学的組成物。

[本発明1156]
動脈内投与、筋肉内投与、腹腔内投与、または静脈内投与用に製剤化されている、本発明1155の薬学的組成物。

[本発明1157]

局部投与用に製剤化されている、本発明1153の薬学的組成物。
[本発明1158]
皮膚または眼への局部投与用に製剤化されている、本発明1157の薬学的組成物。
[本発明1159]
単位用量として製剤化されている、本発明1152～1158のいずれかの薬学的組成物。
[本発明1160]
その必要がある患者における疾患または障害を治療または予防する方法であって、薬学的有効量の本発明1001～1159のいずれかの化合物または組成物を該患者へ投与する段階を含む、方法。
[本発明1161]
患者が哺乳動物である、本発明1160の方法。
[本発明1162]
患者がヒトである、本発明1161の方法。
[本発明1163]
疾患または障害が、サイトカインIL-17の増加した産生に関連している、本発明1160～1162のいずれかの方法。
[本発明1164]
疾患または障害が、血管新生の調節不全に関連している、本発明1160～1163のいずれかの方法。
[本発明1165]
疾患または障害が、自己免疫疾患、臓器拒絶反応、喘息、癌、神経障害、精神障害、神経精神障害、慢性疼痛症候群、炎症状態、網膜障害、または心血管疾患である、本発明1160～1164のいずれかの方法。
[本発明1166]
疾患または障害が、癌である、本発明1165の方法。
[本発明1167]
自己免疫疾患が、乾癬、多発性硬化症、強皮症、関節リウマチ、ループス、乾癬性関節炎、強直性脊椎炎、シェーグレン症候群、白斑、ぶどう膜炎、ドライアイ症候群、全身性硬化症、1型糖尿病、重症筋無力症、および炎症性腸疾患である、本発明1165の方法。
[本発明1168]
心血管疾患が、血管炎、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、心筋炎、心不全、肺高血圧症、または脳卒中である、本発明1165の方法。
[本発明1169]
神経障害が、てんかん、多発性硬化症、脊髄損傷、ギラン・バレー症候群、または炎症性シグナル伝達の調節不全もしくは酸化ストレスを伴う別の神経障害である、本発明1165の方法。
[本発明1170]
神経変性障害が、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、またはハンチントン病である、本発明1169の方法。
[本発明1171]
炎症状態が、膵炎、肝炎、肺線維症、嚢胞性線維症、慢性閉塞性肺疾患、喘息、皮膚炎、胃炎、食道炎、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患、腎炎、筋消耗、または変形性関節症である、本発明1165の方法。
[本発明1172]
慢性疼痛症候群が、線維筋痛症または神経因性疼痛である、本発明1165の方法。
[本発明1173]
疾患または障害が、病原体に対する重度の炎症反応である、本発明1165の方法。
[本発明1174]
病原体に対する重度の炎症反応が、脳炎、髄膜炎、ピロリ菌（H. pylori）、トキソプラズマ原虫（Toxoplasma gondii）、またはリーシュマニア属の種（Leishmania spp）に

由来する、本発明1173の方法。
[本発明1175]
疾患または障害が、肥満であるか、または肥満に関連した状態である、本発明1165の方法。
[本発明1176]
肥満に関連した状態が、インスリン抵抗性または脂肪肝疾患である、本発明1175の方法。
[本発明1177]
網膜障害が、黄斑変性症または網膜の別の障害である、本発明1165の方法。
[本発明1178]
疾患または障害が、炎症に関連している、本発明1160の方法。
[本発明1179]
炎症に関連した疾患または障害が、肥満、2型糖尿病、または1型もしくは2型糖尿病の合併症である、本発明1178の方法。
[本発明1180]
1型もしくは2型糖尿病の合併症が、ニューロパチー、腎機能低下もしくは慢性腎疾患、網膜症、糖尿病性潰瘍、または心血管疾患である、本発明1179の方法。
[本発明1181]
炎症に関連した疾患または障害が、慢性腎疾患である、本発明1178の方法。
[本発明1182]
慢性腎疾患が、遺伝性である、本発明1181の方法。
[本発明1183]
慢性腎疾患が、非遺伝性原因に起因する、本発明1181の方法。
[本発明1184]
化合物を1回投与する段階を含む、本発明1160～1174のいずれかの方法。
[本発明1185]
化合物を2回以上投与する段階を含む、本発明1160～1174のいずれかの方法。

本開示の他の目的、特徴、および利点は、以下の詳細な説明から明らかとなるであろう。しかしながら、この詳細な説明から本発明の趣旨および範囲内の様々な変更および改変が当業者に明らかとなるため、詳細な説明および特定例は、本発明の特定の態様を示すものの、単なる例として提示されることを理解されたい。単にある特定の化合物が1つの特定の一般式に帰されているという理由だけで、その化合物が別の一般式にも属することができないということにはならない。