

【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】平成27年11月12日 (2015.11.12)

【公表番号】特表2014-528485(P2014-528485A)

【公表日】平成26年10月27日 (2014.10.27)

【年通号数】公開・登録公報2014-059

【出願番号】特願2014-535962(P2014-535962)

【国際特許分類】

C 07 J 5/00 (2006.01)

C 07 J 9/00 (2006.01)

C 07 J 31/00 (2006.01)

C 07 J 43/00 (2006.01)

C 07 J 7/00 (2006.01)

A 61 K 31/573 (2006.01)

A 61 K 31/575 (2006.01)

A 61 K 31/58 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 27/16 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 5/00 C S P

C 07 J 9/00

C 07 J 31/00

C 07 J 43/00

C 07 J 7/00

A 61 K 31/573

A 61 K 31/575

A 61 K 31/58

A 61 P 25/00

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 25/18

A 61 P 25/04

A 61 P 25/14

A 61 P 25/16

A 61 P 25/28

A 61 P 25/20

A 61 P 27/16

【手続補正書】

【提出日】平成27年9月25日 (2015.9.25)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

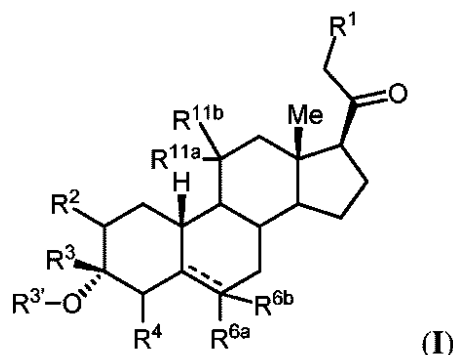
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1 2 6】



またはその薬学的に許容され得る塩であって；

式中：

R^1 は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A2}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{A1}$ 、 $-NHC(=O)OR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)SR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OS(=O)_2R^{A2}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S-S(=O)_2R^{A2}$ 、 $-S-S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S(=O)R^{A2}$ 、 $-SO_2R^{A2}$ または $-S(=O)_2OR^{A1}$ であり、ここで、 R^{A1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、または 2 つの R^{A1} 基が連結して、置換もしくは非置換の複素環式環もしくはヘテロアリール環を形成し； R^{A2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^2 は、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-OR^{B1}$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{B1})_2$ または $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ であり、ここで、 R^{B1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは 2 つの R^{B1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し；

R^3 は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

$R^{3'}$ は、水素、 $-C(=O)R^{C1}$ 、 $-C(=O)OR^{C1}$ 、 $-C(=O)SR^{C1}$ 、 $-C(=O)N(R^{C1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C2}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)_2R^{C2}$ 、 $-P(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)(OR^{C1})_2$ 、 $-P(=O)(R^{C2})_2$ または $-P(=O)(R^{C2})(OR^{C1})$ であり、ここで、 R^{C1} は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{C1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し； R^{C2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^4 は、水素、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換アリール、置換または非置換ヘテロアリールから選択され；

R^{6a} および R^{6b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

R^{11a} および R^{11b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、 $-OH$ 、 $-OR^{D1}$ 、 $-OC(=O)R^{D1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{D1})_2$ または $-NR^{D1}C(=O)R^{D1}$ であり、ここで、 R^{D1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{D1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成するか；あるいは R^{11a} および R^{11b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

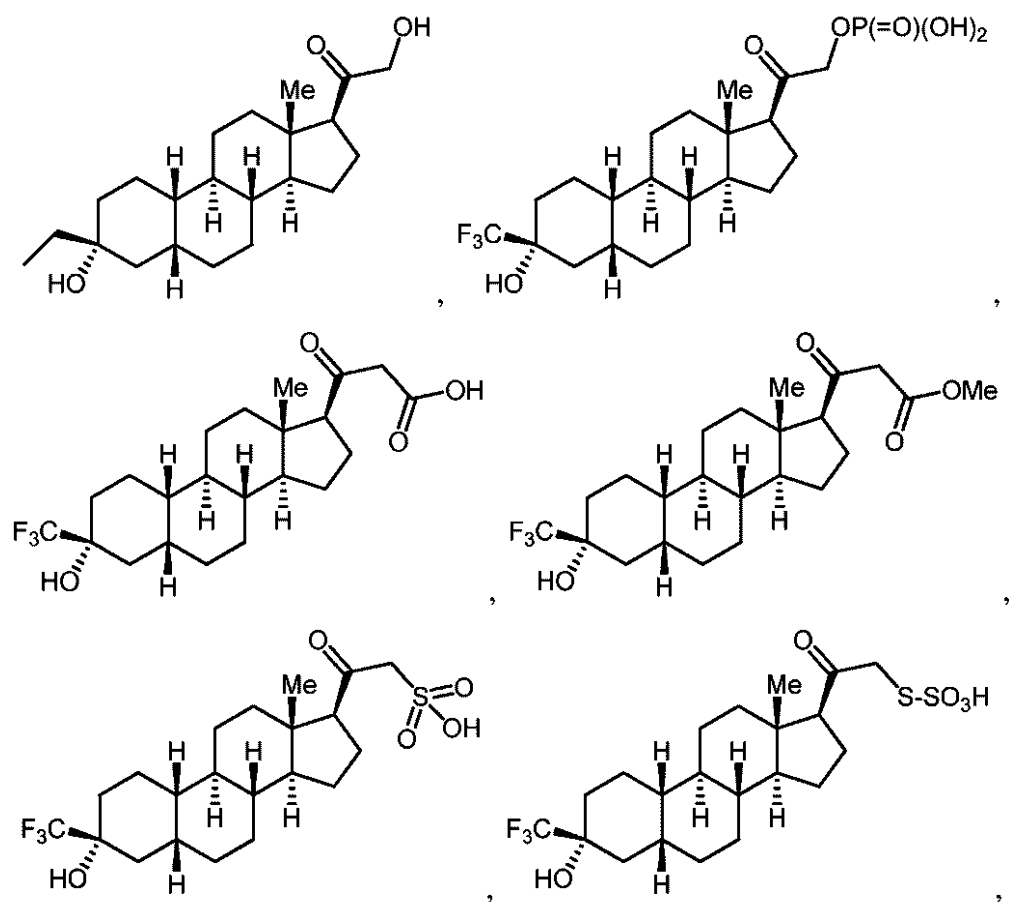
式中、

【化127】

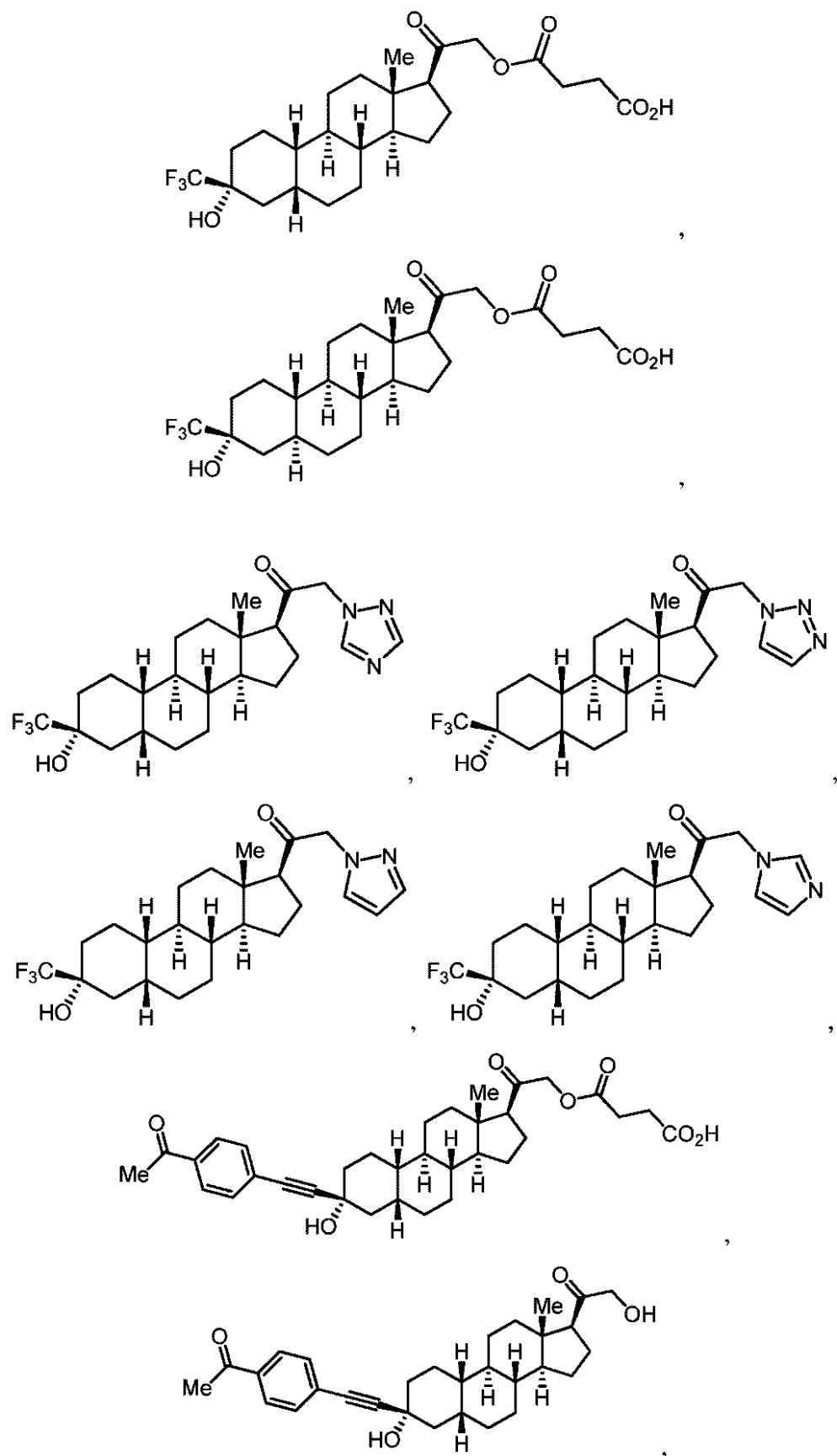
は、単結合または二重結合を表し、二重結合が環Bに存在する場合、 R^{6a} または R^{6b} の一方は、存在せず、単結合が環Bに存在する場合、C5における水素は、アルファ位またはベータ位であるが；

ただし、以下の化合物およびその塩：

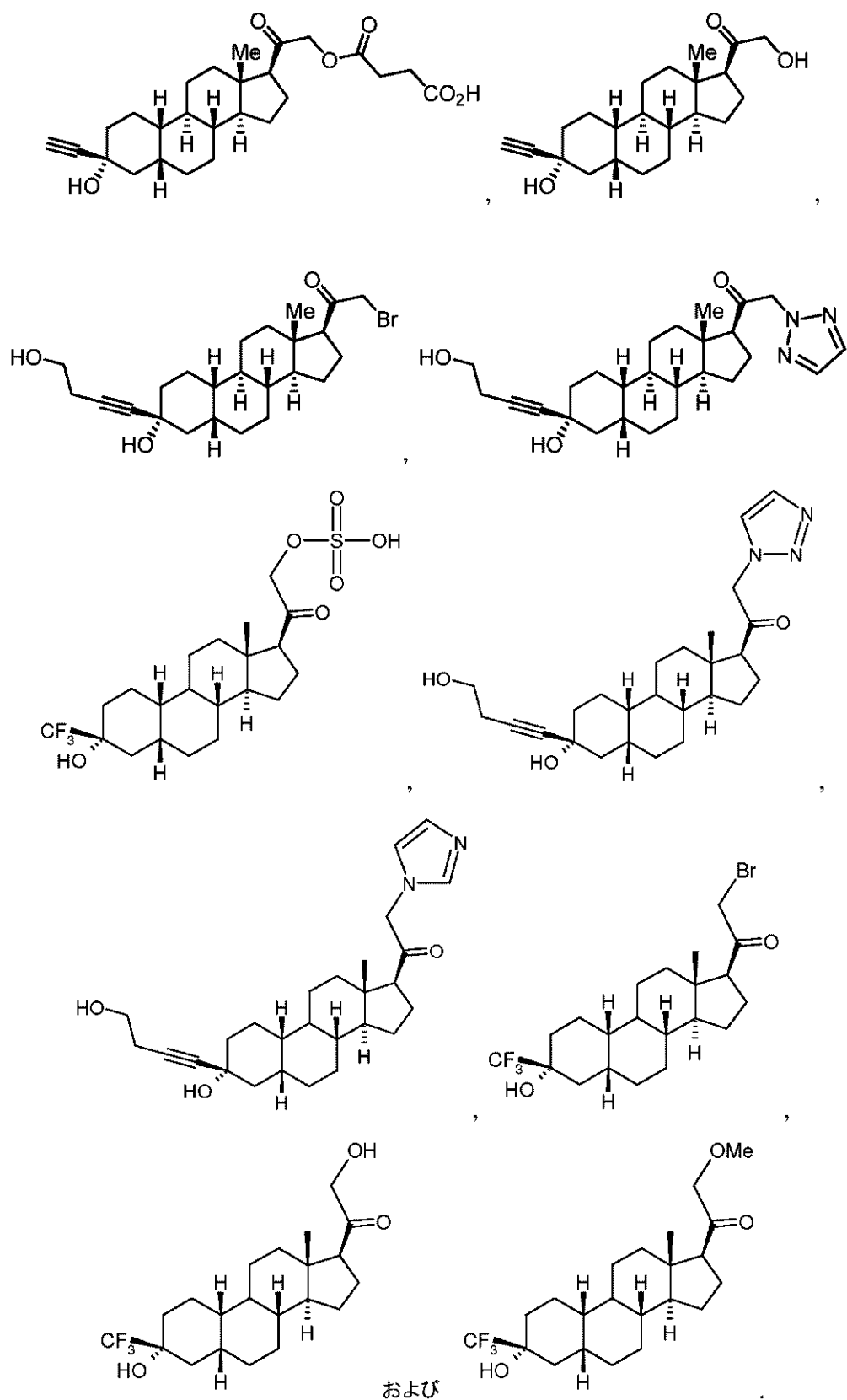
【化 1 2 8】



【化 1 2 9】



【化 1 3 0】

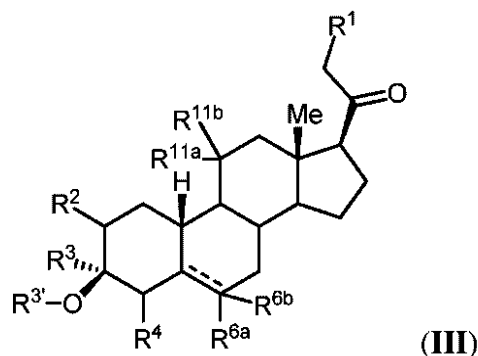


は、明確に排除される、式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 2】

式 (I I I) の化合物：

【化 1 3 1】



またはその薬学的に許容され得る塩であって；

式中：

R^1 は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A2}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{A1}$ 、 $-NHC(=O)OR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)SR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OS(=O)_2R^{A2}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S-S(=O)_2R^{A2}$ 、 $-S-S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S(=O)R^{A2}$ 、 $-SO_2R^{A2}$ または $-S(=O)_2OR^{A1}$ であり、ここで、 R^{A1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、または2つの R^{A1} 基が連結して、置換もしくは非置換の複素環式環もしくはヘテロアリール環を形成し； R^{A2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^2 は、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-OR^{B1}$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{B1})_2$ または $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ であり、ここで、 R^{B1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{B1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し；

R^3 は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

$R^{3'}$ は、水素、 $-C(=O)R^{C1}$ 、 $-C(=O)OR^{C1}$ 、 $-C(=O)SR^{C1}$ 、 $-C(=O)N(R^{C1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C2}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)_2R^{C2}$ 、 $-P(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)(OR^{C1})_2$ 、 $-P(=O)(R^{C2})_2$ または $-P(=O)(R^{C2})(OR^{C1})$ であり、ここで、 R^{C1} は、水

素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{C1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し； R^{C2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^4 は、水素、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換アリール、置換または非置換ヘテロアリールから選択され；

R^{6a} および R^{6b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

R^{11a} および R^{11b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OH、-OR^{D1}、-OC(=O)R^{D1}、-NH₂、-N(R^{D1})₂または-NR^{D1}C(=O)R^{D1}であり、ここで、 R^{D1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{D1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成するか；または R^{11a} および R^{11b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

式中、

【化132】

は、単結合または二重結合を表し、二重結合が環Bに存在する場合、 R^{6a} または R^{6b} の一方は存在せず、単結合が環Bに存在する場合、C5における水素は、アルファ位またはベータ位である、

式(III)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項3】

R^1 が、水素、ハロゲン、-OR^{A1}、-SR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、-OC(=O)SR^{A1}、-OC(=O)N(R^{A1})₂、-SC(=O)R^{A2}、-SC(=O)OR^{A1}、-SC(=O)SR^{A1}、-SC(=O)N(R^{A1})₂、-NHC(=O)R^{A1}、-NHC(=O)OR^{A1}、-NHC(=O)SR^{A1}、-NHC(=O)N(R^{A1})₂、-OS(=O)₂R^{A2}、-OS(=O)₂OR^{A1}、-S-S(=O)₂R^{A2}、-S-S(=O)₂OR^{A1}、-S(=O)R^{A2}、-SO₂R^{A2}または-S(=O)₂OR^{A1}である、請求項1または2に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項4】

R^1 が、水素、ハロゲン、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-S-S(=O)₂R^{A2}、置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項1または2に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項5】

R^2 が、水素、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、-OH、-OR^{B1}、-OC(=O)R^{B1}、-NH₂、-N(R^{B1})₂または-NR^{B1}C(=O)R^{B1}である、請求

項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

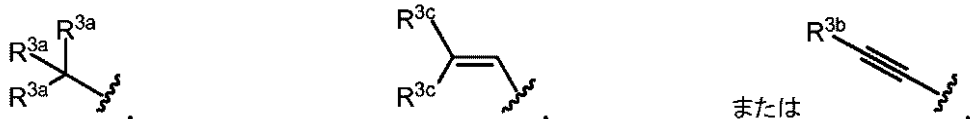
【請求項 6】

R^3 が、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 7】

R^3 が、式：

【化 1 3 3】



の基であり、式中、 R^{3a} の各存在は、水素、ハロまたは $-OR^{F1}$ であり、 R^{F1} は、置換または非置換アルキルであり； R^{3b} および R^{3c} の各存在は、独立して、水素、ハロまたは置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換カルボシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロシクリルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 8】

$R^{3'}$ が、水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 9】

R^4 が、水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 10】

R^{6a} および R^{6b} の各々が、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ (=O) 基を形成する、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 11】

R^{6a} と R^{6b} の両方が、水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 12】

R^{6a} および R^{6b} の一方が、非水素基である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 13】

R^{6a} が、非水素アルファ基である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 14】

R^{6a} が、非水素ベータ基である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 15】

R^{6a} が、ハロまたはアルキルであり、 R^{6b} が、水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 16】

R^{6a} および R^{6b} が、両方ともハロである、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 17】

R^{6a} および R^{6b} が、両方ともアルキルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 18】

R^{6a} および R^{6b} が、連結して、オキシ基を形成する、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 19】

R^{11a} および R^{11b} の各々が、独立して、水素、 $-OH$ 、 $-OR^{D1}$ 、 $-OC(=O)R^{D1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{D1})_2$ もしくは $-NR^{D1}C(=O)R^{D1}$ であるか、または R^{11a} および R^{11b} が、連結して、オキシ(=O)基を形成する、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 20】

R^{11a} と R^{11b} の両方が、水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 21】

R^{11a} および R^{11b} の一方が、非水素基である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

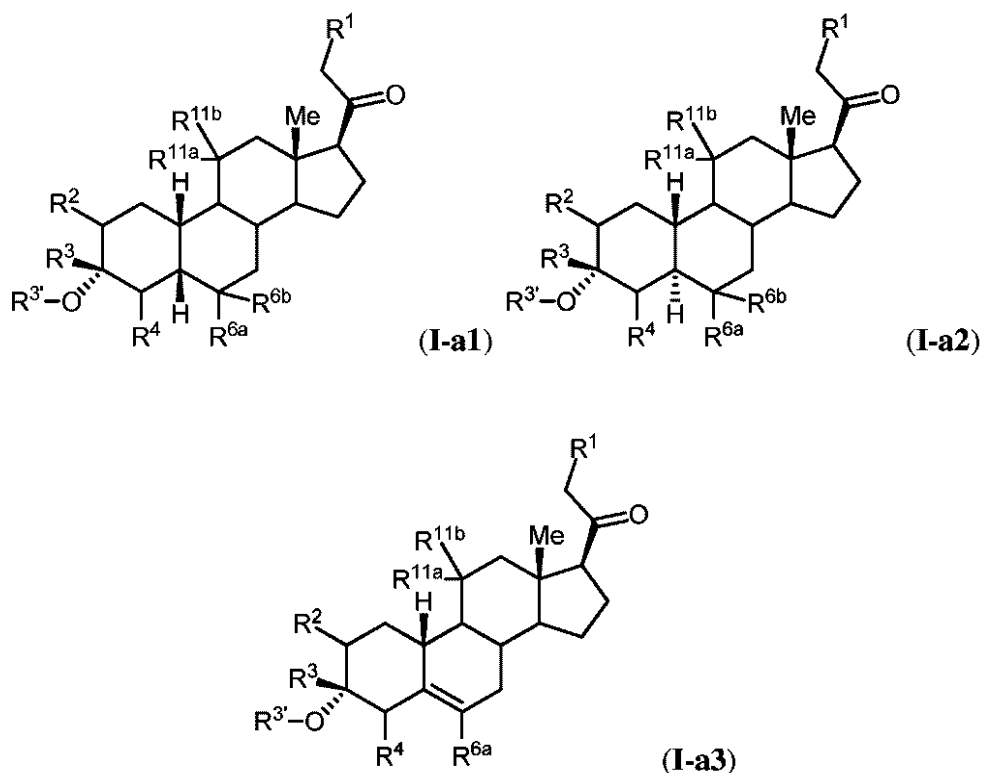
【請求項 22】

R^{11a} および R^{11b} が、連結して、オキシ基を形成する、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 23】

前記式 (I) の化合物が、式 (I-a1)、(I-a2) もしくは (I-a3) :

【化 134】

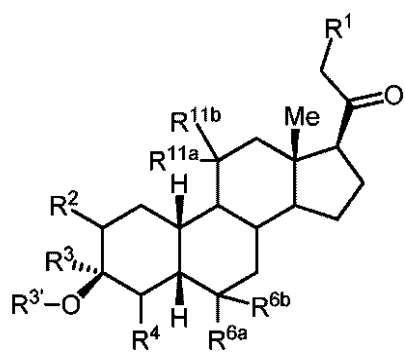


の化合物である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

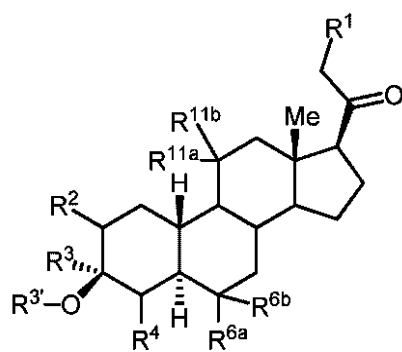
【請求項 24】

式 (III) の化合物が、式 (III-a1)、(III-a2) もしくは (III-a3) :

【化 1 3 5】

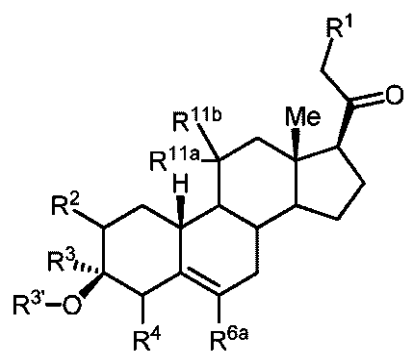


(III-a1)



(III-a2)

【化 1 3 6】



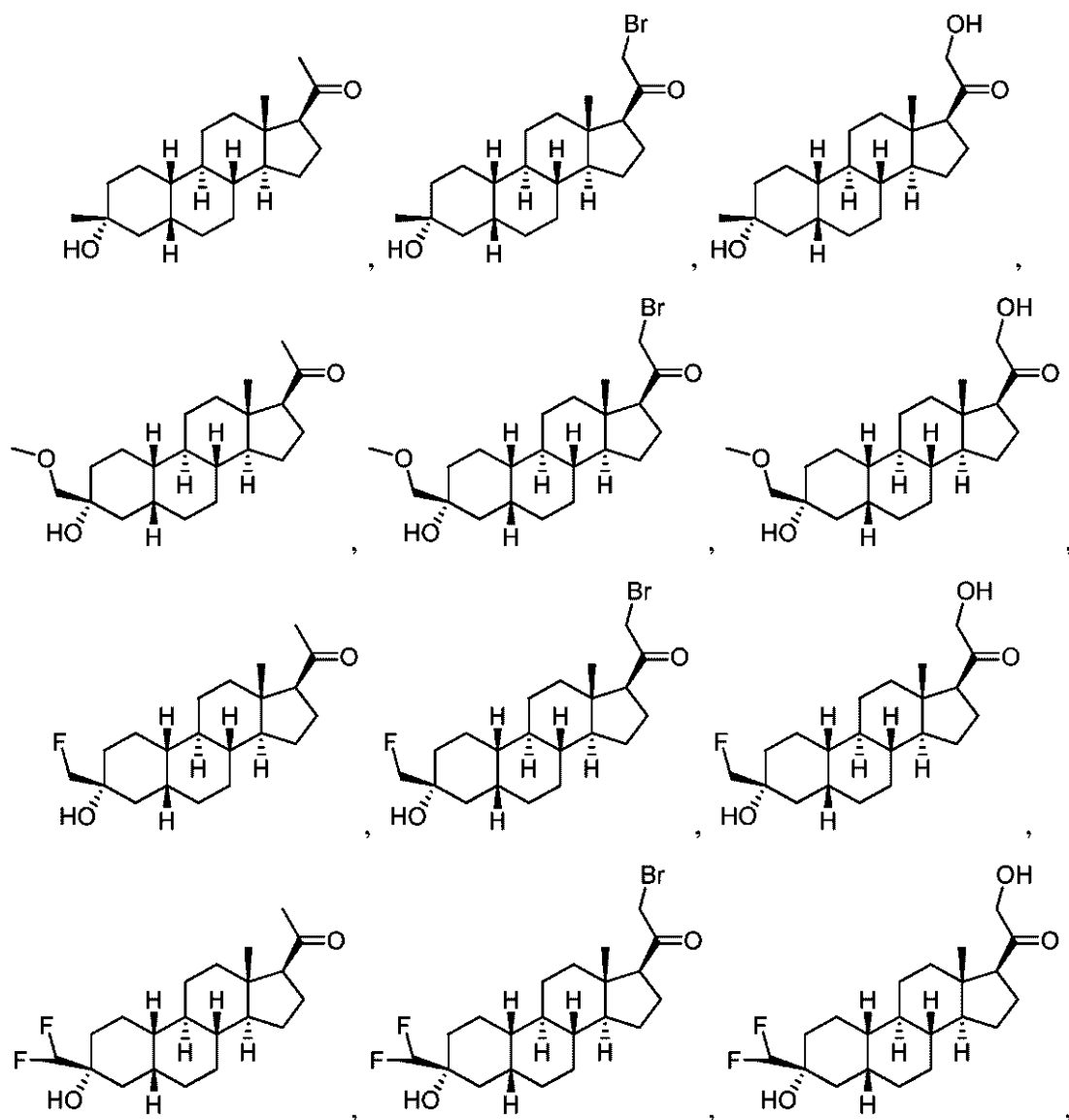
(III-a3)

