

【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31年4月25日 (2019.4.25)

【公表番号】特表2018-508554(P2018-508554A)

【公表日】平成30年3月29日 (2018.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2018-012

【出願番号】特願2017-549093(P2017-549093)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

C 0 7 D 491/147 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/14 1 0 2

C 0 7 D 491/147 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 13/02

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

【手続補正書】

【提出日】平成31年3月15日 (2019.3.15)

【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

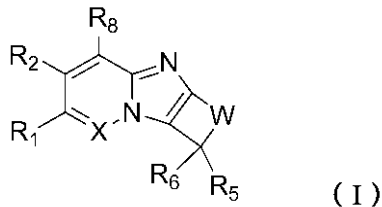
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



〔式中、

X は N であり；

W は

(i) - (CR₃R₃)₂₋₅ - ；(ii) - (CR₃R₃)_x - Y - (CR₃R₃)_y - ；または(iii) - Y - (CR₃R₃)₂₋₃ - Y - 、 - CR₃R₃ - Y - (CR₃R₃)₂ - Y - または - Y - (CR₃R₃)₂ - Y - CR₃R₃ - であり；各 Y は独立して O、NR₄ または S(O)_p であり；

x は 0、1、2、3 または 4 であり；

y は 0、1、2、3 または 4 であるが、ただし (x + y) は 1、2、3 または 4 であり；

R₁ は H、R_{1a}、C₁₋₆ ハロアルキル、0 ~ 6 個の R_{1a} で置換されている C₂₋₆ アルケニル、0 ~ 4 個の R_{1a} で置換されている C₂₋₆ アルキニル、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 3 ~ 14 員カルボシクリル)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されているアリール)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 5 ~ 7 員ヘテロシクリル) または - (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている単環または二環式ヘテロアリール) であり；

R₂ は H、ハロ、- CN、- CF₃、- OCF₃、- NO₂、0 ~ 6 個の R_{1a} で置換されている C₁₋₆ アルキル、- (CR_gR_g)_r OR_e、- (CR_gR_g)_r NR_cR_c、- (CR_gR_g)_r S(O)_pR_b、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 3 ~ 14 員カルボシクリル)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されているアリール)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 5 ~ 7 員ヘテロシクリル) または - (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている単環式ヘテロアリール) であり；

各 R₃ は独立して H、ハロ、- CN、- OH、- OCF₃、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、- (CR_gR_g)_r C(O)R_b、- (CR_gR_g)_r C(O)OR_b、- (CR_gR_g)_r C(O)NR_cR_c、- (CR_gR_g)_r OR_e、- (CR_gR_g)_r OC(O)R_b、- (CR_gR_g)_r OC(O)NR_cR_c、- (CR_gR_g)_r OC(O)OR_d、- (CR_gR_g)_r NR_cR_c、- (CR_gR_g)_r NR_bC(O)R_d、- (CR_gR_g)_r NR_bC(O)OR_d、- (CR_gR_g)_r NR_bC(O)NR_cR_c、- (CR_gR_g)_r NR_bS(O)_pR_d、- (CR_gR_g)_r S(O)_pR_b、- (CR_gR_g)_r S(O)_pNR_cR_c、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 3 ~ 14 員カルボシクリル)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されているアリール)、- (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている 5 ~ 7 員ヘテロシクリル) または - (CR_gR_g)_r (0 ~ 3 個の R_{1a} で置換されている単環または二環式ヘテロア

リール)であるか；または2個の R_3 は、それらが結合している炭素原子と一体となって $C=O$ 、 $C=NOR_b$ 、スピロカルボシクリル基またはスピロヘテロシクリル基を形成し；

