

【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5年1月31日(2023.1.31)

【国際公開番号】WO2020/152361  
 【公表番号】特表2022-518526(P2022-518526A)  
 【公表日】令和4年3月15日(2022.3.15)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-046  
 【出願番号】特願2021-543144(P2021-543144)

【国際特許分類】

10

- C 0 7 D 2 3 1 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 2 3 9 / 2 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 2 4 9 / 0 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 7 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 9 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 9 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 / 1 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 1 7 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 7 / 1 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 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 3 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

30

【F I】

- C 0 7 D 2 3 1 / 1 2            D C S P
- C 0 7 D 2 3 9 / 2 6
- C 0 7 D 2 4 9 / 0 8 5 3 0
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 5
- A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 6
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 5
- A 6 1 P 2 9 / 0 0
- A 6 1 P 3 7 / 0 6
- A 6 1 P 1 / 1 6
- A 6 1 P 1 9 / 0 6
- A 6 1 P 1 9 / 0 2
- A 6 1 P 2 9 / 0 0 1 0 1
- A 6 1 P 1 3 / 1 2
- A 6 1 P 3 / 0 4
- A 6 1 P 3 / 1 0
- A 6 1 P 2 5 / 2 8
- A 6 1 P 1 7 / 0 0
- A 6 1 P 1 7 / 1 0

40

50

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

## 【手続補正書】

【提出日】令和5年1月20日(2023.1.20)

## 【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

10

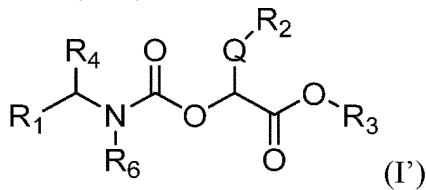
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I')の化合物:



20

であって、式中、

$R_1$ は、5~10員ヘテロアリール、または $C_6 \sim C_{10}$ アリールであり、ここで5~10員ヘテロアリール、または $C_6 \sim C_{10}$ アリールは、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよく;

各 $R_{1S}$ は独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、またはCNであり;少なくとも1個の $R_{1S}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_6$ アリール、ハロ、またはCNであり;ここで $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシは、1個または複数の $R_{1SS}$ で置換されていてもよく;

30

各 $R_{1SS}$ は独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-O-(C_3 \sim C_8$ シクロアルキル)、 $-O-(C_6$ アリール)、 $-O-(5$ 員もしくは6員ヘテロアリール)、 $-O-(C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、またはオキソであり;少なくとも1個の $R_{1SS}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、 $-O-($ フェニル)、またはハロであり;

40

$Q$ は、 $-CH_2-$ であり;

$R_2$ は、5~10員ヘテロアリールであり;

$R_3$ は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり;

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり

$R_6$ は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、化合物、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項2】

$R_1$ が、

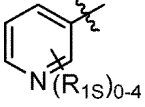
1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい5~10員ヘテロアリールであるか;または

1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい5員または6員ヘテロアリールであるか;

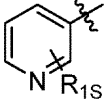
50

または

1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよい6員ヘテロアリアルであるか;または  
1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよいピリジニルであるか;または

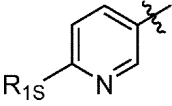


であるか;または



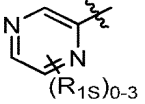
10

であるか;または



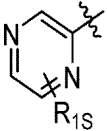
であるか;または

1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよいピリミジニルであるか;または

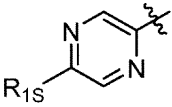


20

であるか;または



であるか;または



30

である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R<sub>1</sub>が、

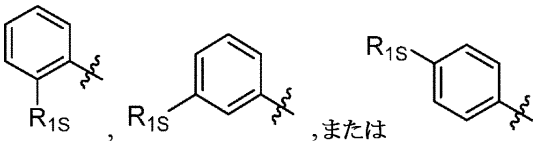
(a) 1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>アリアルであるか;または

(b) 1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよいフェニルであるか;または

(c) 1個のR<sub>1S</sub>で置換されたフェニルであるか;または

40

(d)

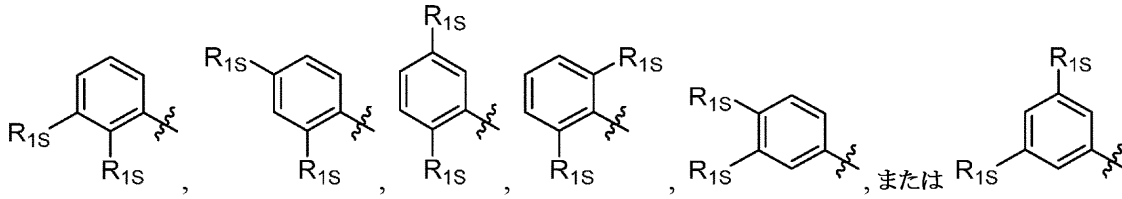


であるか;または

(e) 2個のR<sub>1S</sub>で置換されたフェニルであるか;または

(f)

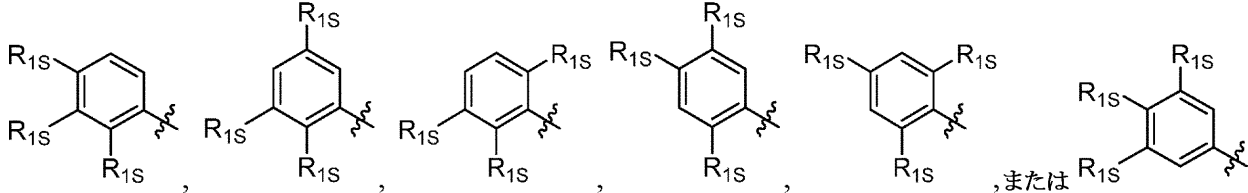
50



であるか;または

(g) 3個のR<sub>1S</sub>で置換されたフェニルであるか;または

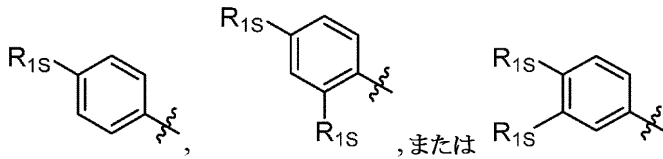
(h)



10

であるか;または

(i)



20

であるか;または

(j) C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、ハロ、またはCNより独立して選択される1個または複数の置換基で置換された、フェニル

であるか;または

(k) メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、エトキシ、シクロプロピル、クロロ、または-CNより独立して選択される1個または複数の置換基で置換された、フェニル

であるか;または

(l) 1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル

30

で置換されたフェニルであるか;または

(m) 1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換されたフェニルであるか;または

(n) 1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換されたフェニルであるか;または

(o) 1個または複数の-O-(フェニル)で置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換されたフェニルであるか;または

(p) 1個または複数のハロで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換されたフェニルであるか;または

(q) 1個、2個、または3個のFで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルで置換されたフェニルであるか;または

40

(r) 1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルで置換されたフェニルであるか;または

(s) 1個または複数のC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルで置換されたフェニルであるか;または

(t) 1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>6</sub>アリーールで置換されたフェニルであるか;または

(u) 1個または複数のC<sub>6</sub>アリーールで置換されたフェニルであるか;または

(v) 1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルであるか;または

(w) 1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルであるか;または

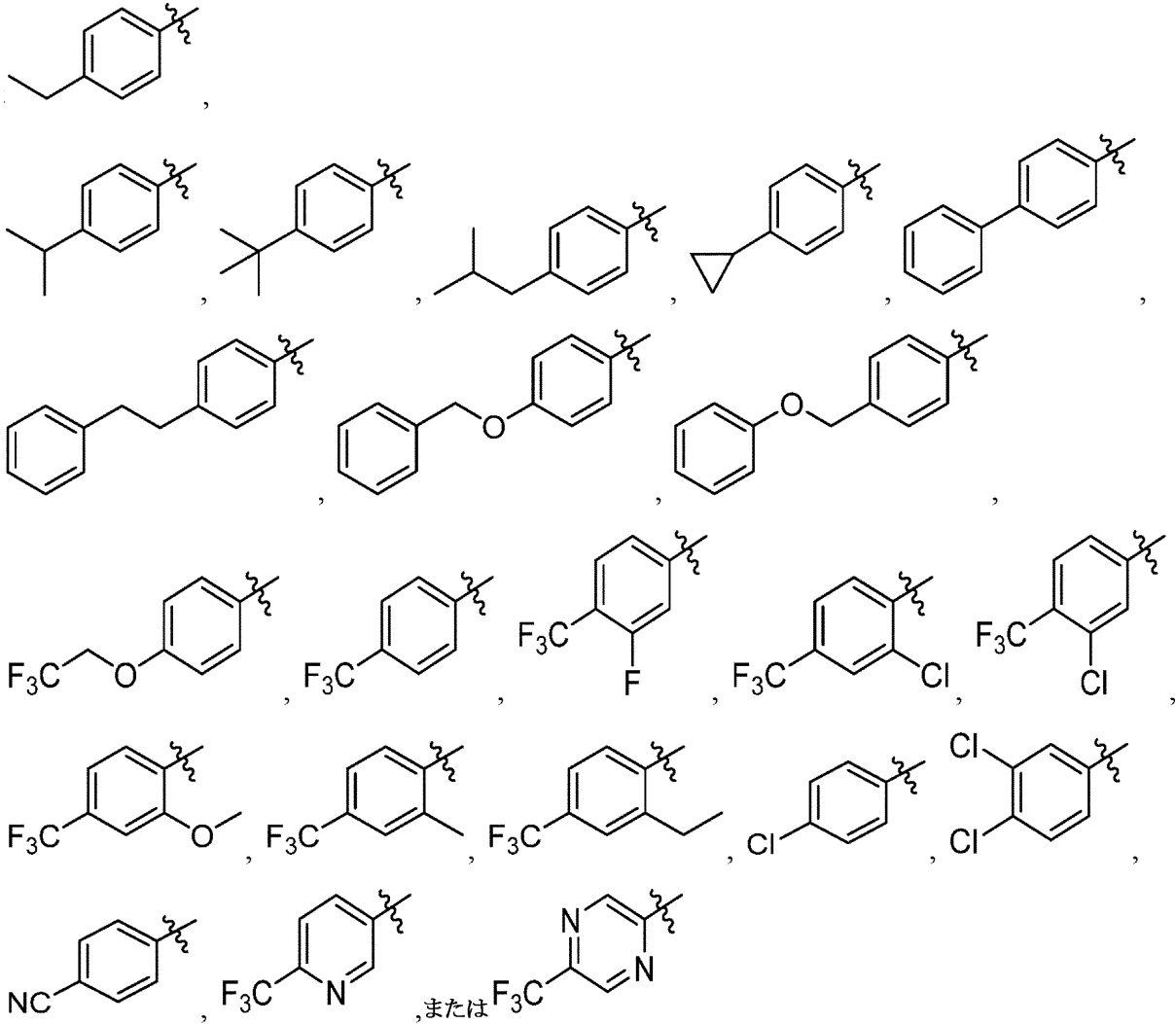
(x) 1個または複数のフェニルで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換

50

されたフェニルであるか;または

(y) 1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルであるか;または

(z)



10

20

30

である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

(a) 少なくとも1個のR<sub>1S</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであるか;または

(b) 少なくとも1個のR<sub>1S</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシであるか;または

(c) 少なくとも1個のR<sub>1S</sub>が、C<sub>6</sub>アリアルであるか;または

(d) 少なくとも1個のR<sub>1S</sub>が、ハロまたはCNである、

請求項1~3のいずれか一項記載の化合物。

40

【請求項5】

(a) 少なくとも1個のR<sub>1SS</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであるか;または

(b) 少なくとも1個のR<sub>1SS</sub>が、フェニルであるか;または

(c) 少なくとも1個のR<sub>1SS</sub>が、-O-(フェニル)であるか;または

(d) 少なくとも1個のR<sub>1SS</sub>が、ハロである、

請求項1~4のいずれか一項記載の化合物。

【請求項6】

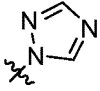
R<sub>2</sub>が、

ピラゾリルであるか;または

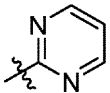
50



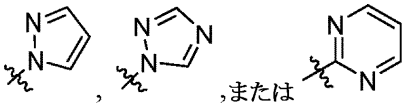
であるか;または  
 トリアゾリルであるか;または



であるか;または  
 ピリミジニルであるか;または



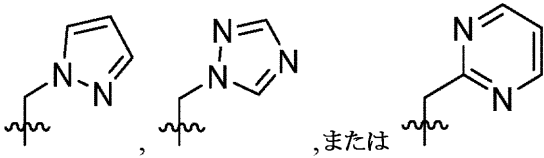
であるか;または



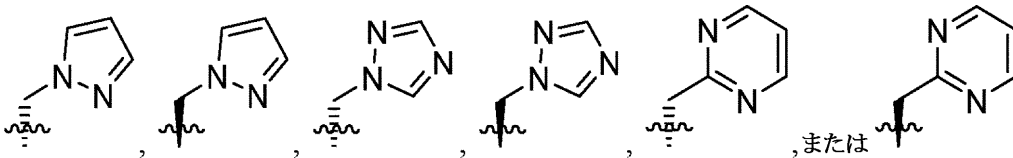
である、請求項1~5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項7】

