

【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3年9月2日(2021.9.2)

【公表番号】特表2020-529405(P2020-529405A)

【公表日】令和2年10月8日(2020.10.8)

【年通号数】公開・登録公報2020-041

【出願番号】特願2020-505150(P2020-505150)

【国際特許分類】

C 07 C	271/30	(2006.01)
A 61 K	31/27	(2006.01)
A 61 K	31/277	(2006.01)
C 07 D	233/60	(2006.01)
C 07 D	231/12	(2006.01)
C 07 D	241/12	(2006.01)
C 07 D	249/08	(2006.01)
A 61 K	31/415	(2006.01)
A 61 K	31/4196	(2006.01)
A 61 K	31/505	(2006.01)
A 61 K	31/4164	(2006.01)
C 07 D	409/12	(2006.01)
A 61 K	31/4155	(2006.01)
A 61 K	31/4965	(2006.01)
A 61 K	31/50	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	19/06	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	11/08	(2006.01)
A 61 P	3/00	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	25/28	(2006.01)
A 61 P	25/16	(2006.01)
C 07 C	271/28	(2006.01)

【F I】

C 07 C	271/30	
A 61 K	31/27	
A 61 K	31/277	
C 07 D	233/60	1 0 4
C 07 D	231/12	C S P D
C 07 D	241/12	
C 07 D	249/08	
C 07 D	249/08	5 1 5

A	6	1	K	31/415		
A	6	1	K	31/4196		
A	6	1	K	31/505		
A	6	1	K	31/4164		
C	0	7	D	409/12		
A	6	1	K	31/4155		
A	6	1	K	31/4965		
A	6	1	K	31/50		
A	6	1	P	29/00		
A	6	1	P	37/06		
A	6	1	P	25/00		
A	6	1	P	35/00		
A	6	1	P	17/00		
A	6	1	P	21/00		
A	6	1	P	1/16		
A	6	1	P	19/02		
A	6	1	P	19/06		
A	6	1	P	29/00	1	0
A	6	1	P	1/04		
A	6	1	P	11/08		
A	6	1	P	3/00		
A	6	1	P	13/12		
A	6	1	P	3/04		
A	6	1	P	25/28		
A	6	1	P	25/16		
C	0	7	C	271/28		

【手續補正書】

【提出日】令和3年7月26日(2021.7.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

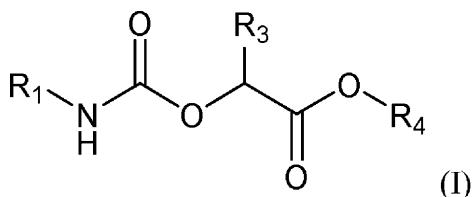
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩：



式中、

R_1 は、 C_8-C_{16} 多環式シクロアルキル、8~12員ヘテロシクロアルキル、または5~6員ヘテロアリールであり、ここで C_8-C_{16} 多環式シクロアルキル、8~12員ヘテロシクロアルキル、または5~6員ヘテロアリールは1個または複数の R_6 で置換されていてもよく、または

R_1 は、1個または複数の R_6 で置換された $C_5 \sim C_{10}$ アリールであり、

R_3 は、H、または1個もしくは複数の R_7 で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり； R_4 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 3-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、または $-(CH_2)_0 \sim 3-C_5 \sim C_6$ アリールであり；

R_6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OH、-CN、-NH₂、-NH($C_1 \sim C_6$ アルキル)、-N($C_1 \sim C_6$ アルキル)₂、-CH₂F、-CHF₂、または-CF₃であり；

R_7 は、-OR₈、 $C_5 \sim C_{10}$ アリール、または5~10員ヘテロアリールであり、ここで該 $C_5 \sim C_{10}$ アリールまたは5~10員ヘテロアリールは1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよく、ここで各 R_{7S} は独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、5~10員ヘテロアリール、ハロ、-OH、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-NH_2$ 、 $-(CH_2)_0 \sim 3-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル)₂、-CH₂F、-CHF₂、または-CF₃であり；

R_8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは5~7員ヘテロシクロアルキルであり、ここで該 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは5~7員ヘテロシクロアルキルは1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい。

【請求項2】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換された $C_8 \sim C_{16}$ 多環式シクロアルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R_1 がアダマンチル、ノルボルニル、またはビシクロ[2.2.2]オクタニルであり、ここで該アダマンチル、ノルボルニル、またはビシクロ[2.2.2]オクタニルが1個または複数の R_6 で置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよい $C_{12} \sim C_{16}$ 三環式飽和シクロアルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよいヘキサヒドロインダセニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

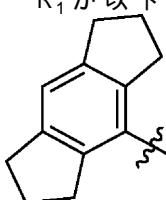
R_1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、オキソ、-OH、および-CF₃より独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で置換されていてもよいヘキサヒドロインダセニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

R_1 がヘキサヒドロインダセニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

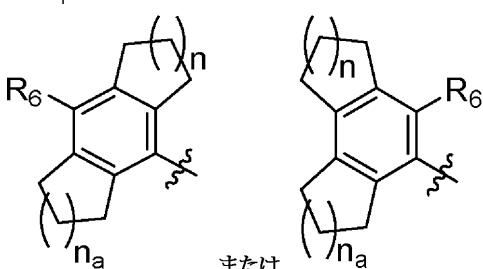
R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

R_1 が以下：



であり、式中、nおよびn_aがそれぞれ独立して0、1、2、または3である、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

R₁が、1個または複数のR₆で置換されたC₅～C₁₀アリールである、請求項1記載の化合物。

【請求項11】

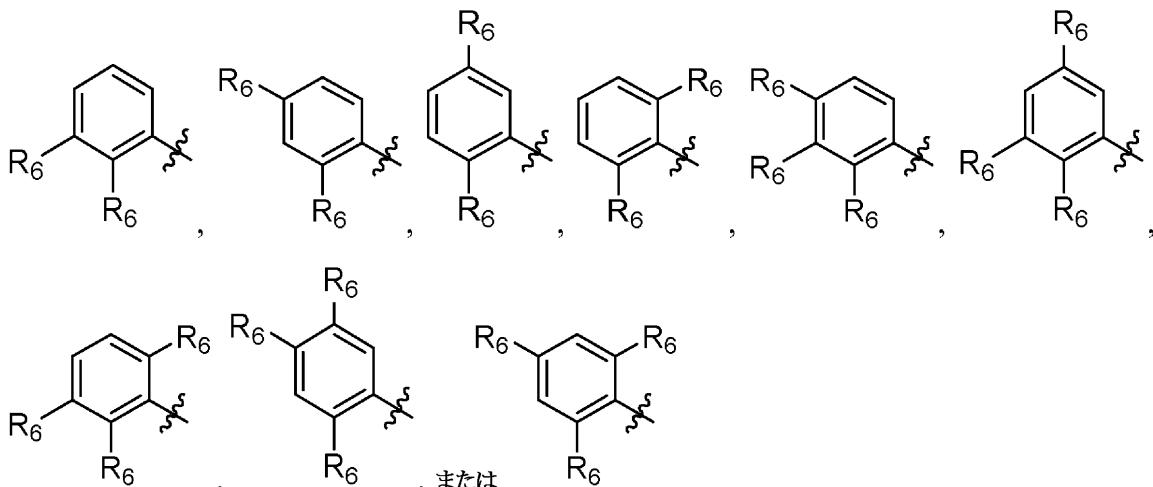
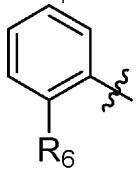
R₁が、1個または複数のR₆で置換されてたフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項12】

R₁が、C₁～C₄アルキル、ハロ、-CN、および-CF₃より独立して選択される1、2、または3個の置換基で置換されたフェニルであり、任意で、該1、2、または3個の置換基がClおよびFより独立して選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項13】

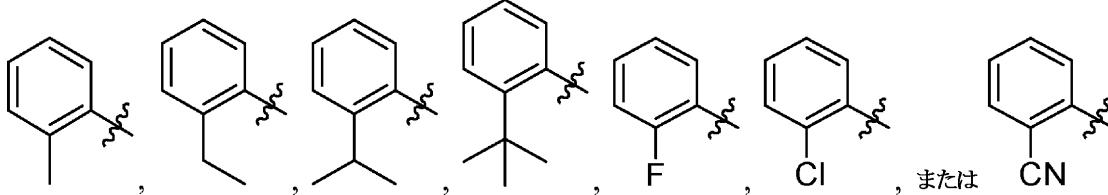
R₁が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項14】

