

【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6年2月7日(2024.2.7)

【国際公開番号】WO2021/155468
 【公表番号】特表2023-513679(P2023-513679A)
 【公表日】令和5年4月3日(2023.4.3)
 【年通号数】公開公報(特許)2023-061
 【出願番号】特願2022-548056(P2022-548056)
 【国際特許分類】

10

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

20

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

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

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

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

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

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

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

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

A 6 1 K 3 1 / 4 0 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 2 0 9 / 3 2 (2 0 0 6 . 0 1)

30

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

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

【 F I 】

C 0 7 D 2 0 9 / 1 4 C S P

A 6 1 P 2 5 / 1 8

A 6 1 P 2 5 / 2 2

A 6 1 P 2 5 / 2 4

A 6 1 P 2 5 / 3 0

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 2 8

40

A 6 1 P 2 5 / 0 8

A 6 1 P 2 5 / 1 6

A 6 1 P 9 / 1 0

A 6 1 P 2 5 / 1 4

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

A 6 1 P 2 1 / 0 0

A 6 1 P 2 7 / 0 2

A 6 1 P 2 7 / 1 6

A 6 1 P 2 5 / 0 2

A 6 1 P 2 5 / 0 6

50

A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 31/4045
 C 0 7 D 209/32
 A 6 1 K 31/661
 C 0 7 F 9/572 A

【手続補正書】【提出日】令和6年1月30日(2024.1.30)【手続補正1】【補正対象書類名】明細書【補正対象項目名】0299【補正方法】変更【補正の内容】

【0299】

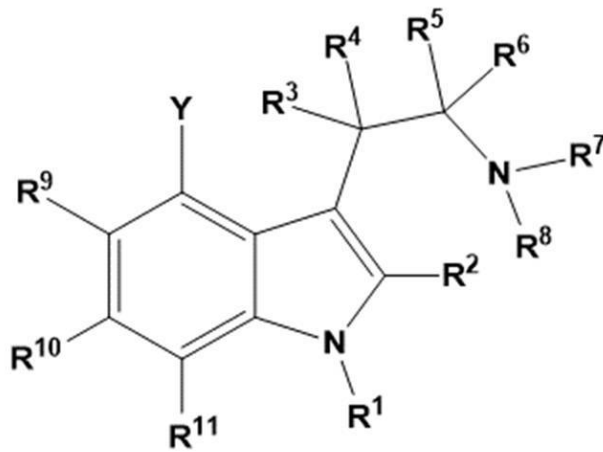
本開示で引用した全ての特許、特許出願、及び刊行物はその全体が参照により本開示に取り込まれる。これらの刊行物の開示はその全体が、本開示に記載されかつ特許請求された出願の出願日における水準をより完全に記載するために、参照により本願に取り込まれる。

本開示に係る態様には以下の態様も含まれる。

< 1 >

式(I)の化合物又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び/若しくはプロドラッグ:

【化16】



(I)

式中、R¹は、水素、C₁~C₃アルキル、C(O)R^{1.2}、CO₂OR^{1.2}、C(O)N(R^{1.2})₂、S(O)R^{1.2}、及びSO₂R^{1.2}から選択され;

R³、R⁴、R⁵、及びR⁶は、水素及びC₁~C₆アルキルから独立に選択され;

R⁷及びR⁸は、水素、置換又は無置換のC₁~C₆アルキル、置換又は無置換のC₂~C₆アルケニル、置換又は無置換のC₂~C₆アルキニル、置換又は無置換のC₁~C₆ハロアルキル、置換又は無置換のC₃~C₇シクロアルキル、置換又は無置換のC₃~C₇ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリール、及び置換又は無置換のヘテロアリールから独立に選択され、あるいは

R⁷及びR⁸は互いの間に存在する窒素原子と共に、O、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1.3}から選択される1~2個の追加的環ヘテロ部分を任意に(optionally)含む3員~7員のヘテロ環を形成し、

ここで、前記C₃~C₇シクロアルキル及び3員~7員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に(optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1.3}、C(O)N(R^{1.3})₂、SO₂R^{1.3}、

10

20

30

40

50

C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 6 シクロアルキル、並びに O、S、N、S(O)、SO₂、及び NR^{1.3} から選択される 1 ~ 2 個の環ヘテロ部分を含む 3 員 ~ 6 員のヘテロ環から選択される置換基により置換され；

R⁹、R^{1.0}、及び R^{1.1} は、水素、ハロゲン、CN、OR^{1.3}、N(R^{1.3})₂、SR^{1.3}、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、CO₂R^{1.3}、C(O)N(R^{1.3})₂、SOR^{1.3}、SO₂R^{1.3}、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル、並びに O、S、S(O)、SO₂、N、及び NR^{1.3} から選択される 1 ~ 2 個の環ヘテロ部分を含む 3 員 ~ 7 員のヘテロ環から独立に選択され、そして、前記 C 1 ~ C 6 アルキル基、C 1 ~ C 6 ハロアルキル基、C 2 ~ C 6 アルケニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 6 アルキニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル基、C 3 ~ C 7 シクロアルキル基、及び 3 員 ~ 7 員のヘテロ環基は、CN、OR^{1.3}、N(R^{1.3})₂、及び SR^{1.3} から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基で任意に (optionally) 置換され、そして、前記 C 3 ~ C 7 シクロアルキル及び 3 員 ~ 7 員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に (optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1.3}、C(O)N(R^{1.3})₂、SO₂R^{1.3}、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 6 シクロアルキル、並びに O、S、S(O)、SO₂、N、及び NR^{1.3} から選択される 1 ~ 2 個の環ヘテロ部分を含む 3 員 ~ 6 員のヘテロ環から選択される置換基により置換され；