各 R_4 は独立してH、0～6個の R_{1a} で置換されている C_{1-6} アルキル、0～6個の R_{1a} で置換されている C_{3-7} シクロアルキル、 $-C(O)R_b$ 、 $-C(O)NR_cR_c$ 、 $-C(O)OR_b$ 、 $-S(O)_2R_b$ 、 $-S(O)_2NR_cR_c$ 、 $-S(O)_2OR_b$ 、 $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている3～14員カルボシクリル)、 $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されているアリール)、 $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている5～7員ヘテロシクリル)または $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている単環式ヘテロアリール)であり；

R_5 は $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている3～14員カルボシクリル)、 $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されているアリール)、 $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている5～10員ヘテロシクリル)または $-(CR_gR_g)_r$ (0～3個の R_{1a} で置換されている単環または二環式ヘテロアリール)であり；

R_6 はH、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであるか；

または R_5 および R_6 は、それらが結合している炭素原子と一体となって5～6員スピロカルボシクリル環またはスピロヘテロシクリル環を形成し、各々0～6個の R_{5a} で置換されており；

各 R_{5a} は独立してH、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} フルオロアルキルおよび C_{1-3} アルコキシから選択されるか；またはスピロ炭素環式またはスピロヘテロ環式環の隣接炭素原子に結合している2個の R_{5a} は、それらが結合している炭素原子と一体となってベンゾ環を形成し、該ベンゾは、0～4個の R_f で置換されているか；またはスピロ炭素環式環またはスピロヘテロ環式環の同じ炭素原子に結合した2個の R_{5a} は $=O$ を形成し；

R_8 はH、ハロ、 $-CN$ 、 C_{1-6} ハロアルキルまたは C_{1-3} アルコキシであり；

各 R_{1a} は独立してF、Cl、 $-CN$ 、0～6個の R_a で置換されている C_{1-6} アルキル、0～6個の R_a で置換されている C_{3-6} シクロアルキル、0～6個の R_a で置換されている C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-3} ハロアルコキシ、0～6個の R_a で置換されているヘテロシクロアルキル、0～6個の R_a で置換されているアリール、0～6個の R_a で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリール、 $-OCH_2$ (0～6個の R_a で置換されているアリール)、 $-C(O)R_b$ 、 $-C(O)OR_b$ 、 $-C(O)NR_cR_c$ 、 $-OC(O)R_b$ 、 $-OC(O)NR_cR_c$ 、 $-OC(O)OR_d$ 、 $-NR_cR_c$ 、 $-NR_bC(O)R_d$ 、 $-NR_bC(O)OR_d$ 、 $-NR_bS(O)_pR_d$ 、 $-NR_bC(O)NR_cR_c$ 、 $-NR_bS(O)_pNR_cR_c$ 、 $-S(O)_pR_b$ 、 $-S(O)_pNR_cR_c$ または $-C(O)NR_b(CH_2)_{1-3}NR_cR_c$ であり；

各 R_a は独立してハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} フルオロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} フルオロアルコキシ、 $-C(O)OH$ 、 $-CH_2C(O)OH$ 、 $-C(O)(C_{1-3}$ アルキル)、 $-C(O)O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-OC(O)(C_{1-3}$ アルキル)、 $-NH(C_{1-3}$ アルキル)、 $-N(C_{1-3}$ アルキル) $_2$ 、 $-C(O)NH(C_{1-3}$ アルキル)、 $-OC(O)NH(C_{1-3}$ アルキル)、 $-NHC(O)NH(C_{1-3}$ アルキル)、 $-C(=NH)(NH_2)$ 、 C_{3-7} カルボシクリル、アリール、5～7員ヘテロシクリル、単環または二環式ヘテロアリール、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ベンジル)、 $-O$ (ヘテロシクリル)、 $-S(C_{1-3}$ アルキル)、 $-S$ (アリール)、 $-S$ (ヘテロシクリル)、 $-S(O)$ (アリール)、 $-S(O)$ (ヘテロシクリル)、 $S(O)_2$ (アリール)、 $-S(O)_2$ (ヘテロシクリル)、 $-NHS(O)_2$ (アリール)、 $-NHS(O)_2$ (ヘテロシクリル)、 $-NHS(O)_2NH$ (アリール)、 $-NHS(O)_2NH$ (ヘテロシクリル)、 $-NH$ (アリール)、 $-NH$ (ヘテロシクリル)、 $-NHC(O)$ (アリール)、 $-NHC(O)(C_{1-3}$ アルキル)、 $-NHC(O)$ (ヘテロシクリル)、 $-OC(O)$ (アリール)、 $-OC(O)$ (ヘテロシクリル)、 $-NHC(O)NH$ (アリール)、 $-NHC(O)NH$ (ヘテロシクリル)、 $-OC(O)O(C_{1-3}$ アルキル)、 $-OC(O)$