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

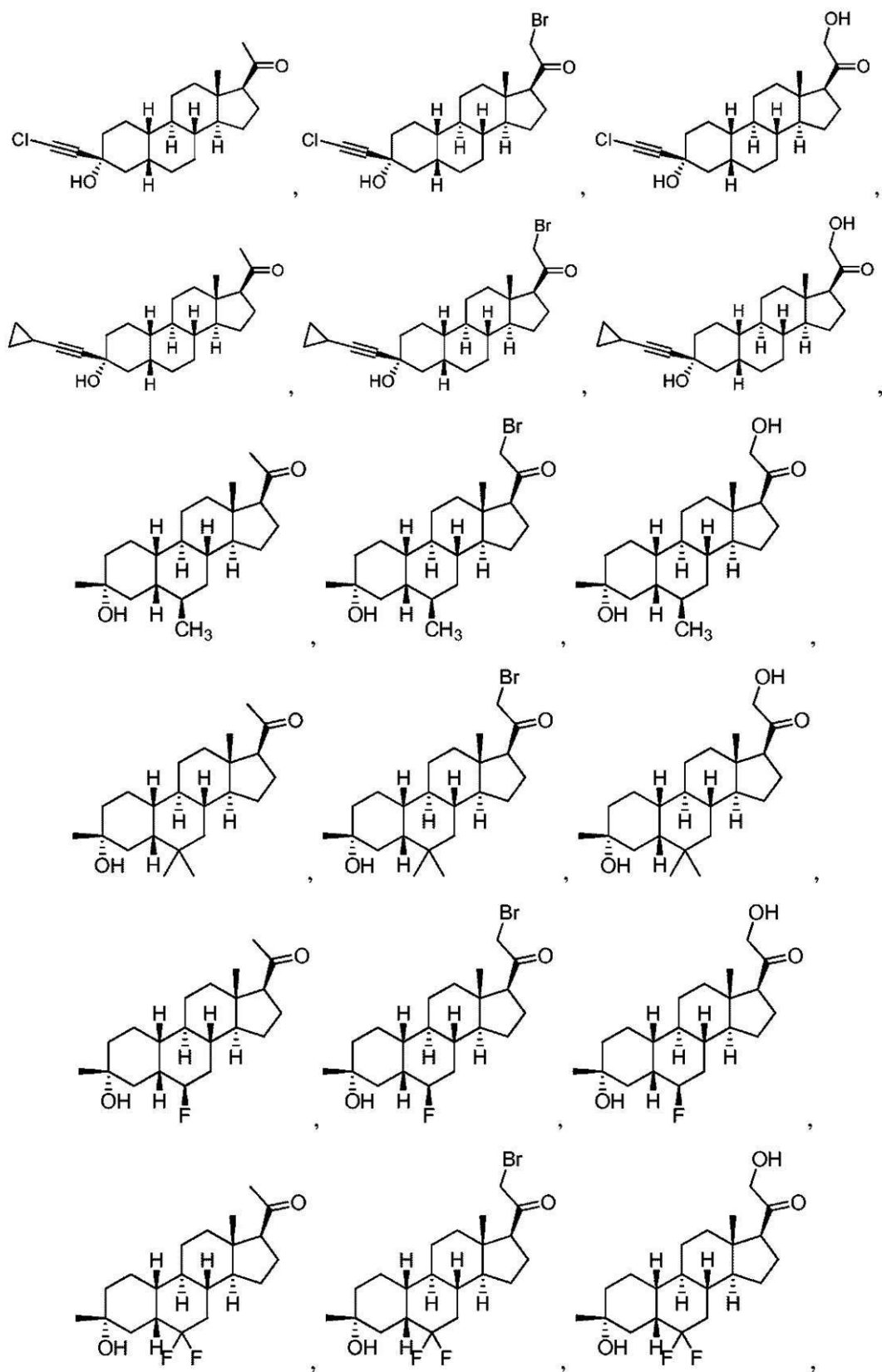
【請求項 2 5】

前記化合物が：

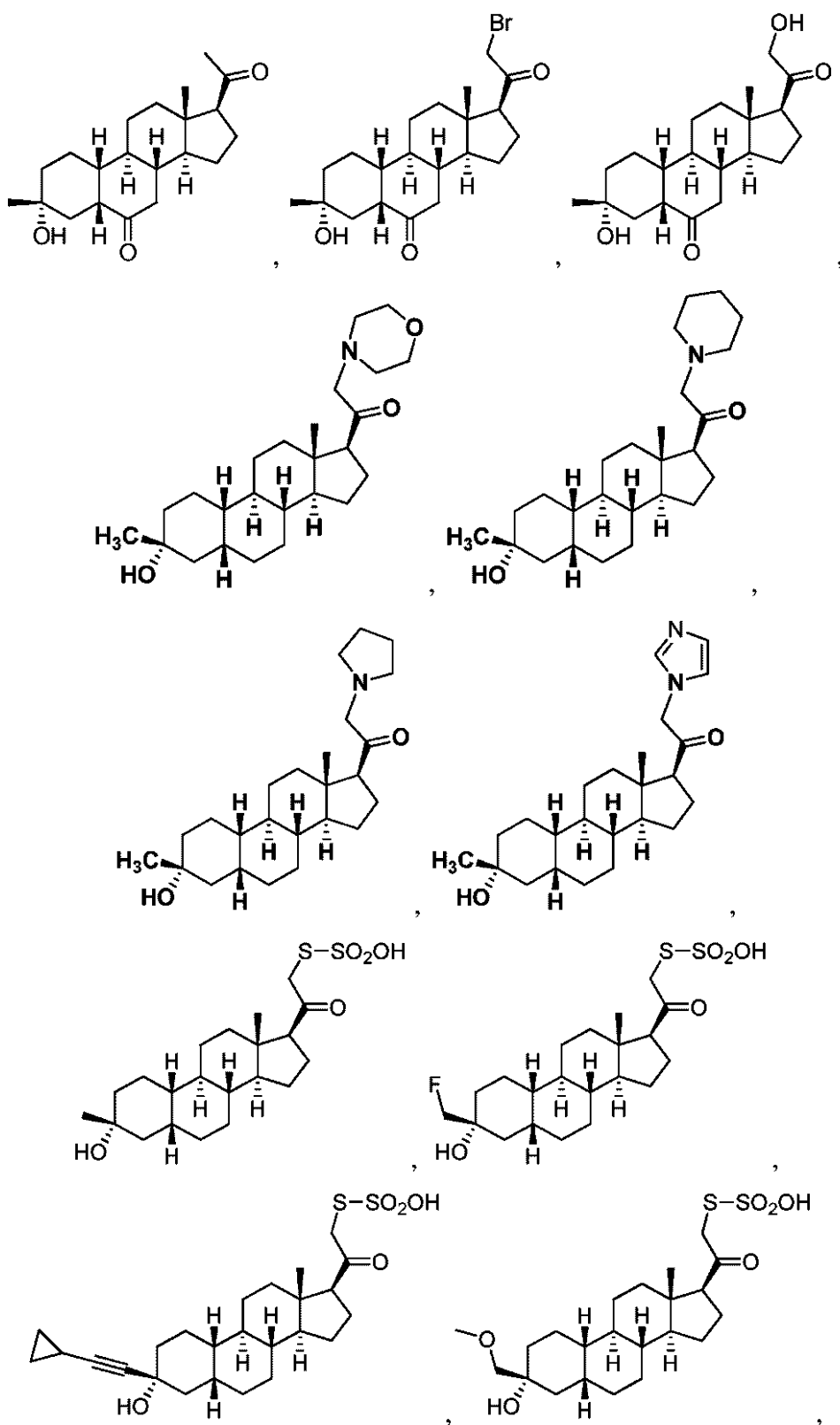
【化 1 3 7】



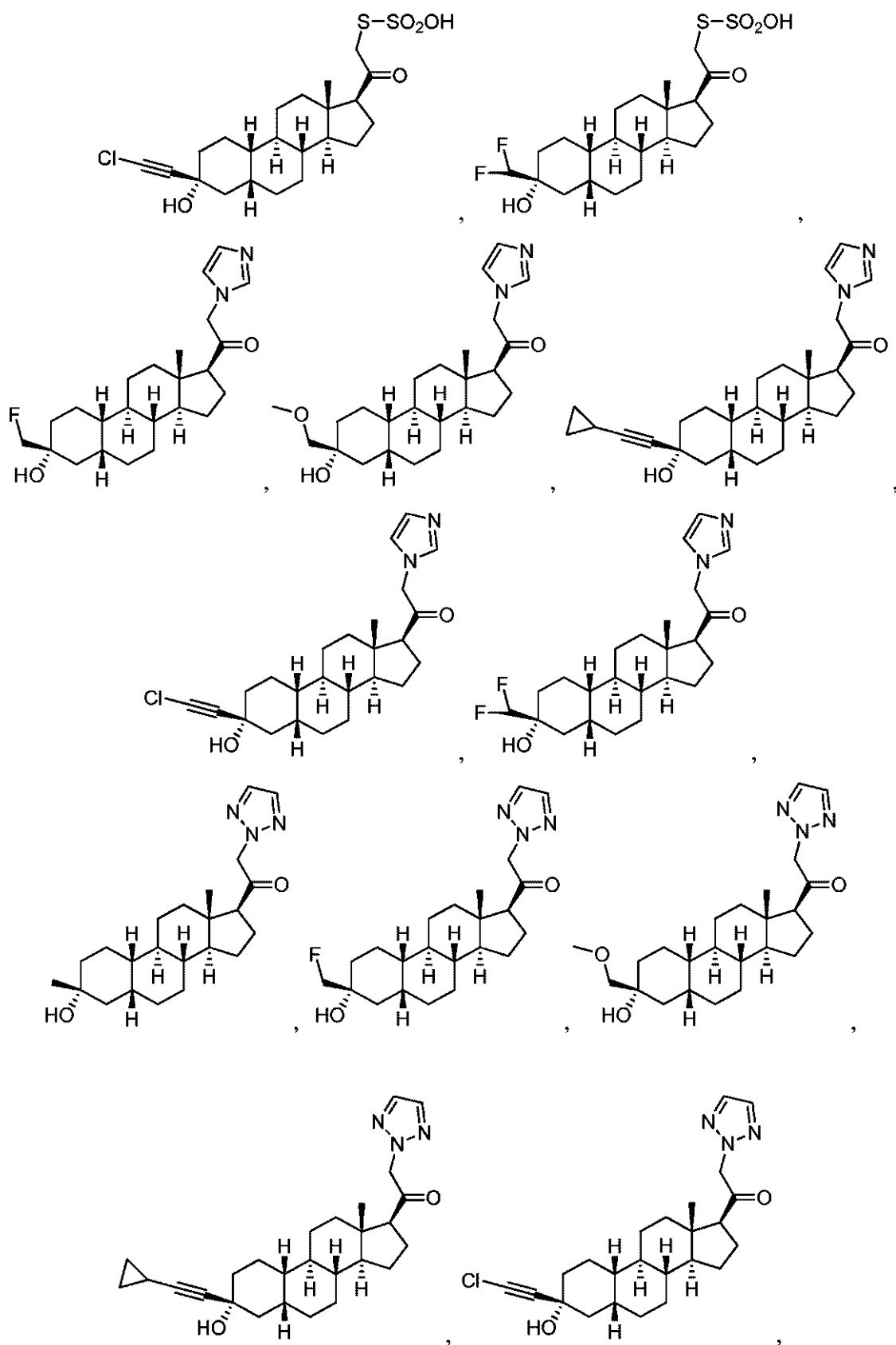
【化 1 3 8】



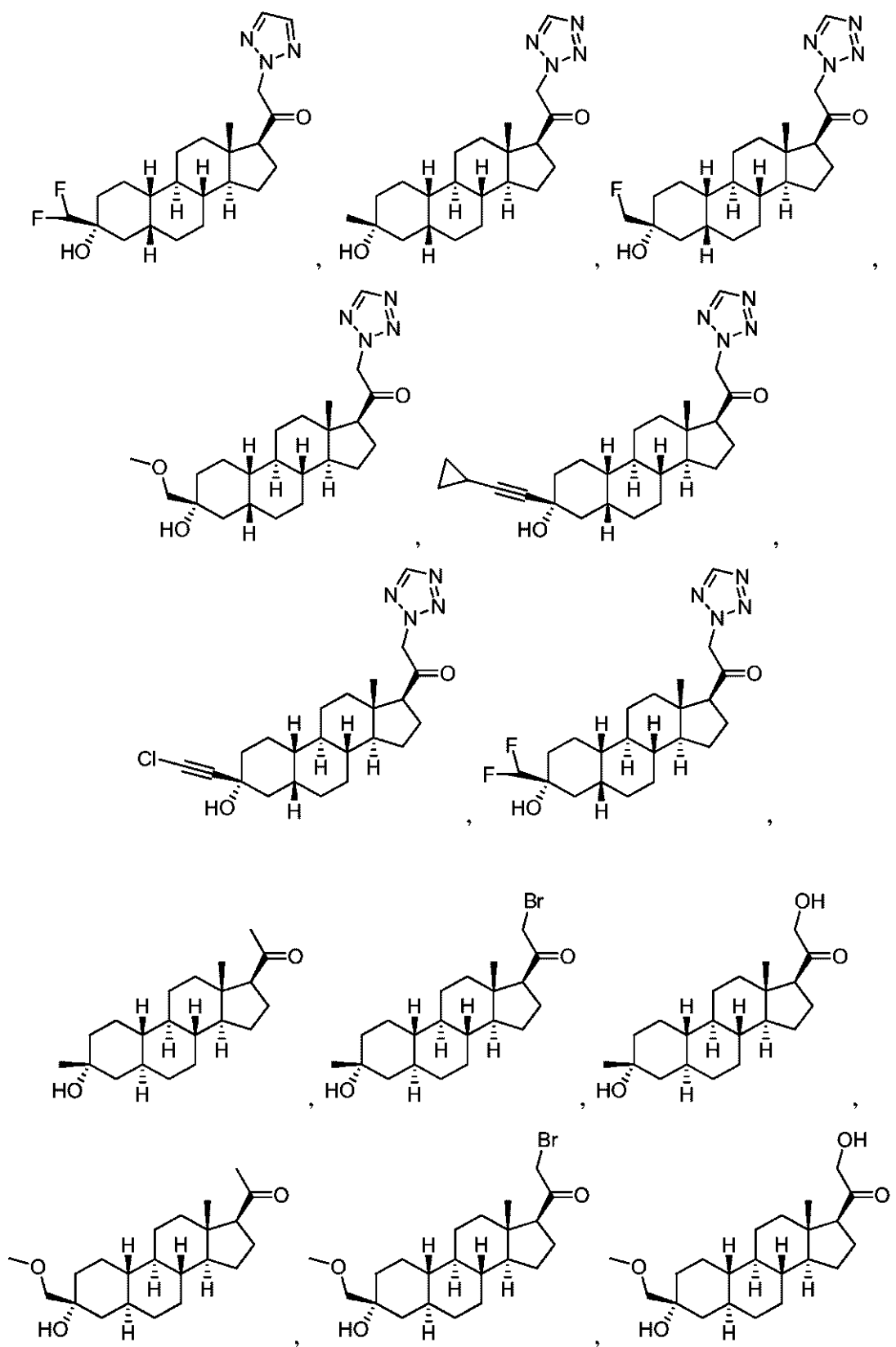
【化 1 3 9】



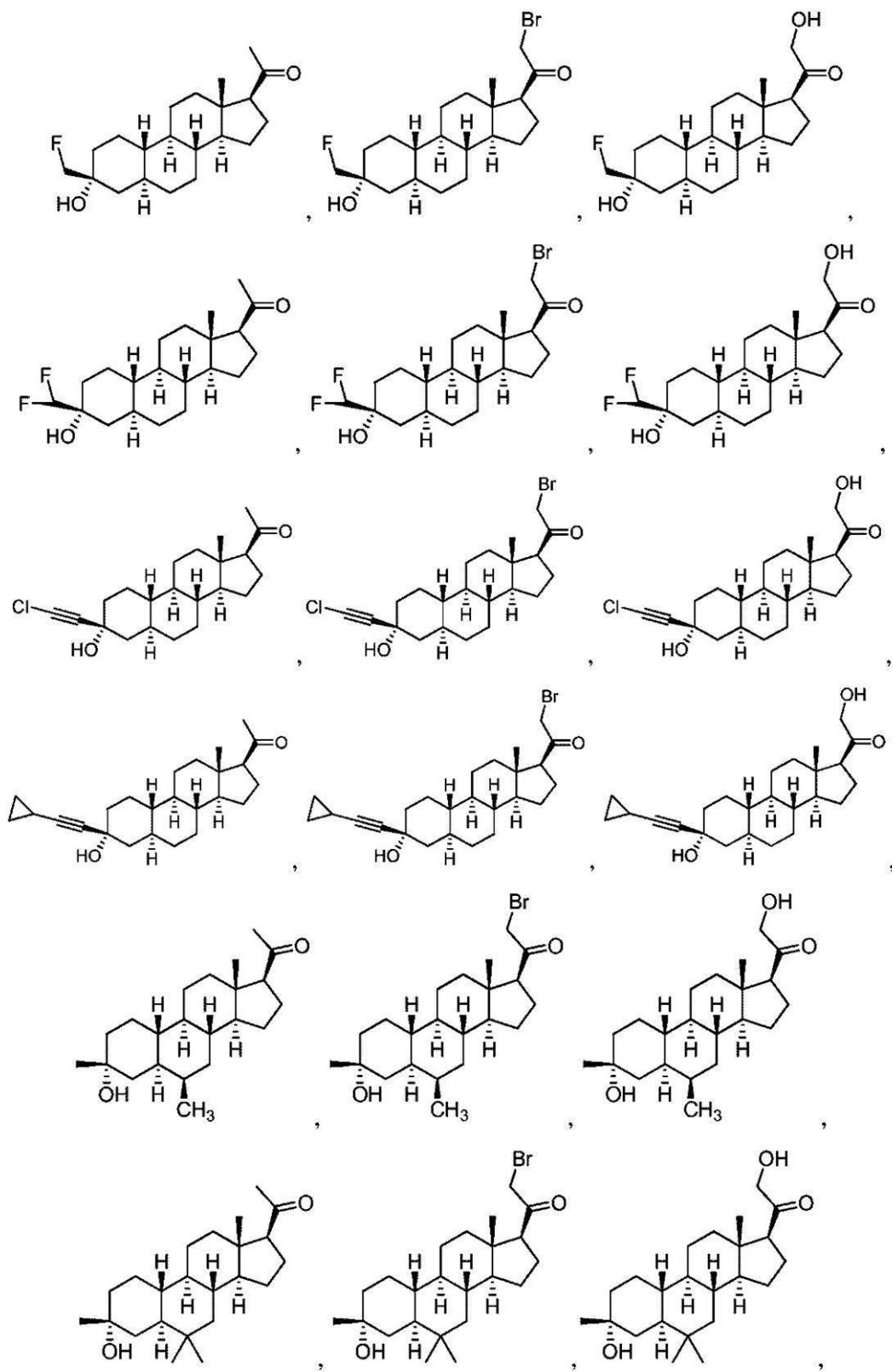
【化 1 4 0】



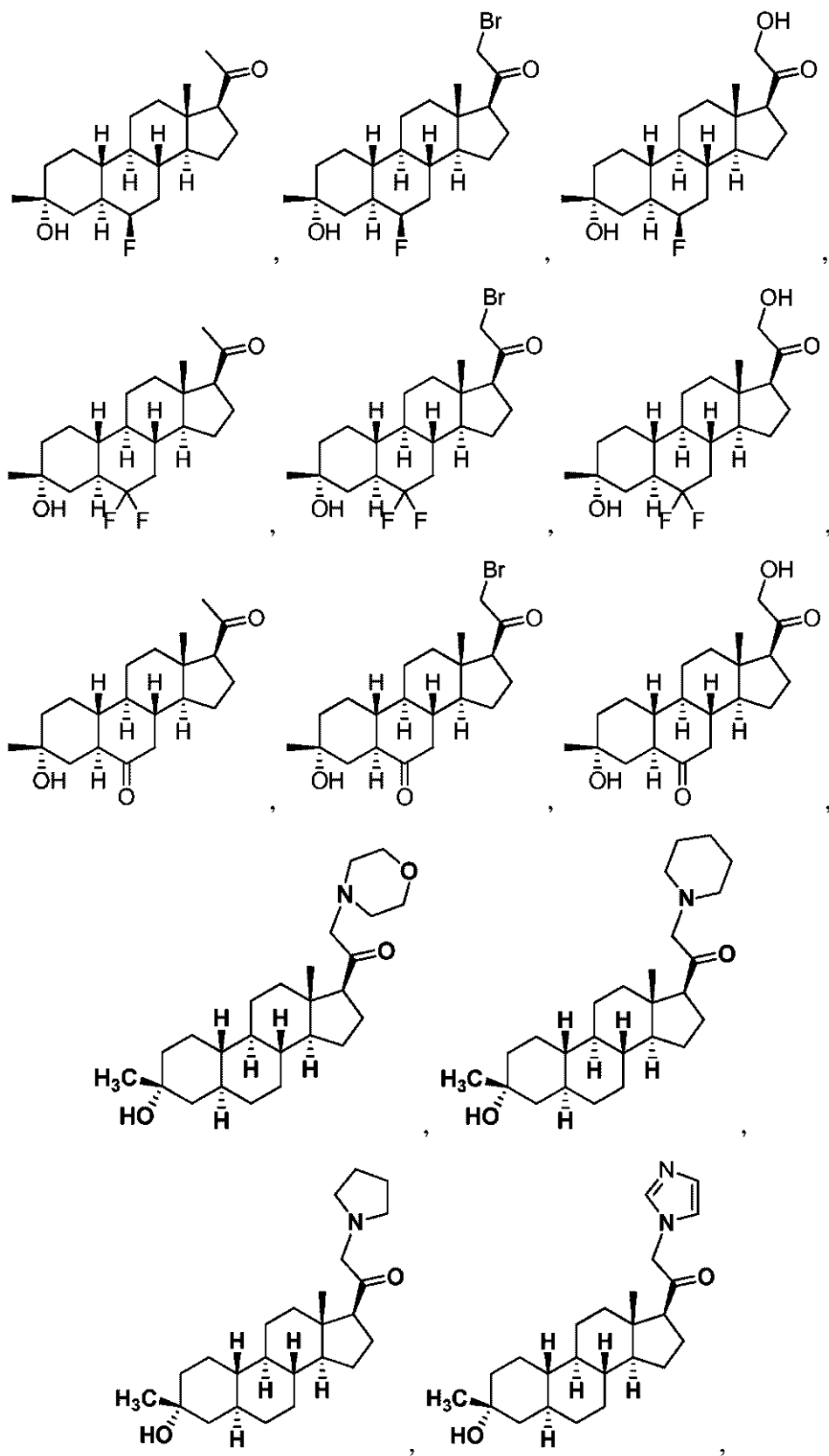
【化 1 4 1】



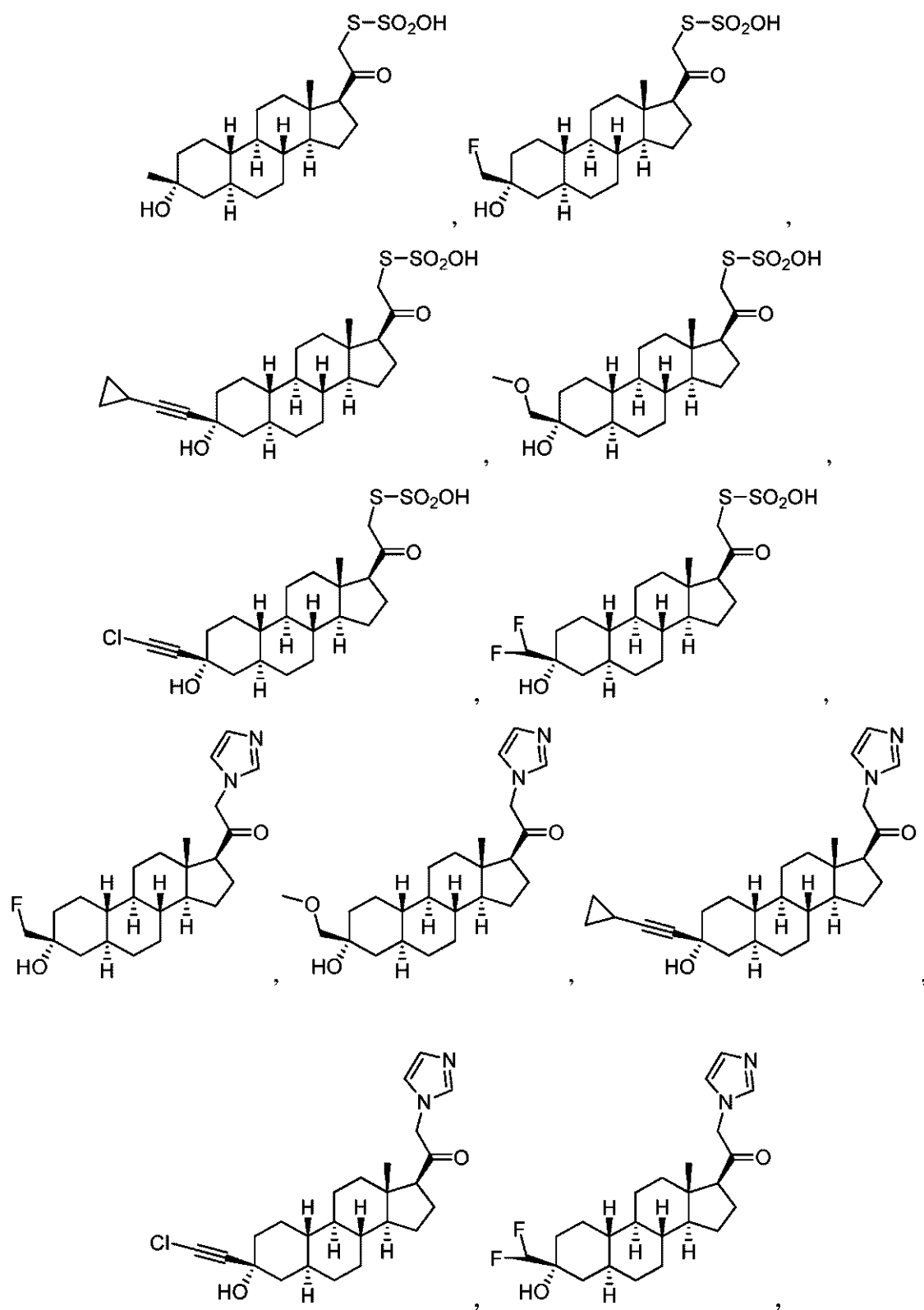
【化 1 4 2】



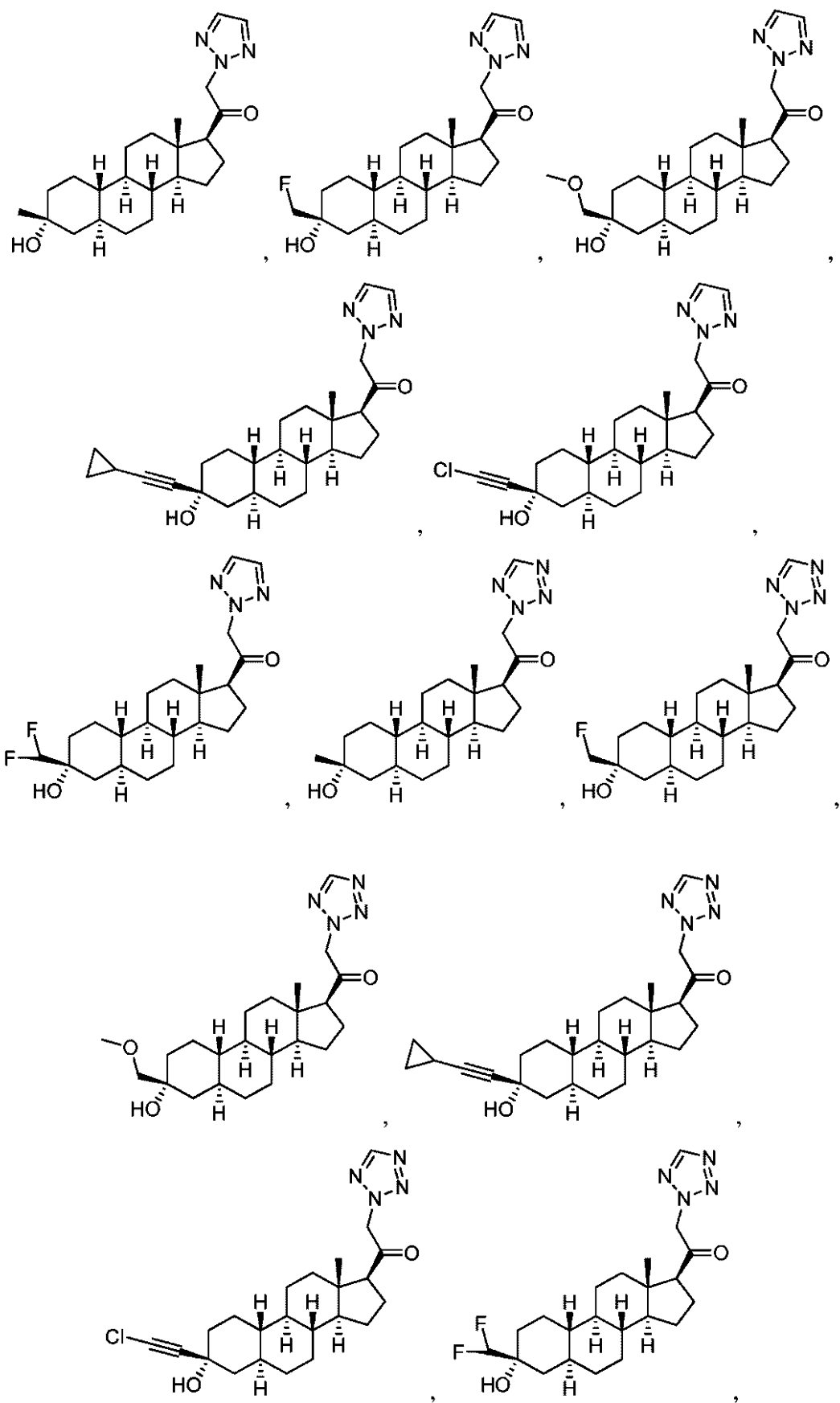
【化 1 4 3】



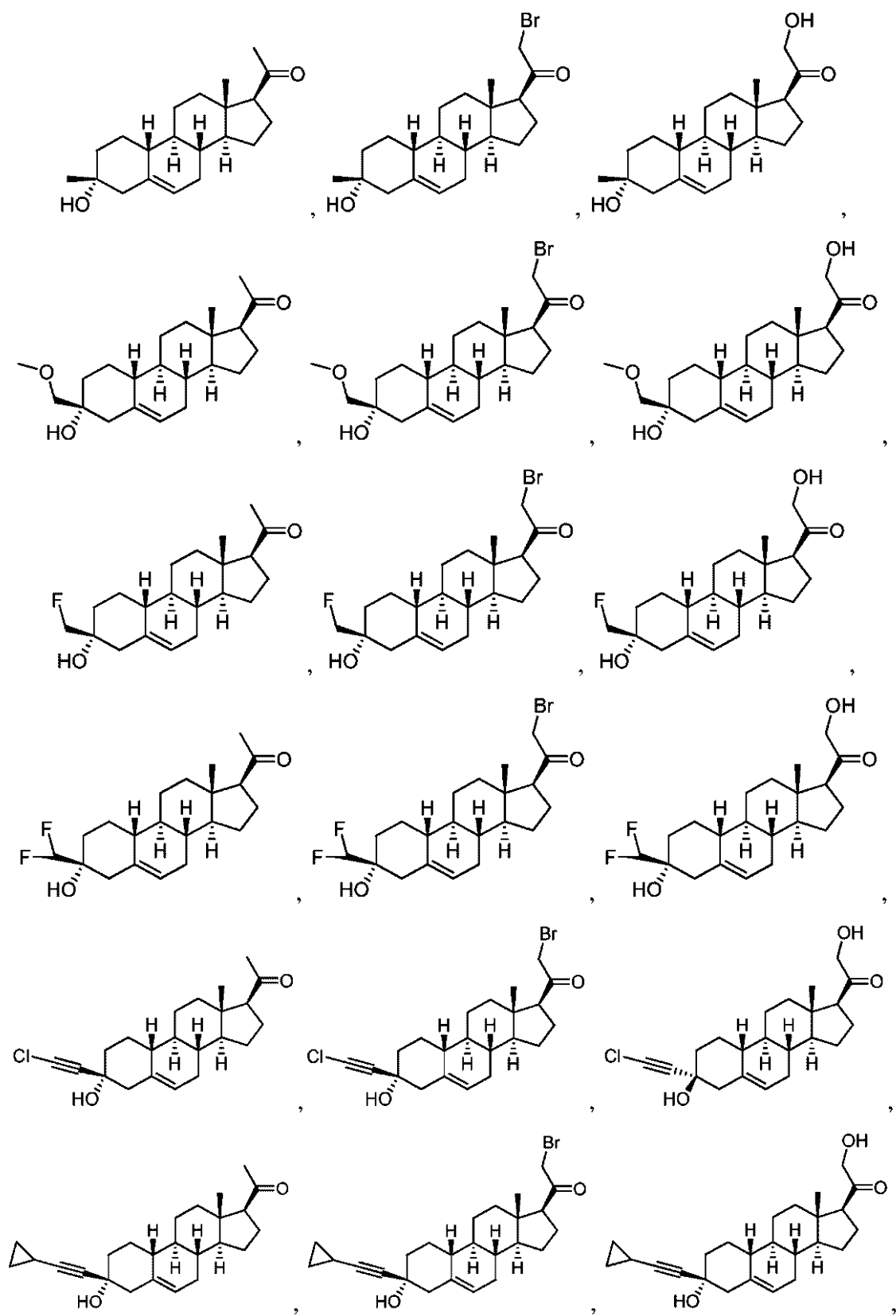
【化 1 4 4】



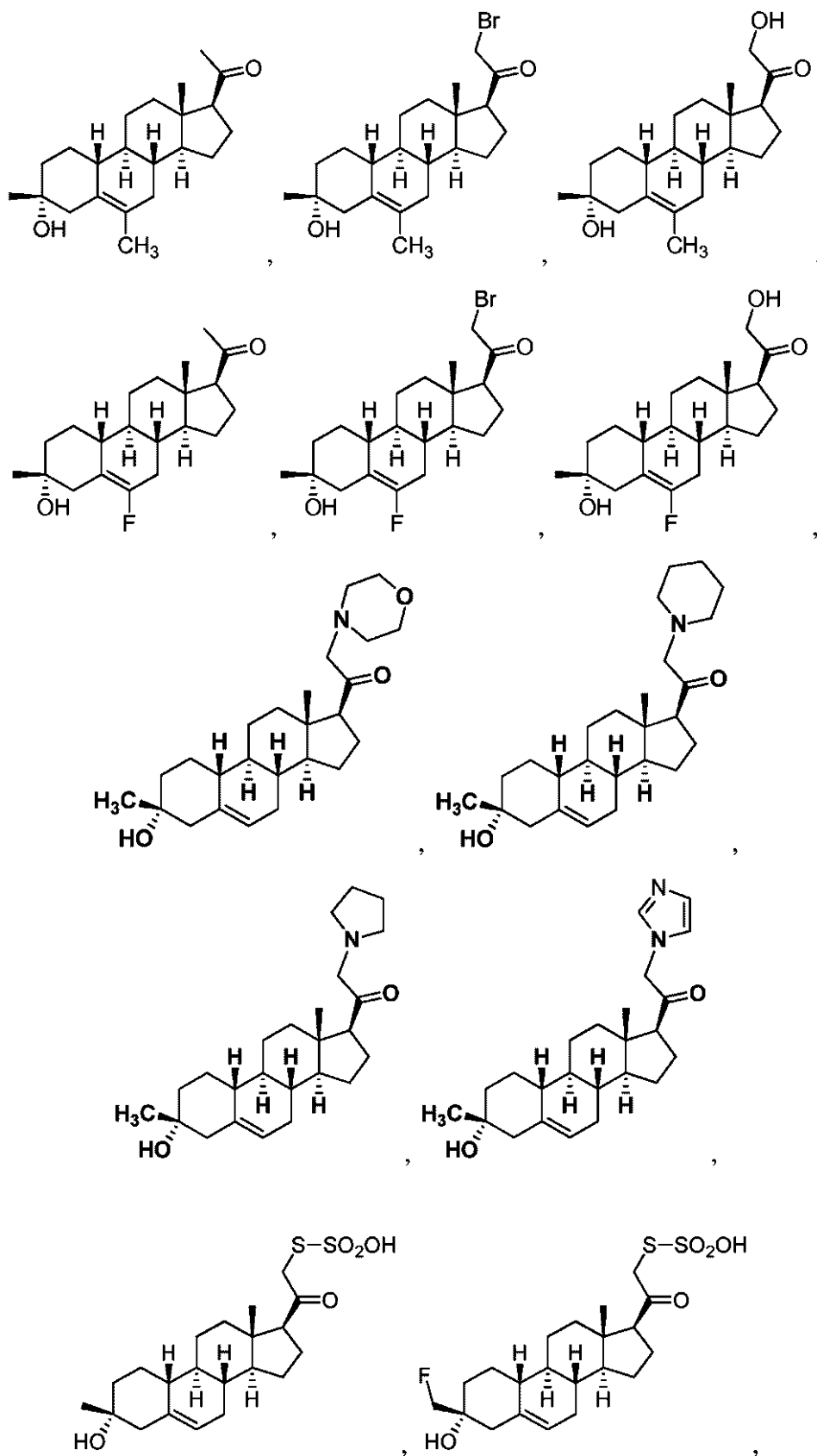
【化 1 4 5】



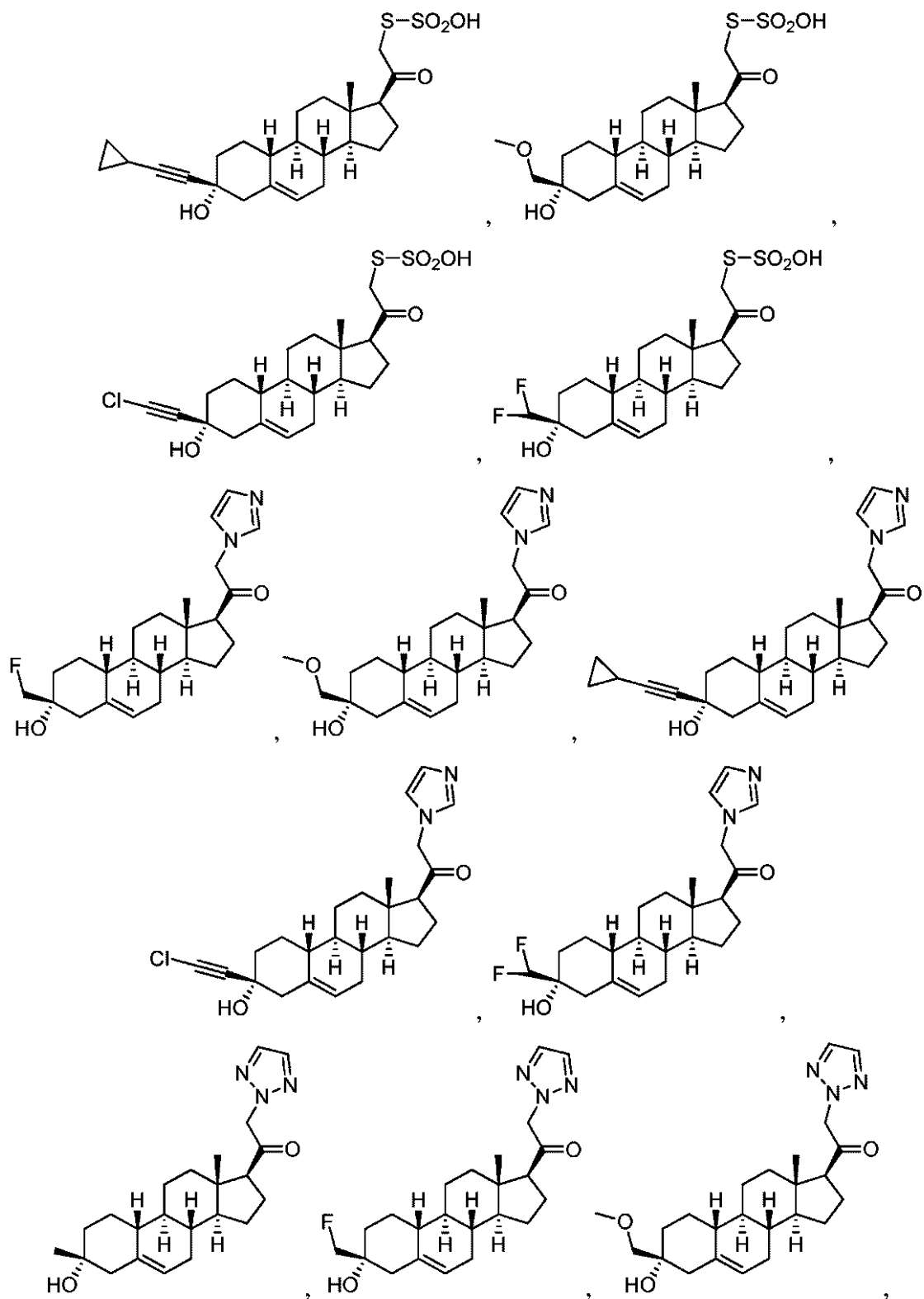
