

【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

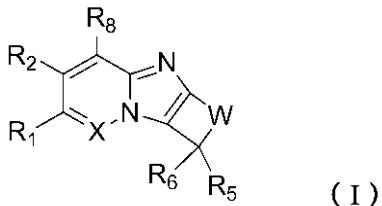
【補正の内容】

【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) - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>2-5</sub> - ；(ii) - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>x</sub> - Y - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>y</sub> - ；または(iii) - Y - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>2-3</sub> - Y - 、 - CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub> - Y - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>2</sub> - Y - または - Y - (CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>2</sub> - Y - CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub> - であり；各Yは独立してO、NR<sub>4</sub>またはS(O)<sub>p</sub>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；

R<sub>1</sub>はH、R<sub>1a</sub>、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、0~6個のR<sub>1a</sub>で置換されているC<sub>2-6</sub>アルケニル、0~4個のR<sub>1a</sub>で置換されているC<sub>2-6</sub>アルキニル、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている3~14員カルボシクリル)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されているアリール)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている5~7員ヘテロシクリル)または-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている单環または二環式ヘテロアリール)であり；R<sub>2</sub>はH、ハロ、-CN、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-NO<sub>2</sub>、0~6個のR<sub>1a</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>OR<sub>e</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている3~14員カルボシクリル)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されているアリール)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている5~7員ヘテロシクリル)または-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている单環式ヘテロアリール)であり；各R<sub>3</sub>は独立してH、ハロ、-CN、-OH、-OCF<sub>3</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>C(O)R<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>C(O)OR<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>C(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>OR<sub>e</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>OC(O)R<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>OC(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>OC(O)OR<sub>d</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>b</sub>C(O)R<sub>d</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>b</sub>C(O)OR<sub>d</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>b</sub>C(O)NR<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>b</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>d</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている3~14員カルボシクリル)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されているアリール)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている5~7員ヘテロシクリル)または-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている单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<sub>3</sub>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 = N OR<sub>b</sub>、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<sub>4</sub>は独立してH、0~6個のR<sub>1a</sub>で置換されているC<sub>1~6</sub>アルキル、0~6個のR<sub>1a</sub>で置換されているC<sub>3~7</sub>シクロアルキル、-C(O)R<sub>b</sub>、-C(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-C(O)OR<sub>b</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>b</sub>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-S(O)<sub>2</sub>OR<sub>b</sub>、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている3~14員カルボシクリル)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されているアリール)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている5~7員ヘテロシクリル)または-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている単環式ヘテロアリール)であり;

R<sub>5</sub>は-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている3~14員カルボシクリル)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されているアリール)、-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>で置換されている5~10員ヘテロシクリル)または-(CR<sub>g</sub>R<sub>g</sub>)<sub>r</sub>(0~3個のR<sub>1a</sub>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<sub>6</sub>はH、C<sub>1~6</sub>アルキルまたはC<sub>1~6</sub>ハロアルキルであるか;

またはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>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<sub>5a</sub>で置換されており;

各R<sub>5a</sub>は独立してH、ハロ、-CN、-OH、C<sub>1~3</sub>アルキル、C<sub>1~3</sub>フルオロアルキルおよびC<sub>1~3</sub>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<sub>5a</sub>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<sub>f</sub>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<sub>5a</sub>は=Oを形成し;

R<sub>8</sub>はH、ハロ、-CN、C<sub>1~6</sub>ハロアルキルまたはC<sub>1~3</sub>アルコキシであり;

各R<sub>1a</sub>は独立してF、Cl、-CN、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているC<sub>1~6</sub>アルキル、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているC<sub>3~6</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているC<sub>1~6</sub>アルコキシ、C<sub>1~3</sub>ハロアルコキシ、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているアリール、0~6個のR<sub>a</sub>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<sub>2</sub>(0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているアリール)、-C(O)R<sub>b</sub>、-C(O)OR<sub>b</sub>、-C(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-OC(O)R<sub>b</sub>、-OC(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-OC(O)OR<sub>d</sub>、-NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-NR<sub>b</sub>C(O)R<sub>d</sub>、-NR<sub>b</sub>C(O)OR<sub>d</sub>、-NR<sub>b</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>d</sub>、-NR<sub>b</sub>C(O)NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-NR<sub>b</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>b</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>または-C(O)NR<sub>b</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>1~3</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>c</sub>であり;

各R<sub>a</sub>は独立してハロ、-CN、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1~3</sub>アルキル、C<sub>1~3</sub>フルオロアルキル、C<sub>2~4</sub>アルケニル、C<sub>2~4</sub>アルキニル、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、C<sub>1~3</sub>フルオロアルコキシ、-C(O)OH、-CH<sub>2</sub>C(O)OH、-C(O)(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-C(O)O(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-OC(O)(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-NH(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-N(C<sub>1~3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C(O)NH(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-OC(O)NH(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-NHC(O)NH(C<sub>1~3</sub>アルキル)、-C(=NH)(NH<sub>2</sub>)、C<sub>3~7</sub>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<sub>1~3</sub>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)<sub>2</sub>(アリール)、-S(O)<sub>2</sub>(ヘテロシクリル)、-NHS(O)<sub>2</sub>(アリール)、-NHS(O)<sub>2</sub>(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<sub>1~3</sub>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<sub>1~3</sub>アルキル)、-OC(O)