10

20

Y はハロゲン及び X - A から選択され；

X は、O、NR^{1.3}、S、S(O)、及び SO₂ から選択され；

A は、水素、C 1 ~ C 10 アルキル、C 2 ~ C 10 アルケニル、C 2 ~ C 10 アルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル、C 4 ~ C 6 シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及び P(O)(OR^{1.2})₂ から選択され、

各 R^{1.2} は、水素、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキル、置換又は無置換の C 2 ~ C 6 アルケニル、置換又は無置換の C 2 ~ C 6 アルキニル、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 ハロアルキル、置換又は無置換の C 3 ~ C 7 シクロアルキル、置換又は無置換の C 3 ~ C 7 ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリール及び置換又は無置換のヘテロアリール、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキレン C 3 ~ C 7 シクロアルキル、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキレン C 3 ~ C 7 ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキレンアリール、及び置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキレンヘテロアリールから独立に選択され；

30

各 R^{1.3} は、水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル、並びに O、S、S(O)、SO₂、N、及び NR^{1.4} から選択される 1 ~ 2 個の環ヘテロ部分を含む 3 員 ~ 7 員のヘテロ環から独立に選択され、ここで、前記 C 1 ~ C 6 アルキル基、C 1 ~ C 6 ハロアルキル基、C 2 ~ C 6 アルケニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 6 アルキニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル基、C 3 ~ C 7 シクロアルキル基、及び 3 員 ~ 7 員のヘテロ環基は任意に (optionally)、CN、OR^{1.4}、N(R^{1.4})₂、及び SR^{1.4} から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基で置換され、そして、前記 C 3 ~ C 7 シクロアルキル及び 3 員 ~ 7 員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に (optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1.4}、C(O)N(R^{1.4})₂、SO₂R^{1.4}、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 6 シクロアルキル、並びに O、S、S(O)、SO₂、N、及び NR^{1.4} から選択される 1 ~ 2 個の環ヘテロ部分を含む 3 員 ~ 6 員のヘテロ環から選択される置換基により置換され、—

40

R^{1.4} は、水素、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 アルキル、置換又は無置換の C 2 ~ C 6 アルケニル、置換又は無置換の C 2 ~ C 6 アルキニル、置換又は無置換の C 1 ~ C 6 ハロ

50

アルキル、置換又は無置換のC₃～C₇シクロアルキル、置換又は無置換のヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリール、及び置換又は無置換のヘテロアリールから選択され；

ここで、R³、R⁴、R⁵、及びR⁶のうちの少なくとも1つは重水素であるか、又は、R³、R⁴、R⁵、及びR⁶のうちの少なくとも1つは重水素を含み、そして

ここで、全ての利用可能な水素原子は、任意に(optionally)、ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は、任意に(optionally)、その代替的同位体によって置き換えられている。

< 2 >

R¹はS(O)R^{1,2}及びSO₂R^{1,2}から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 >に記載の化合物。

10

< 3 >

R¹は水素、C₁～C₃アルキル、C(O)R^{1,2}、CO₂R^{1,2}、及びC(O)N(R^{1,2})₂から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 >に記載の化合物。

< 4 >

R¹は水素、CH₃、CH₂CH₃、及びCH(CH₃)₂から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 3 >に記載の化合物。

20

< 5 >

R¹が水素、重水素、Br、F、CH₃、CF₃、CD₃、CH₂CH₃、CD₂CD₃、CF₂CF₃、CH(CH₃)₂、CD(CD₃)₂、CF(CF₃)₂、C(CD₃)₃、C(CF₃)₃、及びC(CH₃)₂から選択される、< 4 >に記載の化合物。

< 6 >

R¹が水素、重水素、CH₃、CF₃、及びCD₃から選択される、< 5 >に記載の化合物。

30

< 7 >

R²が水素及びC₁～C₄アルキルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 >～< 6 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 8 >

R²が水素、CH₃、CH₂CH₃、CH(CH₃)₂、及びC(CH₃)₃から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 7 >に記載の化合物。

40

< 9 >

R²が水素及び重水素、Br、F、CH₃、CF₃、CD₃、CH₂CH₃、CD₂CD₃、CF₂CF₃、CH(CH₃)₂、CD(CD₃)₂、CF(CF₃)₂、C(CD₃)₃、C(CF₃)₃、及びC(CH₃)₃から選択される、< 8 >に記載の化合物。