【化 1 4 6】



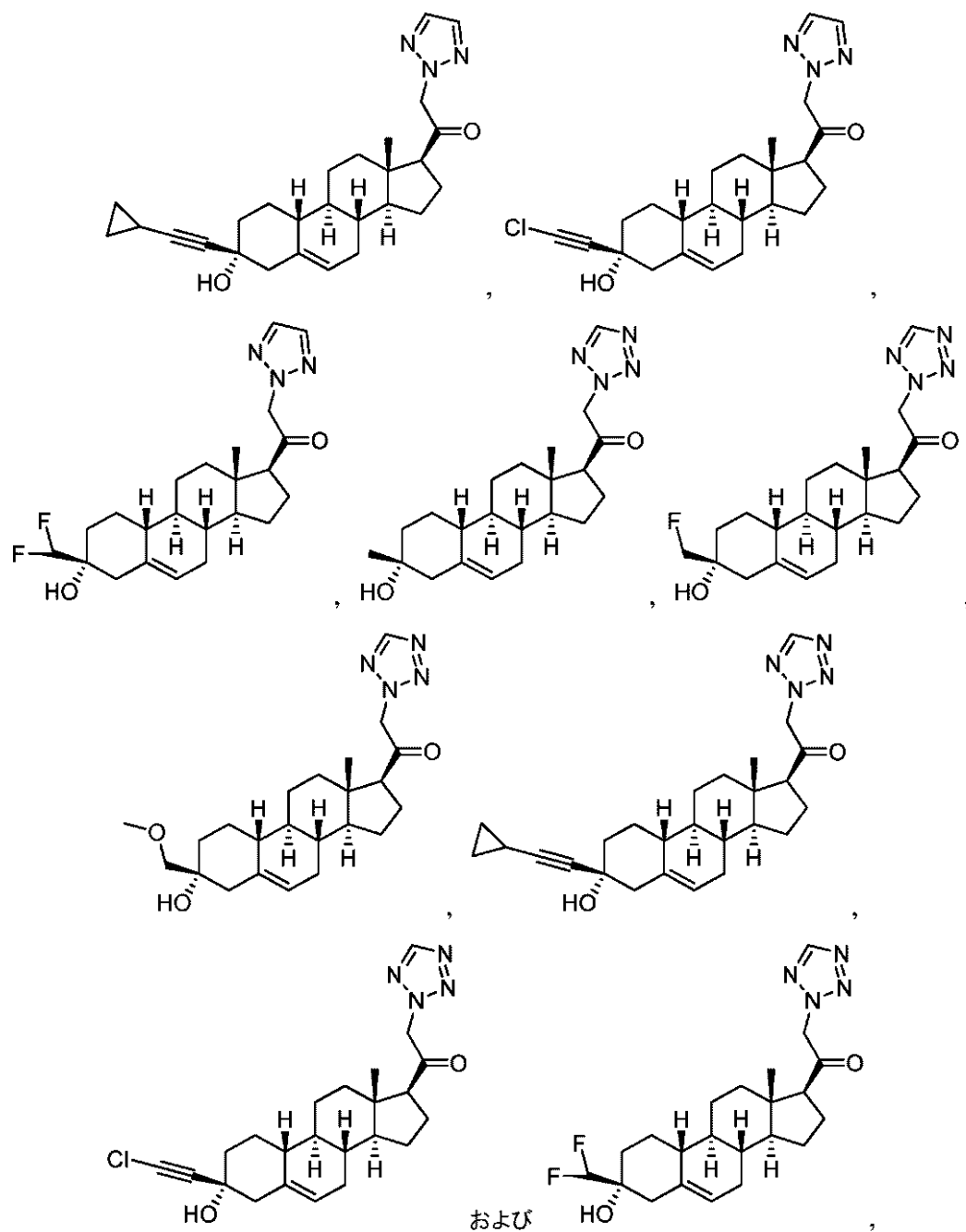
【化 1 4 7】



【化 1 4 8】



【化 1 4 9】

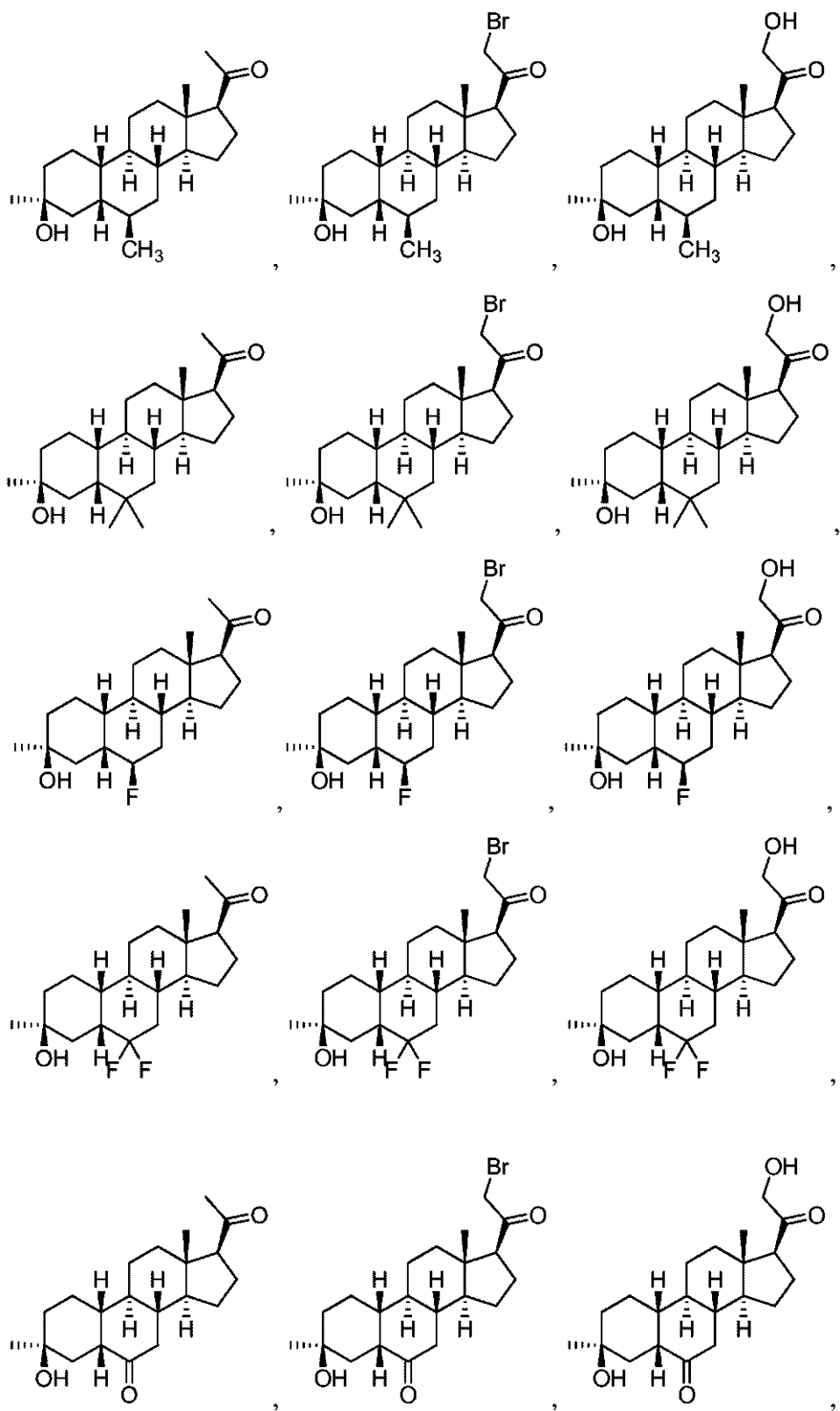


からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物 または その薬学的に許容され得る塩。

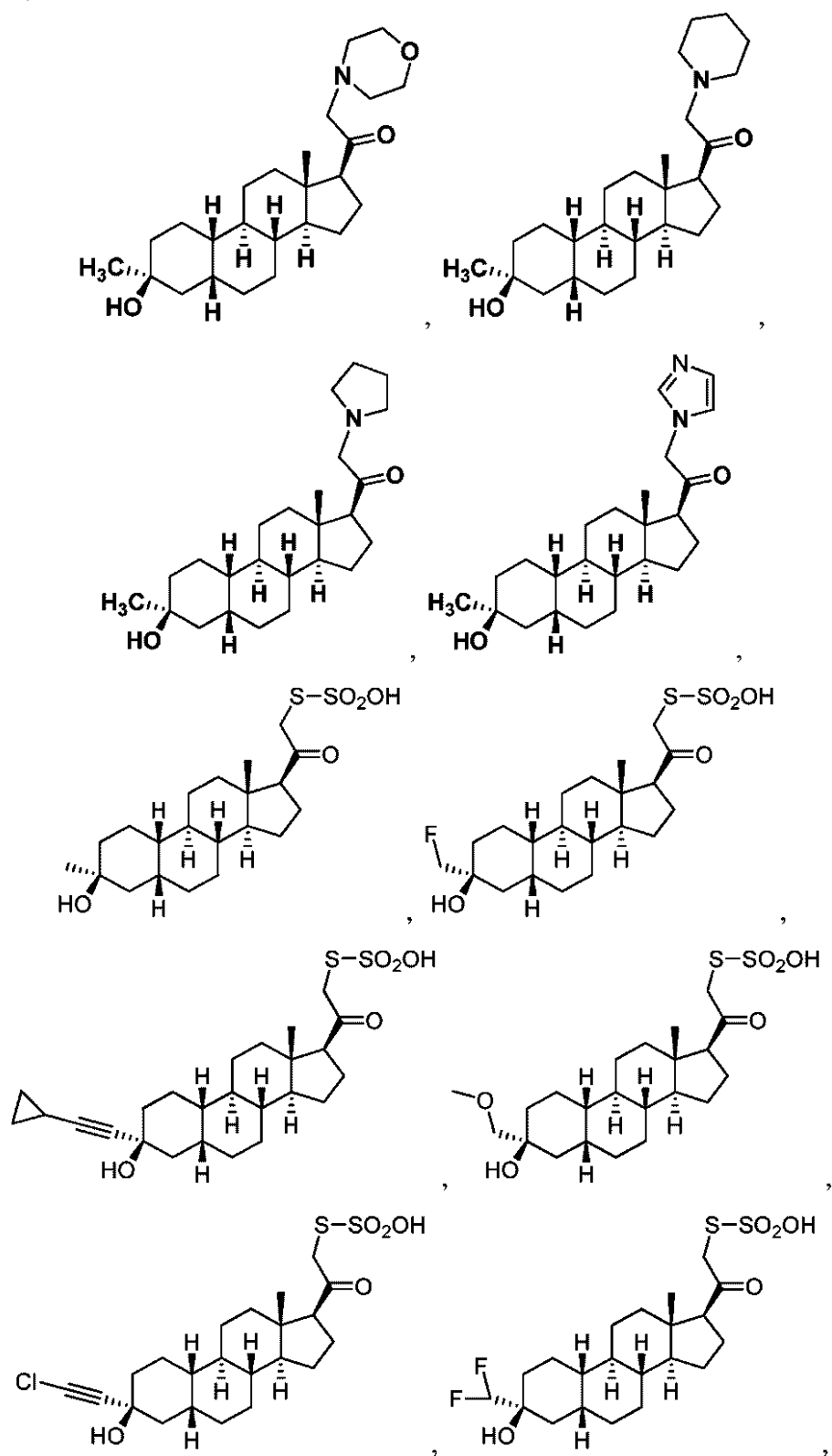
【請求項 2 6】
前記化合物が：

Figure 1 displays 12 chemical structures of steroid derivatives, arranged in a 4x3 grid. Each structure is a steroid nucleus with various substituents at the 3, 17, and 21 positions. The substituents include hydroxyl groups, ketone groups, bromine atoms, and various functional groups like methoxy, fluoro, chloro, and cyclopropylmethyl.