$O$ (アリール)、-OC(O)O(ヘテロシクリル)、-OC(O)NH(アリール)、-OC(O)NH(ヘテロシクリル)、-NHC(O)O(C<sub>1-3</sub>アルキル)、-C(O)NH(アリール)、-C(O)NH(ヘテロシクリル)、-C(O)O(アリール)、-C(O)O(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>NH(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>NH(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)NH(アリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>C(O)NH(ヘテロシクリル)、-OC(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-OC(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)O(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)(ヘテロシクリル)、-C(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-C(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)、-NHS(O)<sub>2</sub>N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-NHS(O)<sub>2</sub>N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)、-NHP(O)<sub>2</sub>N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-NHC(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)S(O)<sub>2</sub>N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(アリール)、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)C(O)N(C<sub>1-3</sub>アルキル)(ヘテロシクリル)または-Si(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>3</sub>であり ;

各R<sub>b</sub>は独立してH、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>3-7</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~3個のR<sub>f</sub>で置換されているアリールまたは0~3個のR<sub>f</sub>で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリールであり；

各R<sub>c</sub>は独立してH、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>3-7</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~3個のR<sub>f</sub>で置換されているアリールまたは0~3個のR<sub>f</sub>で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリールであるか；または同じ窒素に結合しているとき、2個のR<sub>c</sub>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<sub>g</sub>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<sub>d</sub>は独立してH、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>3-7</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~3個のR<sub>f</sub>で置換されているアリールまたは0~3個のR<sub>f</sub>で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリールであり；

各R<sub>e</sub>は独立してH、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>ハロアルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているC<sub>3-7</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>f</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~3個のR<sub>f</sub>で置換されているアリールまたは0~3個のR<sub>f</sub>で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリールであり；

各R<sub>f</sub>は独立してH、ハロ、-OH、-CN、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているC<sub>3-7</sub>シクロアルキル、0~6個のR<sub>a</sub>で置換されているヘテロシクロアルキル、0~3個のR<sub>a</sub>で置換されているアリールまたは0~3個のR<sub>a</sub>で置換されている単環もしくは二環式ヘテロアリールであり；

各R<sub>g</sub>は独立してH、F、-OH、-CN、C<sub>1-3</sub>アルキル、-CF<sub>3</sub>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-(CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、-Y-CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>-または-CR<sub>3</sub>R<sub>3</sub>-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  $-(CR_3R_3)_3$  、  $-(CR_3R_3)_2$  、  $CR_3R_3$  、  $Y$  、  $CR_3R_3Y$  または  $-(CR_3R_3)_2Y$  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 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>4</sub> - 、 - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - 、 - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - 、 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - Y - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - 、 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - Y - または - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - 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 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>5</sub> - 、 - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>4</sub> - 、 - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - 、 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - 、 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - Y - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - 、 - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>4</sub> - Y - 、 - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - Y - 、 - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - Y - または - Y - ( C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - Y - C R <sub>3</sub> R <sub>3</sub> - 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<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub> 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<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-CH(OH)CH<sub>2</sub>O-、-C(CH<sub>3</sub>)(OH)CH<sub>2</sub>O-、-C(OH)(ピリジニル)CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NH-または-CH(OH)CH<sub>2</sub>NH-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  $C_1$ 、-  $CH_3$ 、-  $C(CH_3)_2$   $OH$ 、-  $C(CH_2CH_3)_2OH$ 、-  $C(CH_3)(CH_2CH_3)OH$ 、-  $CH(CH_3)OCH_2CH_3$ 、-  $OCH_3$ 、-  $OCH_2CH_3$ 、-  $OCH_2CH_2CH_3$ 、-  $OCH(CH_3)_2$ 、-  $OCH_2C(CH_3)_3$ 、-  $OCH_2CH(CH_3)_2$ 、-  $OCH_2CH_2OCH_3$ 、-  $OCH_2C(CH_3)_2OH$ 、-  $OCH_2$  (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；

$R$  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】

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) ; (+ / - ) - cis - 2 - (4 - ((6S , 9S) - 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) ; (+ / - ) - trans - 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) ; (+ / - ) - cis - 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)プロパン - 2 - オール(10) ; (+ / - ) - cis - 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) ; cis - (1S , 4S) - 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) ; cis - (1R , 4R) - 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)プロパン - 2 - オール(13) ; trans - (6R , 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(14) ; trans - (6S , 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(15) ; cis - (6R , 9S) - 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)(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)ピコリンアミド(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]イミダゾ[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) ; (+ / - ) - trans - 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) ; (+ / - ) - trans - 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) ; (+ / - ) - cis - 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)



/ - ) - 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 - ヒドロキシベンタ 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  
 ディン - 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 ( 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 ) - 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 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 - 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  
 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(64)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。