< 10 >

R²が水素及び重水素から選択される、< 9 >に記載の化合物。

< 11 >

R³、R⁴、R⁵、及びR⁶は、水素及びC₁～C₄アルキルから独立に選択され、ここで、R³、R⁴、R⁵、及びR⁶のうちの少なくとも1つが重水素であるか、またはR³、R⁴、R⁵、及びR⁶のうちの少なくとも1つが重水素を含み、そして全ての利用可

50

能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 10 \rangle$ のうちいずれか1つに記載の化合物。

$\langle 12 \rangle$

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 が水素、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、及び $C(CH_3)_3$ から独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられており、そして、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つが重水素であるか、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つが重水素を含む、 $\langle 11 \rangle$ に記載の化合物。

10

$\langle 13 \rangle$

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 は水素、重水素、 Br 、 F 、 CH_3 、 CD_2H 、 CDH_2 、 CD_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CH_2D 、 CH_2CD_2H 、及び CD_2CD_3 から独立に選択され、ここで、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つは重水素であるか、または R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つが重水素を含む、 $\langle 12 \rangle$ に記載の化合物。

$\langle 14 \rangle$

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 は水素、重水素、 CH_3 、及び CD_3 から独立に選択され、ここで R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つが重水素であるか、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 のうちの少なくとも1つが重水素を含む、 $\langle 13 \rangle$ に記載の化合物。

20

$\langle 15 \rangle$

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 が全て重水素である、 $\langle 13 \rangle$ に記載の化合物。

$\langle 16 \rangle$

R^7 及び R^8 は、水素、置換又は無置換の $C1 \sim C4$ アルキル、置換又は無置換の $C2 \sim C6$ アルケニル、置換又は無置換の $C2 \sim C6$ アルキニル、置換又は無置換の $C1 \sim C4$ ハロアルキル、置換又は無置換の $C3 \sim C7$ シクロアルキル、置換又は無置換のヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリール、及び置換又は無置換のヘテロアリールから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 15 \rangle$ のうちいずれか1つに記載の化合物。

30

$\langle 17 \rangle$

R^7 及び R^8 は、水素、 $C1 \sim C4$ アルキル、及び $C2 \sim C6$ アルケニルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、 $\langle 16 \rangle$ に記載の化合物。

$\langle 18 \rangle$

R^7 及び R^8 は、水素及び $C1 \sim C4$ アルキルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、 $\langle 17 \rangle$ に記載の化合物。

40

$\langle 19 \rangle$

R^7 及び R^8 は、水素、重水素、 CH_3 、 CD_2H 、 CDH_2 、 CD_3 、 CH_2CH_3 、及び CD_2CD_3 から独立に選択される、 $\langle 18 \rangle$ に記載の化合物。

$\langle 20 \rangle$

R^7 及び R^8 はどちらも、 CH_3 、 CD_3 、 CH_2CH_3 、又は CD_2CD_3 である、 $\langle 19 \rangle$ に記載の化合物。

$\langle 21 \rangle$

R^7 及び R^8 は、互いの間に存在する窒素原子と共に4員～7員のヘテロ環を形成し、

50

該ヘテロ環は任意に (optionally)、O、S、S(O)、SO₂、N、及びN R¹³から選択される1~2個の追加的環ヘテロ部分を含み、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に (optionally) その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 > ~ < 15 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 22 >

R⁷及びR⁸は、互いの間に存在する窒素原子と共に、ピロリジニル、ピペリジニル、又はジアジナニルを形成し、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に (optionally) その代替的同位体によって置き換えられている、< 21 >に記載の化合物。

< 23 >

R⁷及びR⁸は、互いの間に存在する窒素原子と共に、ピロリジニル、ピペリジニル、又はジアジナニルを形成し、ここで全ての利用可能な水素は任意に (optionally) 重水素によって置き換えられている、< 22 >に記載の化合物。

< 24 >

R⁹、R¹⁰、及びR¹¹は、水素、ハロゲン、CN、OR¹³、N(R¹³)₂、SR¹³、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル、CO₂R¹³、C(O)N(R¹³)₂、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、及びC₂~C₆ハロアルキニルから独立に選択され、ここで前記C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、及びC₂~C₆ハロアルキニル基は、任意に (optionally)、CN、OR¹³、N(R¹³)₂、及びSR¹³から独立に選択される1つ又は複数の置換基で置換され、そして全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に (optionally) その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 > ~ < 23 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 25 >

R⁹、R¹⁰、及びR¹¹は、水素、F、Cl、Br、CN、OR¹³、N(R¹³)₂、SR¹³、CH₃、CH₂CH₃、CH(CH₃)₂、C(CH₃)₃、C₁~C₄ハロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル、CO₂R¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)N(R¹³)₂、C₂~C₆アルケニル、及びC₂~C₆アルキニルから独立に選択され、ここで前記C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、及びC₂~C₆アルキニル基は任意に (optionally)、CN、OR¹³、N(R¹³)₂、及びSR¹³から独立に選択される1つ又は2つの置換基で置換され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に (optionally) その代替的同位体によって置き換えられている、< 24 >に記載の化合物。