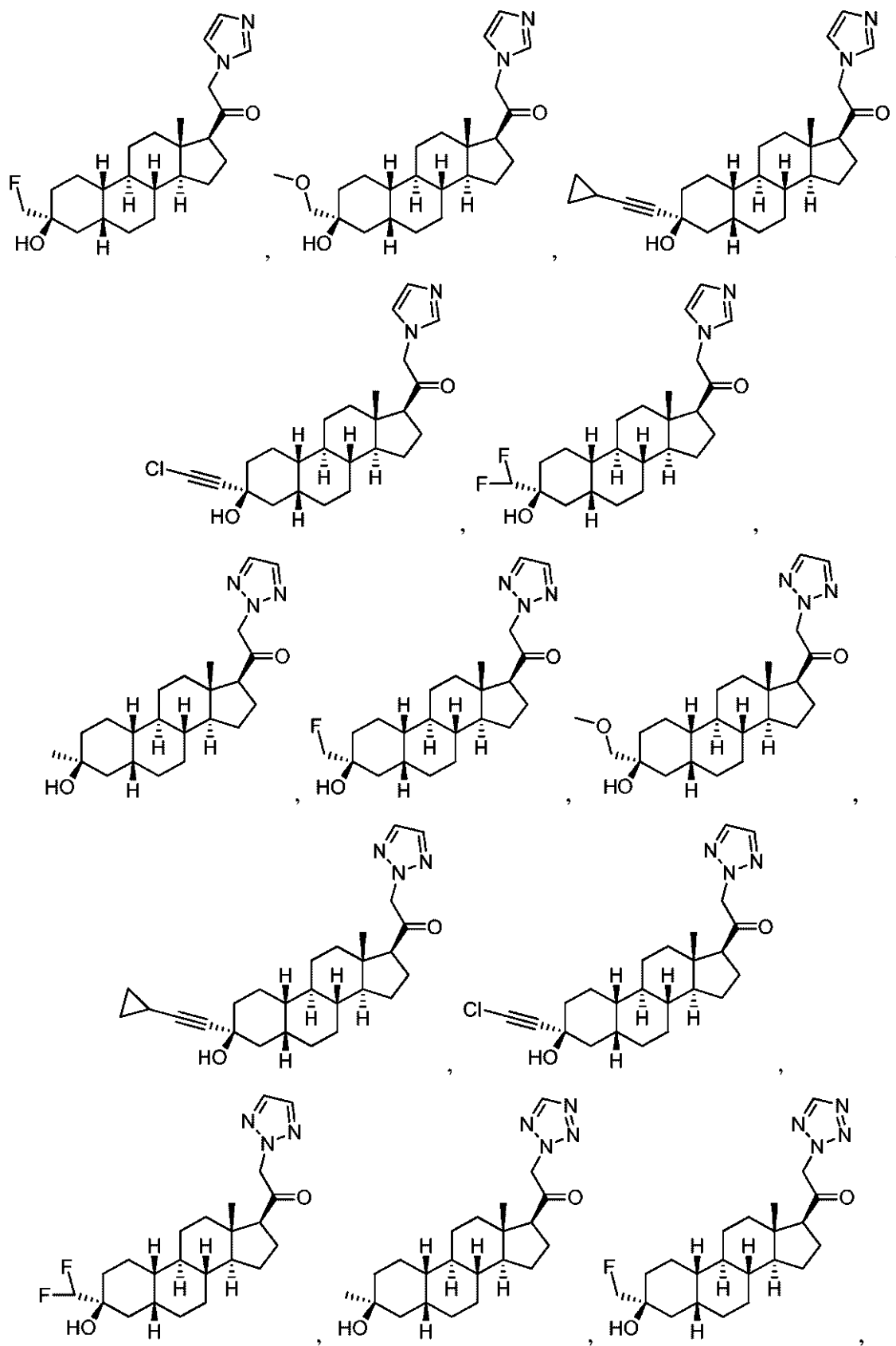
【化 1 5 1】



【化 1 5 2】



【化 1 5 3】



【化 1 5 4】

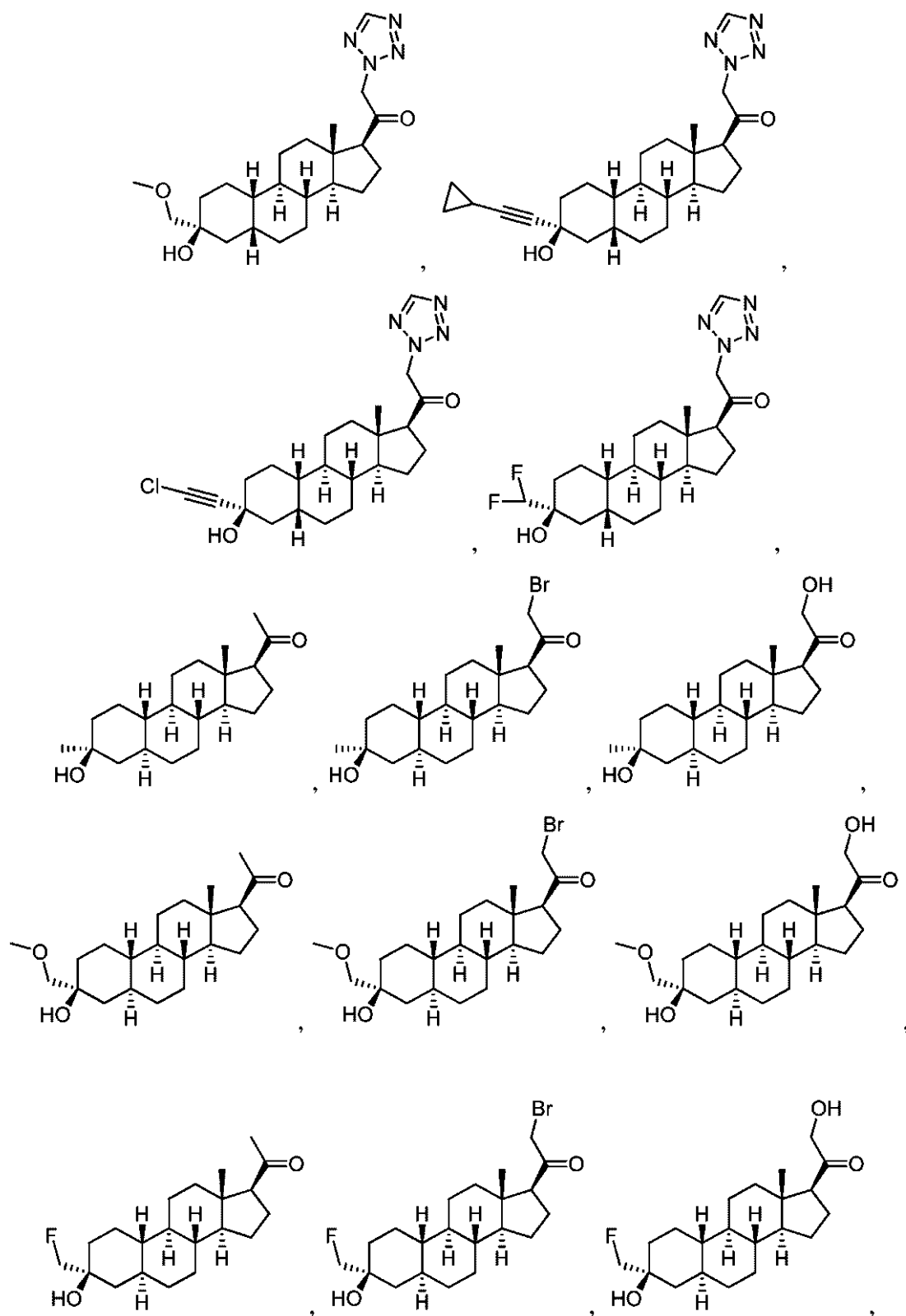
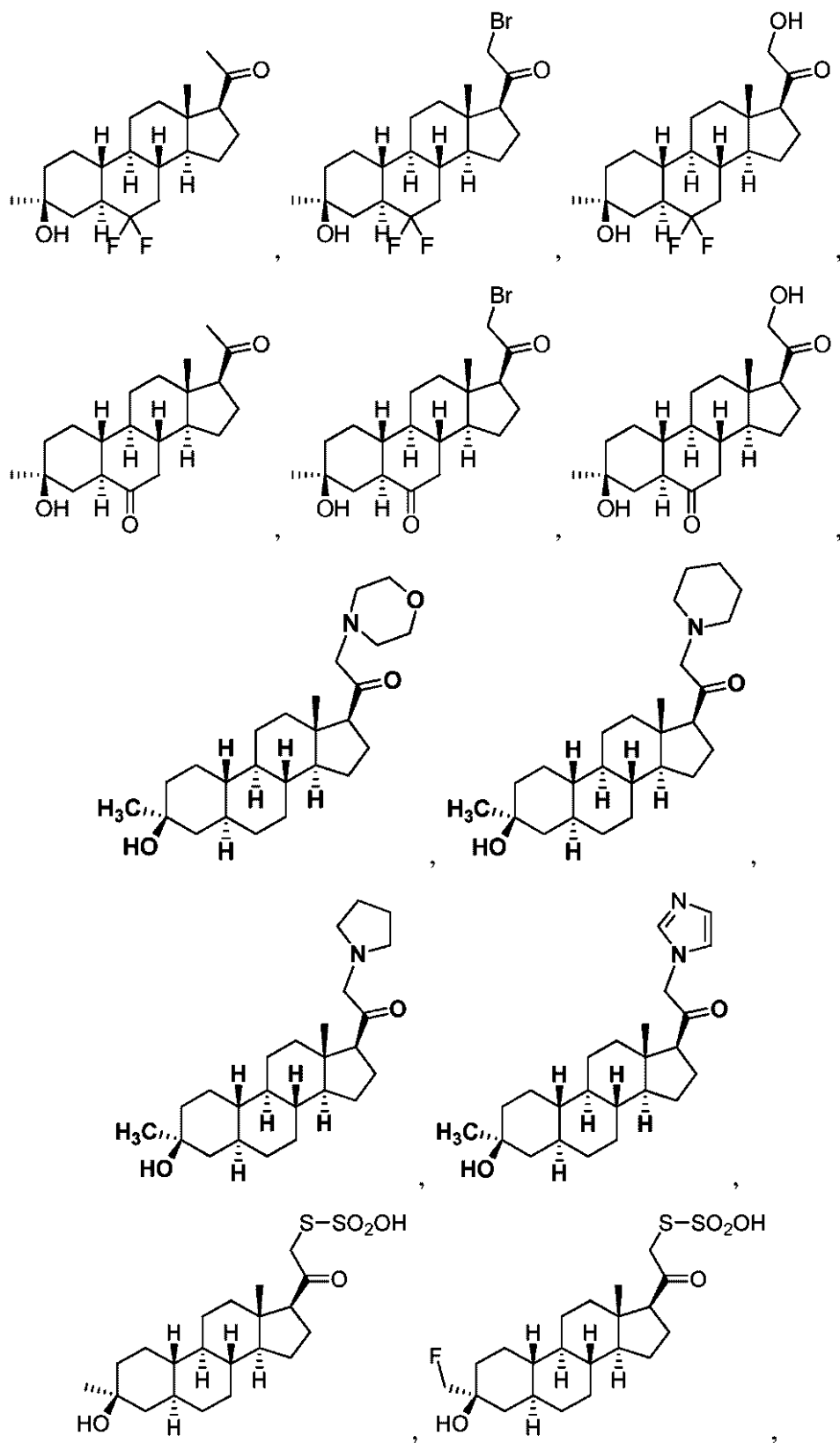
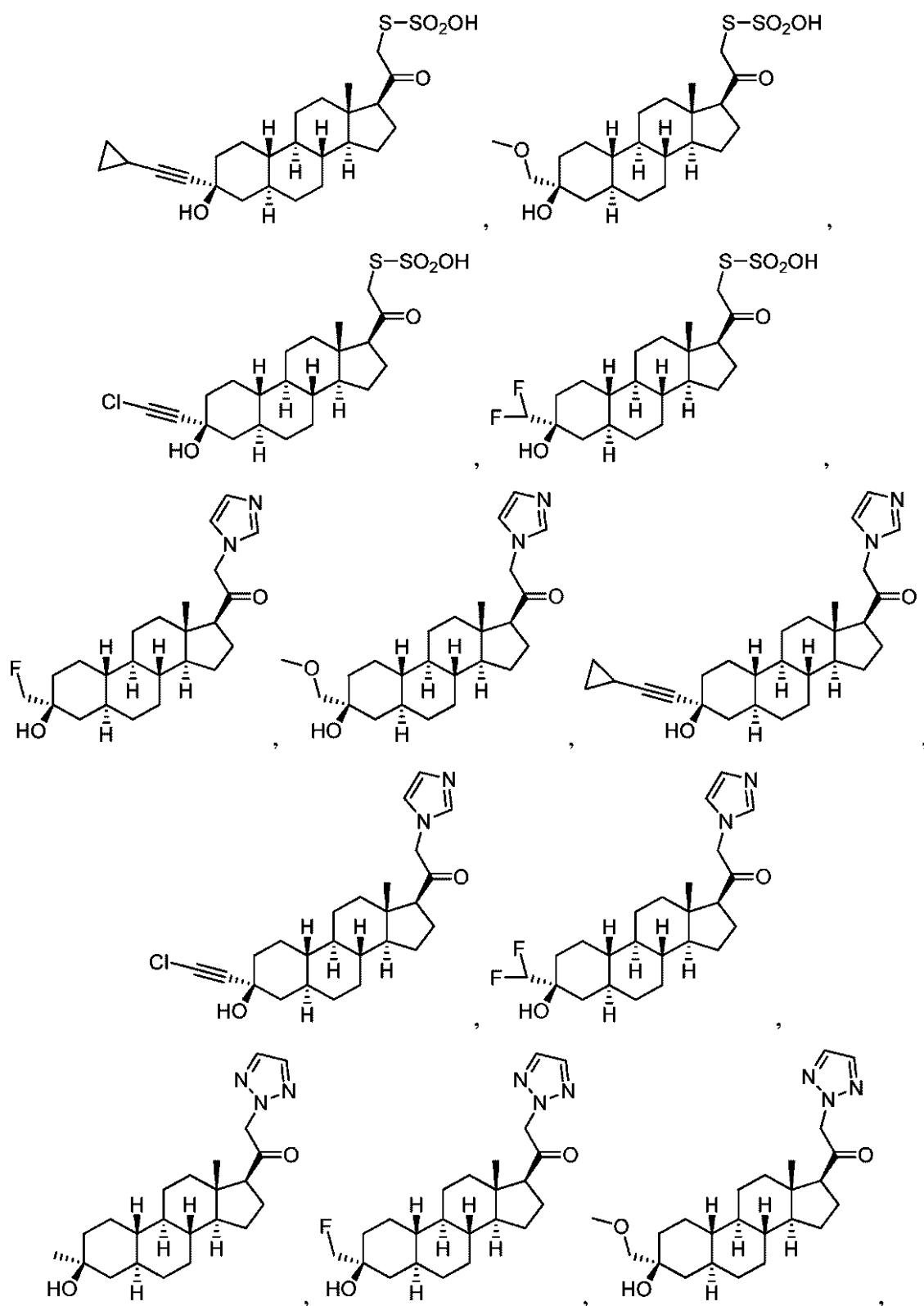


Figure 1 displays 12 chemical structures of steroid derivatives, arranged in a 4x3 grid. Each structure is a steroid nucleus with various substituents at the 3, 14, and 20 positions. The substituents include: 3-fluoro, 3-chloro, 3-ethynylcyclopropyl, 3-hydroxy, 14-bromoacetyl, 14-hydroxyacetyl, 14-methyl, and 14-fluoro. The structures are labeled with numbers 1 through 12 in the bottom right corner of each cell.

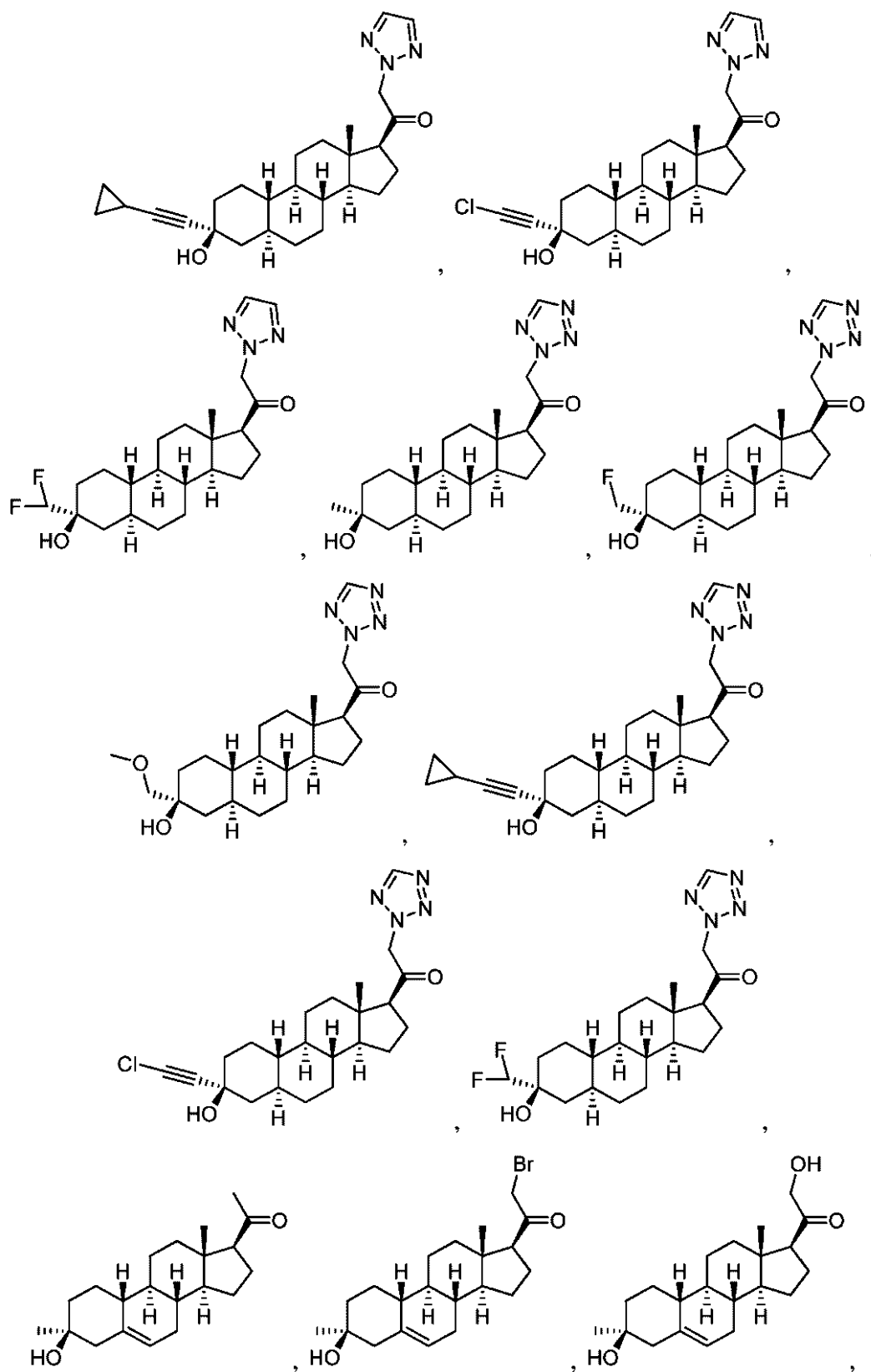
【化 1 5 6】



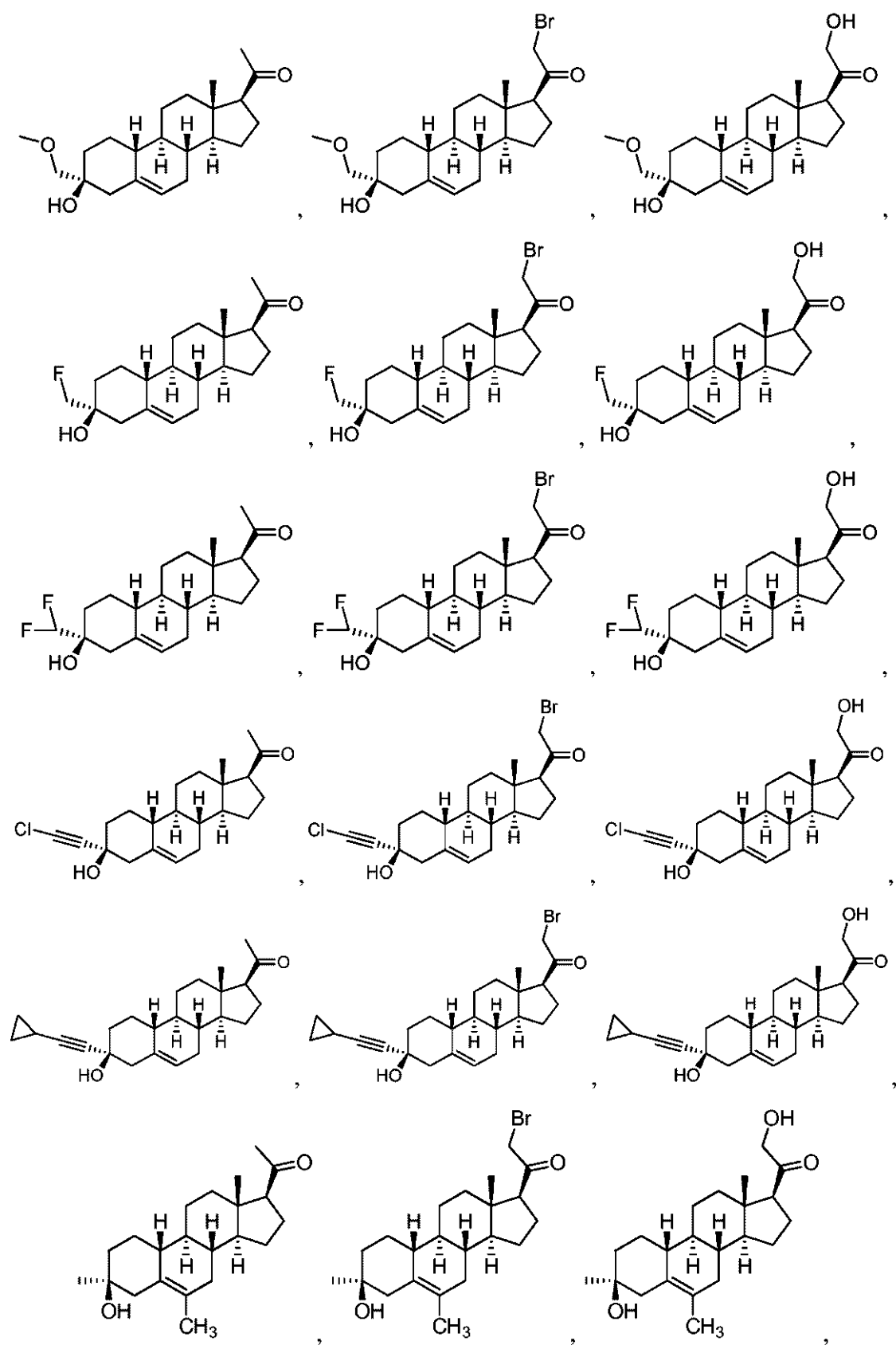
【化 1 5 7】



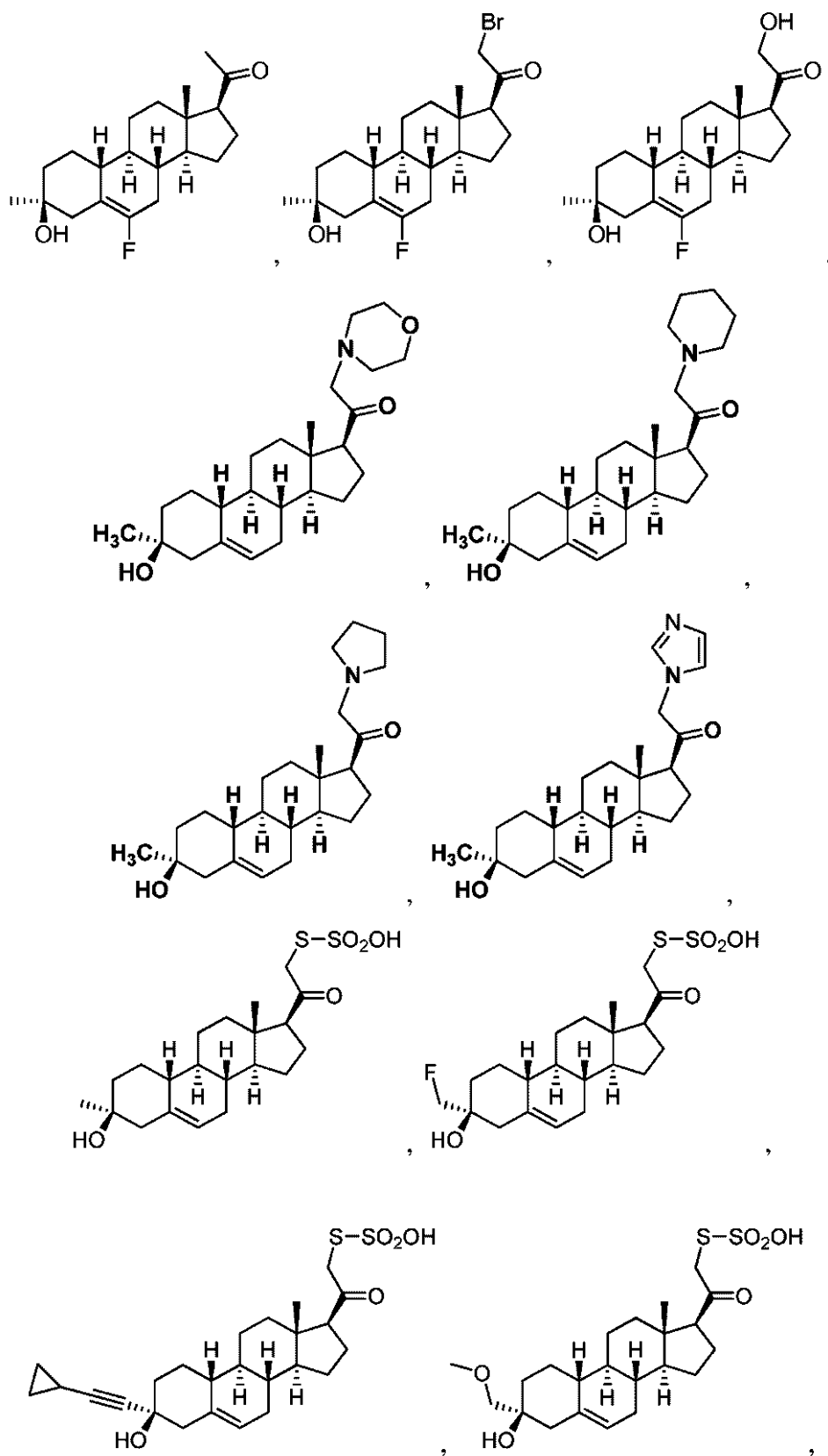
【化 1 5 8】



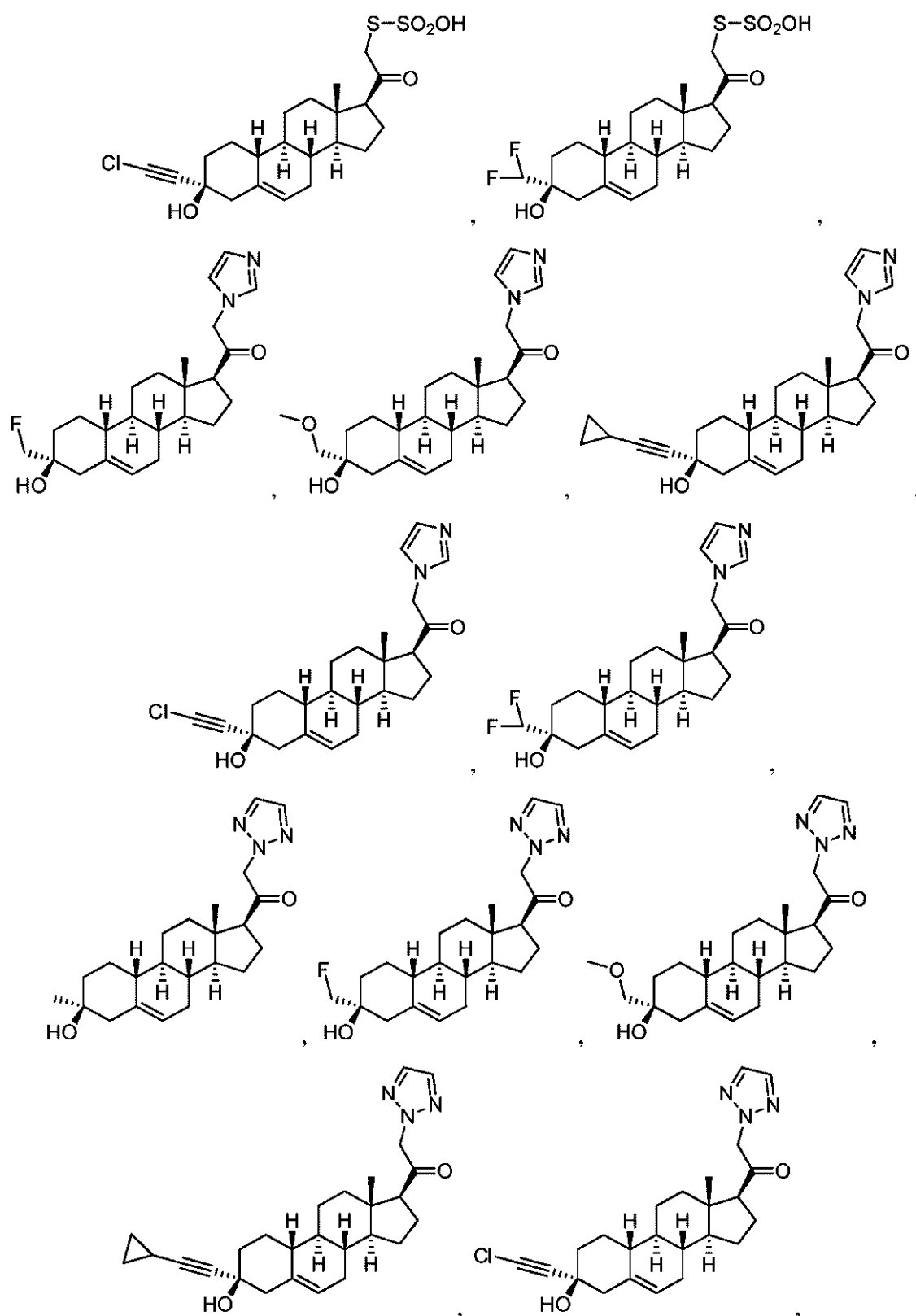
【化 1 5 9】



【化 1 6 0】



【化 1 6 1】



【請求項 27】

【請求項 28】

【請求項 29】

【請求項 30】

【請求項 3 1】

前記組成物が、慢性的に投与されることを特徴とする、請求項 28 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0019

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0019】

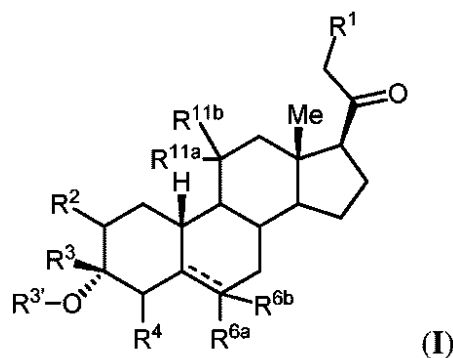
他の目的および利点は、次の詳細な説明、実施例および請求項を考慮することによって、当業者に明らかになるだろう。

本発明は、例えば、以下を提供する。

(項目 1)

式 (I) の化合物：

【化 126】



またはその薬学的に許容され得る塩であって；

式中：

R^1 は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A2}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{A1}$ 、 $-NHC(=O)OR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)SR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OS(=O)_2R^{A2}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S-S(=O)_2R^{A2}$ 、 $-S-S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S(=O)R^{A2}$ 、 $-SO_2R^{A2}$ または $-S(=O)_2OR^{A1}$ であり、ここで、 R^{A1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、または 2 つの R^{A1} 基が連結して、置換もしくは非置換の複素環式環もしくはヘテロアリール環を形成し； R^{A2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^2 は、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-OR^{B1}$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{B1})_2$ または $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ であり、ここで、 R^{B1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは

非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^B

¹基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し；

R^3 は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

$R^{3'}$ は、水素、 $-C(=O)R^{C1}$ 、 $-C(=O)OR^{C1}$ 、 $-C(=O)SR^{C1}$ 、 $-C(=O)N(R^{C1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C2}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)_2R^{C2}$ 、 $-P(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)(OR^{C1})_2$ 、 $-P(=O)(R^{C2})_2$ または $-P(=O)(R^{C2})(OR^{C1})$ であり、ここで、 R^{C1} は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{C1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し； R^{C2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^4 は、水素、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換アリール、置換または非置換ヘテロアリールから選択され；

R^{6a} および R^{6b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

R^{11a} および R^{11b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、 $-OH$ 、 $-OR^{D1}$ 、 $-OC(=O)R^{D1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{D1})_2$ または $-NR^{D1}C(=O)R^{D1}$ であり、ここで、 R^{D1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{D1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成するか；あるいは R^{11a} および R^{11b} は、連結して、オキソ(=O)基を形成し；