QとR<sub>2</sub>とが一緒になって、



を形成するか;または



を形成する、

請求項1~6のいずれか一項記載の化合物。

【請求項8】

R<sub>3</sub>がHである、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物。

【請求項9】

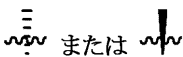
R<sub>3</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり、任意でエチルまたはプロピルである、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物。

【請求項10】

R<sub>4</sub>が

(i) C<sub>1</sub>、C<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>、C<sub>4</sub>、C<sub>5</sub>、またはC<sub>6</sub>アルキルであるか;

(ii) メチルであり、任意で



であるか;

10

20

30

40

50

(iii) エチルであるか;  
(iv) n-プロピルであるか;または  
(v) i-プロピルである、  
 請求項1~9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項11】

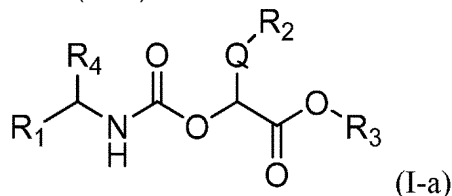
R<sub>6</sub>がHである、請求項1~10のいずれか一項記載の化合物。

【請求項12】

R<sub>6</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり、任意でメチルである、請求項1~11のいずれか一項記載の化合物。

【請求項13】

式(I-a)の化合物:

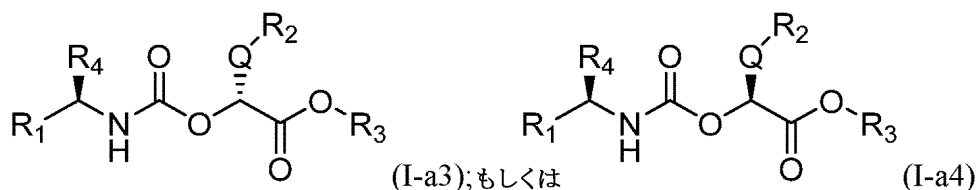
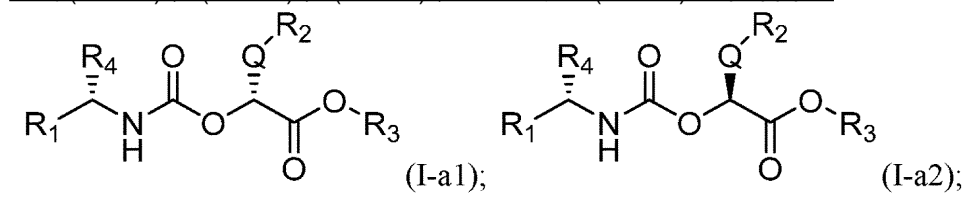


10

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、およびQは請求項1と同意義である;または

式(I-a1)、(I-a2)、(I-a3)、もしくは(I-a4)の化合物:

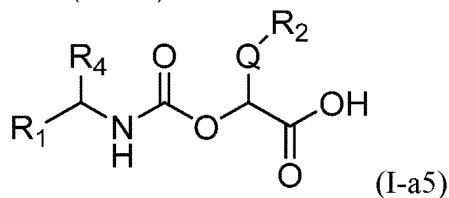
20



30

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、およびQは請求項1と同意義である;または

式(I-a5)の化合物:

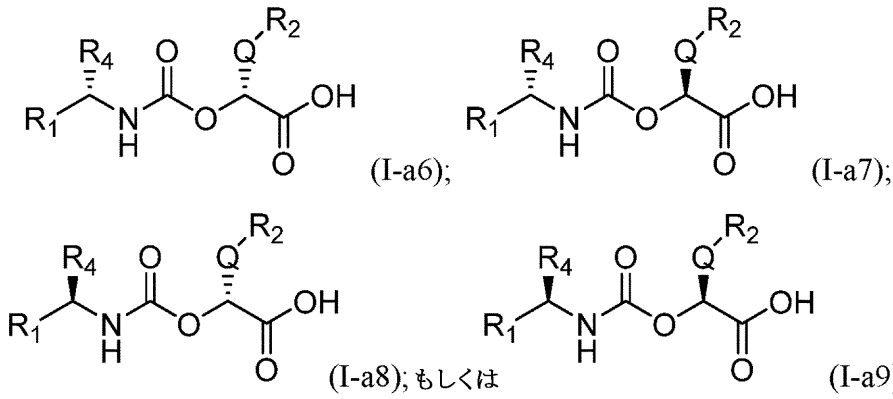


40

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、およびQは請求項1と同意義である;または

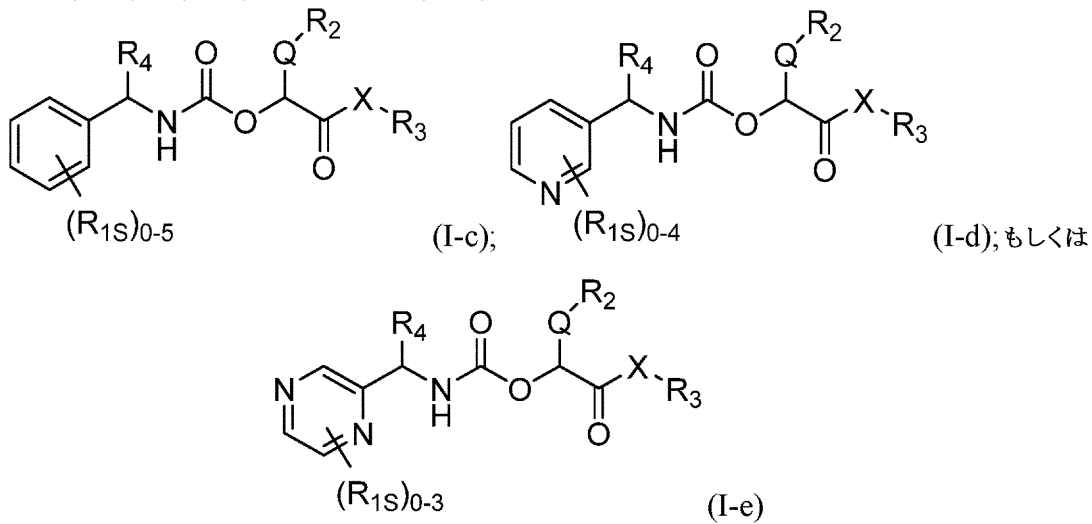
式(I-a6)、(I-a7)、(I-a8)、もしくは(I-a9)の化合物:

50



10

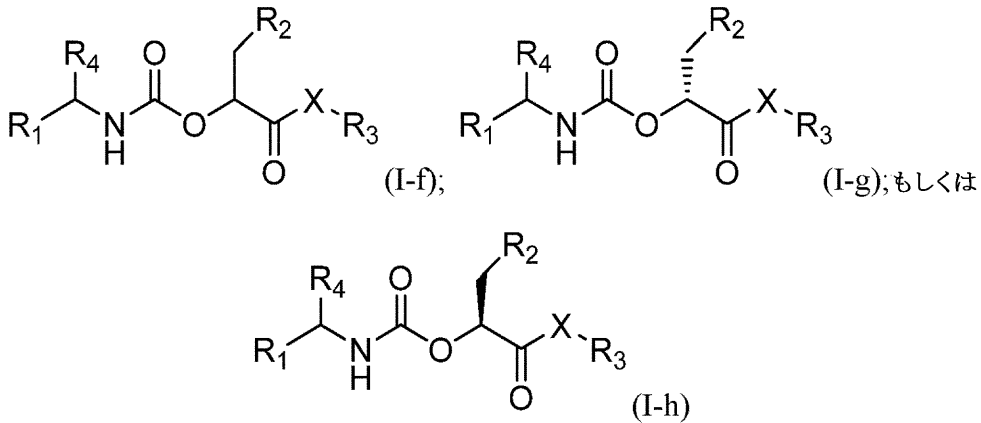
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、および $Q$ は請求項1と同意義である;または式(I-c)、(I-d)、もしくは(I-e)の化合物:



20

30

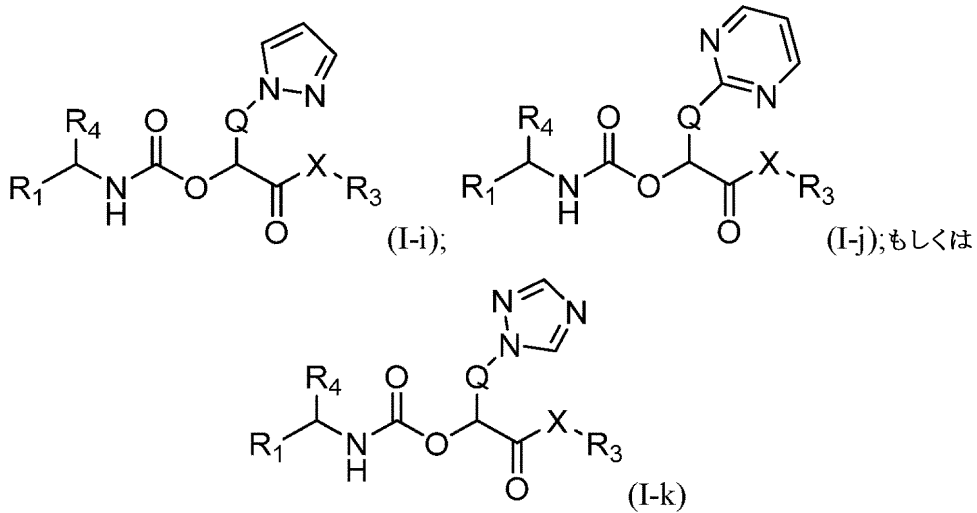
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $X$ 、および $Q$ は請求項1と同意義である;または式(I-f)、(I-g)、もしくは(I-h)の化合物:



40

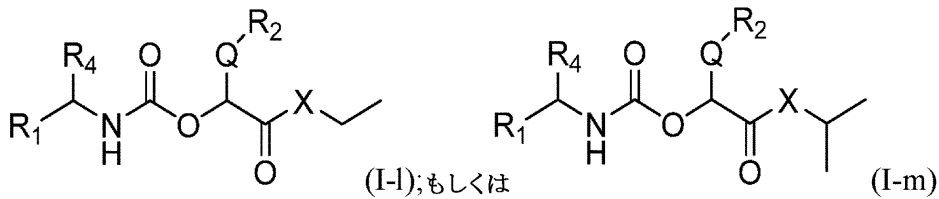
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、および $X$ は請求項1と同意義である;または式(I-i)、(I-j)、もしくは(I-k)の化合物:

50



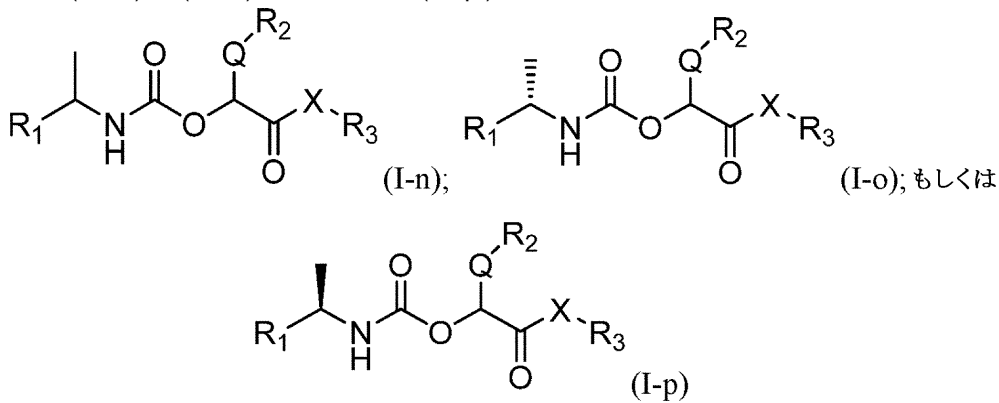
10

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $X$ および $Q$ は請求項1と同意義である;または  
式(I-l)もしくは(I-m)の化合物:



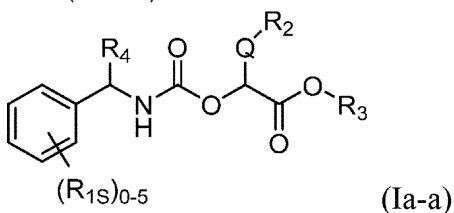
20

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、 $X$ および $Q$ は請求項1と同意義である;または  
式(I-n)、(I-o)、もしくは(I-p)の化合物:



30

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $X$ および $Q$ は請求項1と同意義である;または  
式(Ia-a)の化合物:

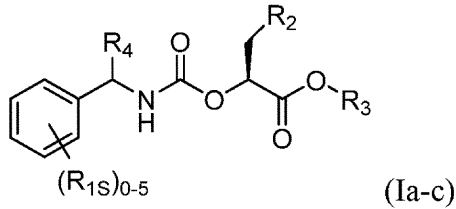
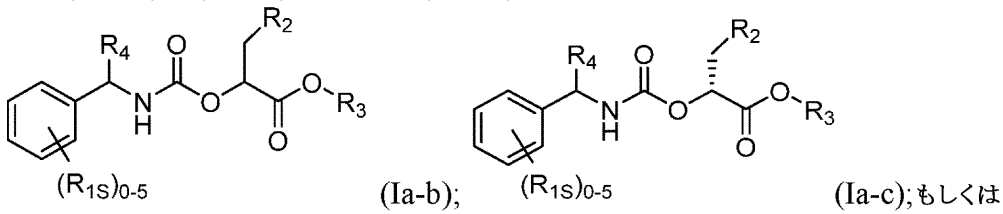


40

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R$

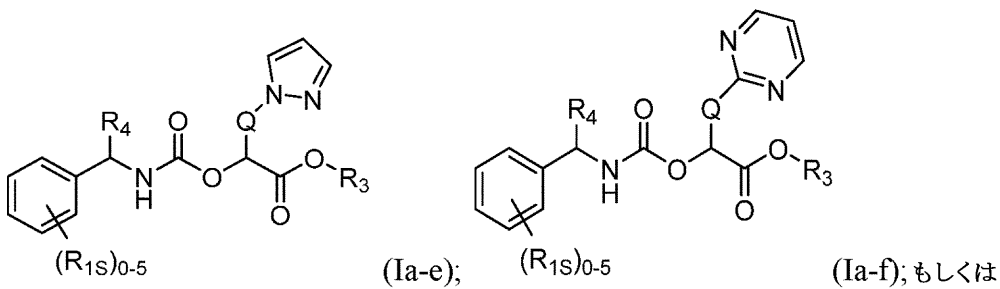
50

4. およびQは請求項1と同意義である;または  
式(Ia-b)、(Ia-c)もしくは(Ia-d)の化合物:

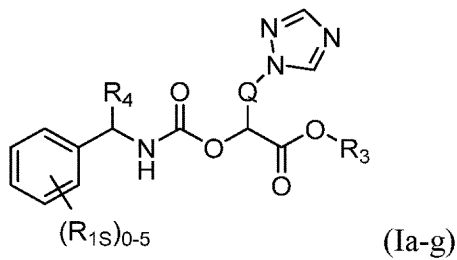


10

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、  
およびR<sub>4</sub>は請求項1と同意義である;または  
式(Ia-e)、(Ia-f)、もしくは(Ia-g)の化合物:

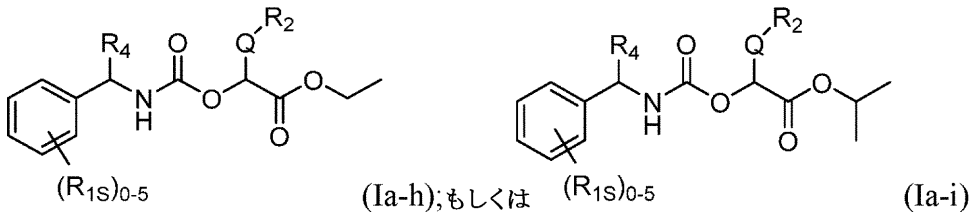


20



30

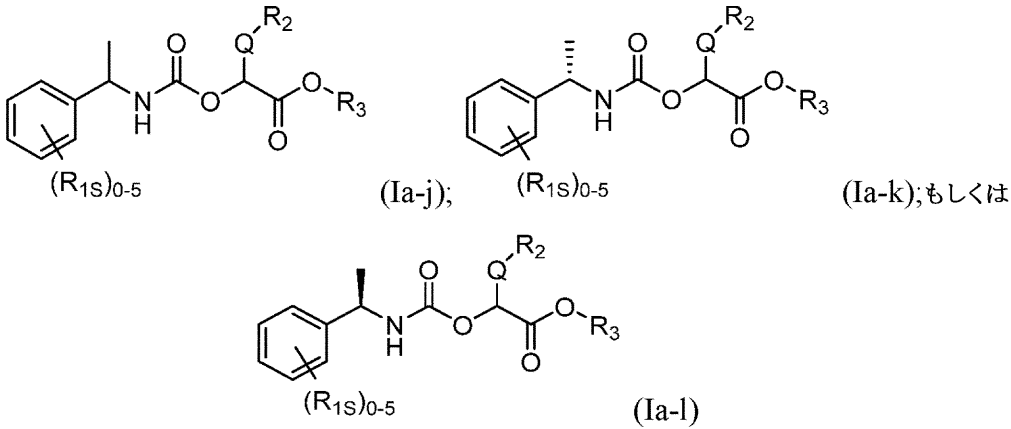
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、  
およびQは請求項1と同意義である;または  
式(Ia-h)もしくは(Ia-i)の化合物:



40

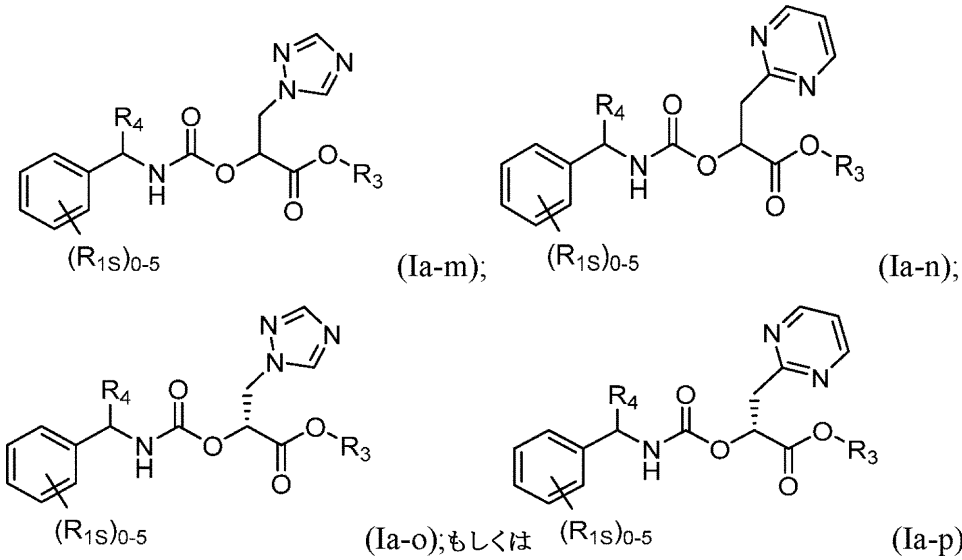
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、  
およびQは請求項1と同意義である;または  
式(Ia-j)、(Ia-k)、もしくは(Ia-l)の化合物:

50



10

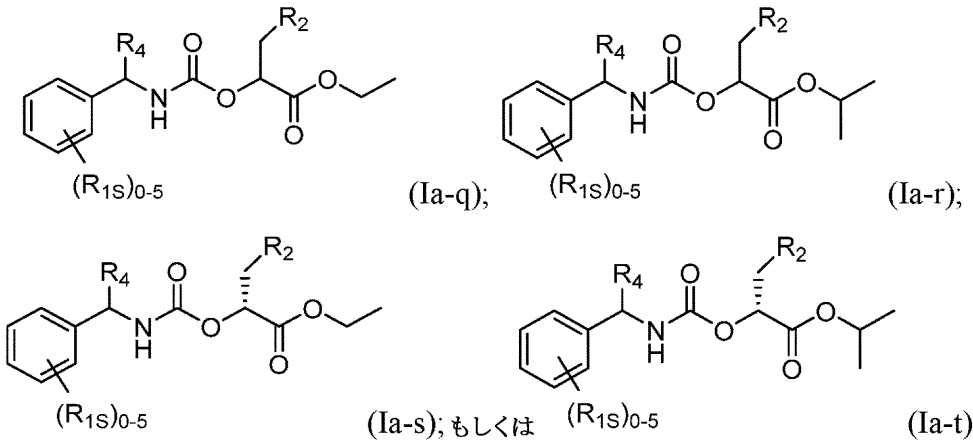
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、および $Q$ は請求項1と同意義である;または  
式(Ia-m)、(Ia-n)、(Ia-o)、もしくは(Ia-p)の化合物:



20

30

、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_3$ 、および $R_4$ は請求項1と同意義である;または  
式(Ia-q)、(Ia-r)、(Ia-s)、もしくは(Ia-t)の化合物:

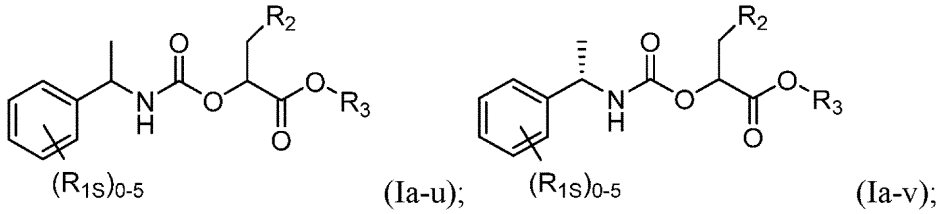


40

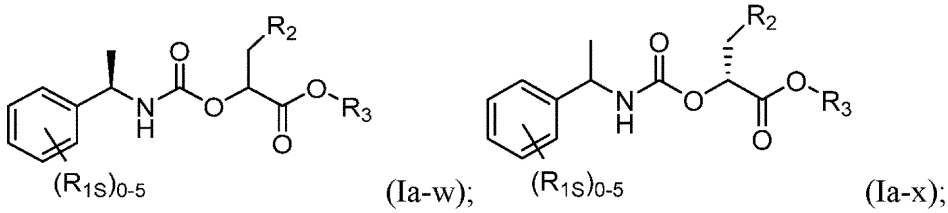
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、および $R_4$ は請求項1と同意義である;または

50

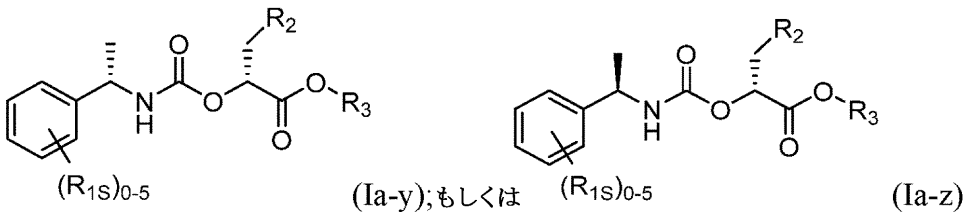
式 (Ia-u)、(Ia-v)、(Ia-w)、(Ia-x)、(Ia-y)、もしくは (Ia-z) の化合物:



10

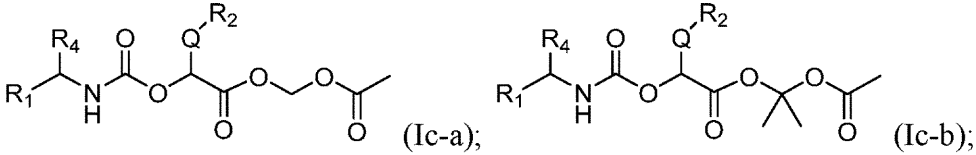


20

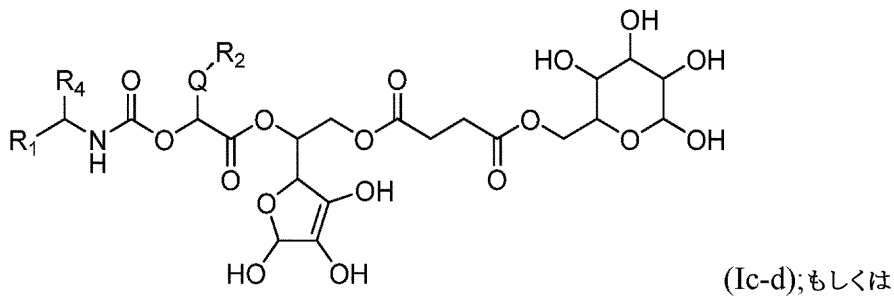
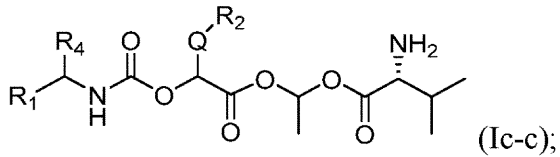