< 26 >

R⁹、R¹⁰、及びR¹¹は、水素、F、Cl、Br、CN、OR¹³、N(R¹³)₂、SR¹³、CH₃、CH₂CH₃、CH(CH₃)₂、C(CH₃)₃、C₁~C₄ハロアルキル、C₂~C₆ハロアルケニル、CO₂R¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、及びC₂~C₆アルケニルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に (optionally) その代替的同位体によって置き換えられている、< 25 >に記載の化合物。

< 27 >

R⁹、R¹⁰、及びR¹¹は、水素、重水素、F、Cl、Br、及びCNから独立に選択される、< 26 >に記載の化合物。

< 28 >

R¹⁰が水素、重水素、F、Cl、Br、及びCNから選択され、R⁹及びR¹¹が水

10

20

30

40

50

素及び重水素から選択される、< 27 >に記載の化合物。

< 29 >

R^{1 0}は水素、F、及びCNから選択され、R⁹及びR^{1 1}はどちらも水素である、< 28 >に記載の化合物。

< 30 >

各R^{1 2}は水素、置換または無置換のC1～C4アルキル、置換または無置換のC2～C6アルケニル、置換または無置換のC2～C6アルキニル、置換または無置換のC1～C4ハロアルキル、置換または無置換のC3～C7シクロアルキル、置換または無置換のヘテロシクロアルキル、置換または無置換のアリール、置換または無置換のヘテロアリールから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 >～< 29 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

10

< 31 >

各R^{1 2}は水素、C1～C4アルキル、及びC2～C6アルケニルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 30 >に記載の化合物。

< 32 >

R^{1 2}は水素、重水素、CH₃、CD₂H、CDH₂、CD₃、CH₂CH₃、及びCD₂CD₃から選択される、< 31 >に記載の化合物。

20

< 33 >

各R^{1 2}は水素、重水素、CH₃、CD₃、CH₂CH₃、及びCD₂CD₃から独立に選択される、< 32 >に記載の化合物。

< 34 >

Yがハロゲンであり、Yにおける前記ハロゲンがF、Cl、及びBrから選択される、< 1 >～< 33 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 35 >

YがX-Aである、< 1 >～< 33 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 36 >

XがO、NR^{1 3}、及びSから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 35 >に記載の化合物。

30

< 37 >

XがOである、< 35 >に記載の化合物。

< 38 >

Aは水素、C1～C6アルキル、C2～C6アルケニル、C2～C6アルキニル、C3～C7シクロアルキル、C4～C6シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びP(O)(OR^{1 2})₂から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 35 >に記載の化合物。

40

< 39 >

Aは水素、C1～C4アルキル、及びC2～C6アルケニルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 36 >に記載の化合物。

< 40 >

AはP(O)(OR^{1 2})₂であり、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optio

50

nally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 3 8 >に記載の化合物。

< 4 1 >

各R^{1 3}は水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル、並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 4}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 7員のヘテロ環から独立に選択され、ここで前記C 1 ~ C 6 アルキル基、C 1 ~ C 6 ハロアルキル基、C 2 ~ C 6 アルケニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル基、C 2 ~ C 6 アルキニル基、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル基、C 3 ~ C 7 シクロアルキル基、及び3員 ~ 7員のヘテロ環基は任意に(optionally)、CN、OR^{1 4}、N(R^{1 4})₂、及びSR^{1 4}から独立に選択される1つ又は複数の置換基で置換され、そして前記C 3 ~ C 7 シクロアルキル及び3員 ~ 7員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に(optionally)ハロゲン、CO₂R^{1 4}、C(O)N(R^{1 4})₂、SO₂R^{1 4}、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、及びC 2 ~ C 6 ハロアルキニルから選択される置換基によって置換され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 > ~ < 4 0 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 4 2 >

各R^{1 3}は水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 ハロアルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 2 ~ C 6 ハロアルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 4}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 7員のヘテロ環から独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 4 1 >に記載の化合物。

< 4 3 >

各R^{1 3}は水素、C 1 ~ C 6 アルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、及びC 2 ~ C 6 アルキニルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 4 2 >に記載の化合物。

< 4 4 >

各R^{1 3}は水素及びC 1 ~ C 6 アルキルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)重水素によって置き換えられている、< 4 3 >に記載の化合物。

< 4 5 >

R^{1 4}は水素、置換または無置換のC 1 ~ C 4 アルキル、置換または無置換のC 2 ~ C 6 アルケニル、置換または無置換のC 2 ~ C 6 アルキニル、置換または無置換のC 1 ~ C 4 ハロアルキル、置換または無置換のC 3 ~ C 7 シクロアルキル、置換または無置換のヘテロシクロアルキル、置換または無置換のアリール、及び置換または無置換のヘテロアリールから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、< 1 > ~ < 4 4 >のうちいずれか1つに記載の化合物。

< 4 6 >

R^{1 4}は水素、C 1 ~ C 4 アルキル、及びC 2 ~ C 6 アルケニルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き