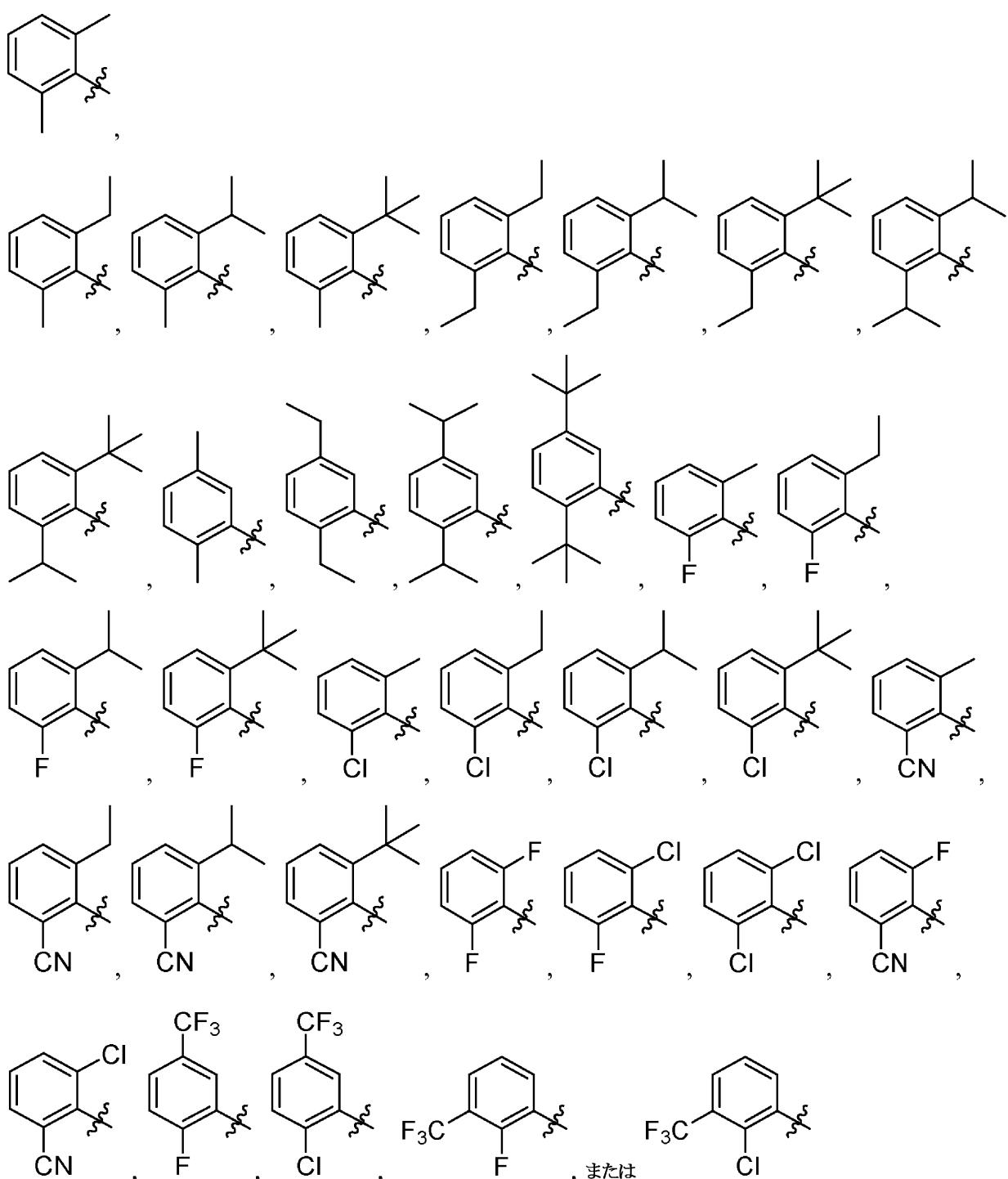
R₁が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項15】

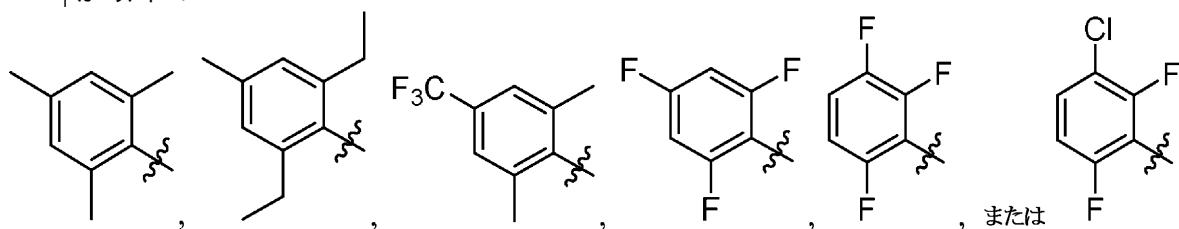
R₁が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項 16】

R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

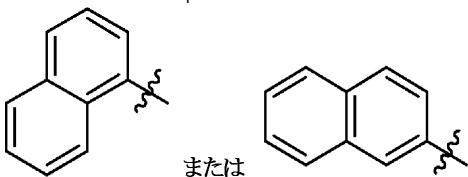
【請求項 17】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよいナフタレンilである、請求項1記載の化合物。

【請求項 1 8】

R_1 が非置換ナフタレンイルであり；

任意で、 R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

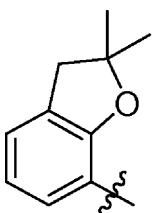
【請求項 1 9】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよい8~12員ヘテロシクロアルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項 2 0】