、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、および  $R_3$  は請求項 1 と同意義である; または

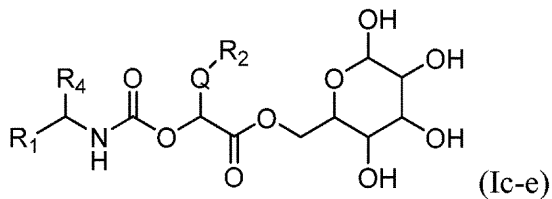
式 (Ic-a)、(Ic-b)、(Ic-c)、(Ic-d)、もしくは (Ic-e) の化合物:



30



40



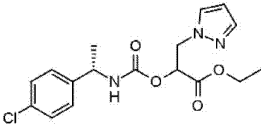
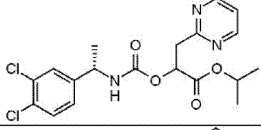
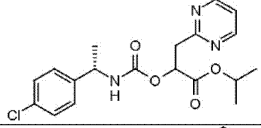
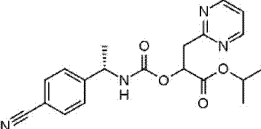
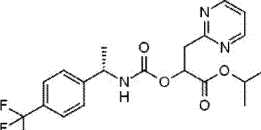
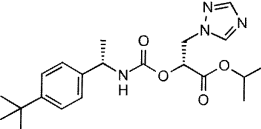
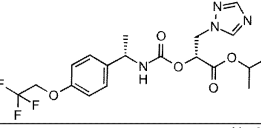
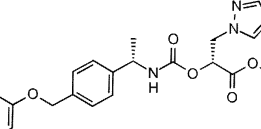
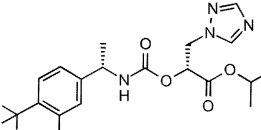
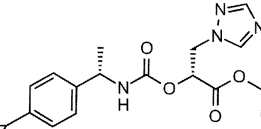
、またはその溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_4$ 、 $Q$ 、および  $R_2$  は請求項 1 と同意義である、

請求項 1 ~ 12 のいずれか一項記載の化合物。

50

【請求項 1 4】

以下:

化合物番号	構造
1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	
8	
9	
10	

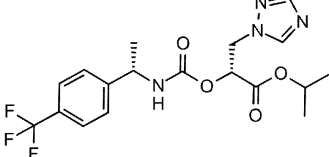
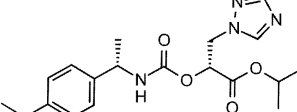
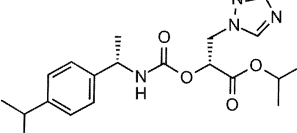
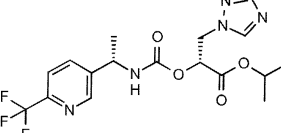
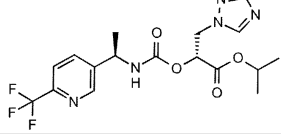
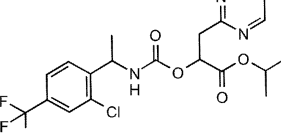
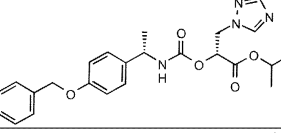
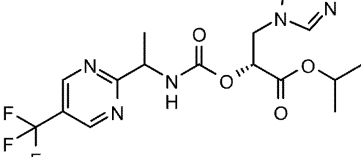
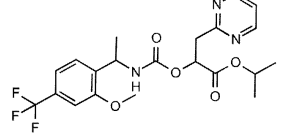
10

20

30

40

50

化合物番号	構造
11	
12	
13	
14	
15	
16	
17	
18	
19	

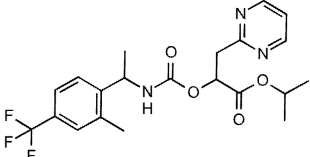
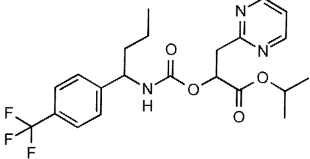
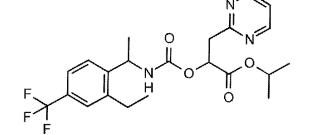
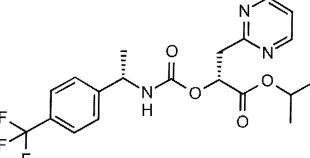
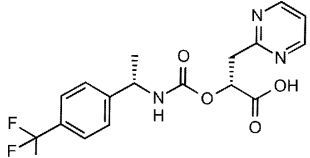
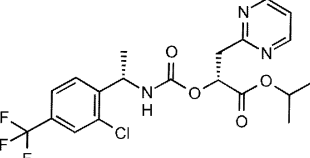
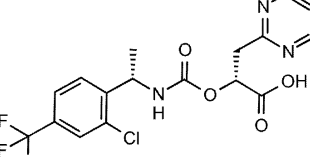
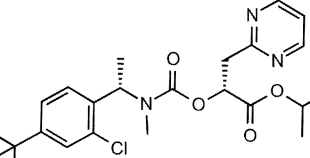
10

20

30

40

50

化合物番号	構造
20	
21	
22	
23	
24	
25	
26	
27	

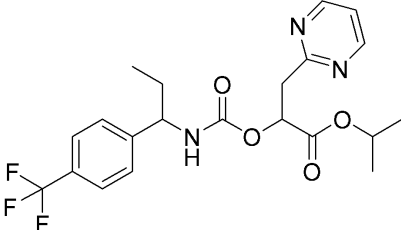
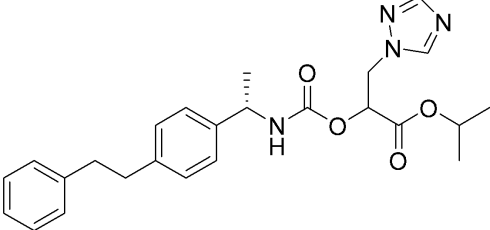
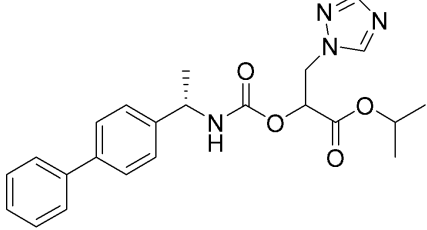
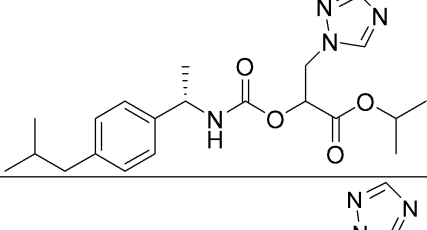
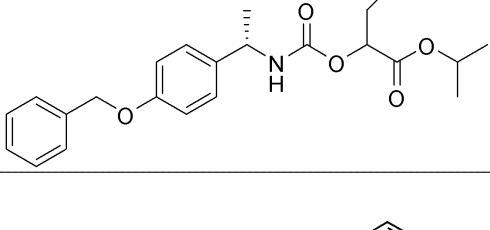
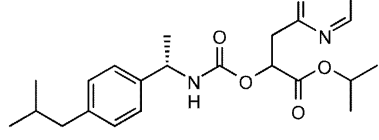
10

20

30

40

50

化合物番号	構造
28	
29	
30	
31	
32	
33	

10

20

30

40

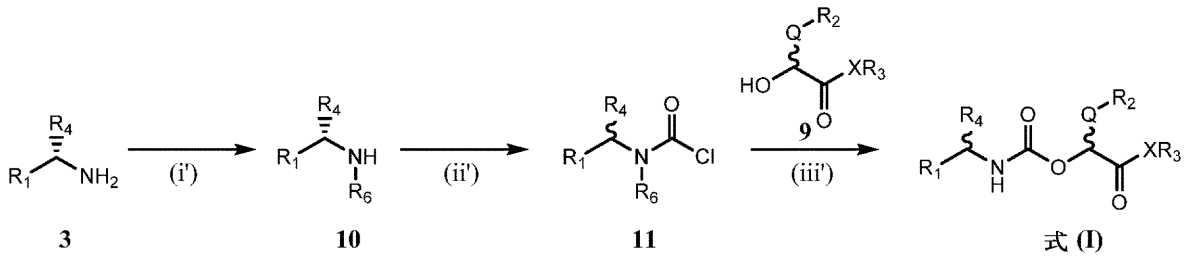
の化合物番号1～33およびその薬学的に許容される塩より選択される、請求項1～13のいずれか一項記載の化合物。

【請求項15】

スキーム1またはスキーム2:

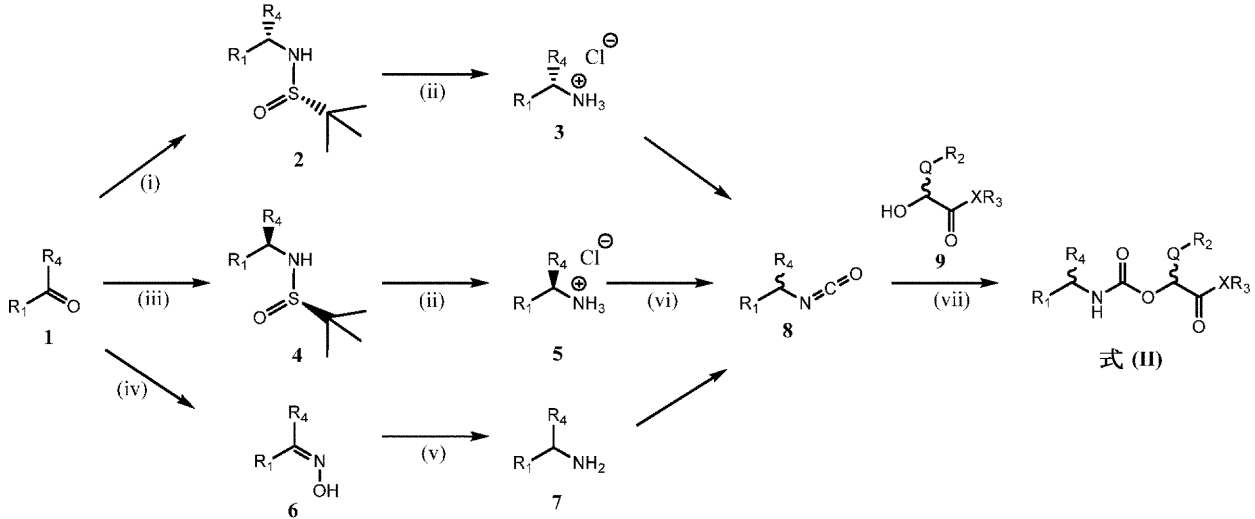
50

スキーム 1



10

スキーム 2



20

に記載の1つまたは複数の工程を含む、請求項1～14のいずれか一項記載の化合物を調製する方法。

【請求項16】

請求項1～14のいずれか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される希釈剤または担体とを含む、薬学的組成物。

30

【請求項17】

対象における疾患または障害の処置または予防に使用するための、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項18】

疾患または障害が、

(a) インフラマソーム活性の関与を伴い、任意で、疾患または障害が、インフラマソーム活性が関与する疾患または障害であるか;または

(b) 炎症性障害、自己炎症性障害、自己免疫障害、神経変性疾患、またはがんであり;

任意で

(i) 疾患または障害が、クリオピリン関連自己炎症性症候群(CAPS;例えば家族性寒冷自己炎症性症候群(FCAS)、マックル・ウェルズ症候群(MWS)、慢性乳児神経皮膚関節(CI-NCA)症候群/新生児期発症多臓器性炎症性疾患(NOMID))、家族性地中海熱(FMF)、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、痛風、関節リウマチ、変形性関節症、クローン病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、慢性腎疾患(CKD)、線維症、肥満、2型糖尿病、多発性硬化症、皮膚疾患(例えばざ瘡)、およびタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばプリオン病)において生じる神経炎症より選択されるか;または