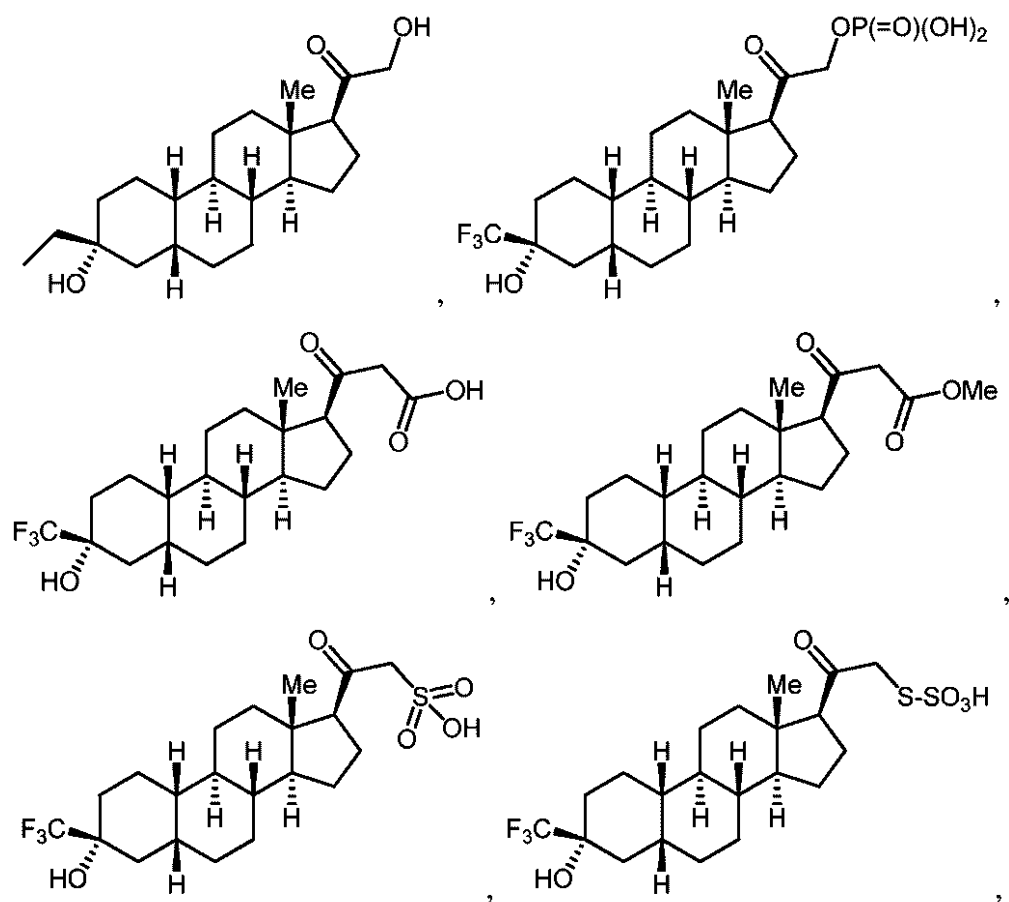
式中、

【化127】

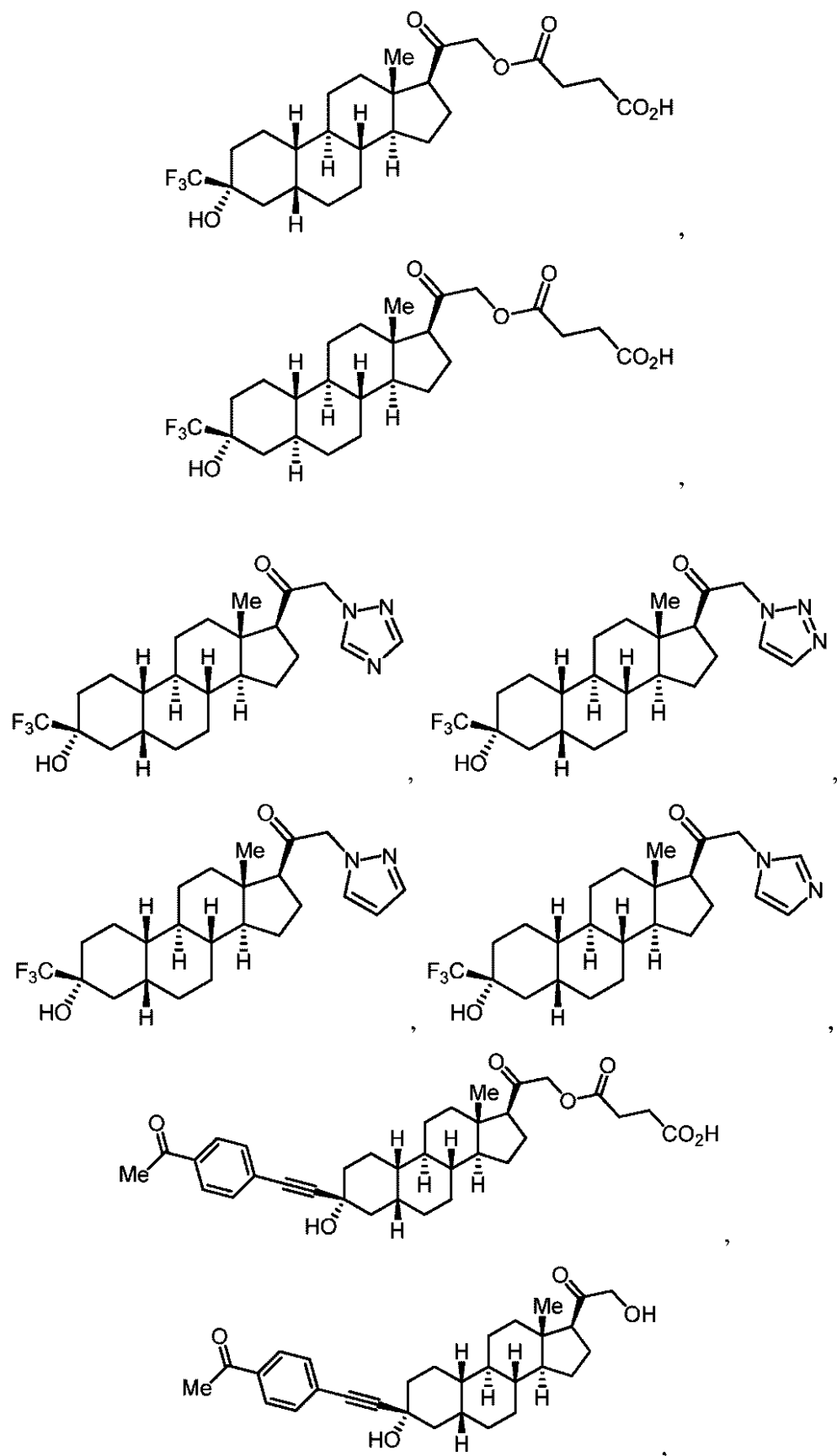
は、単結合または二重結合を表し、二重結合が環Bに存在する場合、 R^{6a} または R^{6b} の一方は、存在せず、単結合が環Bに存在する場合、C5における水素は、アルファ位またはベータ位であるが；

ただし、以下の化合物およびその塩；

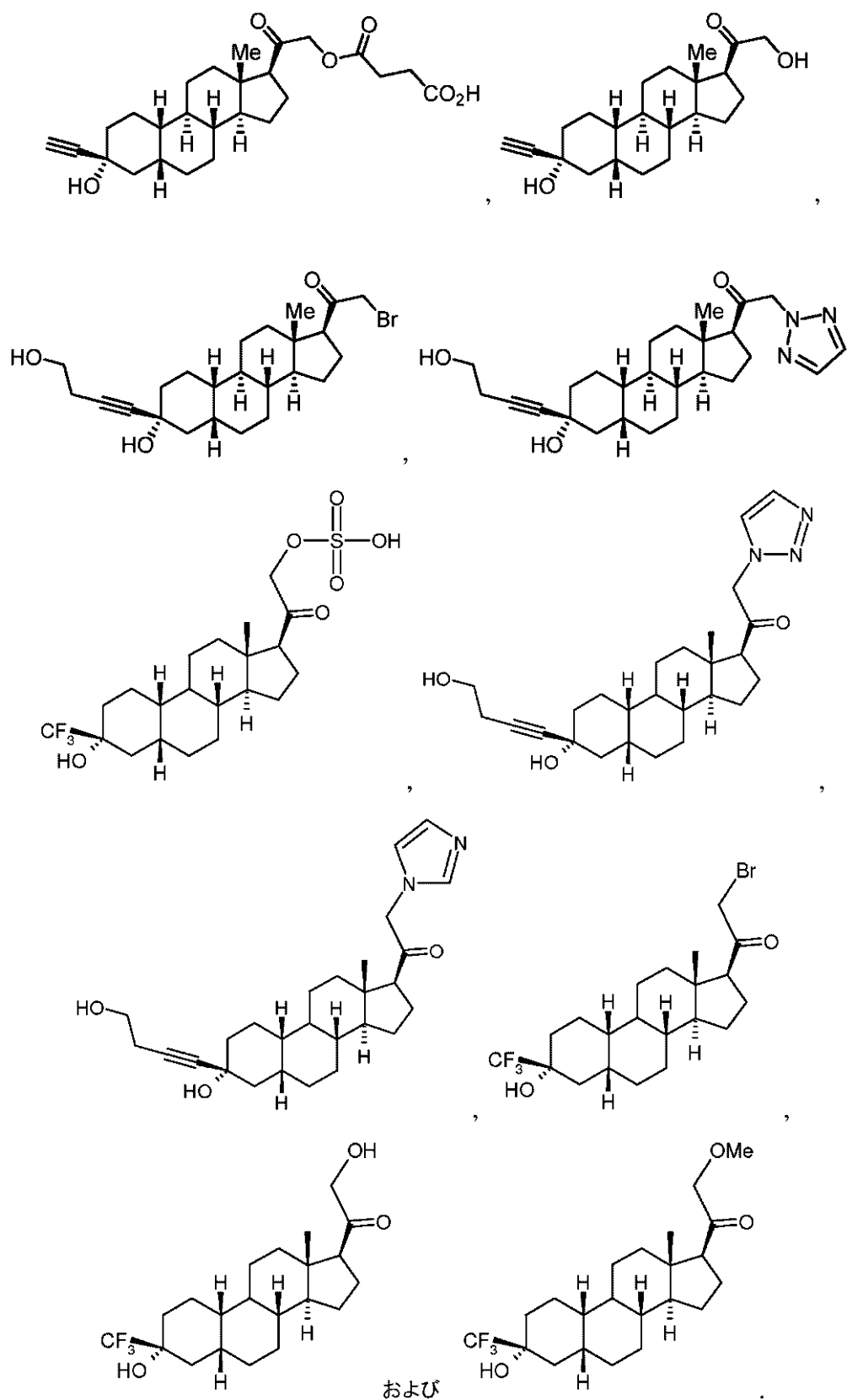
【化 1 2 8】



【化 1 2 9】



【化 1 3 0】

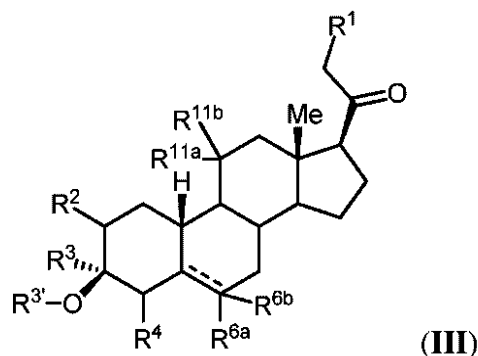


は、明確に排除される、式（Ⅰ）の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目 2）

式（ⅠⅠⅠ）の化合物：

【化 1 3 1】



またはその薬学的に許容され得る塩であって；

式中：

R^1 は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、 $-OC(=O)SR^{A1}$ 、 $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-SC(=O)R^{A2}$ 、 $-SC(=O)OR^{A1}$ 、 $-SC(=O)SR^{A1}$ 、 $-SC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{A1}$ 、 $-NHC(=O)OR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)SR^{A1}$ 、 $-NHC(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OS(=O)_2R^{A2}$ 、 $-OS(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S-S(=O)_2R^{A2}$ 、 $-S-S(=O)_2OR^{A1}$ 、 $-S(=O)R^{A2}$ 、 $-SO_2R^{A2}$ または $-S(=O)_2OR^{A1}$ であり、ここで、 R^{A1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、または 2 つの R^{A1} 基が連結して、置換もしくは非置換の複素環式環もしくはヘテロアリール環を形成し； R^{A2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^2 は、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-OR^{B1}$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{B1})_2$ または $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ であり、ここで、 R^{B1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは 2 つの R^{B1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し；

R^3 は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

$R^{3'}$ は、水素、 $-C(=O)R^{C1}$ 、 $-C(=O)OR^{C1}$ 、 $-C(=O)SR^{C1}$ 、 $-C(=O)N(R^{C1})_2$ 、 $-S(=O)_2R^{C2}$ 、 $-S(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)_2R^{C2}$ 、 $-P(=O)_2OR^{C1}$ 、 $-P(=O)(OR^{C1})_2$ 、 $-P(=O)(R^{C2})_2$ または $-P(=O)(R^{C2})(OR^{C1})$ であり、ここで、 R^{C1} は、水

素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、硫黄保護基（硫黄原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{C1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成し； R^{C2} は、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^4 は、水素、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換アリール、置換または非置換ヘテロアリールから選択され；

R^{6a} および R^{6b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ（=O）基を形成し；

R^{11a} および R^{11b} の各々は、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、-OH、-OR^{D1}、-OC(=O)R^{D1}、-NH₂、-N(R^{D1})₂または-NR^{D1}C(=O)R^{D1}であり、ここで、 R^{D1} の各存在は、独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリールまたは置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素保護基（酸素原子に結合しているとき）、窒素保護基（窒素原子に結合しているとき）であるか、あるいは2つの R^{D1} 基が連結して、置換または非置換の複素環式環を形成するか；または R^{11a} および R^{11b} は、連結して、オキソ（=O）基を形成し；

式中、

【化132】

は、単結合または二重結合を表し、二重結合が環Bに存在する場合、 R^{6a} または R^{6b} の一方は存在せず、単結合が環Bに存在する場合、C5における水素は、アルファ位またはベータ位である、

式（III）の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

（項目3）

R^1 が、水素、ハロゲン、-OR^{A1}、-SR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、-OC(=O)SR^{A1}、-OC(=O)N(R^{A1})₂、-SC(=O)R^{A2}、-SC(=O)OR^{A1}、-SC(=O)SR^{A1}、-SC(=O)N(R^{A1})₂、-NHC(=O)R^{A1}、-NHC(=O)OR^{A1}、-NHC(=O)SR^{A1}、-NHC(=O)N(R^{A1})₂、-OS(=O)₂R^{A2}、-OS(=O)₂OR^{A1}、-S-S(=O)₂R^{A2}、-S-S(=O)₂OR^{A1}、-S(=O)R^{A2}、-SO₂R^{A2}または-S(=O)₂OR^{A1}である、項目1または2に記載の化合物。

（項目4）

R^1 が、水素、ハロゲン、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-S-S(=O)₂R^{A2}、置換もしくは非置換ヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールである、項目1または2に記載の化合物。

（項目5）

R^2 が、水素、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、-OH、-OR^{B1}、-OC(=O)R^{B1}、-NH₂、-N(R^{B1})₂または-NR^{B1}C(=O)R^{B1}である、項目

1 または 2 に記載の化合物。

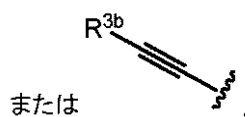
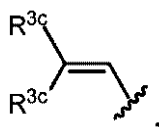
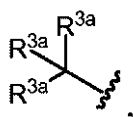
(項目 6)

R^3 が、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 7)

R^3 が、式：

【化 1 3 3】



の基であり、式中、 R^{3a} の各存在は、水素、ハロまたは $-OR^{F1}$ であり、 R^{F1} は、置換または非置換アルキルであり； R^{3b} および R^{3c} の各存在は、独立して、水素、ハロまたは置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換カルボシクリルまたは置換もしくは非置換ヘテロシクリルである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 8)

$R^{3'}$ が、水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 9)

R^4 が、水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 10)

R^{6a} および R^{6b} の各々が、独立して、水素、ハロ、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニルまたは置換もしくは非置換アルキニルであるか、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、連結して、オキソ (=O) 基を形成する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 11)

R^{6a} と R^{6b} の両方が、水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 12)

R^{6a} および R^{6b} の一方が、非水素基である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 13)

R^{6a} が、非水素アルファ基である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 14)

R^{6a} が、非水素ベータ基である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 15)

R^{6a} が、ハロまたはアルキルであり、 R^{6b} が、水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 16)

R^{6a} および R^{6b} が、両方ともハロである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 17)

R^{6a} および R^{6b} が、両方ともアルキルである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 18)

R^{6a} および R^{6b} が、連結して、オキソ基を形成する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 19)

R^{11a} および R^{11b} の各々が、独立して、水素、 $-OH$ 、 $-OR^{D1}$ 、 $-OC(=O)R^{D1}$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(R^{D1})_2$ もしくは $-NR^{D1}C(=O)R^{D1}$ であるか、または R^{11a} および R^{11b} が、連結して、オキソ (=O) 基を形成する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 20)

R^{11a} と R^{11b} の両方が、水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 2 1)

R^{1 1 a} および R^{1 1 b} の一方が、非水素基である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

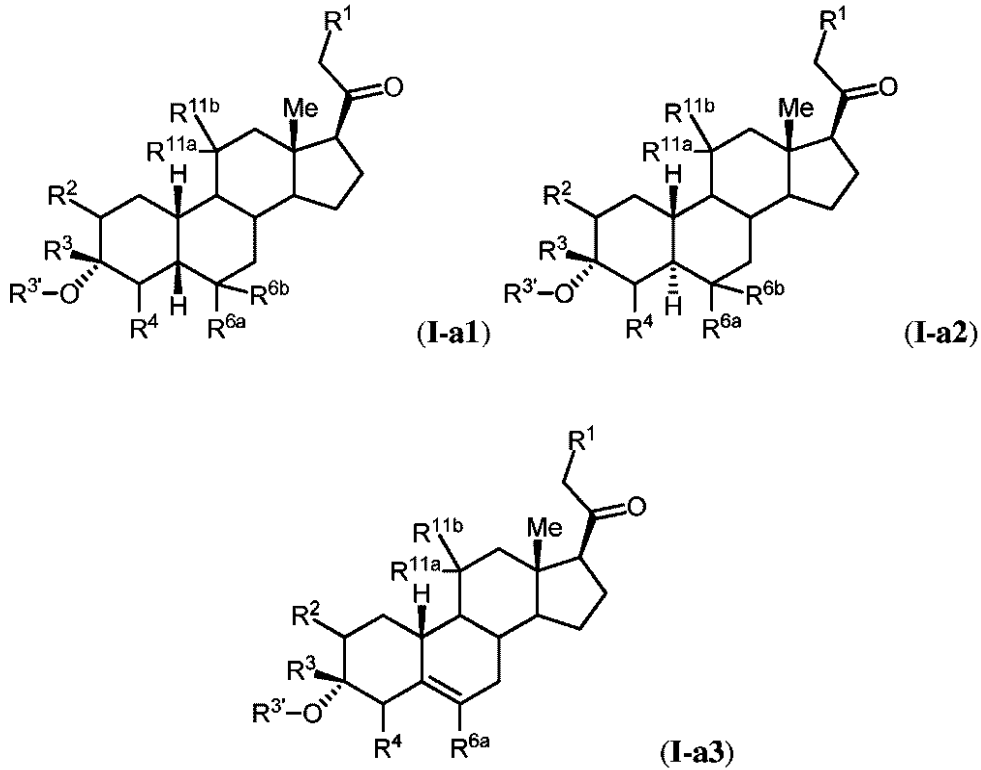
(項目 2 2)

R^{1 1 a} および R^{1 1 b} が、連結して、オキシ基を形成する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 2 3)

前記式 (I) の化合物が、式 (I - a 1)、(I - a 2) もしくは (I - a 3) :

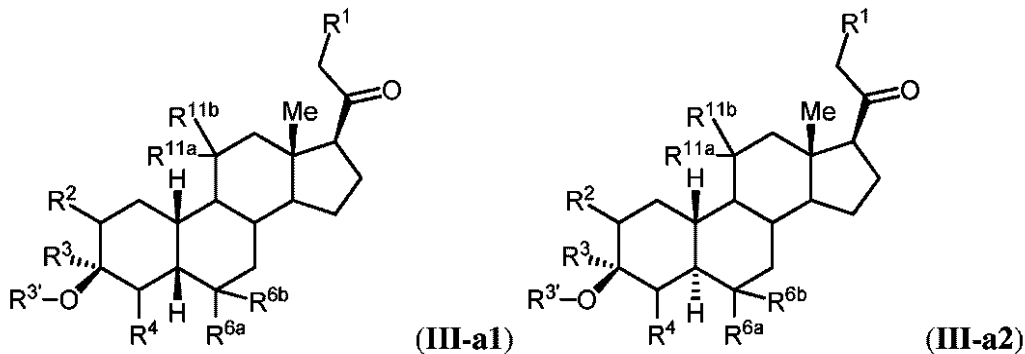
【化 1 3 4】

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩である、項目 1 に記載の化合物。

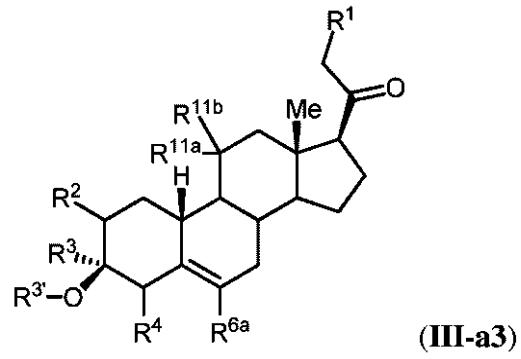
(項目 2 4)

式 (I I I) の化合物が、式 (I I I - a 1)、(I I I - a 2) もしくは (I I I - a 3) :

【化 1 3 5】



【化 1 3 6】

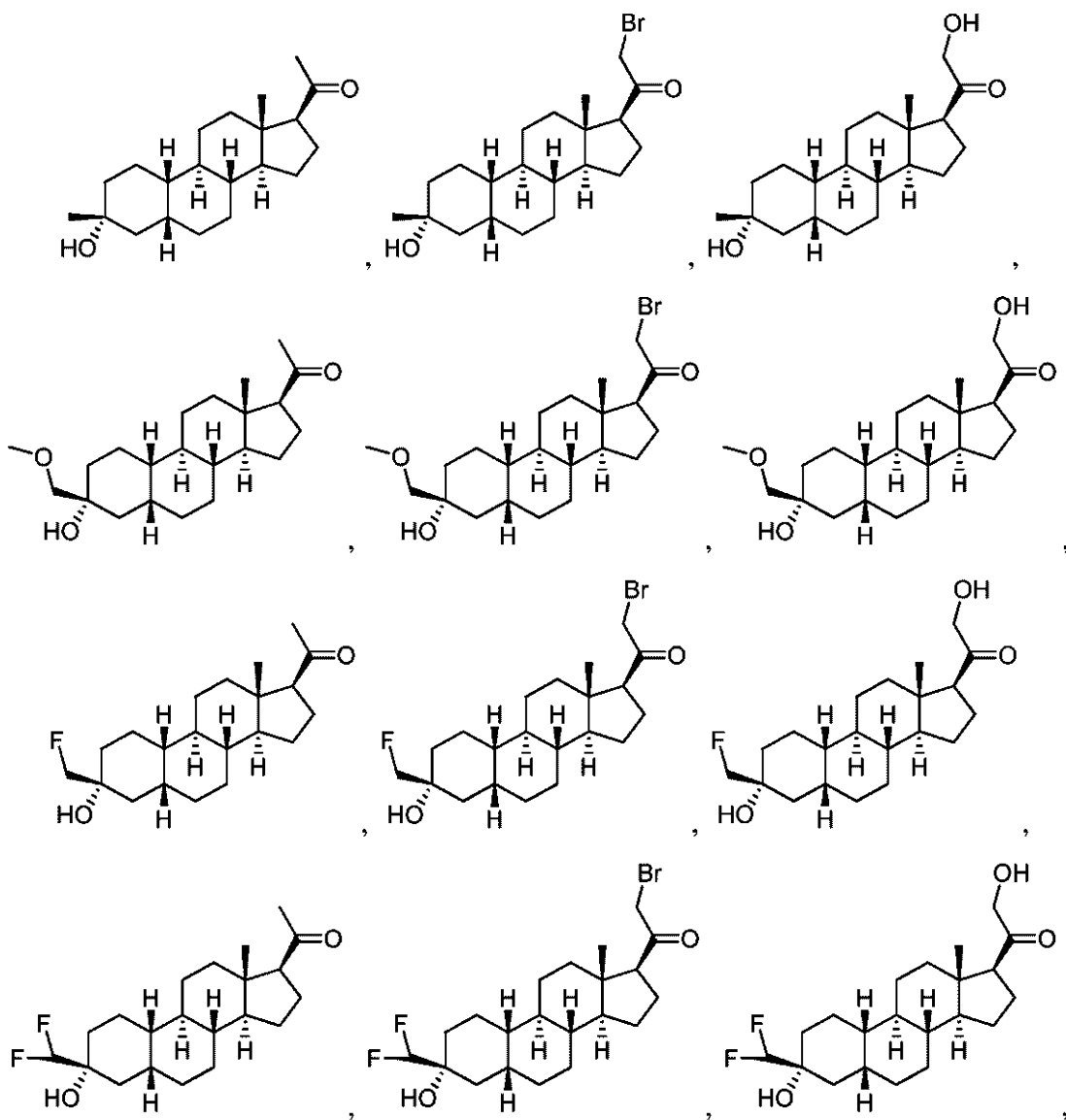


の化合物またはその薬学的に許容され得る塩である、項目 2 に記載の化合物。

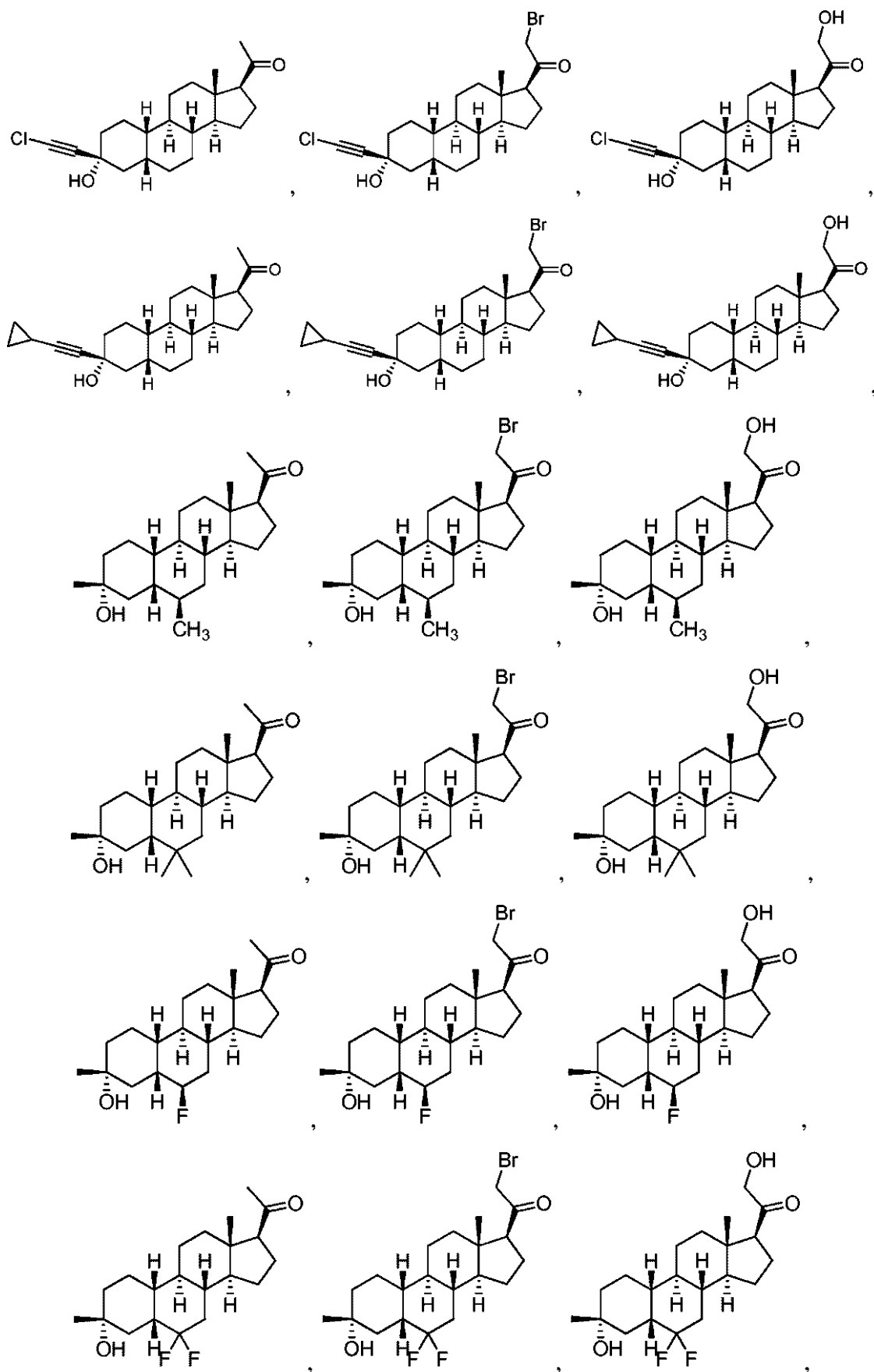
(項目 2 5)