10

20

30

40

50

換えられている、< 4 5 > に記載の化合物。

< 4 7 >

R¹⁻⁴は水素及びC 1 ~ C 4 アルキルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)重水素によって置き換えられている、< 4 6 > に記載の化合物。

< 4 8 >

R¹⁻⁴が水素、重水素、C H₃、C D₂ H、C D H₂、C D₃、C H₂ C H₃、及びC D₂ C D₃から選択される、< 4 7 > に記載の化合物。

< 4 9 >

前記式 (I) の化合物が以下に列挙した化合物、又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び/若しくはプロドラッグ、から選択される、< 1 > に記載の化合物:

10

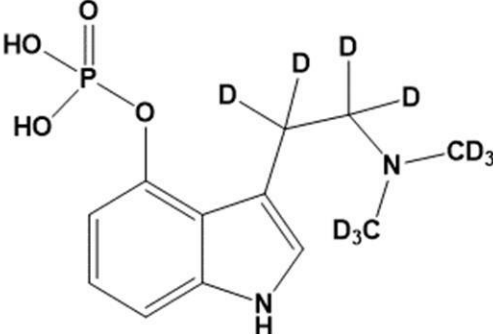
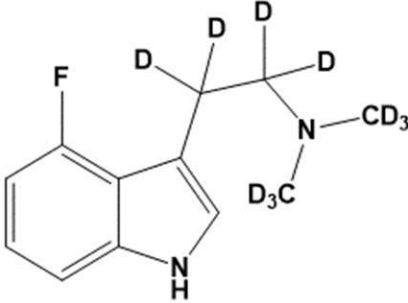
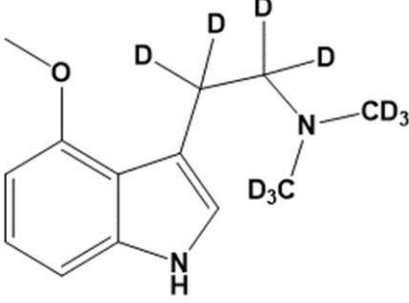
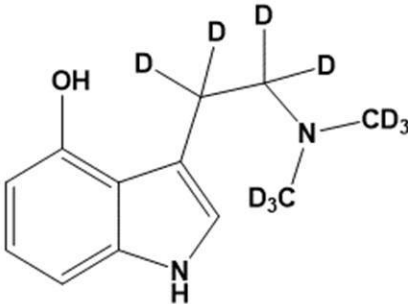
20

30

40

50

【表 2 3】

| 化合物識別番号 | 化学構造 |
|---------|--|
| I-3 |  |
| I-43 |  |
| I-44 |  <p style="text-align: right;">, 及び</p> |
| I-45 |  |

10

20

30

40

—

< 5 0 >

< 1 > ~ < 4 9 > のうちいずれか 1 つに記載の 1 種又は複数種の化合物、及びキャリアを含む、組成物。

< 5 1 >

< 1 > ~ < 4 9 > のうちいずれか 1 つに記載の 1 種又は複数種の化合物、及び医薬的に許容可能なキャリアを含む、医薬組成物。

< 5 2 >

生物学的サンプル内における、あるいは患者内における細胞内のセロトニン受容体を活

50

性化する方法であって、有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を前記細胞に投与することを含む方法。

< 53 >

治療有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を治療を必要とする対象に投与することを含む、セロトニン受容体の活性化により疾患、障害、又は状態を治療する方法。

< 54 >

生物学的サンプル内における、又は患者内における細胞内の5-HT_{2A}を活性化する方法であって、有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を前記細胞に投与することを含む方法。

< 55 >

治療有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を治療を必要とする対象に投与することを含む、精神疾患を治療する方法。

< 56 >

前記精神疾患が、幻覚及び妄想並びにこれらの組み合わせから選択される、< 55に記載の方法。

< 57 >

前記精神疾患が、不安障害；抑うつ；気分障害；精神障害；衝動制御及び嗜癮障害；薬物嗜癮；強迫性障害（OCD）；外傷後ストレス障害（PTSD）；ストレス応答症候群；解離症；離人症；作為症；性障害及び性別障害；身体症状症；及びこれらの組み合わせから選択される、< 55に記載の方法。

< 58 >

治療有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を治療を必要とする対象に投与することを含む、精神病又は精神病症状を治療する方法。

< 59 >

治療有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を治療を必要とする対象に投与することを含む、中枢神経系（CNS）の疾患、障害、若しくは状態及び/又は神経性の疾患、障害、若しくは状態を治療する方法。