O(アリーール)、-OC(O)O(ヘテロシクリル)、-OC(O)NH(アリーール)、-OC(O)NH(ヘテロシクリル)、-NHC(O)O(アリーール)、-NHC(O)O(ヘテロシクリル)、-NHC(O)O(C₁₋₃アルキル)、-C(O)NH(アリーール)、-C(O)NH(ヘテロシクリル)、-C(O)O(アリーール)、-C(O)O(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂NH(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂NH(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)NH(アリーール)、-(CH₂)₀₋₃C(O)NH(ヘテロシクリル)、-OC(O)N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-OC(O)N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)O(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)O(ヘテロシクリル)、-C(O)N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-C(O)N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-NHS(O)₂N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-NHS(O)₂N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-NHP(O)₂N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-NHC(O)N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-NHC(O)N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)S(O)₂N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)N(C₁₋₃アルキル)(アリーール)、-N(C₁₋₃アルキル)C(O)N(C₁₋₃アルキル)(ヘテロシクリル)または-Si(C₁₋₃アルキル)₃であり；

各R_bは独立してH、0～6個のR_fで置換されているC₁₋₆アルキル、0～6個のR_fで置換されているC₃₋₇シクロアルキル、0～6個のR_fで置換されているヘテロシクロアルキル、0～3個のR_fで置換されているアリーールまたは0～3個のR_fで置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリーールであり；

各R_cは独立してH、0～6個のR_fで置換されているC₁₋₆アルキル、0～6個のR_fで置換されているC₃₋₇シクロアルキル、0～6個のR_fで置換されているヘテロシクロアルキル、0～3個のR_fで置換されているアリーールまたは0～3個のR_fで置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリーールであるか；または同じ窒素に結合しているとき、2個のR_cは、それらが結合している窒素原子とともに、場合によりR_gで置換されていてよい4～8員ヘテロ環式環を形成し；

各R_dは独立してH、0～6個のR_fで置換されているC₁₋₆アルキル、0～6個のR_fで置換されているC₃₋₇シクロアルキル、0～6個のR_fで置換されているヘテロシクロアルキル、0～3個のR_fで置換されているアリーールまたは0～3個のR_fで置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリーールであり；

各R_eは独立してH、0～6個のR_fで置換されているC₁₋₆アルキル、C₁₋₃ハロアルキル、0～6個のR_fで置換されているC₃₋₇シクロアルキル、0～6個のR_fで置換されているヘテロシクロアルキル、0～3個のR_fで置換されているアリーールまたは0～3個のR_fで置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリーールであり；

各R_fは独立してH、ハロ、-OH、-CN、0～6個のR_aで置換されているC₁₋₆アルキル、C₁₋₃アルコキシ、0～6個のR_aで置換されているC₃₋₇シクロアルキル、0～6個のR_aで置換されているヘテロシクロアルキル、0～3個のR_aで置換されているアリーールまたは0～3個のR_aで置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリーールであり；

各R_gは独立してH、F、-OH、-CN、C₁₋₃アルキル、-CF₃またはフェニルであり；

各pは独立して0、1または2であり；

各rは独立して0、1、2、3または4である。]