40

(ii) 疾患または障害が神経変性疾患であり、任意で、パーキンソン病またはアルツハイマー病であるか;または

(iii) 疾患または障害ががんであり、任意で、転移性がん、脳がん、胃腸がん、皮膚が

50

ん、非小細胞肺癌、頭頸部扁平上皮癌、または結腸直腸腺癌である、  
請求項17記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

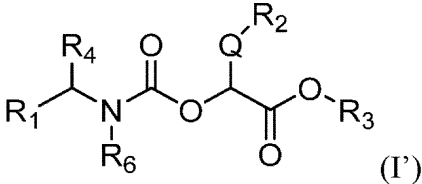
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

[本発明1001]

式(1')の化合物:



であって、式中、

R<sub>1</sub>は、C<sub>3</sub>~C<sub>16</sub>シクロアルキル、5~10員ヘテロアリール、またはC<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>アリールであり、ここでC<sub>3</sub>~C<sub>16</sub>シクロアルキル、5員もしくは6員ヘテロアリール、またはC<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>アリールは、1個または複数のR<sub>1S</sub>で置換されていてもよく;

各R<sub>1S</sub>は独立して、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、ハロ、またはCNであり;ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>10</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、またはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシは、1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよく;

各R<sub>1SS</sub>は独立して、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、-O-(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル)、-O-(C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール)、-O-(5員もしくは6員ヘテロアリール)、-O-(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル)、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソであり;

Qは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり;ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよく;

R<sub>2</sub>は、5~10員ヘテロアリールまたは4~8員ヘテロシクロアルキルであり;ここで5~10員ヘテロアリールまたは4~8員ヘテロシクロアルキルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよく;

R<sub>3</sub>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり;ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキ

10

20

30

40

50

ル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、オキソ、または $R_{3S}$ で置換されていてもよく、

各 $R_{3S}$ は、 $-OC(=O)R_{3Sa}$ または5～6員ヘテロシクロアルキルより独立して選択され、ここで5員または6員ヘテロシクロアルキルは、1個または複数の $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、またはオキソで置換されていてもよく、

$R_{3Sa}$ は、1個または複数の $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、オキソ、または $-C(=O)OR_{3Sb}$ で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

$R_{3Sb}$ は、4～8員ヘテロシクロアルキルまたは $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-(4 \sim 8$ 員ヘテロシクロアルキル)であり、ここで4～8員ヘテロシクロアルキルまたは $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-(4 \sim 8$ 員ヘテロシクロアルキル)は、1個または複数の $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、またはオキソで置換されていてもよく、

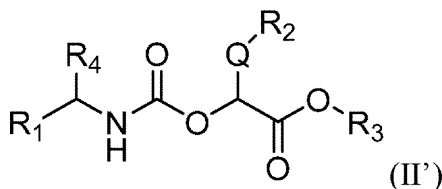
$R_4$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、ここで $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルは、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、またはオキソで置換されていてもよく、

$R_6$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、ここで $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルは、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、またはオキソで置換されていてもよい、化合物

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩。

[本発明1002]

式(II')の化合物:



、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

XがOである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1004]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_3 \sim C_{16}$ シクロアルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1005]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい5～10員ヘテロアリールである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1006]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい5員または6員ヘテロアリールで

ある、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1007]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい6員ヘテロアールである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1008]

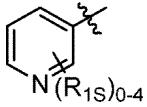
$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよいピリジニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1009]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよいピラジニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1010]

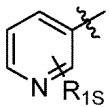
$R_1$ が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1011]

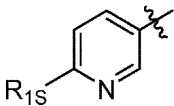
$R_1$ が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1012]

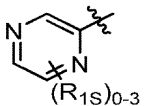
$R_1$ が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1013]

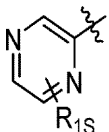
$R_1$ が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1014]

$R_1$ が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1015]

$R_1$ が、

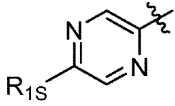
10

20

30

40

50



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1016]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_5 \sim C_{10}$ アリールである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1017]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよい $C_5 \sim C_6$ 単環式アリールである、前記本発明のいずれかの化合物。

10

[本発明1018]

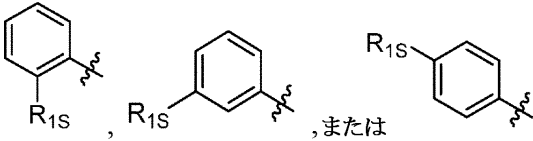
$R_1$ が、1個または複数の $R_{1S}$ で置換されていてもよいフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1019]

$R_1$ が、1個の $R_{1S}$ で置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1020]

$R_1$ が、



20

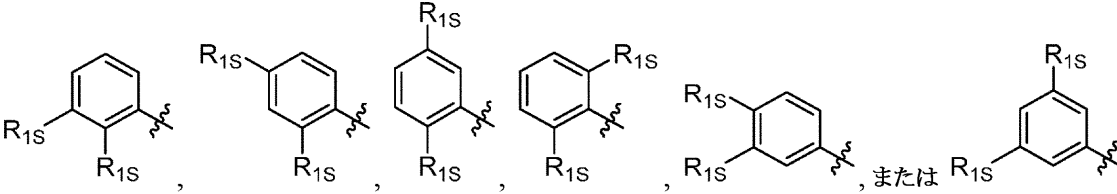
である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1021]

$R_1$ が、2個の $R_{1S}$ で置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1022]

$R_1$ が、



30

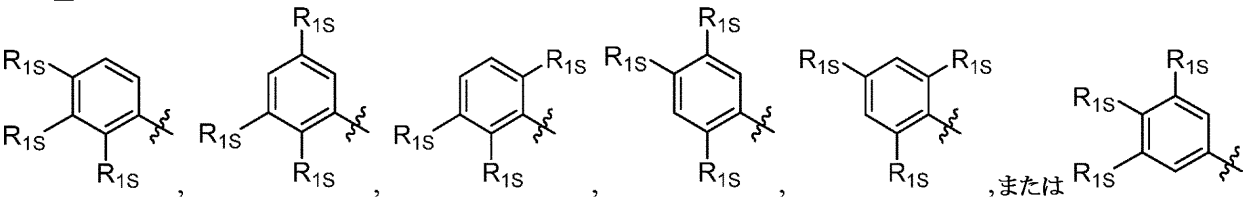
である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1023]

$R_1$ が、3個の $R_{1S}$ で置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1024]

$R_1$ が、



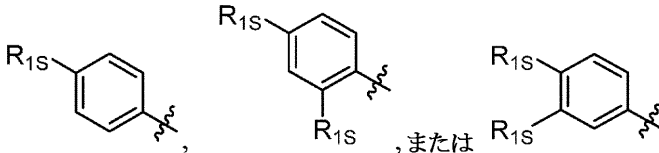
40

である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1025]

$R_1$ が、

50



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1026]

$R_1$ が、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、またはCNより独立して選択される1個または複数の置換基で置換された、フェニル

10

である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1027]

$R_1$ が、

メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、エトキシ、シクロプロピル、クロロ、または-CNより独立して選択される1個または複数の置換基で置換された、フェニル

である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1028]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1SS}$ で置換されていてもよい1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1029]

$R_1$ が、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

20

[本発明1030]

$R_1$ が、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換された1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1031]

$R_1$ が、1個または複数の-O-( $C_5 \sim C_6$ アリール)で置換された1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1032]

$R_1$ が、1個または複数のハロで置換された1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

30

[本発明1033]

$R_1$ が、1個、2個、または3個のFで置換された1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1034]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1SS}$ で置換されていてもよい1個または複数の $C_2 \sim C_6$ アルケニルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1035]

$R_1$ が、1個または複数の $C_2 \sim C_6$ アルケニルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

40

[本発明1036]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1SS}$ で置換されていてもよい1個または複数の $C_2 \sim C_6$ アルキニルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1037]

$R_1$ が、1個または複数の $C_2 \sim C_6$ アルキニルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1038]

$R_1$ が、1個または複数の $R_{1SS}$ で置換されていてもよい1個または複数の $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1039]

50

R<sub>1</sub>が、1個または複数のC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1040]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリールで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1041]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のC<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリールで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1042]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数の5員または6員ヘテロアリールで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

10

[本発明1043]

R<sub>1</sub>が、1個または複数の5員または6員ヘテロアリールで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1044]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1045]

R<sub>1</sub>が、1個またはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

20

[本発明1046]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のR<sub>1SS</sub>で置換されていてもよい1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1047]

R<sub>1</sub>が、1個またはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1048]

R<sub>1</sub>が、1個または複数のC<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリールで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1049]

30

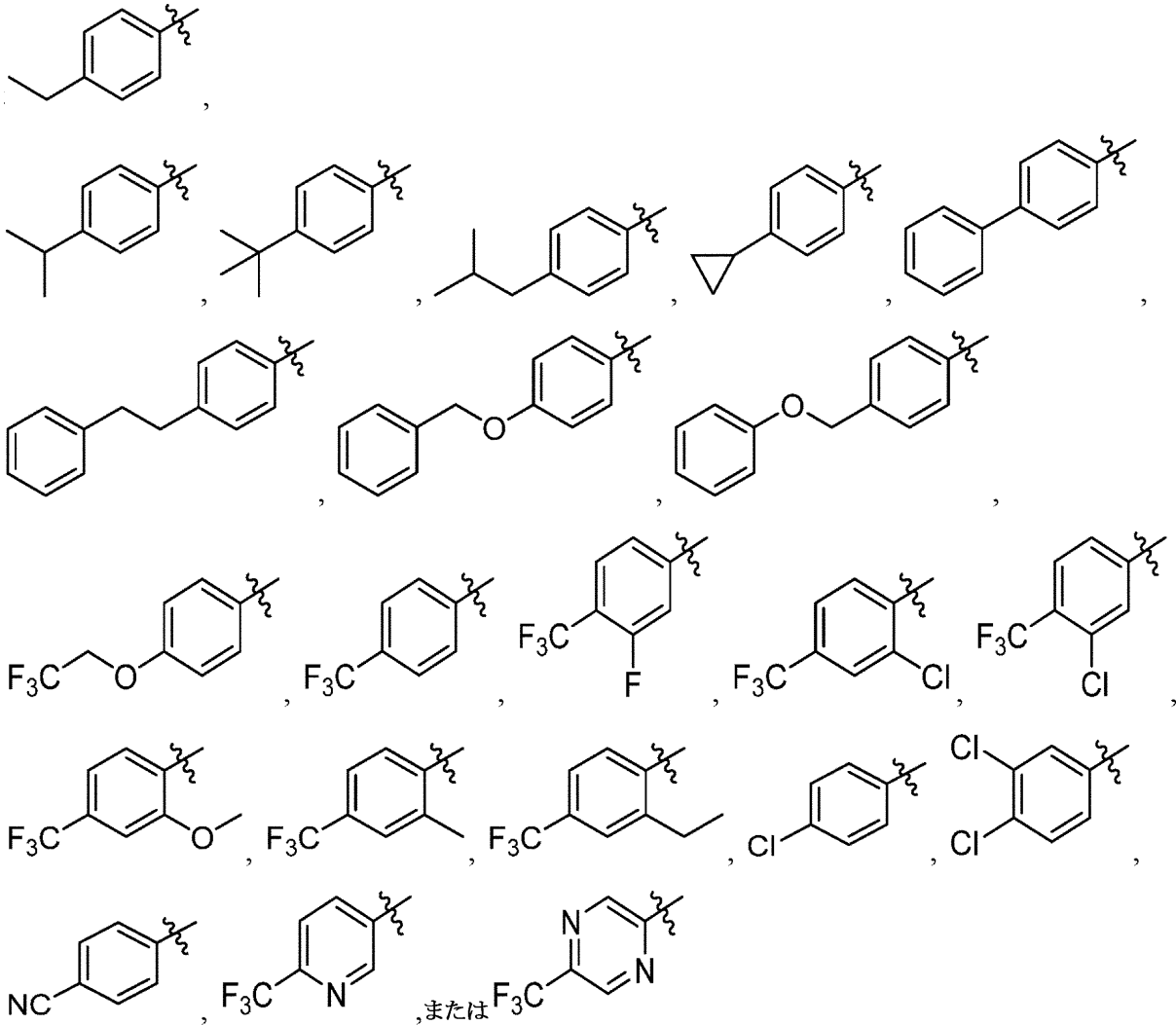
R<sub>1</sub>が、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルで置換された1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシで置換されたフェニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1050]

R<sub>1</sub>が、

40

50



10

20

30

40

50

## [本発明1060]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、5員または6員ヘテロアリアルである、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1061]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1062]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $-O-$  ( $C_5 \sim C_6$ アリアル) である、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1063]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $-O-$  (フェニル) である、前記本発明のいずれかの化合物。