< 60 >

前記CNSの疾患、障害、若しくは状態及び/又は神経性の疾患、障害、若しくは状態が、神経発達障害及び神経変性疾患を含む神経疾患、例として、アルツハイマー病；初老期認知症；老人性認知症；血管性認知症；レビー小体型認知症；認知障害、パーキンソン病、及びパーキンソン病関連障害、例えばパーキンソン認知症、皮質基底核変性症、及び核上性麻痺；てんかん；CNS外傷；CNS感染；CNS炎症；脳卒中；多発性硬化症；ハンチントン病；ミトコンドリア障害；脆弱X症候群；アンジェルマン症候群；遺伝性運動失調症；神経耳科学的障害及び眼球運動障害；網膜の神経変性疾患 筋萎縮性側索硬化症；遅発性ジスキネジア；多動障害；注意欠陥多動性障害及び注意欠陥障害；下肢静止不能症候群；トゥレット症候群；統合失調症；自閉症スペクトラム障害；結節性硬化症；レット症候群；脳性麻痺；神経性食欲不振症（AN）及び神経性過食症等（BN）の摂食障害等の、報酬系の障害；及び過食性障害（BED）、抜毛癮、自傷性皮膚症、爪噛み；片頭痛；繊維筋痛症；並びに、任意の病因の末梢神経障害、並びにこれらの組み合わせ、から選択される、< 59に記載の方法。

< 61 >

治療有効量の< 1 > ~ < 49 >のうちいずれか1つに記載の1種又は複数種の化合物を治療を必要とする非ヒト対象に投与することを含む、行動上の問題を治療する方法。

< 62 >

前記非ヒト対象が、神経疾患、行動上の問題、調教可能性の問題、及び/又はそれらの組み合わせを患っているイヌ又はネコである、< 61に記載の方法。

< 63 >

前記神経疾患、行動上の問題、調教可能性の問題が、不安、恐れ及びストレス、睡眠障

10

20

30

40

50

害、認知障害、攻撃性、及び/又はこれらの組み合わせを含むがこれらに限定されない、
 < 6 2 に記載の方法。>

< 6 4 >

セロトニン受容体の活性化による疾患、障害、又は状態の治療のために有用な他の既知
 の剤と組み合わせて、治療有効量の< 1 > ~ < 4 9 >のうちいずれか1つに記載の1種又
 は複数種の化合物を治療を必要とする対象に投与することを含む、セロトニン受容体の活
 性化により疾患、障害、又は状態を治療する方法。>

< 6 5 >

< 1 > ~ < 6 1 >のうちいずれか1つに記載の化合物及び追加的な治療剤を含む、医薬
 組成物。>

< 6 6 >

前記追加的な治療剤が精神賦活薬である、< 6 5 に記載の組成物。>

【手続補正2】

【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

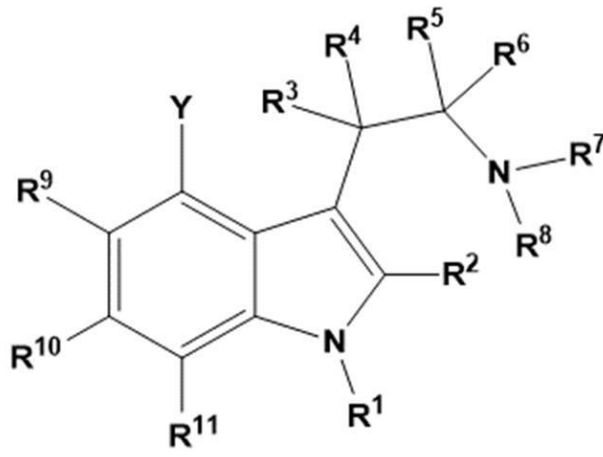
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び/若しくはプロドラ
 ッグ: 20

【化1】



(I)

式中、R¹は、水素、C₁ ~ C₃アルキル、C(O)R^{1 2}、CO₂R^{1 2}、C(O)
 N(R^{1 2})₂、S(O)R^{1 2}、及びSO₂R^{1 2}から選択され;

R²は水素及びC₁ ~ C₄アルキルから選択され、

R³、R⁴、R⁵、及びR⁶は、水素及びC₁ ~ C₆アルキルから独立に選択され;

R⁷及びR⁸は、水素、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキル、置換又は無置換のC₂
 ~ C₆アルケニル、置換又は無置換のC₂ ~ C₆アルキニル、置換又は無置換のC₁ ~ C
 6ハロアルキル、置換又は無置換のC₃ ~ C₇シクロアルキル、置換又は無置換のC₃ ~
 C₇ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリール、及び置換又は無置換のヘテロア
 リールから独立に選択され、あるいは 40

R⁷及びR⁸は互いの中に存在する窒素原子と共に、O、S、S(O)、SO₂、N、
 及びNR^{1 3}から選択される1 ~ 2個の追加的環ヘテロ部分を任意に(optionally)含む
 3員 ~ 7員のヘテロ環を形成し、

ここで、前記C₃ ~ C₇シクロアルキル及び3員 ~ 7員のヘテロ環はそれぞれさらに任
 意に(optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1 3}、C(O)N(R^{1 3})₂、SO₂R^{1 3}、
 C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロ 50

アルケニル、C₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、並びにO、S、N、S(O)、SO₂、及びNR^{1 3}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 6員のヘテロ環から選択される置換基により置換され；