の化合物またはその塩。

【請求項2】

Wが-(CR₃R₃)₂-、-Y-CR₃R₃-または-CR₃R₃-Y-である、請求

項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

W が $-(CR_3R_3)_3-$ 、 $-Y-(CR_3R_3)_2-$ 、 $-CR_3R_3-Y-CR_3R_3-$ または $-(CR_3R_3)_2-Y-$ である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

W が $-(CR_3R_3)_4-$ 、 $-Y-(CR_3R_3)_3-$ 、 $-CR_3R_3-Y-(CR_3R_3)_2-$ 、 $-(CR_3R_3)_2-Y-CR_3R_3-$ 、 $-(CR_3R_3)_3-Y-$ または $-Y-(CR_3R_3)_2-Y-$ である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 5】

W が $-(CR_3R_3)_5-$ 、 $-Y-(CR_3R_3)_4-$ 、 $-CR_3R_3-Y-(CR_3R_3)_3-$ 、 $-(CR_3R_3)_2-Y-(CR_3R_3)_2-$ 、 $-(CR_3R_3)_3-Y-CR_3R_3-$ 、 $-(CR_3R_3)_4-Y-$ 、 $-Y-(CR_3R_3)_3-Y-$ 、 $-CR_3R_3-Y-(CR_3R_3)_2-Y-$ または $-Y-(CR_3R_3)_2-Y-CR_3R_3-$ である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

各 R_3 が独立して H、F、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ またはピリジニルである、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

W が $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH(OH)CH_2O-$ 、 $-C(CH_3)(OH)CH_2O-$ 、 $-C(OH)(ピリジニル)CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2NH-$ 、 $-CHFCH_2NH-$ または $-CH(OH)CH_2NH-$ であり；

R_1 がフェニル、ピリジニルまたはピリミジニルであり、各々 Cl 、 $-CH_3$ 、 $-C(CH_3)_2OH$ 、 $-C(CH_2CH_3)_2OH$ 、 $-C(CH_3)(CH_2CH_3)OH$ 、 $-CH(CH_3)OCH_2CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-OCH_2CH_2CH_3$ 、 $-OCH(CH_3)_2$ 、 $-OCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-OCH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-OCH_2CH_2OCH_3$ 、 $-OCH_2C(CH_3)_2OH$ 、 $-OCH_2$ (メトキシフェニル)、 $-S(O)_2CH_3$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、 $-S(O)_2NH(CH_3)$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)$ (モルホリニル)、 $-C(O)$ (メトキシアゼチジニル)、 $-C(O)NH$ (シクロプロピル)、ヒドロキシシクロプロピル、モルホリニルおよびカルボキシメチルピペラジニルから独立して選択される 1 ~ 2 置換基で置換されており；

R_2 が H であり；

R_5 が F、 Cl 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ および $-OCF_3$ から独立して選択される 1 ~ 2 置換基で置換されているフェニルであり；

R_6 が H または $-CH_3$ であり；および

R_8 が H である、

請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 8】

(+/-) - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン(1)；(+/-) - 2 - (4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)プロパン - 2 - オール(2)；(+/-) - 2 - (5 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ピリミジン - 2 - イル)プロパン - 2 - オール(3)；(+/-) - cis および trans - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(4 および 5)；cis - (6R, 9R) - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(6)；cis - (6S, 9S) - 9 - (2 - (ジフ

ルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) -
 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン -
 6 - オール(7); (+ / -) - c i s - 2 - (4 - ((6 S, 9 S) - 9 - (2 - (ジフルオロメ
 トキシ)フェニル) - 6 - フルオロ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5
]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)プロパン - 2 - オール(8); (+
 / -) - t r a n s - 2 - (4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - フルオ
 ロ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジ
 ン - 2 - イル)フェニル)プロパン - 2 - オール(9); (+ / -) - c i s - 2 - (5 - (9 -
 (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - フルオロ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリ
 ド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ピリミジン - 2 - イル
)プロパン - 2 - オール(10); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェ
 ニル) - 6 - フルオロ - 2 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒ
 ドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン(11); c i s - (1 S,
 4 S) - 2 - (4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - フルオロ - 6, 7, 8,
 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)
 フェニル)プロパン - 2 - オール(12); c i s - (1 R, 4 R) - 2 - (4 - (9 - (2 - (ジ
 フルオロメトキシ)フェニル) - 6 - フルオロ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4',
 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)プロパン - 2 - オー
 ル(13); t r a n s - (6 R, 9 S) - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド
 [4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(14); t r a n s - (6
 S, 9 R) - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロ
 パン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミ
 ダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(15); c i s - (6 R, 9 S) - 9 - (2 - (ジフ
 ルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 6, 7, 8, 9 - テ
 トラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(16
); 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (2 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2
 - イル)ピリミジン - 5 - イル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]
 イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(17); (4 - (9 - (2 - (ジフルオロメト
 キシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5
]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)(3 - メトキシアゼチジン - 1 -
 イル)メタノン(18); (4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキ
 シ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジ
 ン - 2 - イル)フェニル)(モルホリノ)メタノン(19); N - シクロプロピル - 4 - (9 - (2
 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリ
 ド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ベンズアミド(20);
 N - シクロプロピル - 5 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ
 - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン
 - 2 - イル)ピコリンアミド(21); 2 - (4 - (5 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フ
 ェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダ
 ズ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ピリミジン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - イル)酢酸
 (22); (+ / -) - t r a n s - 9 - (4 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 2 - (4
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4',
 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(23); (+ / -) - t r
 a n s - 9 - (2 - エチルフェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フ
 ェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピ
 リダジン - 6 - オール(24); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - エチルフェニル) - 2 - (4
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4',
 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(25); 2 - (4 - (2 -
 ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 9 - (2 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)

- 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン
 - 6 - オール(26); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2
 - (4 - イソプトキシフェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]
 イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(27); (+ / -) - t r a n s - 9 - (5 -
 クロロ - 2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2
 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1,
 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(28); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメト
 キシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ)フェニル) - 6, 7,
 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オ
 ール(29); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (
 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ) - 3 - メトキシフェニル) - 6, 7, 8, 9 - テト
 ラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(30)
 ; (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - エトキシフ
 ェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピ
 リダジン - 6 - オール(31); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェ
 ニル) - 2 - (4 - イソプロポキシフェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3
 ' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(32); (+ / -) - c i s - 9
 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - プロポキシフェニル) - 6, 7, 8, 9
 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(
 33); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 -
 メトキシエトキシ)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イ
 ミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(34); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフ
 ルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (1 - エトキシエチル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 -
 テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(3
 5); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (1 - ヒ
 ドロキシシクロプロピル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4,
 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(36); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (
 ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - ((2 - メトキシベンジル)オキシ)フェニル) -
 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン -
 6 - オール(37); (+ / -) - t r a n s - 9 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) -
 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ
 ピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(38); (+ / -
) - c i s - 9 - (4 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 2 - (4 - (2 -
 ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3
 ' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(39); (+ / -) - c i s - 4
 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6, 7, 8, 9 - テトラヒ
 ドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 2 - イル) - N - メチル
 ベンゼンスルホンアミド(40); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フ
 ェニル) - 2 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[
 4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(41); (+ / -) - c i
 s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (ネオペンチルオキシ)フェニ
 ル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダ
 ジン - 6 - オール(42); (+ / -) - c i s - 9 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル)
 - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒド
 ロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(43); (+ /
 -) - t r a n s - 9 - (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキ
 シプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[4', 3' : 4, 5
]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(44); (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジ
 フルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - モルホリノフェニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒ
 ドロピリド[4', 3' : 4, 5]イミダゾ[1, 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(45); (+