10

## [本発明1064]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $-O-$  (5員または6員ヘテロアリアル) である、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1065]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $-O-$  ( $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル) である、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1066]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシである、前記本発明のいずれかの化合物。

20

## [本発明1067]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、ハロ、 $-CN$ 、またはオキソである、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1068]

少なくとも1個の $R_{1SS}$ が、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、または $-N$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>である、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1069]

Qが、

1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリアル、5員もしくは6員ヘテロアリアル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、メチルである、前記本発明のいずれかの化合物。

30

## [本発明1070]

Qがメチルである、前記本発明のいずれかの化合物。

## [本発明1071]

$R_2$ が、

1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリアル、5員もしくは6員ヘテロアリアル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、5~10員ヘテロアリアルである、前記本発明のいずれかの化合物。

40

## [本発明1072]

$R_2$ が、

1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリアル、5員もしくは6員ヘテロアリアル、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N$  ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>、または

50

オキソで置換されていてもよい、ピラゾリル  
である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1073]

R<sub>2</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1074]

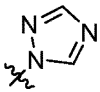
R<sub>2</sub>が、

1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、トリアゾリル

である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1075]

R<sub>2</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1076]

R<sub>2</sub>が、

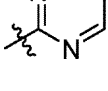
1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、または

オキソで置換されていてもよい、ピリミジニル

である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1077]

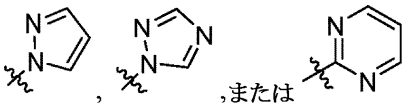
R<sub>2</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1078]

R<sub>2</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1079]

QとR<sub>2</sub>とが一緒になって、

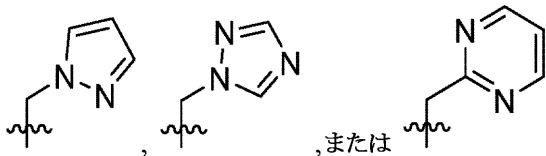
10

20

30

40

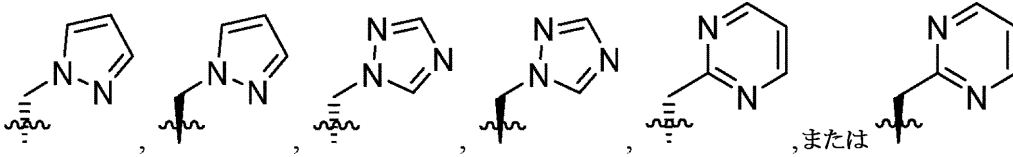
50



を形成する、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1080]

QとR<sub>2</sub>とが一緒になって、



を形成する、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1081]

R<sub>3</sub>が、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり；ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、オキソ、またはR<sub>3S</sub>で置換されていてもよい、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1082]

R<sub>3</sub>が、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり；ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1083]

R<sub>3</sub>がHである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1084]

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり；ここでC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルは、1個または複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1085]

R<sub>3</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1086]

R<sub>3</sub>がエチルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1087]

R<sub>3</sub>がプロピルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1088]

R<sub>3</sub>が、1個または複数のR<sub>3S</sub>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1089]

10

20

30

40

50

R<sub>3S</sub>が-OC(=O)R<sub>3Sa</sub>である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1090]

R<sub>3S</sub>が、

1個または複数の-OH、ハロ、-CN、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、5~6員ヘテロシクロアルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1091]

R<sub>3S</sub>が、1個または複数の-OHで置換されていてもよい5~6員ヘテロシクロアルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1092]

R<sub>3Sa</sub>が、1個または複数の-C(=O)OR<sub>3Sb</sub>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1093]

R<sub>3Sb</sub>が、

1個または複数の-OH、ハロ、-CN、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、4~8員ヘテロシクロアルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1094]

R<sub>3Sb</sub>が、

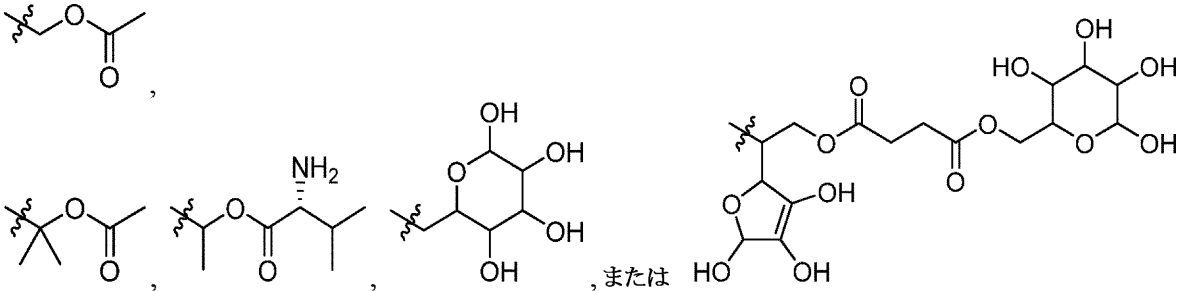
1個または複数の-OH、ハロ、-CN、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)-(4~8員ヘテロシクロアルキル)である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1095]

R<sub>3Sb</sub>が、1個または複数の-OHで置換されていてもよい-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)-(4~8員ヘテロシクロアルキル)である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1096]

R<sub>3</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1097]

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1098]

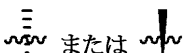
R<sub>4</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1099]

R<sub>4</sub>がメチルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1100]

R<sub>4</sub>が、



である、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1101]

$R_5$ がHである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1102]

$R_5$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり；ここで $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルは、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ アリール、5員もしくは6員ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、ハロ、-CN、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、-N( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>、またはオキソで置換されていてもよい、前記本発明のいずれかの化合物。

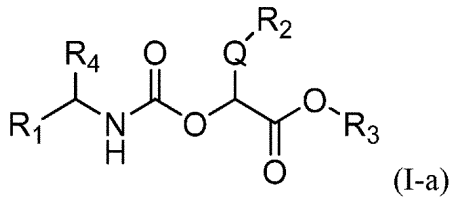
10

[本発明1103]

$R_6$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、または $C_2 \sim C_6$ アルキニルである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1104]

式(I-a)の化合物：

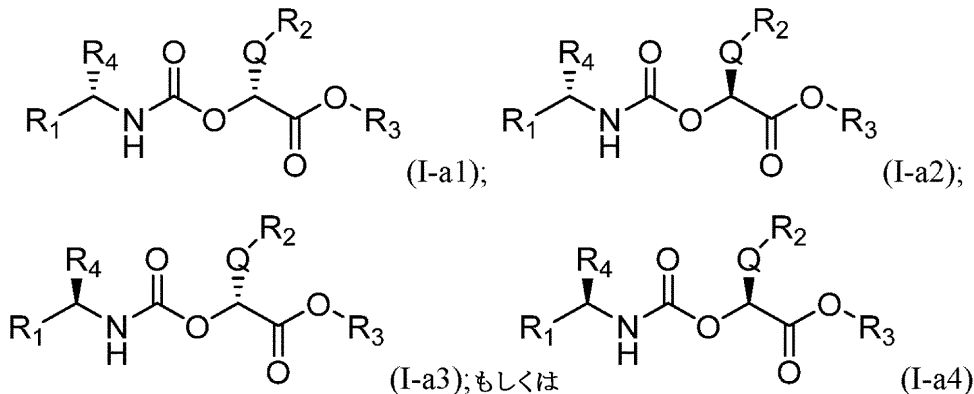


20

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、およびQは本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1105]

式(I-a1)、(I-a2)、(I-a3)、もしくは(I-a4)の化合物：



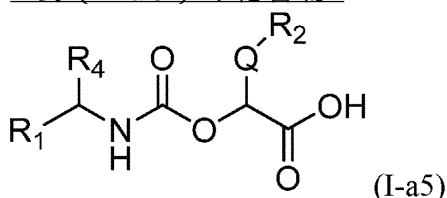
30

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、およびQは本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

40

[本発明1106]

式(I-a5)の化合物：

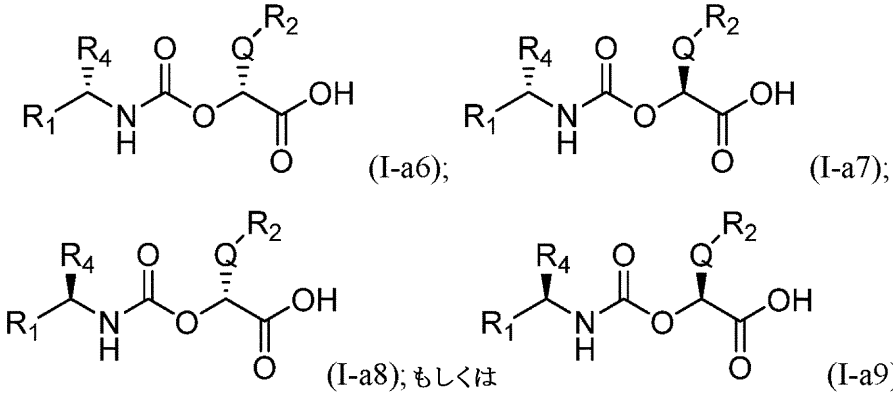


50

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1107]

式(I-a6)、(I-a7)、(I-a8)、もしくは(I-a9)の化合物:

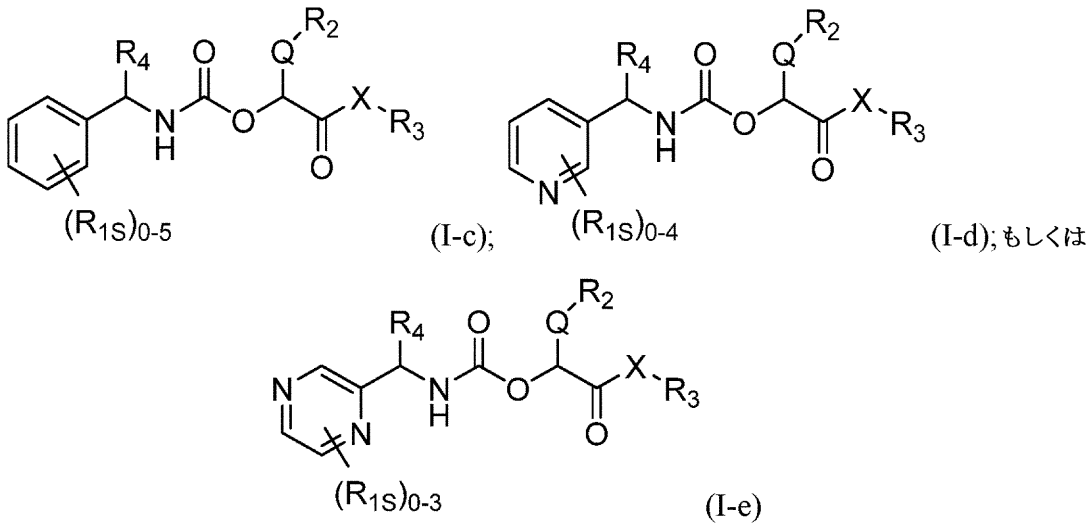


10

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1108]

式(I-c)、(I-d)、もしくは(I-e)の化合物:



20

30

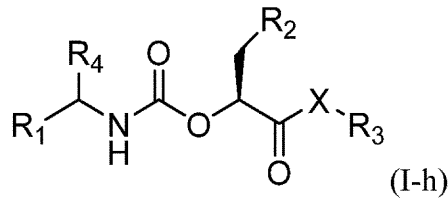
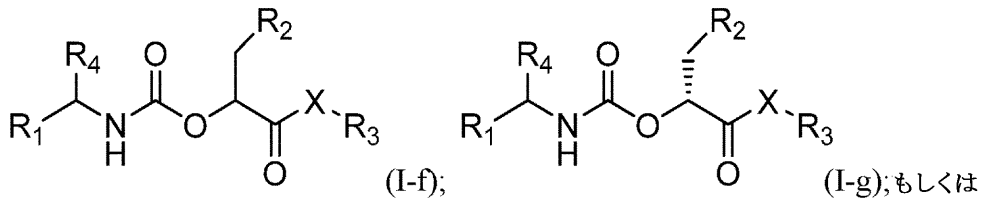
、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $X$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1109]

式(I-f)、(I-g)、もしくは(I-h)の化合物:

40

50

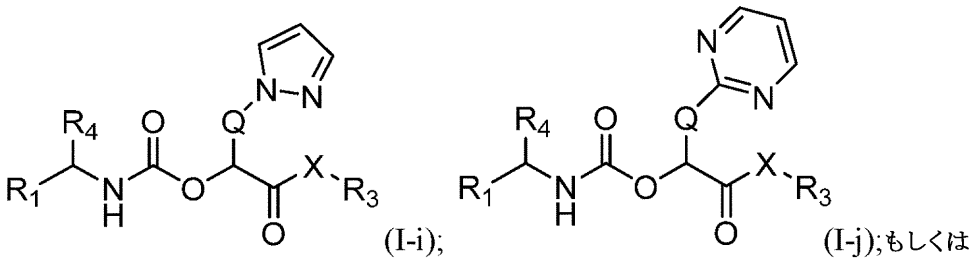


10

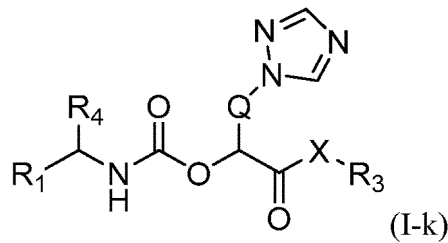
、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、および $X$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11110]

式 (I-i)、(I-j)、もしくは (I-k) の化合物:



20

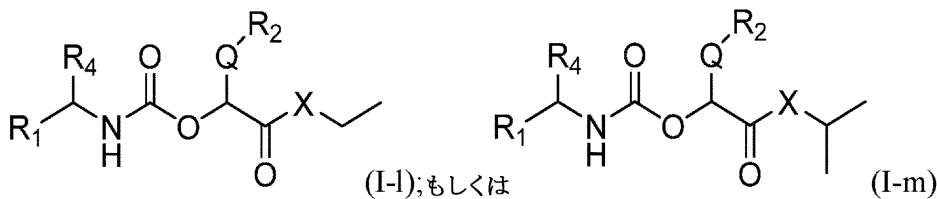


30

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $X$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11111]

式 (I-l) もしくは (I-m) の化合物:



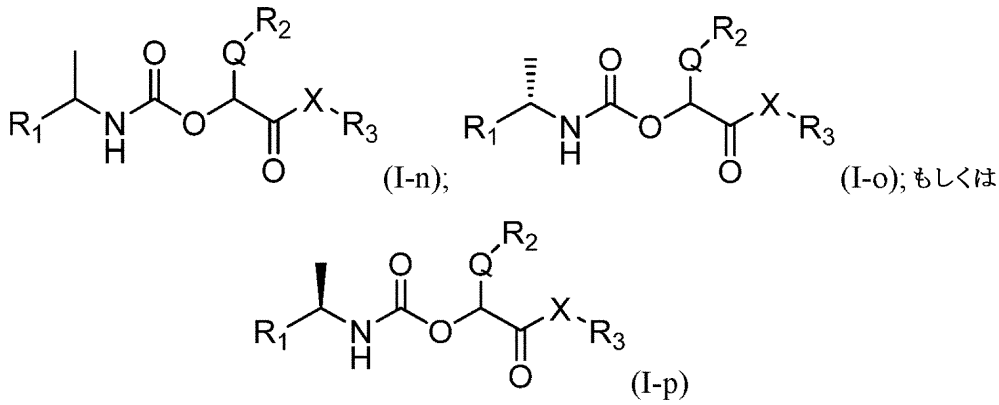
40

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_4$ 、 $X$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11112]

式 (I-n)、(I-o)、もしくは (I-p) の化合物:

50

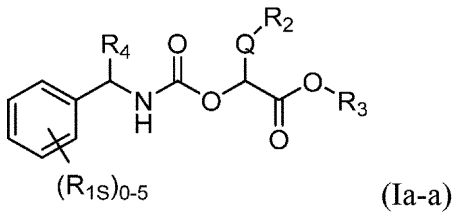


10

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $X$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11113]

式(Ia-a)の化合物:

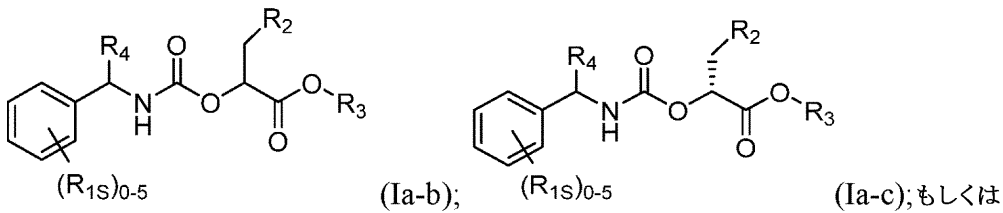


20

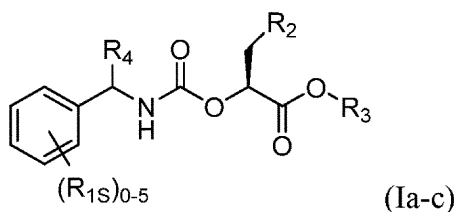
、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、および $Q$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11114]

式(Ia-b)、(Ia-c)もしくは(Ia-d)の化合物:



30



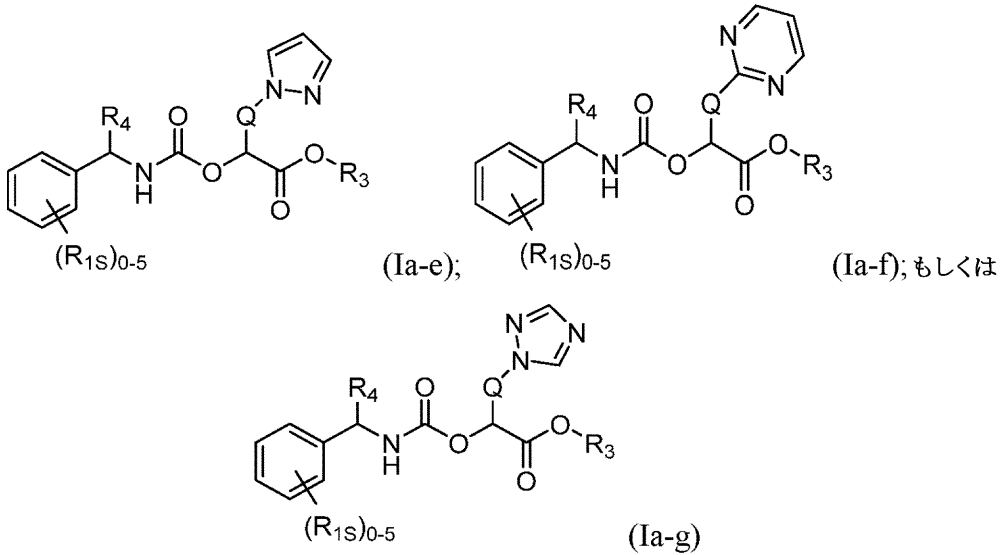
40

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、 $R_{1s}$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、および $R_4$ は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明11115]

式(Ia-e)、(Ia-f)、もしくは(Ia-g)の化合物:

50



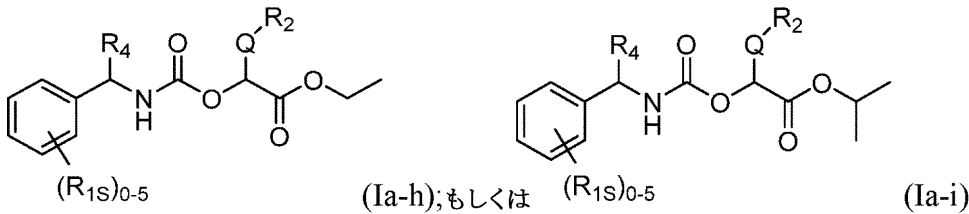
10

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、およびQは本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物

[本発明11116]

20

式 (Ia-h) もしくは (Ia-i) の化合物:

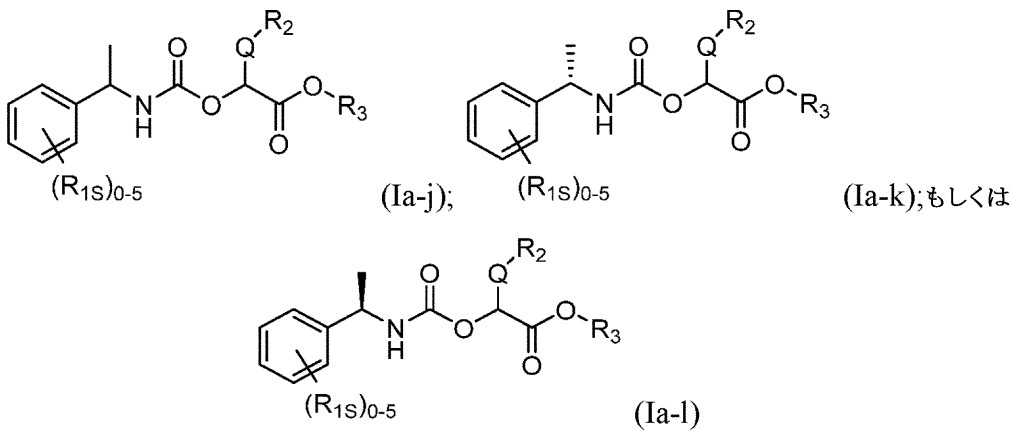


、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、およびQは本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物

30

[本発明11117]

式 (Ia-j)、(Ia-k)、もしくは (Ia-l) の化合物:



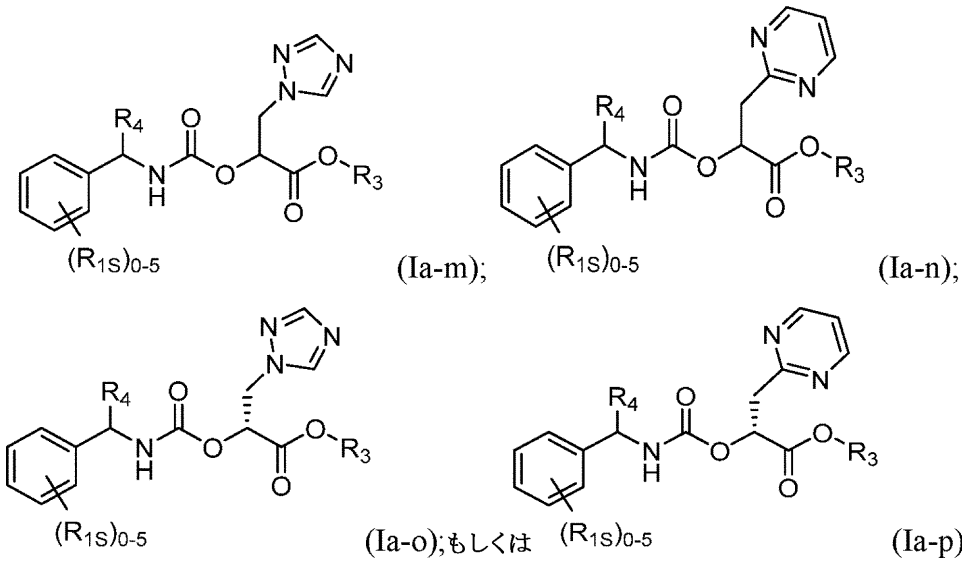
40

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、およびQは本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物

[本発明11118]

50

式 (1a-m)、(1a-n)、(1a-o)、もしくは(1a-p)の化合物:

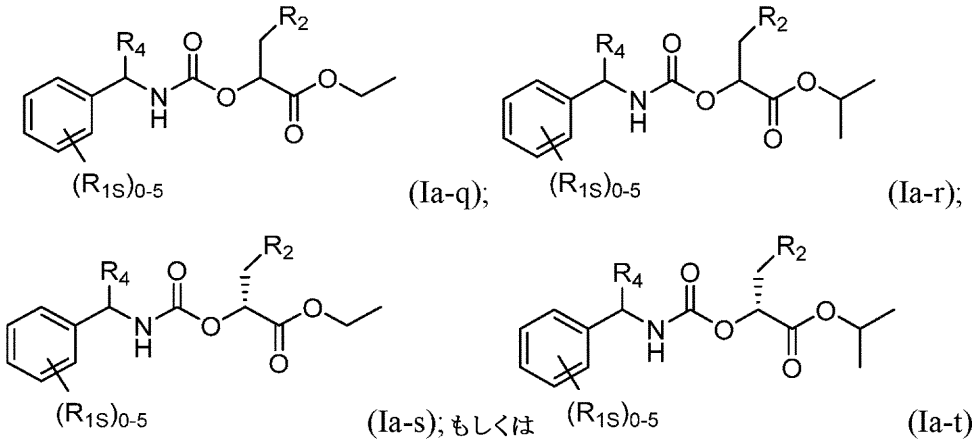


10

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>3</sub>、およびR<sub>4</sub>は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。  
[本発明1119]