R⁹、R^{1 0}、及びR^{1 1}は、水素、ハロゲン、CN、OR^{1 3}、N(R^{1 3})₂、SR^{1 3}、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆ハロアルケニル、CO₂R^{1 3}、C(O)N(R^{1 3})₂、SOR^{1 3}、SO₂R^{1 3}、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₃ ~ C₇シクロアルキル、並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 3}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 7員のヘテロ環から独立に選択され、そして、前記C₁ ~ C₆アルキル基、C₁ ~ C₆ハロアルキル基、C₂ ~ C₆アルケニル基、C₂ ~ C₆ハロアルケニル基、C₂ ~ C₆アルキニル基、C₂ ~ C₆ハロアルキニル基、C₃ ~ C₇シクロアルキル基、及び3員 ~ 7員のヘテロ環基は、CN、OR^{1 3}、N(R^{1 3})₂、及びSR^{1 3}から独立に選択される1つ又は複数の置換基で任意に(optionally)置換され、そして、前記C₃ ~ C₇シクロアルキル及び3員 ~ 7員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に(optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1 3}、C(O)N(R^{1 3})₂、SO₂R^{1 3}、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニル、C₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 3}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 6員のヘテロ環から選択される置換基により置換され；

Yはハロゲン及びX - Aから選択され；

Xは、O、NR^{1 3}、S、S(O)、及びSO₂から選択され；

Aは、C₁ ~ C₁₀アルキル、C₂ ~ C₁₀アルケニル、C₂ ~ C₁₀アルキニル、C₃ ~ C₇シクロアルキル、C₄ ~ C₆シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、及びP(O)(OR^{1 2})₂から選択され、

各R^{1 2}は、水素、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキル、置換又は無置換のC₂ ~ C₆アルケニル、置換又は無置換のC₂ ~ C₆アルキニル、置換又は無置換のC₁ ~ C₆ハロアルキル、置換又は無置換のC₃ ~ C₇シクロアルキル、置換又は無置換のC₃ ~ C₇ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のアリーール、置換又は無置換のヘテロアリーール、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキレンC₃ ~ C₇シクロアルキル、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキレンC₃ ~ C₇ヘテロシクロアルキル、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキレンアリーール、及び置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキレンヘテロアリーールから独立に選択され；

各R^{1 3}は、水素、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニル、C₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₃ ~ C₇シクロアルキル、並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 4}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 7員のヘテロ環から独立に選択され、ここで、前記C₁ ~ C₆アルキル基、C₁ ~ C₆ハロアルキル基、C₂ ~ C₆アルケニル基、C₂ ~ C₆ハロアルケニル基、C₂ ~ C₆アルキニル基、C₂ ~ C₆ハロアルキニル基、C₃ ~ C₇シクロアルキル基、及び3員 ~ 7員のヘテロ環基は任意に(optionally)、CN、OR^{1 4}、N(R^{1 4})₂、及びSR^{1 4}から独立に選択される1つ又は複数の置換基で置換され、そして、前記C₃ ~ C₇シクロアルキル及び3員 ~ 7員のヘテロ環はそれぞれさらに任意に(optionally)、ハロゲン、CO₂R^{1 4}、C(O)N(R^{1 4})₂、SO₂R^{1 4}、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニル、C₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、並びにO、S、S(O)、SO₂、N、及びNR^{1 4}から選択される1 ~ 2個の環ヘテロ部分を含む3員 ~ 6員のヘテロ環から選択される置換基により置換され、

R^{1 4}は、水素、置換又は無置換のC₁ ~ C₆アルキル、置換又は無置換のC₂ ~ C₆アルケニル、置換又は無置換のC₂ ~ C₆アルキニル、置換又は無置換のC₁ ~ C₆ハロアルキル、置換又は無置換のC₃ ~ C₇シクロアルキル、置換又は無置換のヘテロシクロ

10

20

30

40

50

アルキル、置換又は無置換のアリール、及び置換又は無置換のヘテロアリールから選択され；

ここで、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、及び R^8 はそれぞれ独立に重水素であるか、又は重水素を含み、そして

ここで、全ての利用可能な水素原子は、任意に(optionally)、ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は、任意に(optionally)、その代替的同位体によって置き換えられている。

【請求項 2】

R^1 は $S(O)R^{1,2}$ 及び $SO_2R^{1,2}$ から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 に記載の化合物。

10

【請求項 3】

R^1 は水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C(O)R^{1,2}$ 、 $CO_2R^{1,2}$ 、及び $C(O)N(R^{1,2})_2$ から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が水素、重水素、 CH_3 、 CF_3 、及び CD_3 から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

20

【請求項 5】

R^2 が水素、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、及び $C(CH_3)_3$ から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 ~ 4 のうちいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R^2 が水素及び重水素から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 は、水素及び $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立に選択され、ここで、 R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 はそれぞれ独立に重水素であるか、または重水素を含む、請求項 1 ~ 6 のうちいずれか一項に記載の化合物。

30

【請求項 8】

R^3 、 R^4 、 R^5 、及び R^6 が全て重水素である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^7 及び R^8 はどちらも、 CD_3 又は CD_2CD_3 である、請求項 1 ~ 8 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