/ -) - c i s - 4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6 ,
 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 2
 - イル)ベンゼンスルホンアミド(4 6) ; (+ / -) - c i s - (2 - クロロ - 4 - (9 - (2
 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド
 [4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)(モルホリノ)
 メタノン(4 7) ; (+ / -) - c i s - 2 - クロロ - 4 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)
 フェニル) - 6 - ヒドロキシ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミ
 ダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ベンズアミド(4 8) ; (+ / -) - c i s - 9 - (2
 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (3 - ヒドロキシペンタ n - 3 - イル)フ
 ェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピ
 リダジン - 6 - オール(4 9) ; (+ / -) - c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェ
 ニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシブタン - 2 - イル)フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒ
 ドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 0) ; (+
 / -) - t r a n s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (6 - メトキシピリ
 ジン - 3 - イル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2
 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 1) ; (+ / -) - t r a n s - 9 - (2
 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロボキシ)
 フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]
 ピリダジン - 6 - オール(5 2) ; (+ / -) - t r a n s - 9 - (2 , 5 - ジメチルフェニル
) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒド
 ロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 3) ; (+ /
 -) - c i s - 9 - (5 - クロロ - 2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 -
 ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3
 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 4) ; (+ / -) - t r a n s
 - 9 - (5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシブ
 ロパン - 2 - イル)フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イ
 ミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 5) ; (+ / -) - t r a n s - 9 - (5 - ク
 ロロ - 2 - メトキシフェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル
) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジ
 ン - 6 - オール(5 6) ; r a c - (6 S , 9 S) - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル
) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 7 , 9 - ジヒドロ - 6 H -
 ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 7) ; c i s
 - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 -
 イル)フェニル) - 6 , 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 -
 b]ピリダジン - 6 - オール(5 8) ; 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フェニル) - 6 - メチル - 6 , 9 - ジヒドロ - 7 H
 - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(5 9) ; 9 - (2
 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)フ
 ェニル) - 6 - (ピリジン - 4 - イル) - 6 , 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 ,
 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(6 0) ; c i s - 9 - (2 - (ジフルオロ
 メトキシ)フェニル) - 2 - (2 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)ピリミジン - 5 -
 イル) - 6 , 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダ
 ジン - 6 - オール(6 1) ; c i s - 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 2 - (2
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)ピリミジン - 5 - イル) - 6 , 9 - ジヒドロ - 7 H
 - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 6 - オール(6 1) ; 2 - (4
 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 7 , 9 - ジヒドロ - 6 H - ピラノ[4 ' ,
 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)フェニル)プロパン - 2 - オー
 ル(6 2) ; 2 - (5 - (9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル) - 7 , 9 - ジヒドロ - 6
 H - ピラノ[4 ' , 3 ' : 4 , 5]イミダゾ[1 , 2 - b]ピリダジン - 2 - イル)ピリミジン -
 2 - イル)プロパン - 2 - オール(6 3) ; または 9 - (2 - (ジフルオロメトキシ)フェニル

) - 2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 7 , 9 - ジヒドロ - 6 H - ピラノ [4 ' , 3 ' : 4 , 5] イミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン (6 4) である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 9】

1 以上の請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩；および薬学的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物 またはその塩を含む、炎症性または自己免疫性疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 11】

疾患がクローン病、潰瘍性大腸炎、喘息、移植片対宿主病、同種移植片拒絶反応、慢性閉塞性肺疾患、グレーブス病、リウマチ性関節炎、全身性エリテマトーデス、ループス腎炎、皮膚ループス、乾癬、クリオピリン関連周期性症候群、TNF 受容体関連周期熱症候群、家族性地中海熱、成人発症スチル病、全身発症若年性特発性関節炎、多発性硬化症、神経障害性疼痛、痛風および痛風関節炎から選択される、請求項 10 に記載の 医薬組成物。

【請求項 12】

炎症性または自己免疫性疾患の処置用医薬の製造における、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物 またはその塩 の使用。