前記化合物が：

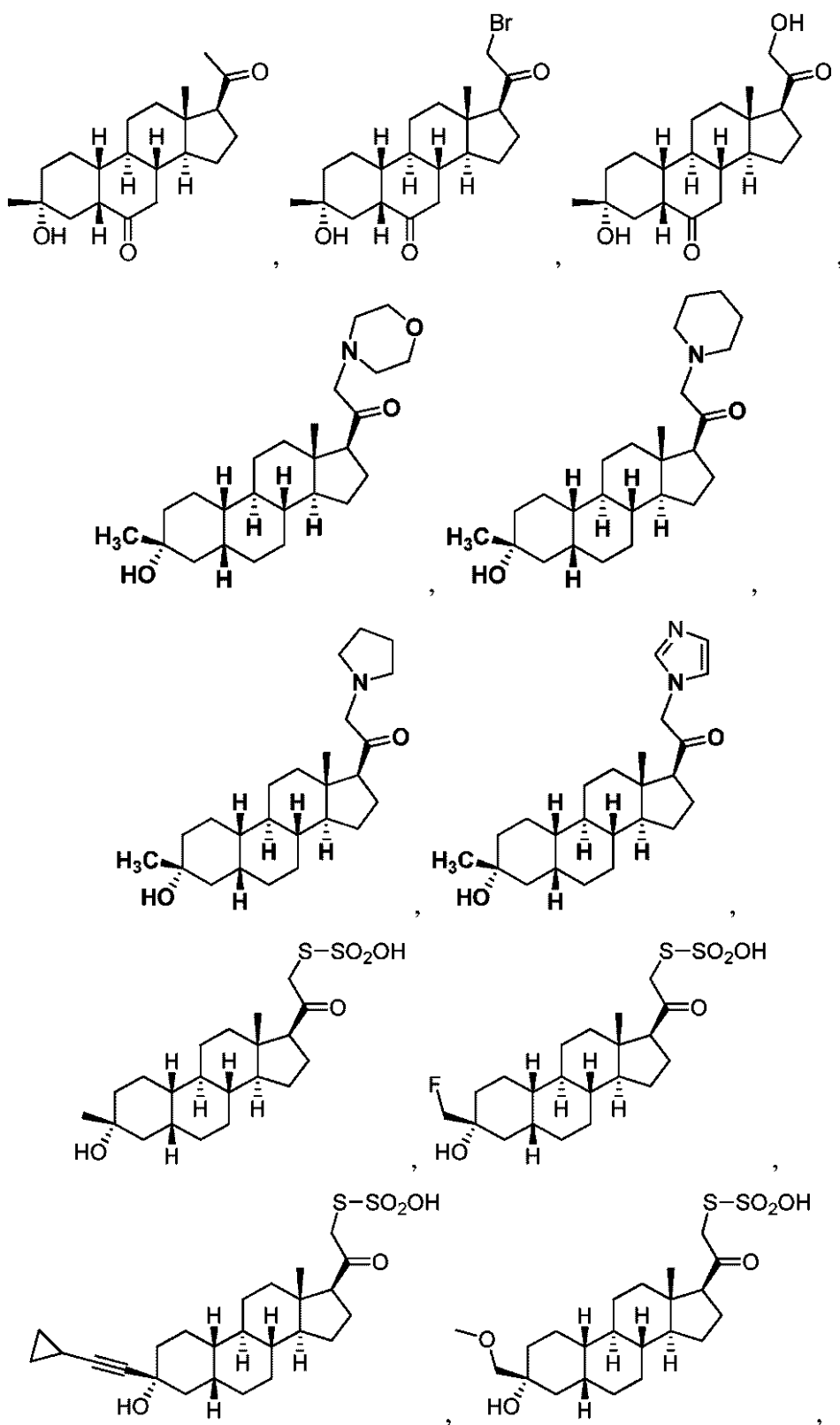
【化 1 3 7】



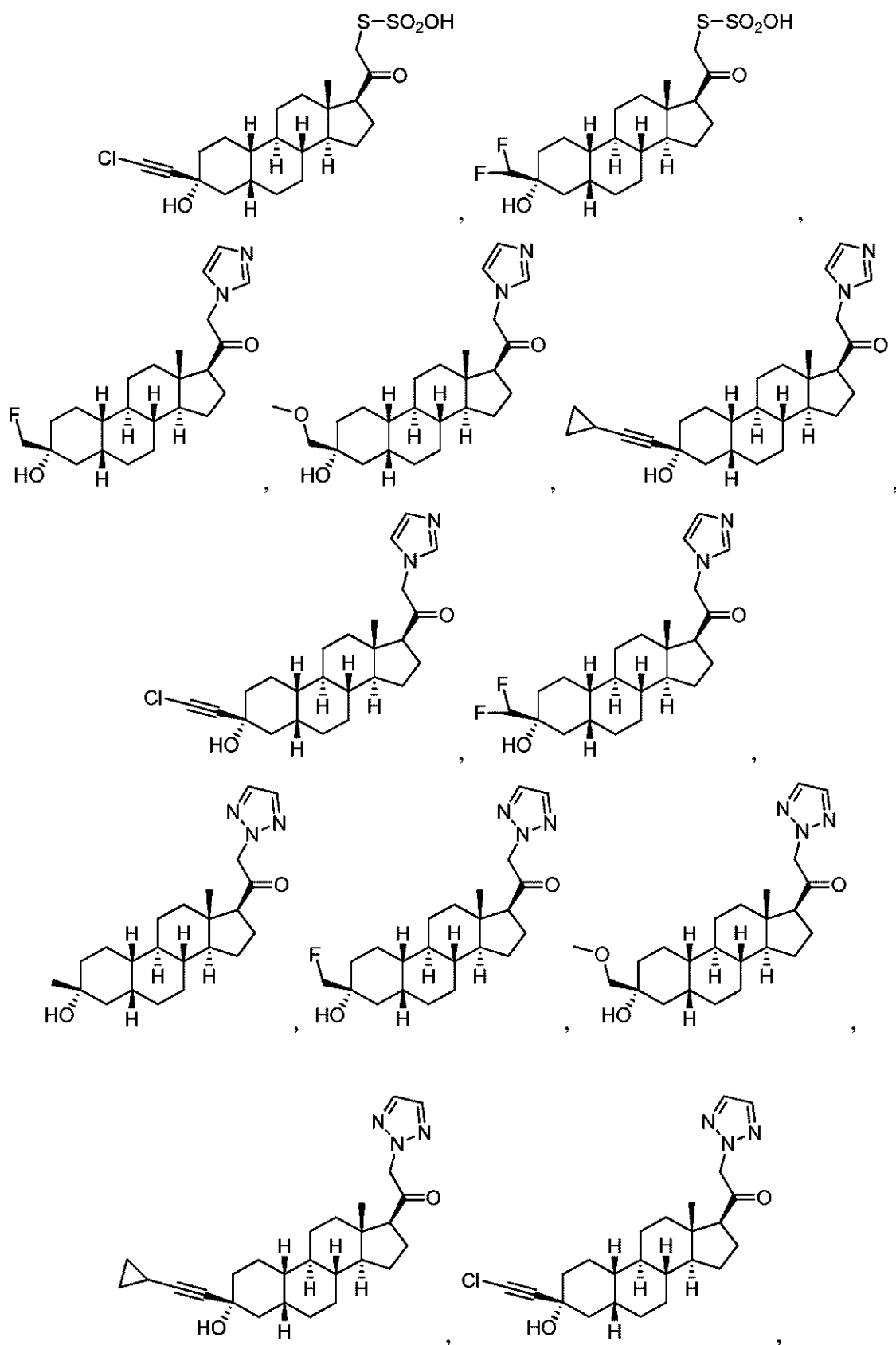
【化 1 3 8】



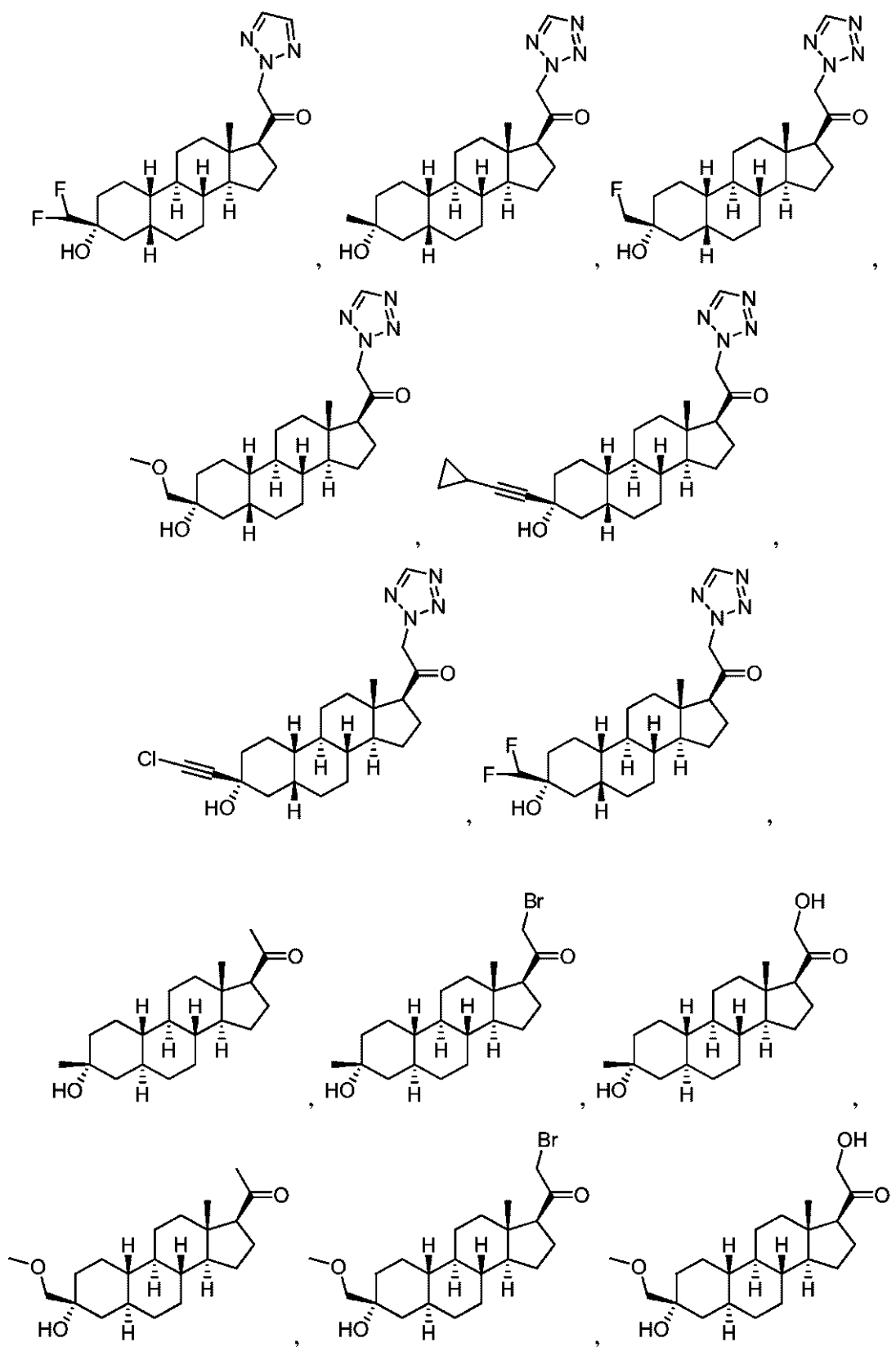
【化 1 3 9】



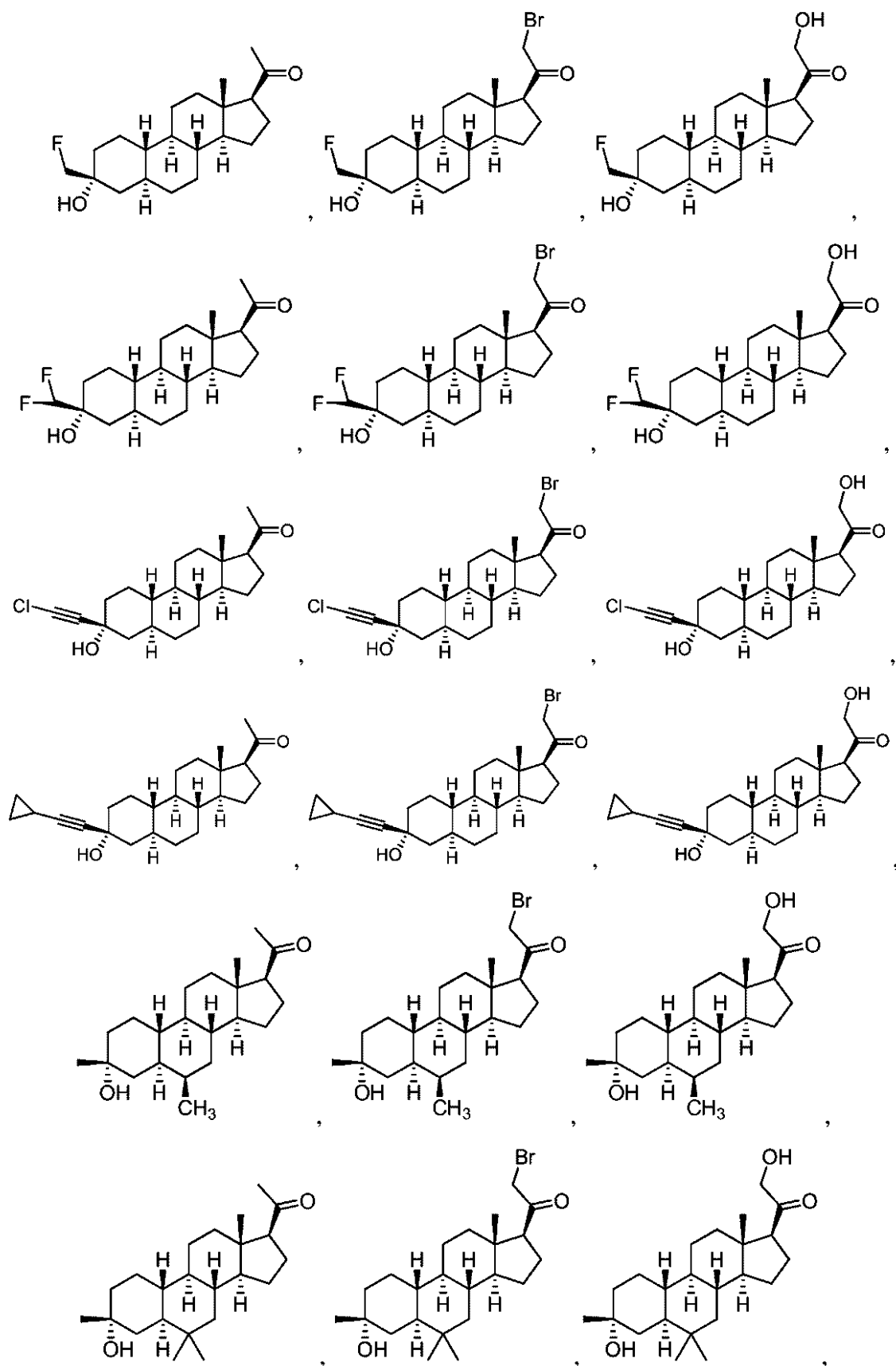
【化 1 4 0】



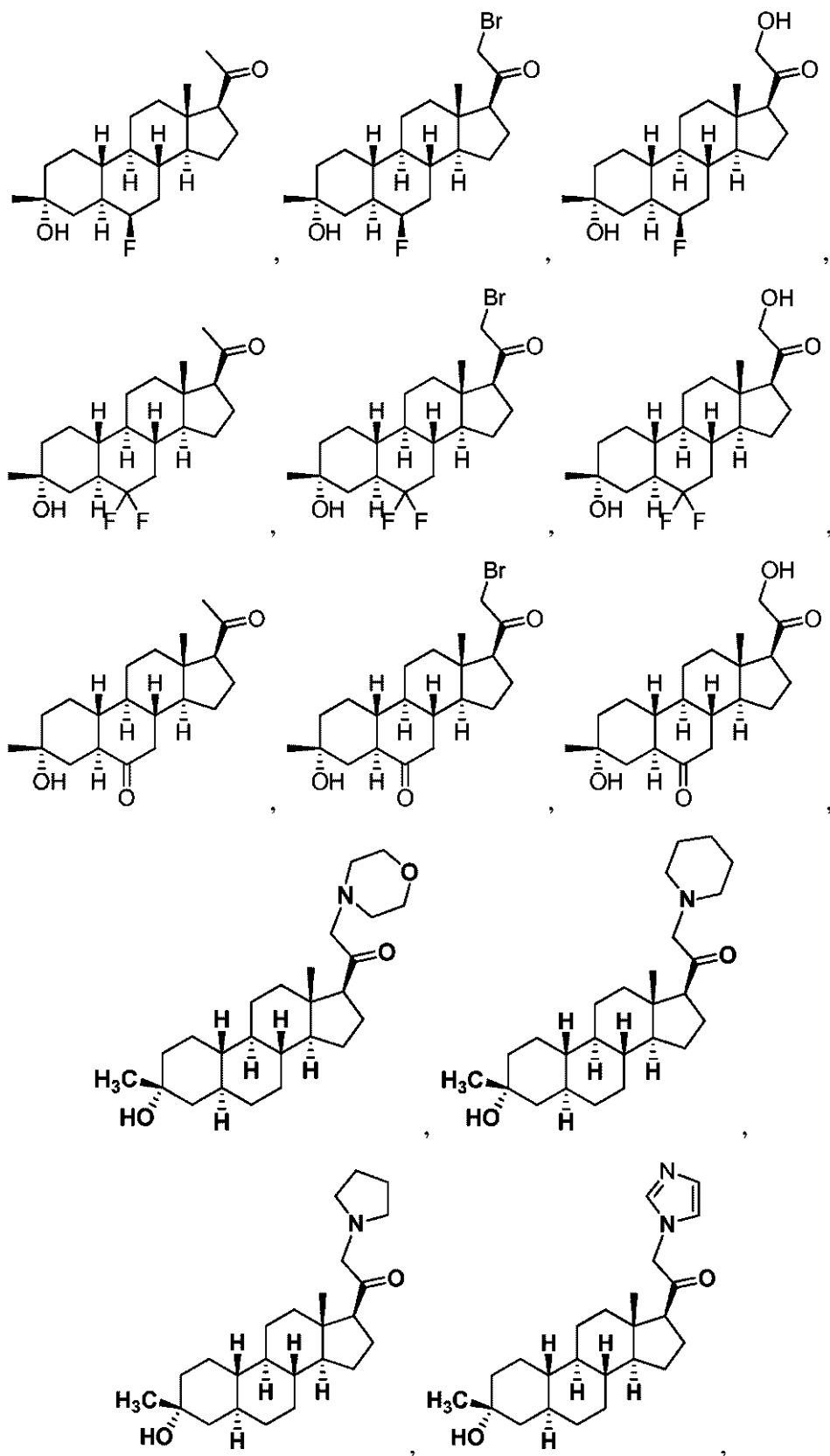
【化 1 4 1】



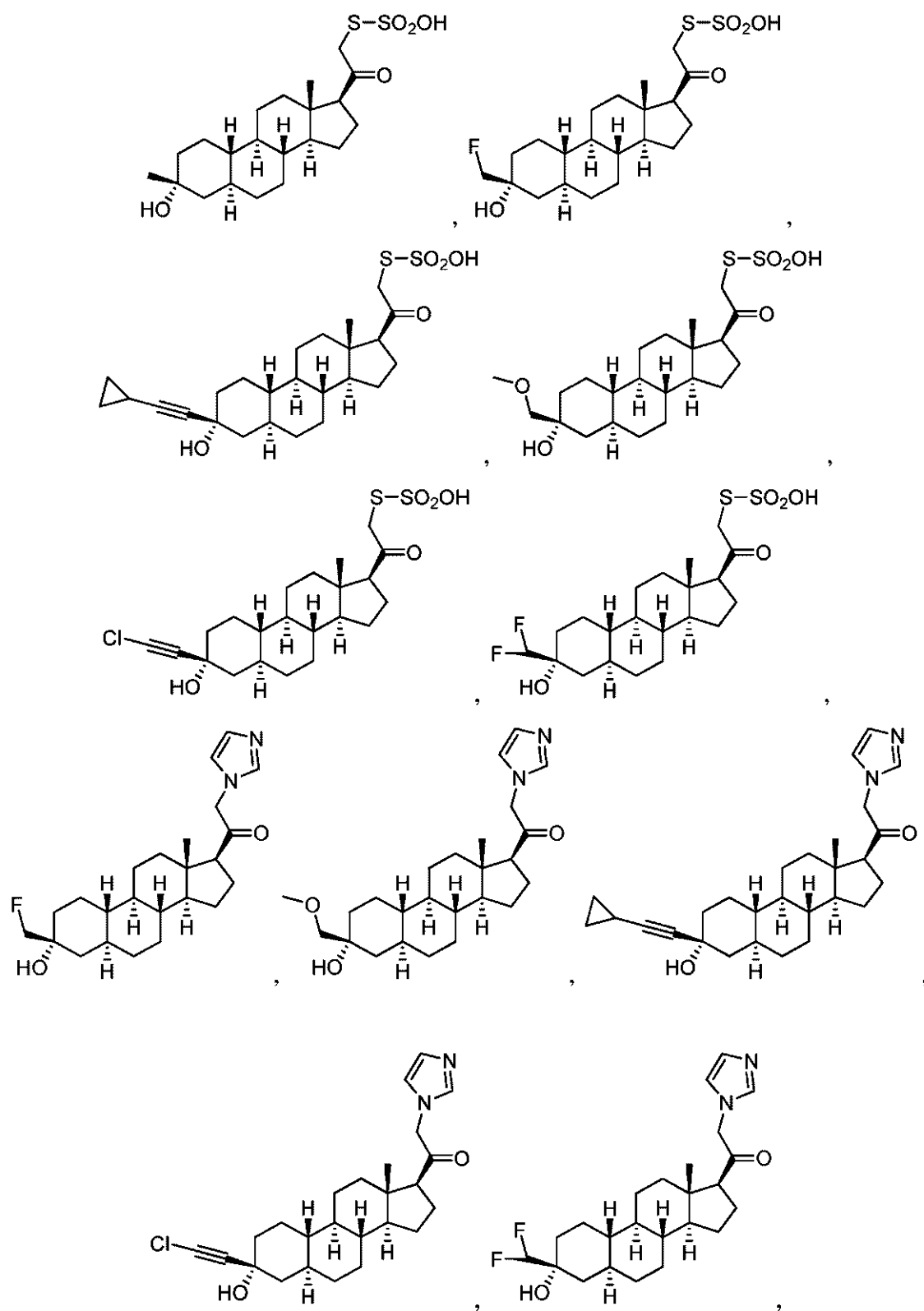
【化 1 4 2】



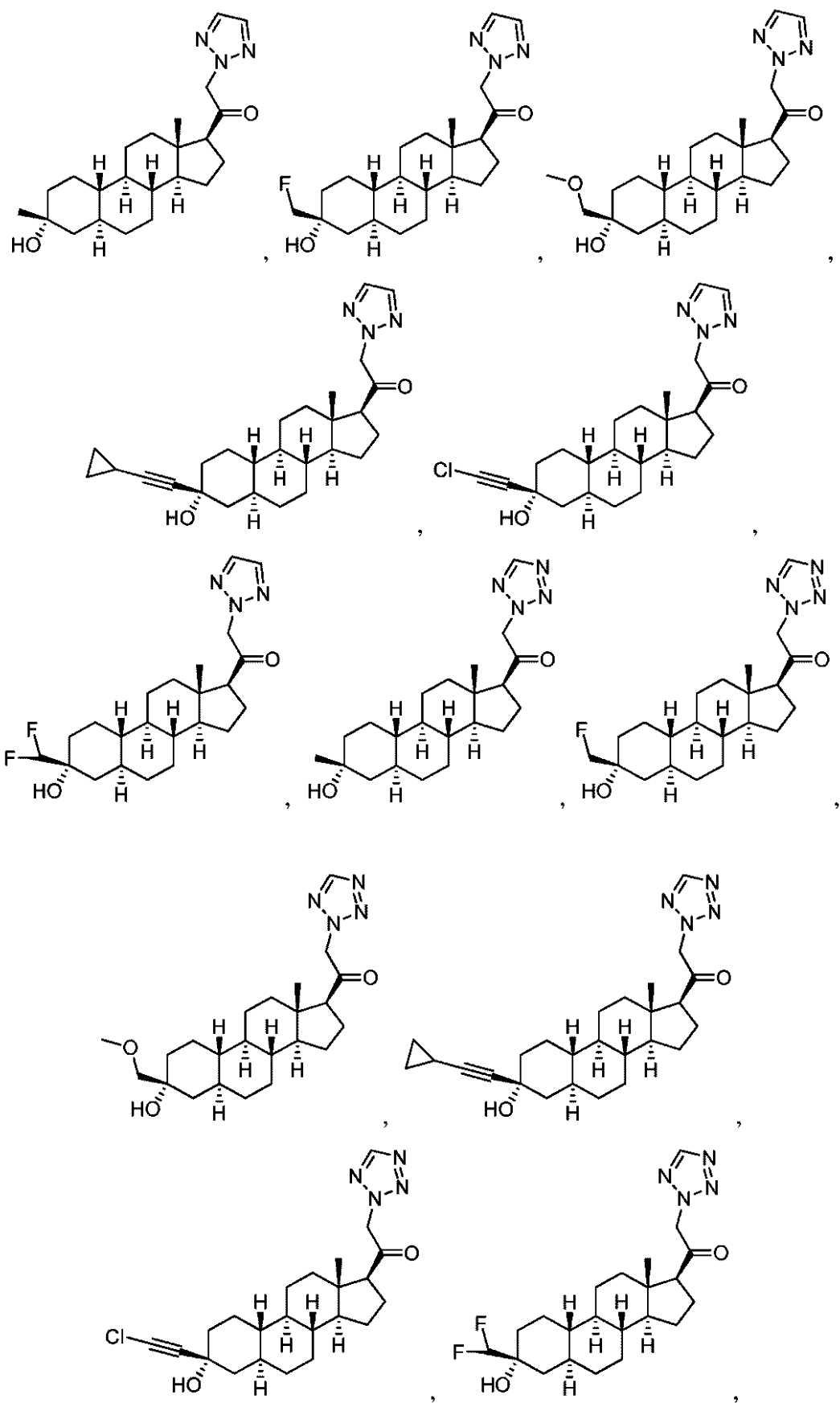
【化 1 4 3】



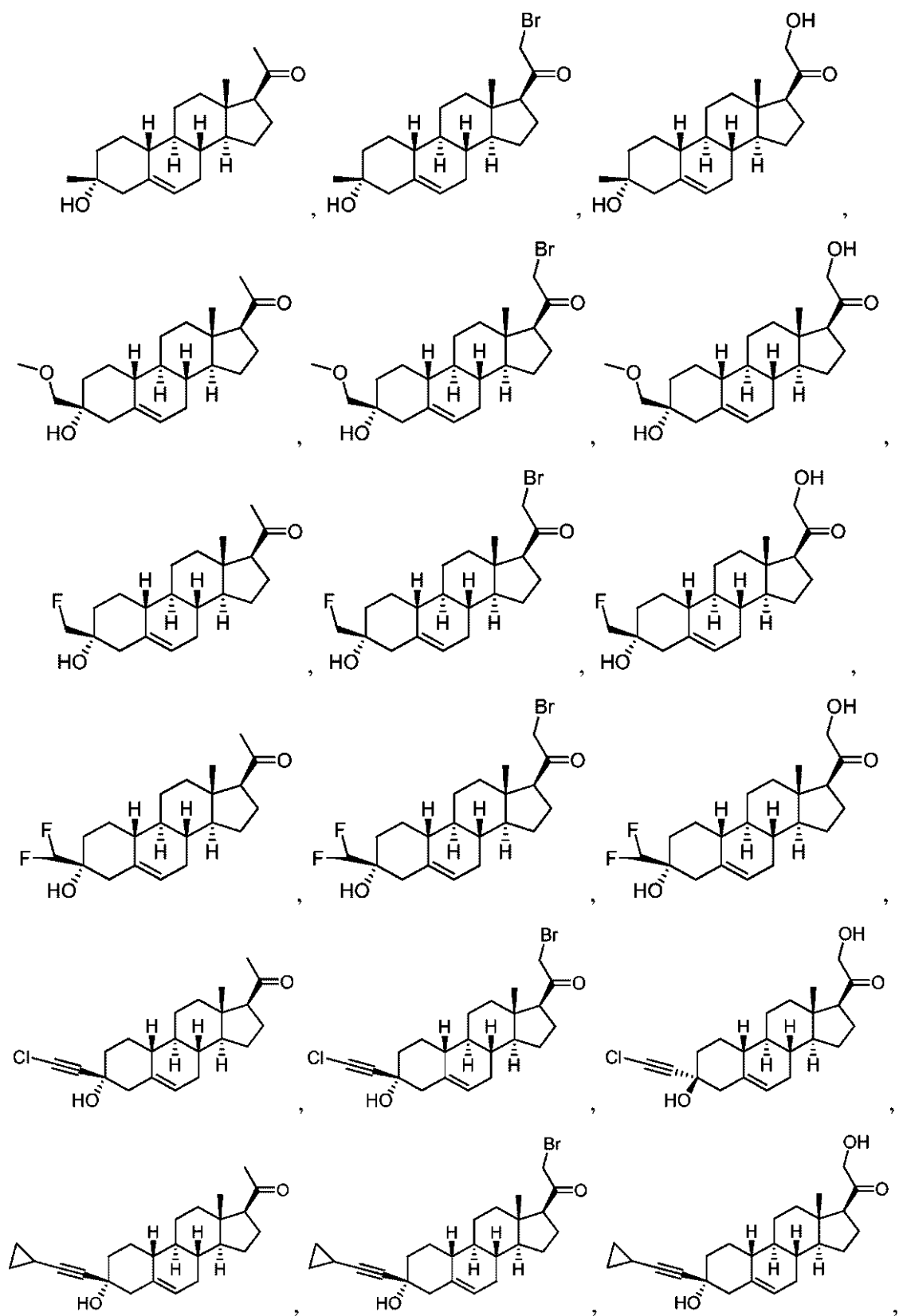
【化 1 4 4】



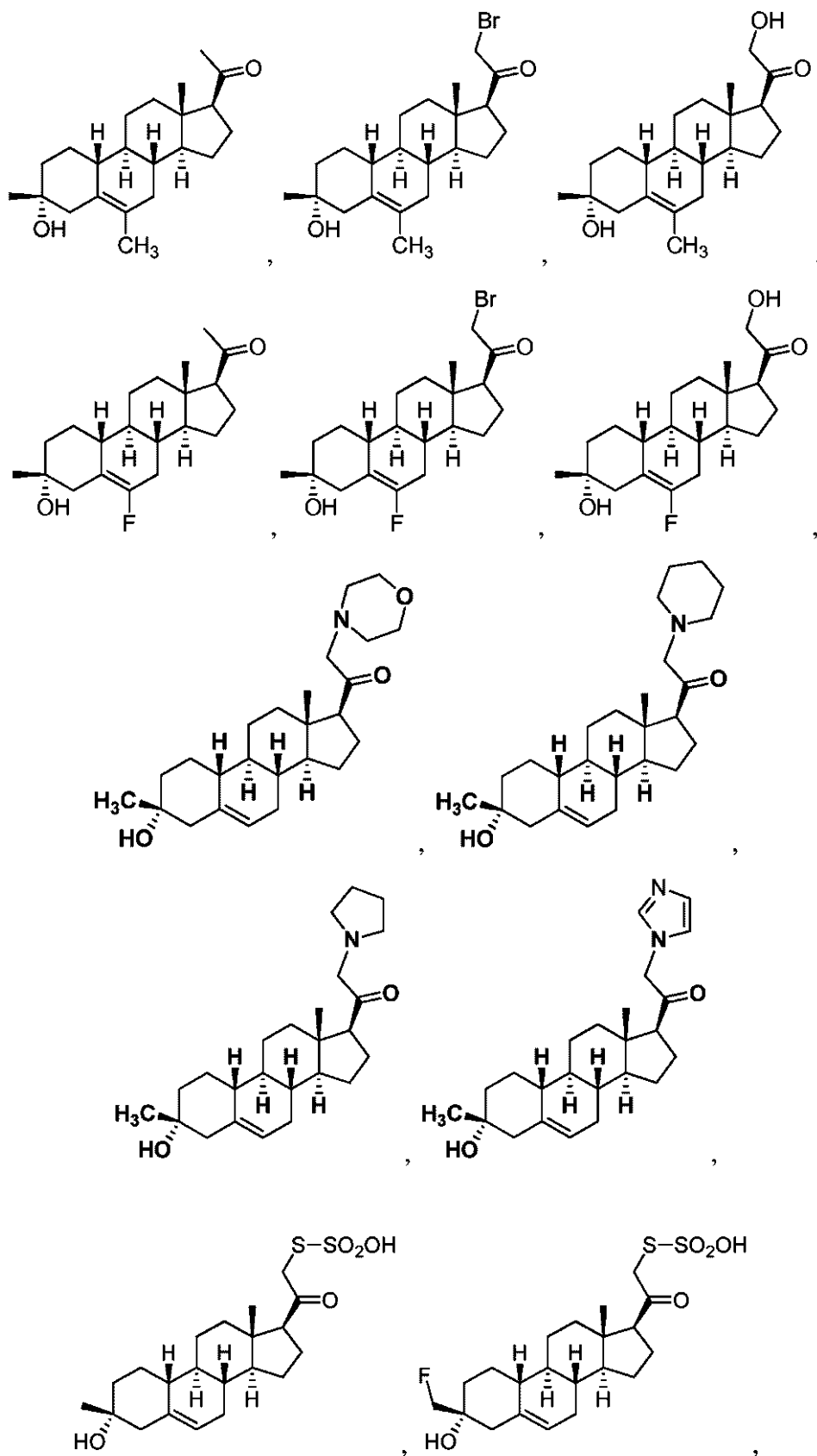
【化 1 4 5】



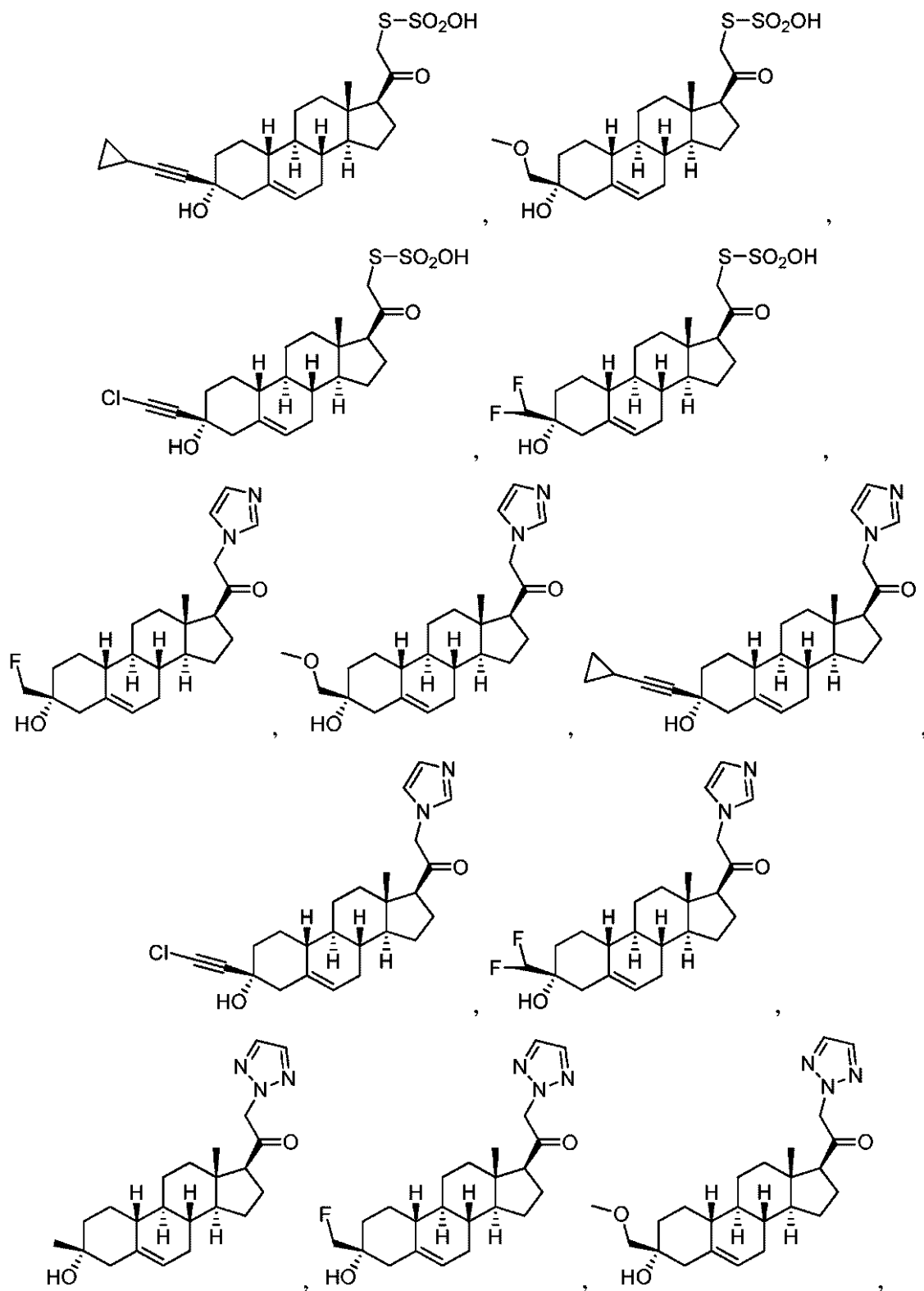
【化 1 4 6】



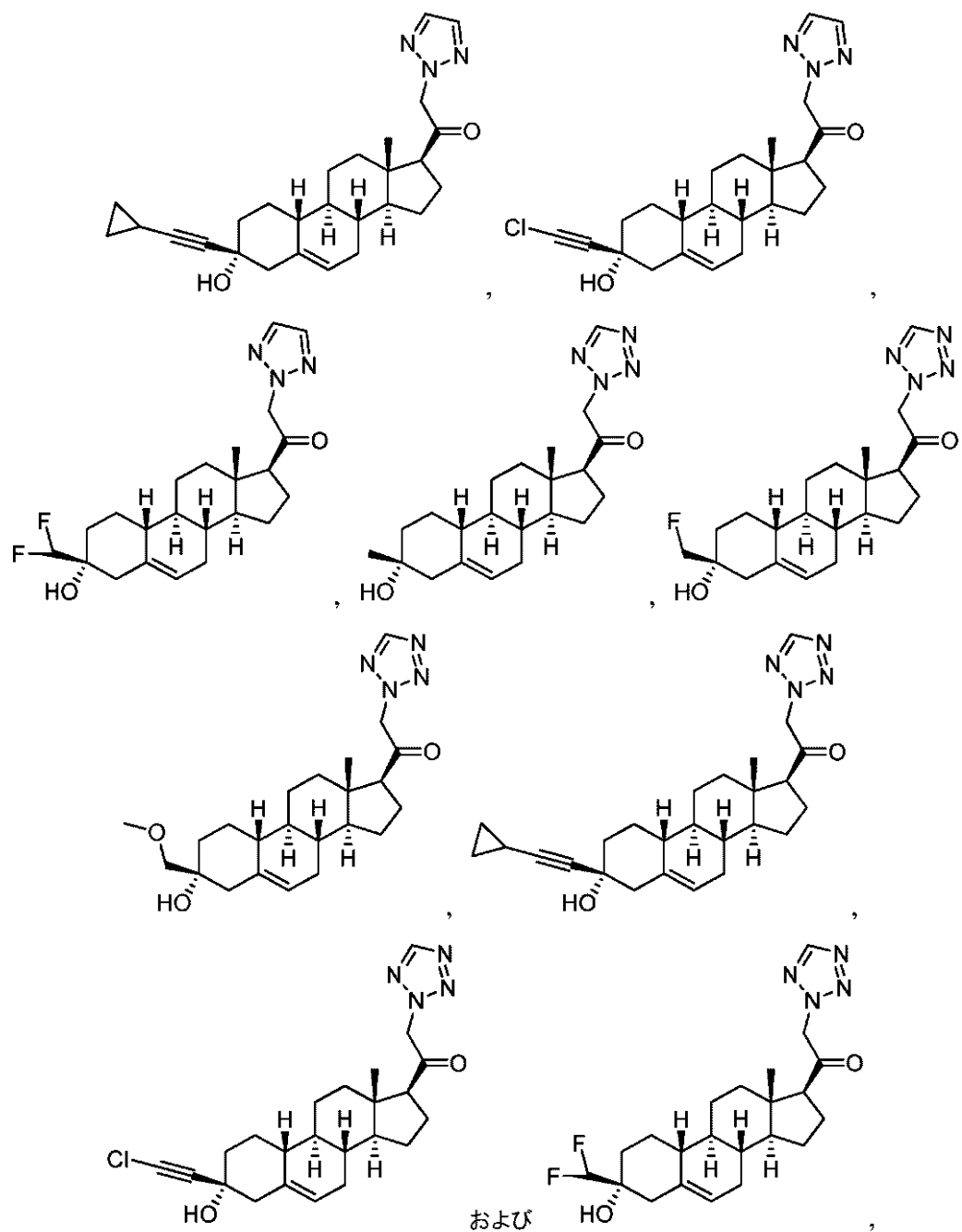
【化 1 4 7】



【化 1 4 8】



【化 1 4 9】

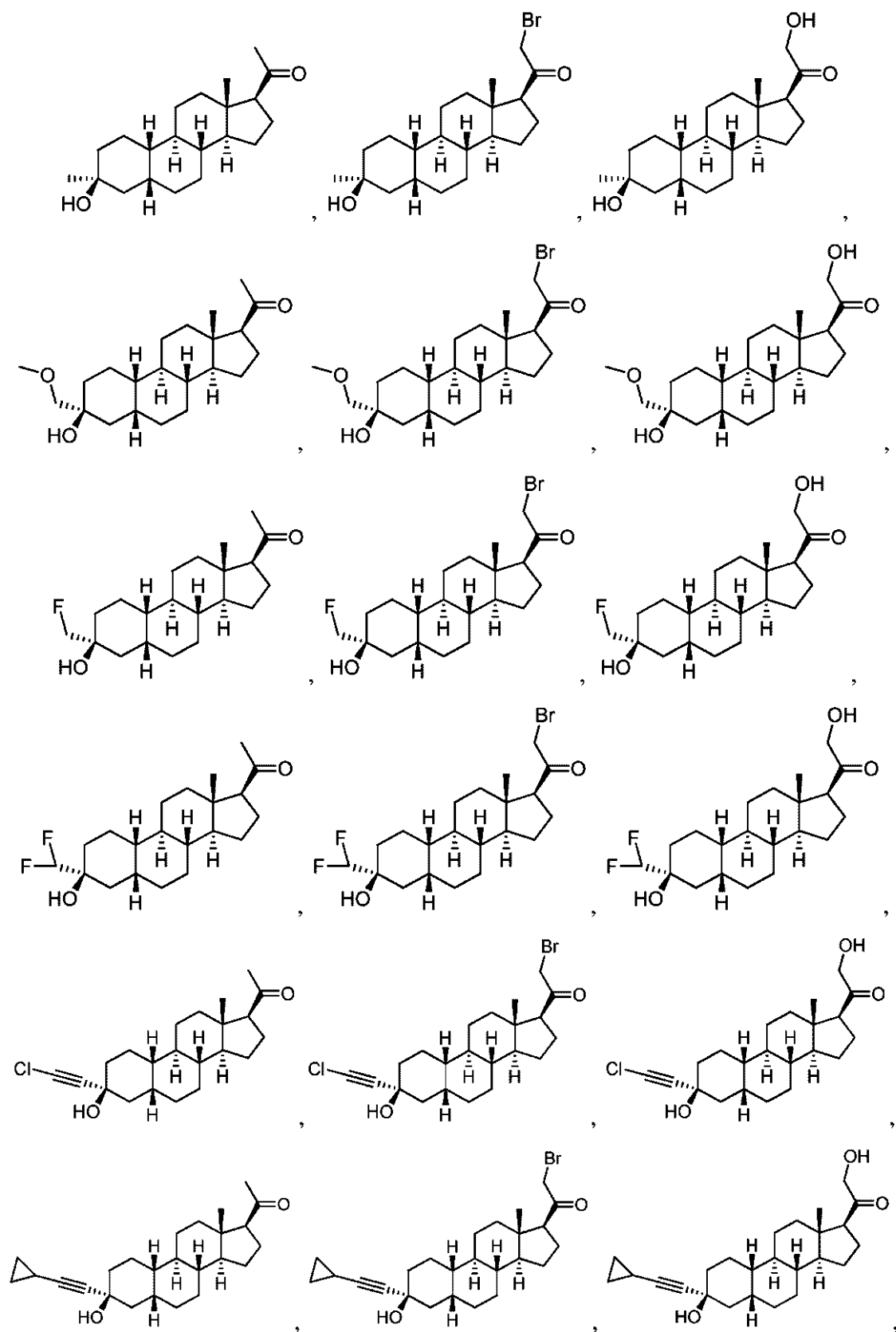


ならびにその薬学的に許容され得る塩からなる群より選択される、項目 1 に記載の化合物

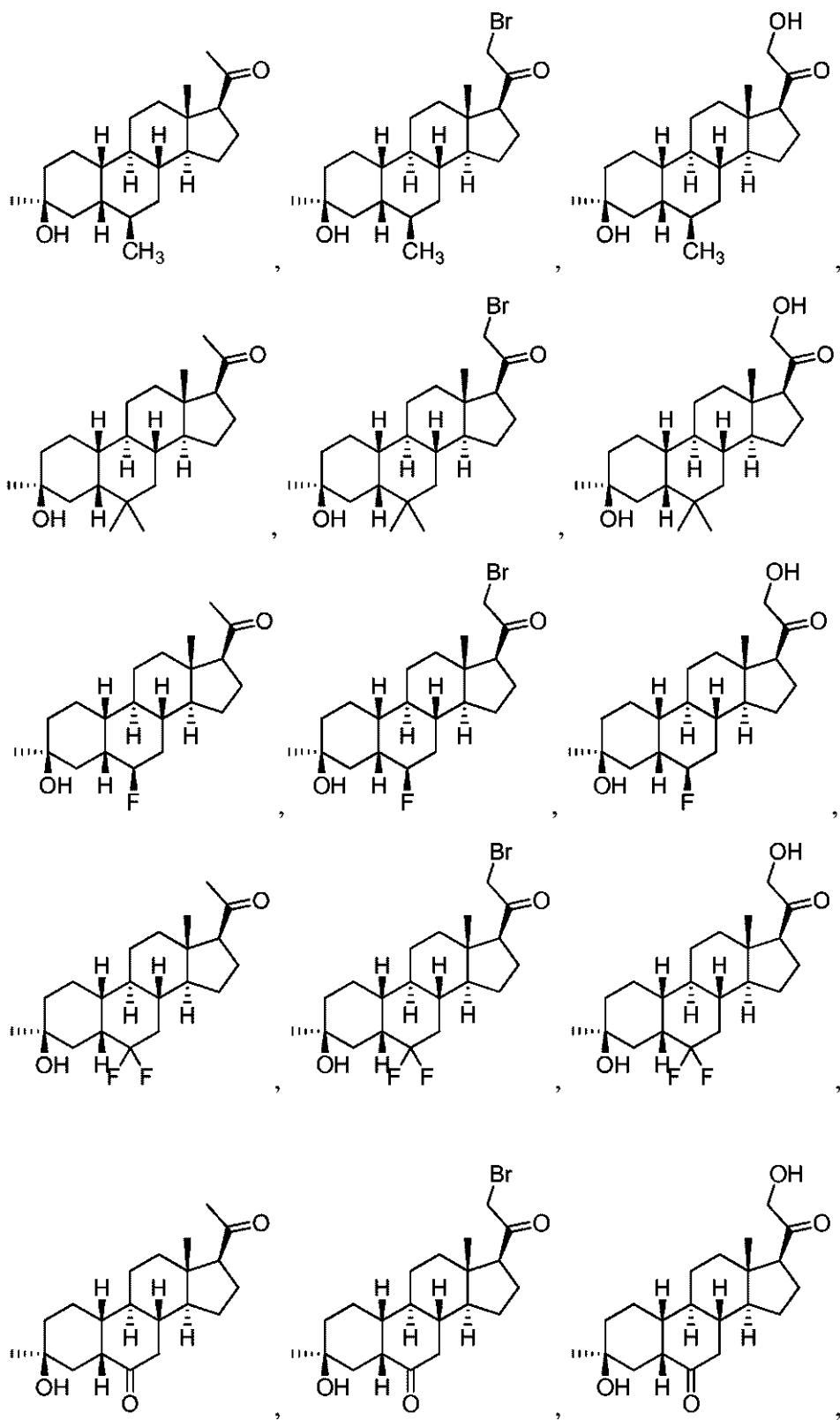
（項目 2 6）

前記化合物が：

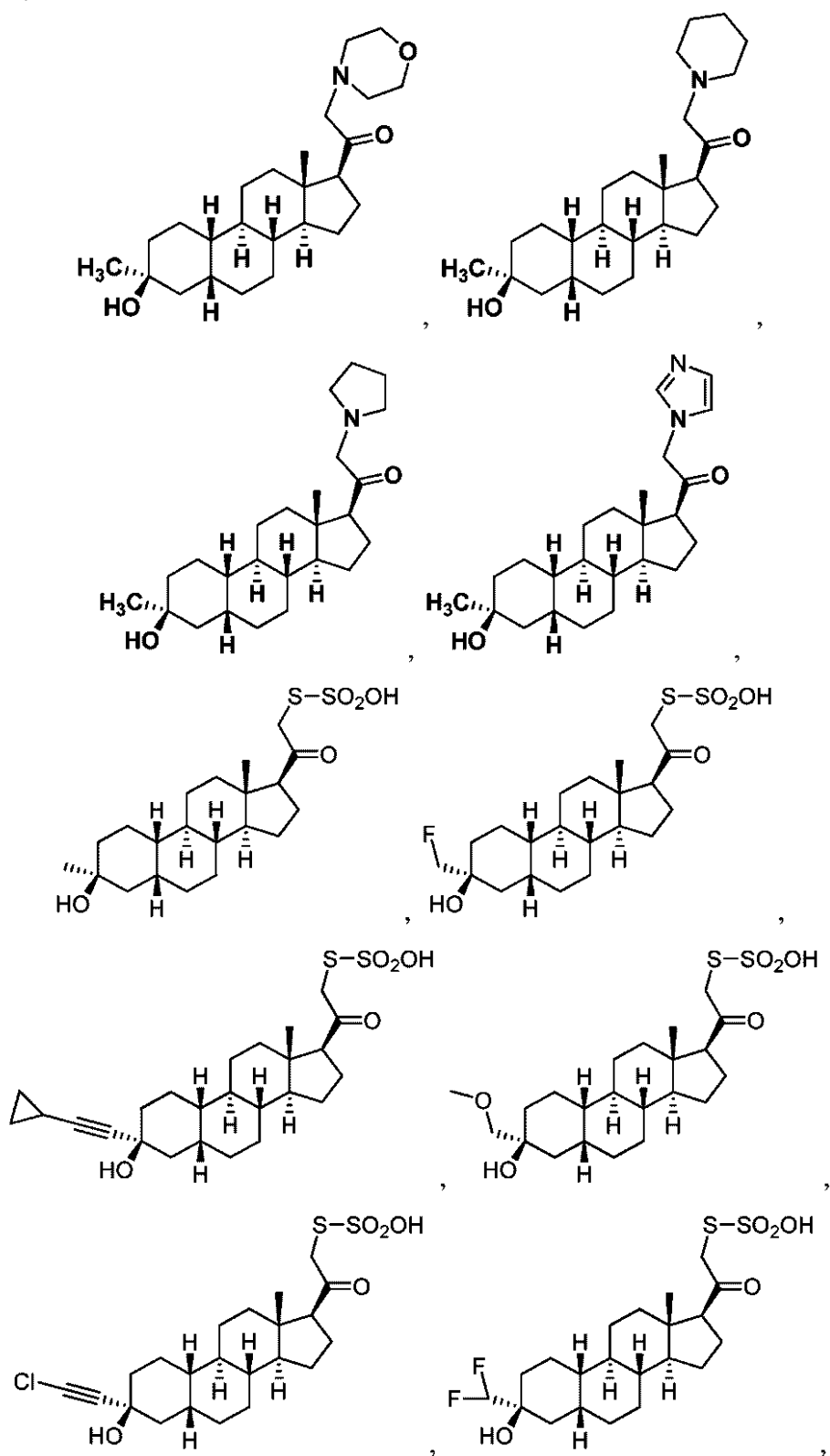
【化 1 5 0】



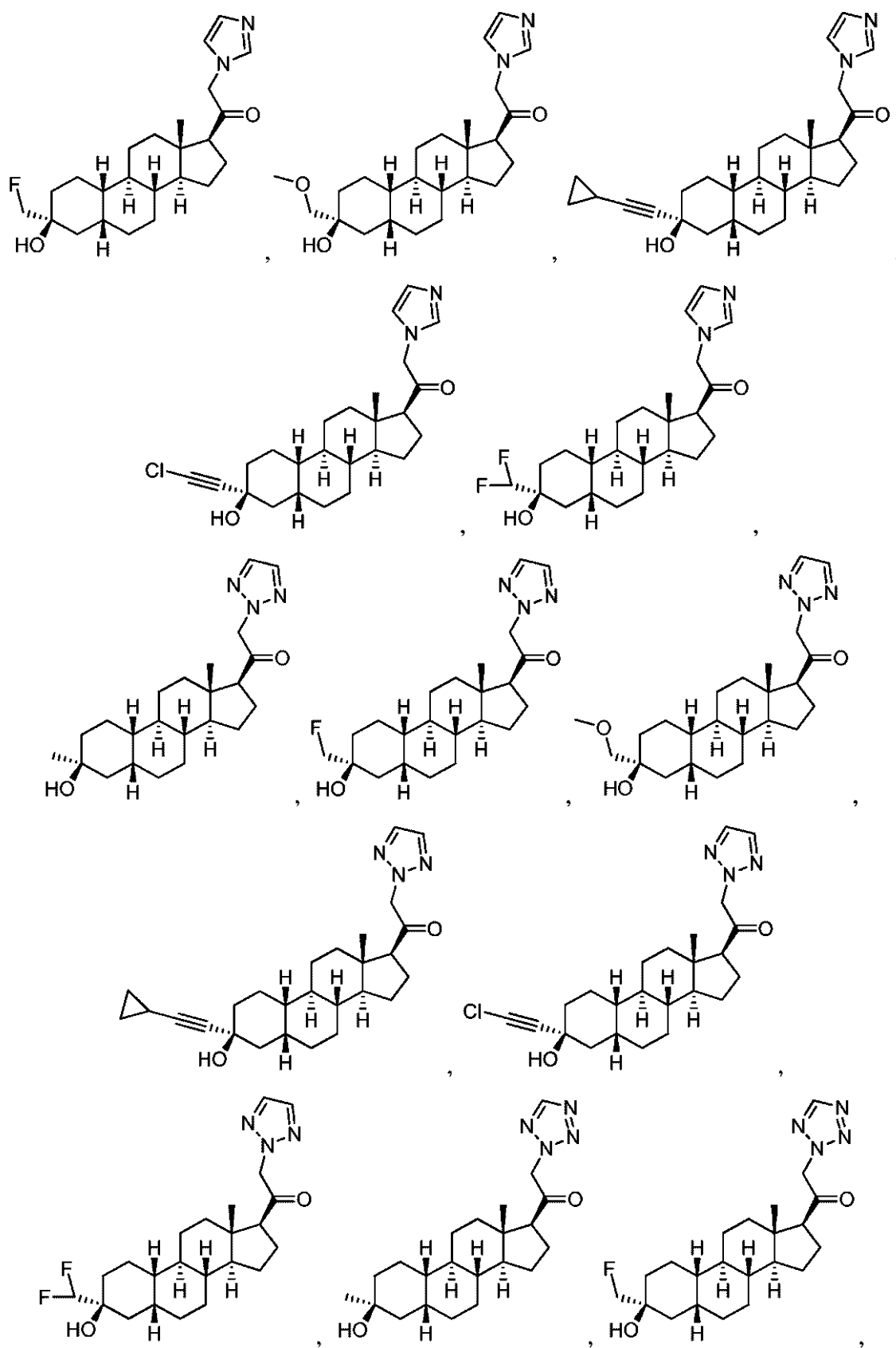
【化 1 5 1】



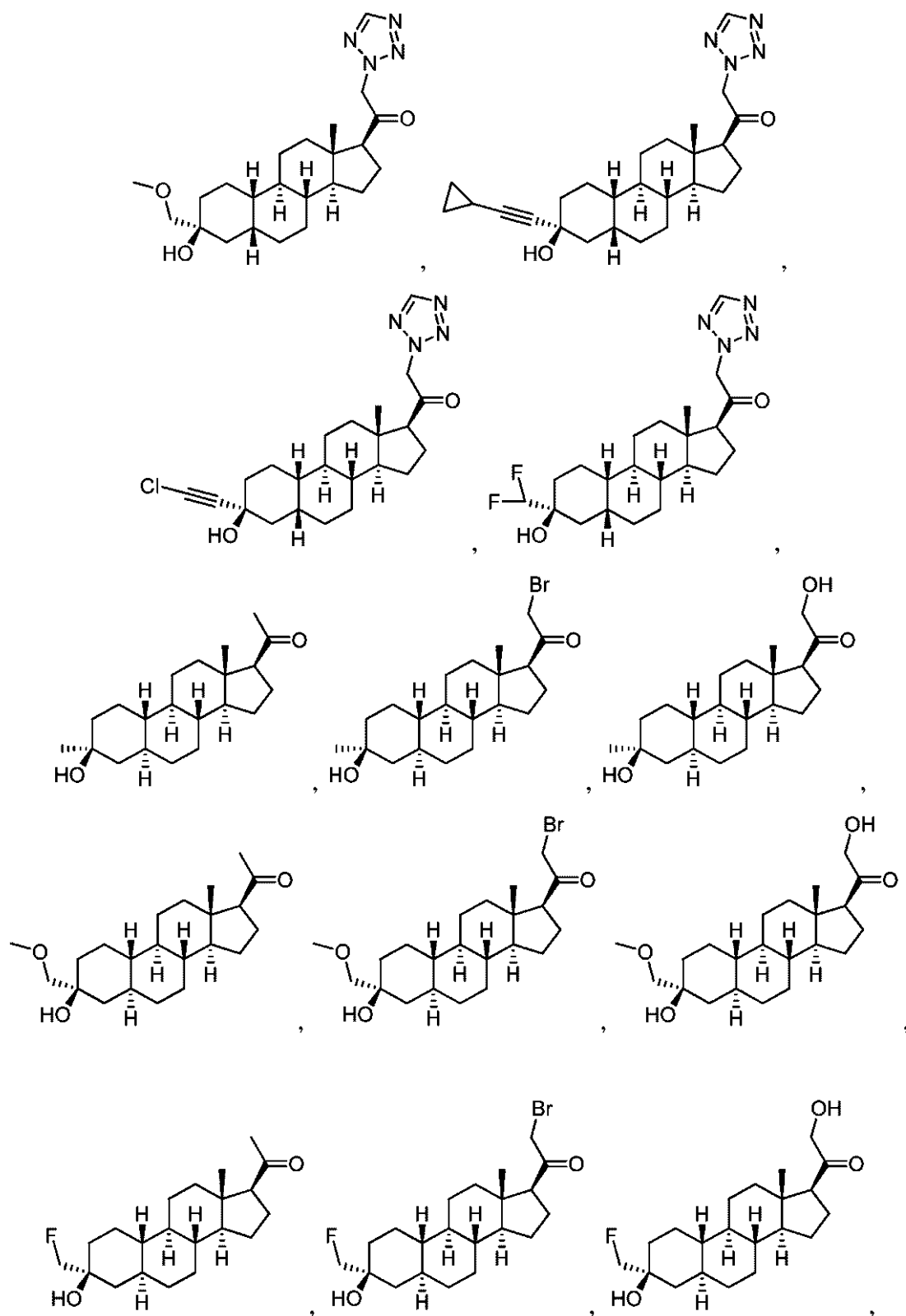
【化 1 5 2】



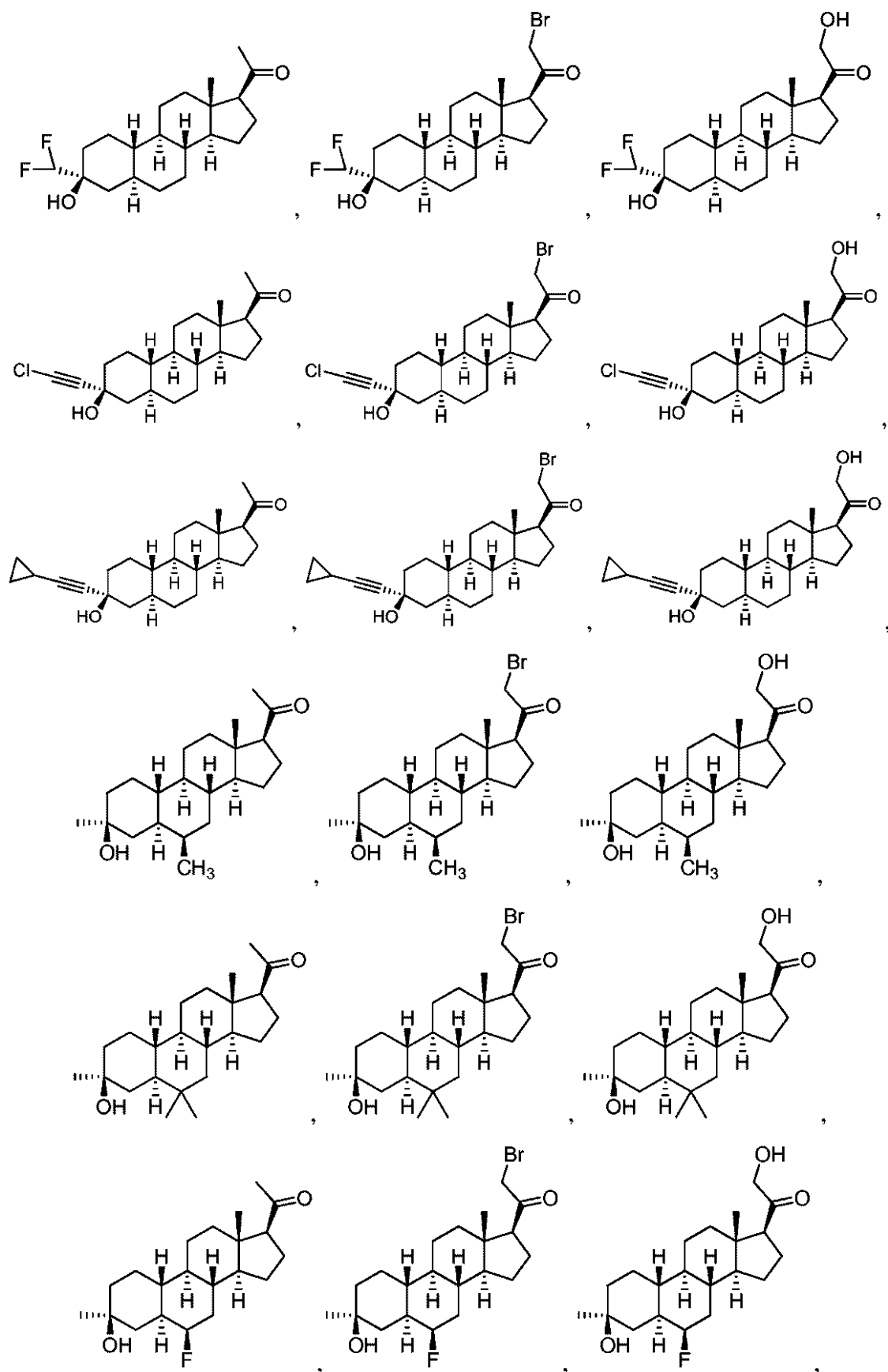
【化 1 5 3】



【化 1 5 4】



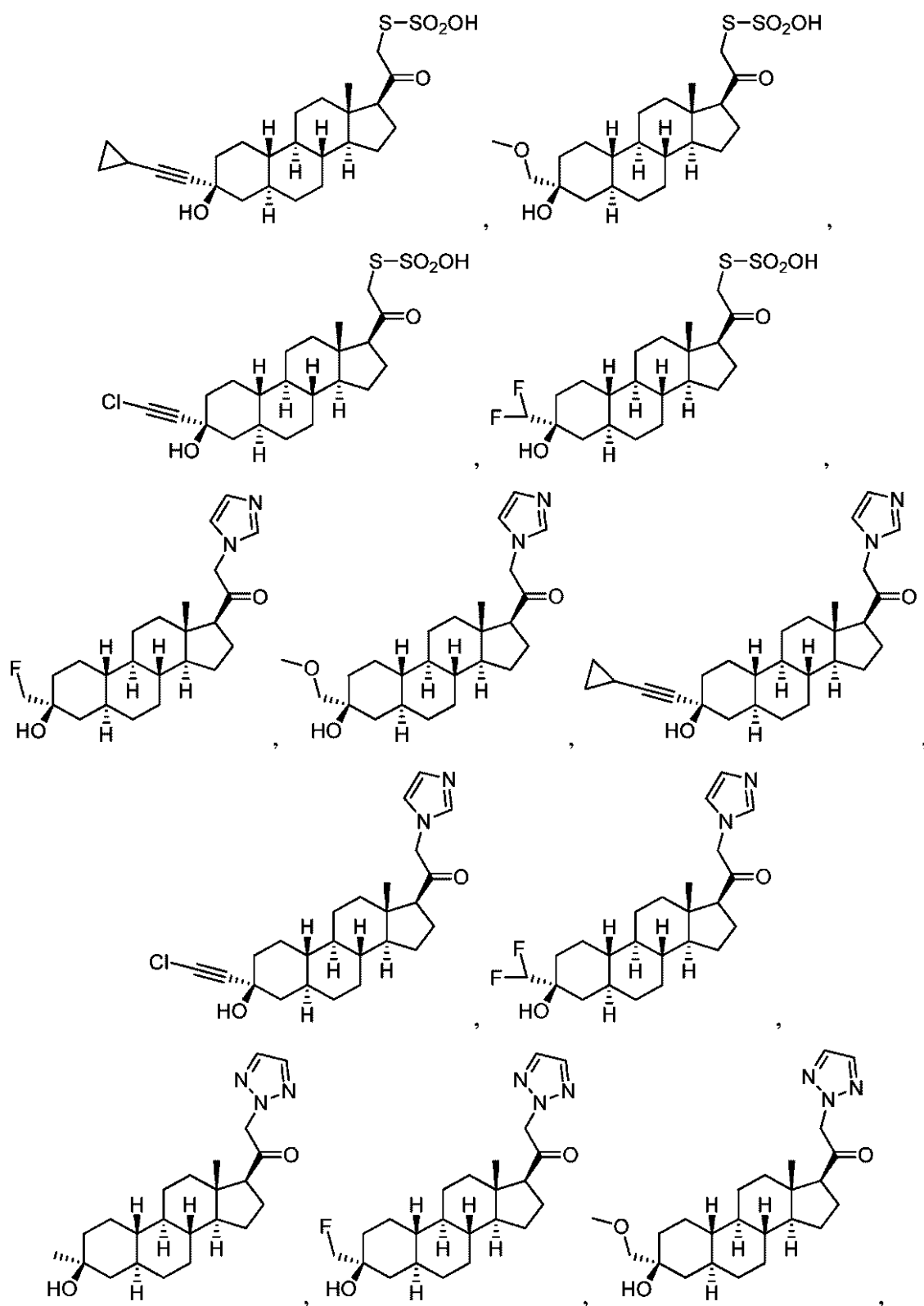
【化 1 5 5】



The image displays 11 chemical structures of steroid derivatives, arranged in four rows. Each structure is a steroid nucleus with a methyl group at C-10 and a hydroxyl group at C-3. The structures are separated by commas. The functional groups at the 20-position and 3-position are as follows:

- Structure 1: 20-acetyl, 3-(difluoromethyl)
- Structure 2: 20-(bromomethyl), 3-(difluoromethyl)
- Structure 3: 20-(hydroxymethyl), 3-(difluoromethyl)
- Structure 4: 20-acetyl, 3-keto
- Structure 5: 20-(bromomethyl), 3-keto
- Structure 6: 20-(hydroxymethyl), 3-keto
- Structure 7: 20-(4-morpholinylmethyl), 3-(hydroxymethyl)
- Structure 8: 20-(4-piperidinylmethyl), 3-(hydroxymethyl)
- Structure 9: 20-(pyrrolidin-1-ylmethyl), 3-(hydroxymethyl)
- Structure 10: 20-(1H-imidazol-2-ylmethyl), 3-(hydroxymethyl)
- Structure 11: 20-(sulfamoylmethyl), 3-(hydroxymethyl)
- Structure 12: 20-(sulfamoylmethyl), 3-(hydroxymethyl) with a fluorine atom at C-6

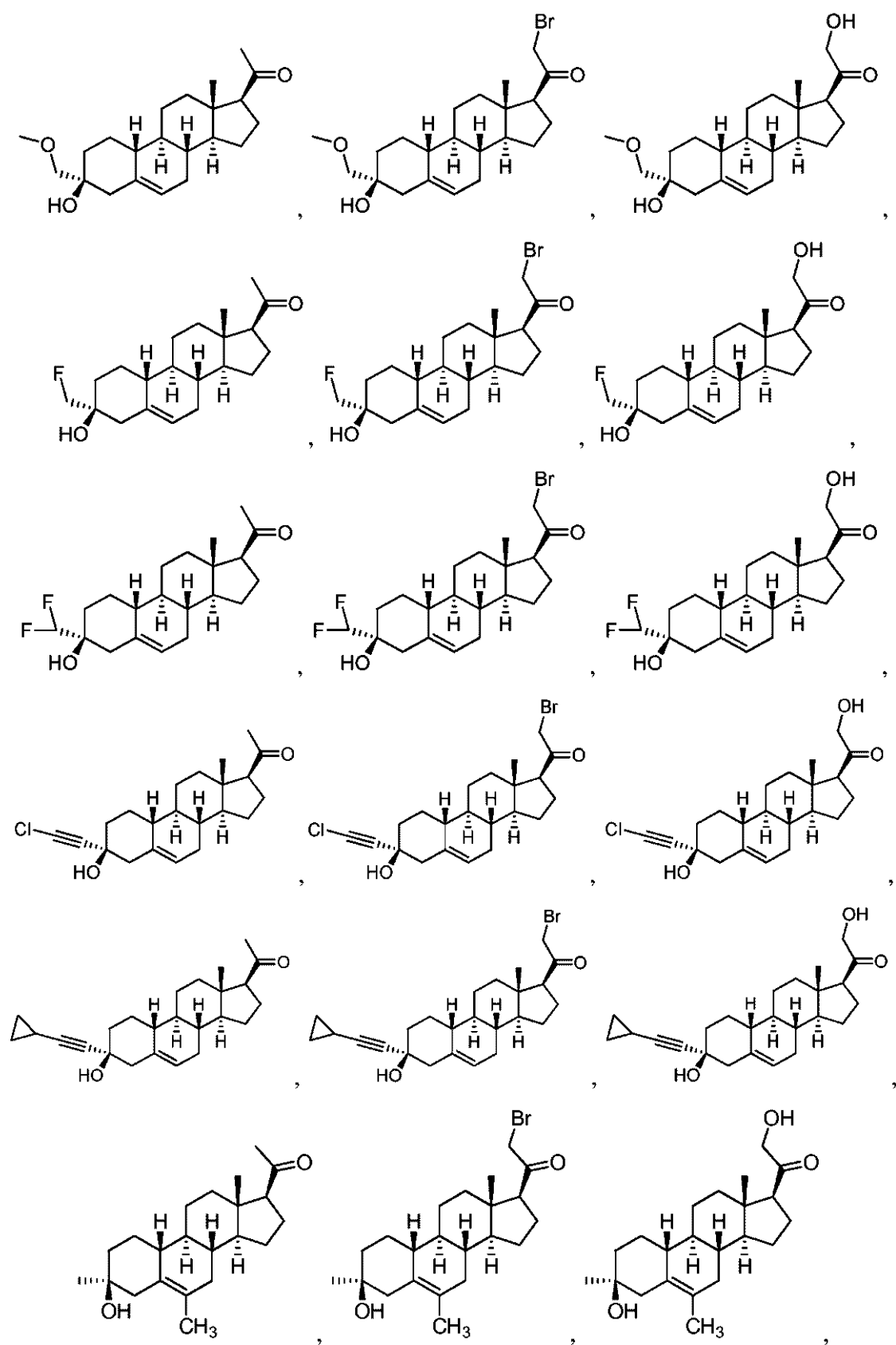
【化 1 5 7】



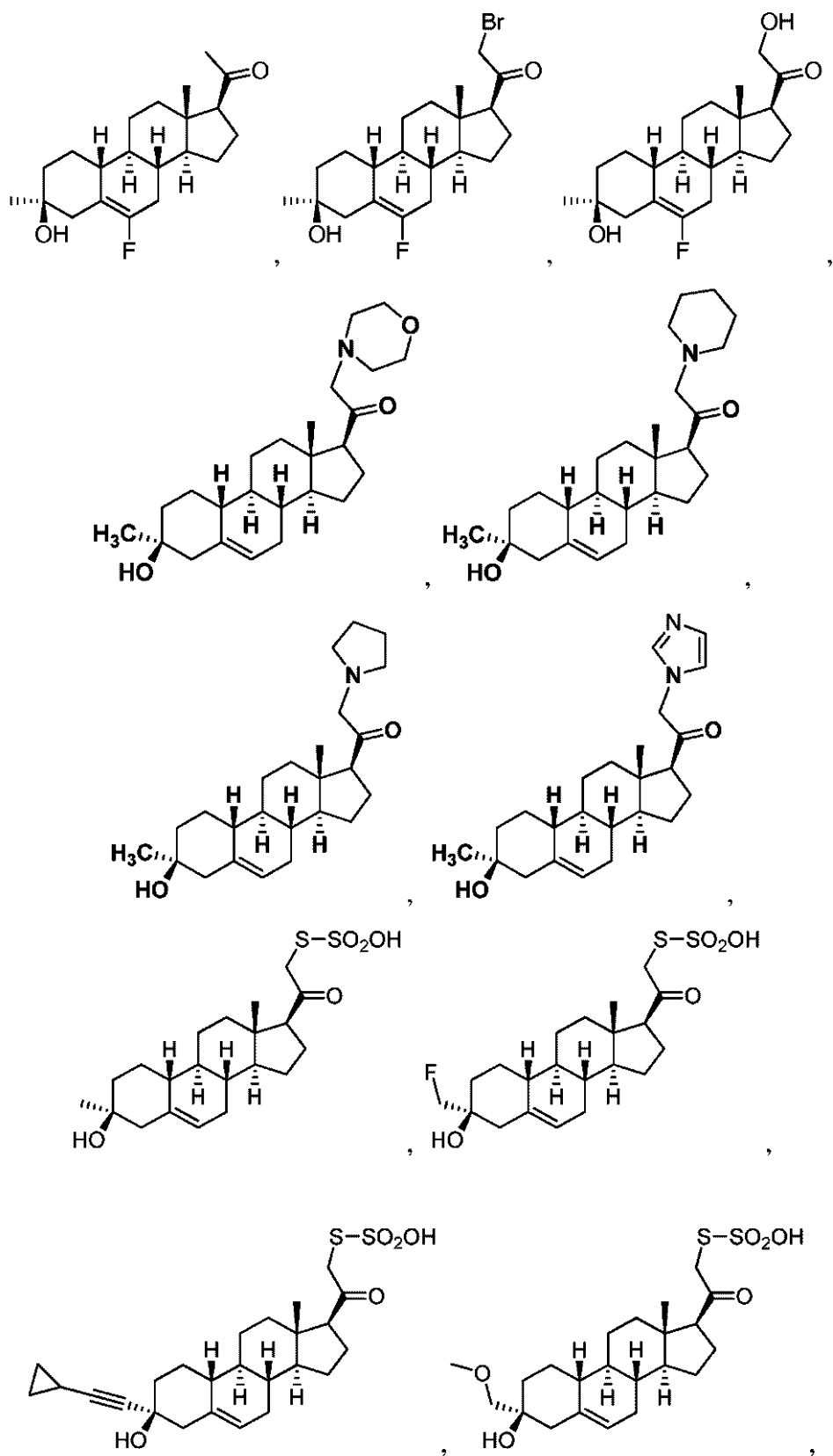
The image displays 11 chemical structures of steroid derivatives, arranged in four rows. Each structure is a steroid nucleus with a 14-azapent-1-en-3-one side chain at C-14. The structures are separated by commas. The substituents at the 3 and 14 positions are as follows:

- Structure 1: 3-(cyclopropylmethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 2: 3-(chloromethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 3: 3-(difluoromethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 4: 