R^7 及び R^8 は、互いの中に存在する窒素原子と共に 4 員 ~ 7 員のヘテロ環を形成し、該ヘテロ環は任意に(optionally)、O、S、 $S(O)$ 、 SO_2 、N、及び $NR^{1,3}$ から選択される 1 ~ 2 個の追加的環ヘテロ部分を含み、ここで少なくとも 1 つの利用可能な水素原子は重水素であり、残りの水素原子はどれも任意に(optionally)フッ素原子によって置き換えられている、請求項 1 ~ 8 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

40

【請求項 11】

R^9 、 R^{10} 、及び R^{11} は、水素、重水素、F、Cl、Br、及びCNから独立に選択される、請求項 1 ~ 9 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

各 $R^{1,2}$ は水素、置換または無置換の $C_1 \sim C_4$ アルキル、置換または無置換の $C_2 \sim C_6$ アルケニル、置換または無置換の $C_2 \sim C_6$ アルキニル、置換または無置換の $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、置換または無置換の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、置換または無置換のヘテロシクロアルキル、置換または無置換のアリール、及び置換または無置換のヘテロア

50

ルールから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 ~ 1.1 のうちいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1.3】

各 $R^{1.2}$ は水素、C 1 ~ C 4 アルキル、及び C 2 ~ C 6 アルケニルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1.2 に記載の化合物。

【請求項 1.4】

Y がハロゲンであり、Y における前記ハロゲンが F、Cl、及び Br から選択される、請求項 1 ~ 1.3 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1.5】

Y が X - A であり、X が O、 $NR^{1.3}$ 、及び S から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 ~ 1.3 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1.6】

X が O である、請求項 1.5 に記載の化合物。

【請求項 1.7】

A は C 1 ~ C 6 アルキル、C 2 ~ C 6 アルケニル、C 2 ~ C 6 アルキニル、C 3 ~ C 7 シクロアルキル、C 4 ~ C 6 シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及び $P(O)(OR^{1.2})_2$ から選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1.6 に記載の化合物。

【請求項 1.8】

A は C 1 ~ C 4 アルキル及び C 2 ~ C 6 アルケニルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1.7 に記載の化合物。

【請求項 1.9】

A は $P(O)(OR^{1.2})_2$ であり、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1.7 に記載の化合物。

【請求項 2.0】

各 $R^{1.3}$ は水素及び C 1 ~ C 6 アルキルから独立に選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)重水素によって置き換えられている、請求項 1 ~ 1.9 のうちいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2.1】

$R^{1.4}$ は水素、置換または無置換の C 1 ~ C 4 アルキル、置換または無置換の C 2 ~ C 6 アルケニル、置換または無置換の C 2 ~ C 6 アルキニル、置換または無置換の C 1 ~ C 4 ハロアルキル、置換または無置換の C 3 ~ C 7 シクロアルキル、置換または無置換のヘテロシクロアルキル、置換または無置換のアリール、及び置換または無置換のヘテロアリールから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に(optionally)ハロゲン原子によって置き換えられ、及び/又は全ての利用可能な原子は任意に(optionally)その代替的同位体によって置き換えられている、請求項 1 ~ 2.0 のうちいずれか一項に記載の化合物。

10

20

30

40

50

【請求項 2 2】

R¹⁴ は水素及び C 1 ~ C 4 アルキルから選択され、ここで全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) ハロゲン原子によって置き換えられ、及び / 又は全ての利用可能な水素原子は任意に (optionally) 重水素によって置き換えられている、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

前記式 (I) の化合物が以下に列挙した化合物、又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び / 若しくはプロドラッグ、から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

【表 1】

| 化合物識別番号 | 化学構造 |
|---------|--------|
| I-3 | |
| I-43 | 及び |
| I-44 | |

10

20

30

40

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 2 3 のうちいずれか 1 項に記載の 1 種又は複数種の化合物又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び / 若しくはプロドラッグ、及び医薬的に許容可能なキャリアを含む、医薬組成物。

【請求項 2 5】

請求項 1 ~ 2 3 のうちいずれか 1 項に記載の 1 種又は複数種の化合物又はその医薬的に許容可能な塩、溶媒和物、及び / 若しくはプロドラッグを含む、セロトニン受容体の活性化により治療される疾患、障害、又は状態を治療するための医薬。

【請求項 2 6】

50

前記疾患、障害、又は状態が精神疾患、精神病、又は精神病症状である、請求項 2.5 に記載の医薬。

【請求項 2.7】

前記疾患、障害、又は状態が、外傷後ストレス障害 (PTSD)、大うつ病性障害、不安障害、抑うつ、気分障害、精神障害、衝動制御障害、薬物嗜癖障害、嗜癖障害、強迫性障害 (OCD)、パニック障害、摂食障害、精神神経疾患、精神病症状、ストレス応答症候群、解離症、病状末期のがん患者における抑うつ、生命を脅かす疾患に付随する抑うつ、生命を脅かす疾患に関連する不安、終末期不安、全般不安障害、注意欠陥多動性障害、アルツハイマー病における抑うつ、及びこれらの組み合わせ、から選択される、請求項 2.5 に記載の医薬。

10

20

30

40

50