20

式 (1a-q)、(1a-r)、(1a-s)、もしくは(1a-t)の化合物:



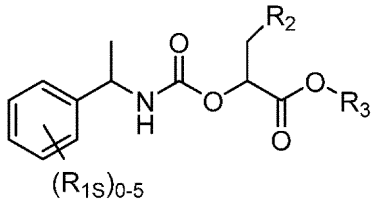
30

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、およびR<sub>4</sub>は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。  
[本発明1120]

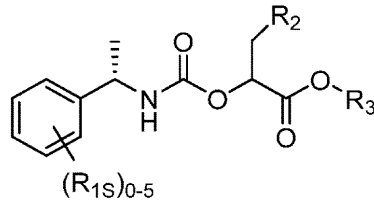
式 (1a-u)、(1a-v)、(1a-w)、(1a-x)、(1a-y)、もしくは(1a-z)の化合物:

40

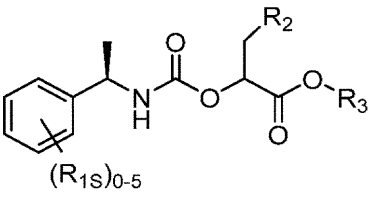
50



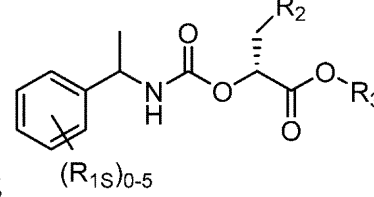
(Ia-u);



(Ia-v);

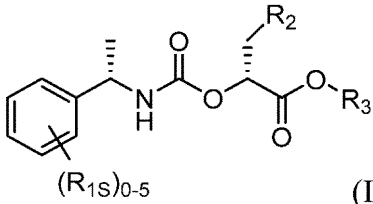


(Ia-w);

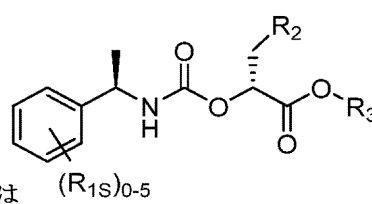


(Ia-x);

10



(Ia-y);



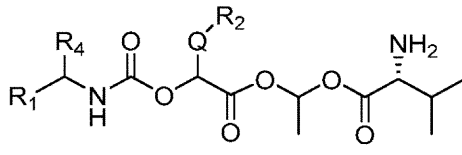
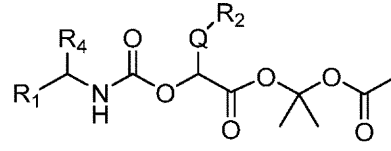
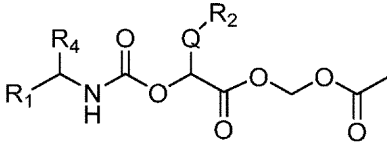
(Ia-z)

、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1s</sub>、R<sub>2</sub>、およびR<sub>3</sub>は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

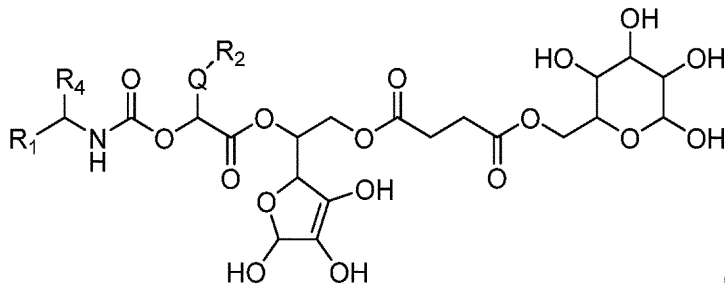
20

[本発明1121]

式 (Ic-a)、(Ic-b)、(Ic-c)、(Ic-d)、もしくは(Ic-e)の化合物:

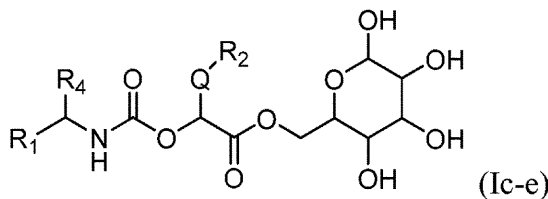


30



もしくは

40



、またはそのプロドラッグ、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩であり、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>4</sub>、Q、およびR<sub>2</sub>は本明細書に記載の通りである、前記本発明のいずれかの化合物。

[本発明1122]

50

化合物番号1～32ならびにそのプロドラッグおよび薬学的に許容される塩より選択される、本発明1001～1121のいずれかの化合物。

[本発明1123]

化合物番号1～32およびその薬学的に許容される塩より選択される、本発明1001～1121のいずれかの化合物。

[本発明1124]

化合物番号1～32より選択される、本発明1001～1121のいずれかの化合物。

[本発明1125]

本発明1001～1124のいずれかの化合物の同位体誘導体である化合物。

[本発明1126]

化合物番号1～32ならびにそのプロドラッグおよび薬学的に許容される塩のうちのいずれか一つの重水素標識化合物である、本発明1125の化合物。

[本発明1127]

化合物番号1～32のうちのいずれか一つの重水素標識化合物である、本発明1125の化合物。

[本発明1128]

本明細書に記載の方法によって得ることができるかまたは得られる化合物であって、任意で、前記方法が、スキーム1またはスキーム2に記載の1つまたは複数の工程を含む、化合物。

[本発明1129]

本発明1001～1128のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される希釈剤または担体とを含む、薬学的組成物。

[本発明1130]

化合物が、化合物番号1～32より選択される、本発明1129の薬学的組成物。

[本発明1131]

インフラマソーム活性を阻害する方法であって、細胞と、有効量の本発明1001～1128のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩とを接触させる段階を含み、任意で、インフラマソームがNLRP3インフラマソームであり、活性がインビトロまたはインビボである、方法。

[本発明1132]

疾患または障害を処置または予防することを必要とする対象においてそれを行う方法であって、該対象に治療有効量の本発明1001～1128のいずれかの化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または本発明1129もしくは本発明1130のいずれかの薬学的組成物を投与する段階を含む、方法。

[本発明1133]

疾患または障害が、インフラマソーム活性の関与を伴い、任意で、疾患または障害が、インフラマソーム活性が関与する疾患または障害である、本発明1132の方法。

[本発明1134]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、自己免疫障害、神経変性疾患、またはがんである、本発明1132または本発明1133の方法。

[本発明1135]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、または自己免疫障害であり、任意で、疾患または障害が、クリオピリン関連自己炎症性症候群(CAPS;例えば家族性寒冷自己炎症性症候群(FCAS)、マックル・ウェルズ症候群(MWS)、慢性乳児神経皮膚関節(CINCA)症候群/新生児期発症多臓器性炎症性疾患(NOMID))、家族性地中海熱(FMF)、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、痛風、関節リウマチ、変形性関節症、クローン病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、慢性腎疾患(CKD)、線維症、肥満、2型糖尿病、多発性硬化症、皮膚疾患(例えばざ瘡)、およびタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばプリオン病)において生じる神

10

20

30

40

50

経炎症より選択される、本発明1132～1134のいずれかの方法。

[本発明1136]

疾患または障害が神経変性疾患であり、任意で、疾患または障害がパーキンソン病またはアルツハイマー病である、本発明1132～1134のいずれかの方法。

[本発明1137]

疾患または障害ががんであり、任意で、がんが、転移性がん、脳がん、胃腸がん、皮膚がん、非小細胞肺癌、頭頸部扁平上皮癌、または結腸直腸腺癌である、本発明1132～1134のいずれかの方法。

[本発明1138]

任意で、インフラマソームがNLRP3インフラマソームであり、活性がインビトロまたはインビボである、インフラマソーム活性を阻害することにおける使用のための、本発明1001～1128のいずれかの化合物または本発明1129もしくは本発明1130のいずれかの薬学的組成物。

10

[本発明1139]

疾患または障害を処置または予防することにおける使用のための、本発明1001～1128のいずれかの化合物または本発明1129もしくは本発明1130のいずれかの薬学的組成物。

[本発明1140]

疾患または障害が、インフラマソーム活性の関与を伴い、任意で、疾患または障害が、インフラマソーム活性が関与する疾患または障害である、本発明1139の化合物または薬学的組成物。

20

[本発明1141]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、自己免疫障害、神経変性疾患、またはがんである、本発明1139または本発明1140の化合物または薬学的組成物。

[本発明1142]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、または自己免疫障害であり、任意で、疾患または障害が、クリオピリン関連自己炎症性症候群(CAPS;例えば家族性寒冷自己炎症性症候群(FCAS)、マックル・ウェルズ症候群(MWS)、慢性乳児神経皮膚関節(CINCA)症候群/新生児期発症多臓器性炎症性疾患(NOMID))、家族性地中海熱(FMF)、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、痛風、関節リウマチ、変形性関節症、クローン病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、慢性腎疾患(CKD)、線維症、肥満、2型糖尿病、多発性硬化症、皮膚疾患(例えばざ瘡)、およびタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばプリオン病)において生じる神経炎症より選択される、本発明1139～1141のいずれかの化合物または薬学的組成物。

30

[本発明1143]

疾患または障害が神経変性疾患であり、任意で、疾患または障害がパーキンソン病またはアルツハイマー病である、本発明1139～1141のいずれかの化合物または薬学的組成物。

[本発明1144]

疾患または障害ががんであり、任意で、がんが、転移性がん、胃腸がん、脳がん、皮膚がん、非小細胞肺癌、頭頸部扁平上皮癌、または結腸直腸腺癌である、本発明1139～1141のいずれかの化合物または薬学的組成物。

40

[本発明1145]

任意で、インフラマソームがNLRP3インフラマソームであり、活性がインビトロまたはインビボである、インフラマソーム活性を阻害するための医薬の製造における、本発明1001～1128のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩の使用。

[本発明1146]

疾患または障害を処置または予防するための医薬の製造における、本発明1001～1128のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩の使用。

[本発明1147]

50

疾患または障害が、インフラマソーム活性の関与を伴い、任意で、疾患または障害が、インフラマソーム活性が関与する疾患または障害である、本発明1146の使用。

[本発明1148]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、自己免疫障害、神経変性疾患、またはがんである、本発明1146または本発明1147の使用。

[本発明1149]

疾患または障害が、炎症性障害、自己炎症性障害、または自己免疫障害であり、任意で、疾患または障害が、クリオピリン関連自己炎症性症候群(CAPS;例えば家族性寒冷自己炎症性症候群(FCAS)、マックル・ウェルズ症候群(MWS)、慢性乳児神経皮膚関節(CINCA)症候群/新生児期発症多臓器性炎症性疾患(NOMID))、家族性地中海熱(FMF)、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、痛風、関節リウマチ、変形性関節症、クローン病、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、慢性腎疾患(CKD)、線維症、肥満、2型糖尿病、多発性硬化症、皮膚疾患(例えばざ瘡)、およびタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばプリオン病)において生じる神経炎症より選択される、本発明1146~1148のいずれかの使用。

10

[本発明1150]

疾患または障害が神経変性疾患であり、任意で、疾患または障害がパーキンソン病またはアルツハイマー病である、本発明1146~1148のいずれかの使用。

[本発明1151]

疾患または障害が皮膚疾患であり;任意で、疾患または障害がざ瘡である、本発明1146~1148のいずれかの使用。

20

[本発明1152]

疾患または障害ががんであり、任意で、がんが、転移性がん、脳がん、胃腸がん、皮膚がん、非小細胞肺癌、頭頸部扁平上皮癌、または結腸直腸腺癌である、本発明1146~1148のいずれかの使用。

別途定義がない限り、本明細書において使用されるすべての技術用語および科学用語は、本開示が属する技術分野の当業者が通常理解するものと同じ意味を有する。本明細書では、文脈上別途明らかな指示がない限り、単数形は複数も含む。本明細書に記載のものと同様または同等の方法および材料を本開示の実施または試験において使用することができるが、好適な方法および材料を以下に記載する。本明細書において言及されるすべての刊

行物、特許出願、特許、および他の参考文献は、参照により組み入れられる。本明細書において引用される参考文献は、特許請求される本発明の先行技術であるとは認められない。矛盾がある場合は、定義を含む本明細書が優先する。さらに、材料、方法、および実施例は、例示的なものでしかなく、限定的であるようには意図されていない。化学構造と本明細書に開示される化合物の名称との間に矛盾がある場合は、化学構造が優先する。

30

40

50