3-(hydroxymethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 5: 3-(hydroxymethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 6: 3-(methoxymethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 7: 3-(cyclopropylmethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 8: 3-(chloromethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 9: 3-(difluoromethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 10: 3-(hydroxymethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)
- Structure 11: 3-(hydroxymethyl), 14-(1H-1,2,4-triazol-1-ylmethyl)

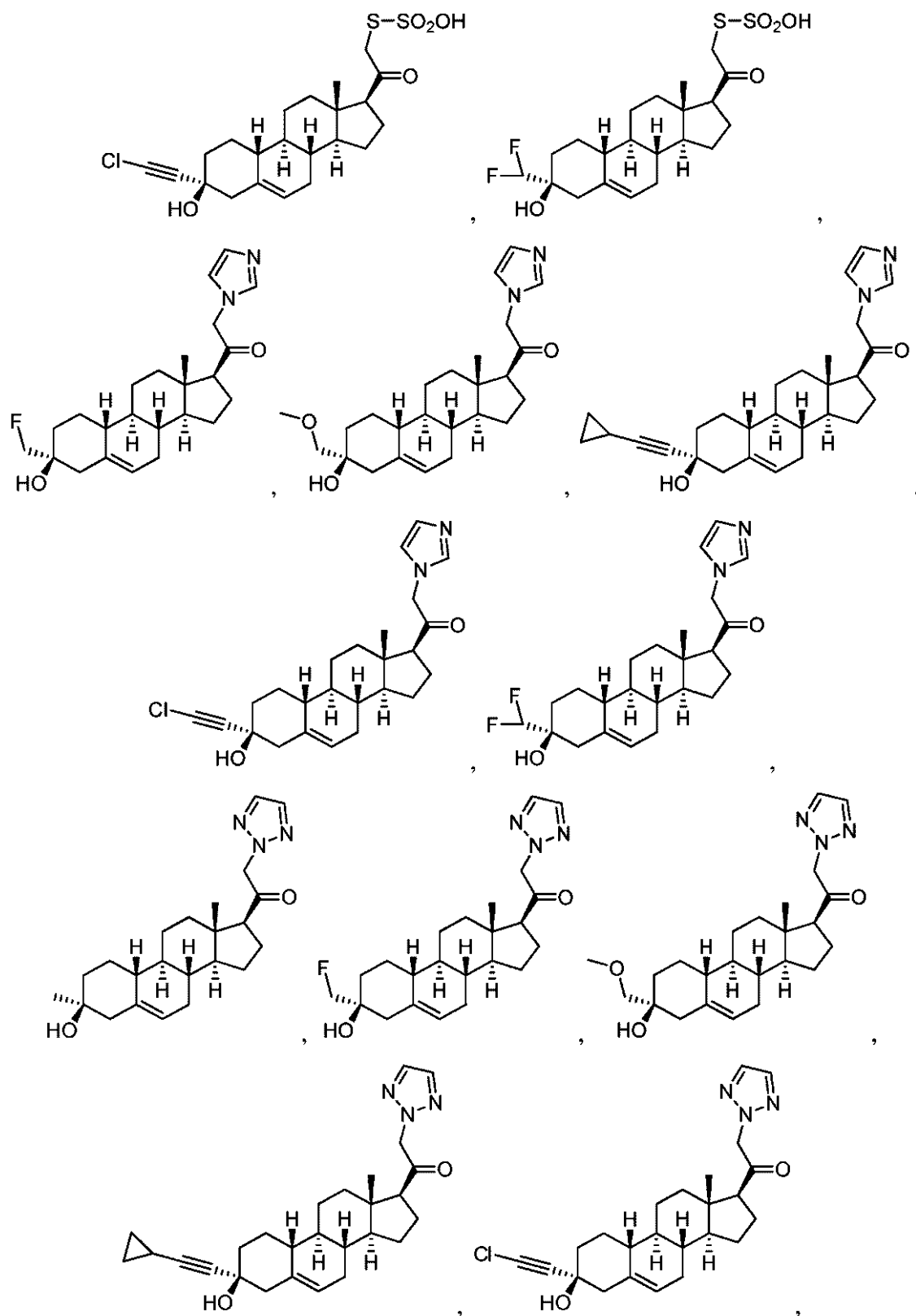
【化 1 5 9】



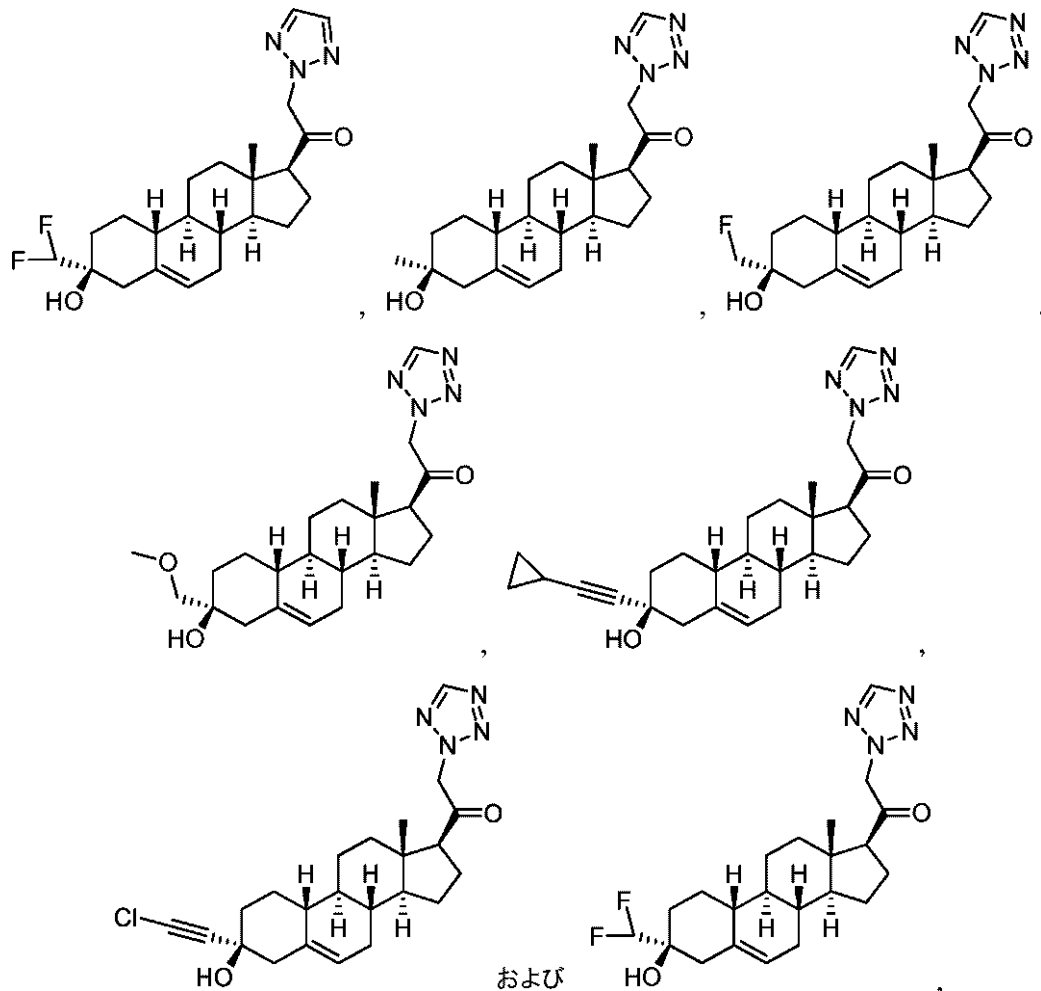
【化 1 6 0】



【化 1 6 1】



【化 1 6 2】



ならびにその薬学的に許容され得る塩からなる群より選択される、項目 2 に記載の化合物。

(項目 2 7)

薬学的に許容され得るキャリアおよび項目 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、薬学的組成物。

(項目 2 8)

CNS 関連障害の処置を必要とする被験体における CNS 関連障害を処置するための方法であって、有効量の項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を該被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目 2 9)

前記疾患または症状が、不眠、うつ、気分障害、痙攣性障害、記憶障害、注意障害、不安障害、双極性障害、精神分裂病、うつ、双極性障害、統合失調感情障害、気分障害、不安障害、人格障害、精神病、強迫性障害、外傷後ストレス障害、自閉症圏障害、気分変調、社会不安障害、強迫性障害、疼痛、睡眠障害、記憶障害、認知症、アルツハイマー病、発作性障害、外傷性脳損傷、脳卒中、嗜癮障害、自閉症、ハンチントン病、パーキンソン病、レット症候群、離脱症候群または耳鳴である、項目 2 8 に記載の方法。

(項目 3 0)

前記化合物が、経口的に投与される、項目 2 8 に記載の方法。

(項目 3 1)

前記化合物が、慢性的に投与される、項目 2 8 に記載の方法。