R_1 がベンゾフラニルまたはジヒドロベンゾフラニルであり、ここで該ベンゾフラニルまたはジヒドロベンゾフラニルが1個または複数の R_6 で置換されていてもよく；

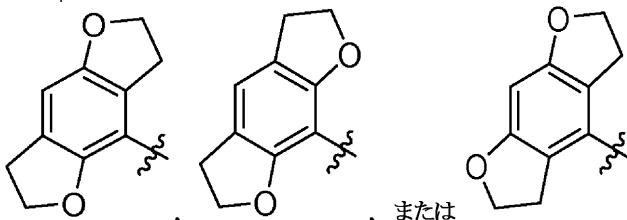
任意で、 R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項 2 1】

R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

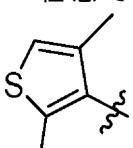
【請求項 2 2】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよい5~6員ヘテロアリールである、請求項1記載の化合物。

【請求項 2 3】

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよいチオフェニルであり；

任意で、 R_1 が以下：



である、請求項1記載の化合物。

【請求項 2 4】

R_3 がHである、請求項1~23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 2 5】

R_3 が、1個または複数の R_7 で置換されていてもよいC₁~C₄アルキルである、請求項1~23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 2 6】

R_3 がメチルまたはエチルである、請求項1~23のいずれか一項記載の化合物。

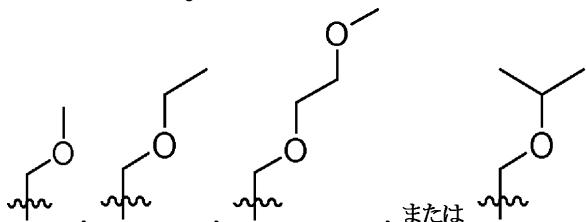
【請求項 27】

R_3 が、1個または複数の R_7 で置換された $C_1 \sim C_4$ アルキルである、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 28】

R_3 が、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルコキシで置換されたメチルであり、ここで該 $C_1 \sim C_6$ アルコキシが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルコキシで置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

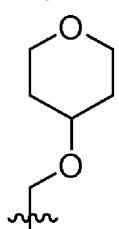


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 29】

R_3 が、1個または複数の-0-(5～7員ヘテロシクロアルキル)で置換されたメチルであり；

任意で、 R_3 が以下：

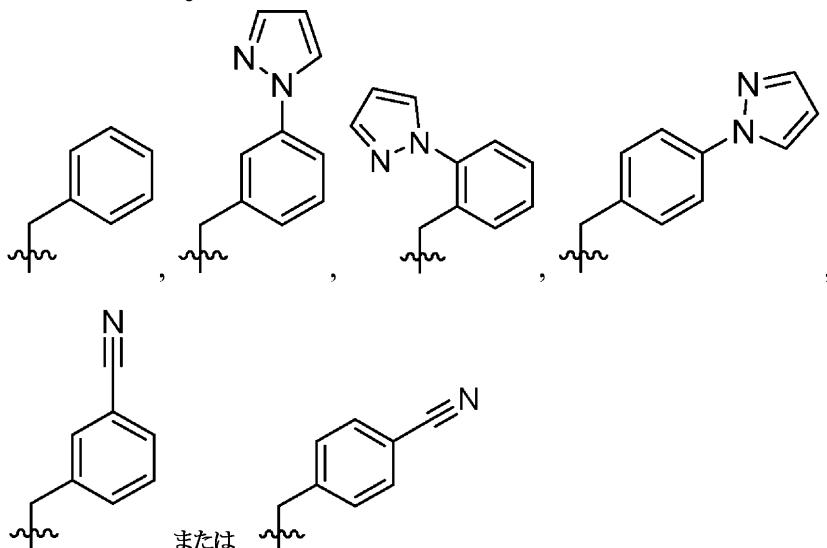


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 30】

R_3 が、1個または複数の $C_5 \sim C_{10}$ アリールを有するメチルであり、ここで該 $C_5 \sim C_{10}$ アリールが1個または複数の5～10員ヘテロアリールまたは-CNで置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：



である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

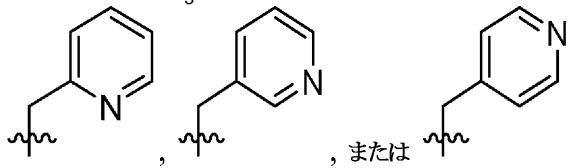
【請求項 31】

R_3 が、1個または複数の5～10員ヘテロアリールで置換されたメチルであり、ここで該5～10員ヘテロアリールが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6\text{アルキル})_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよい、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 32】

R_3 が、1個または複数のピリジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

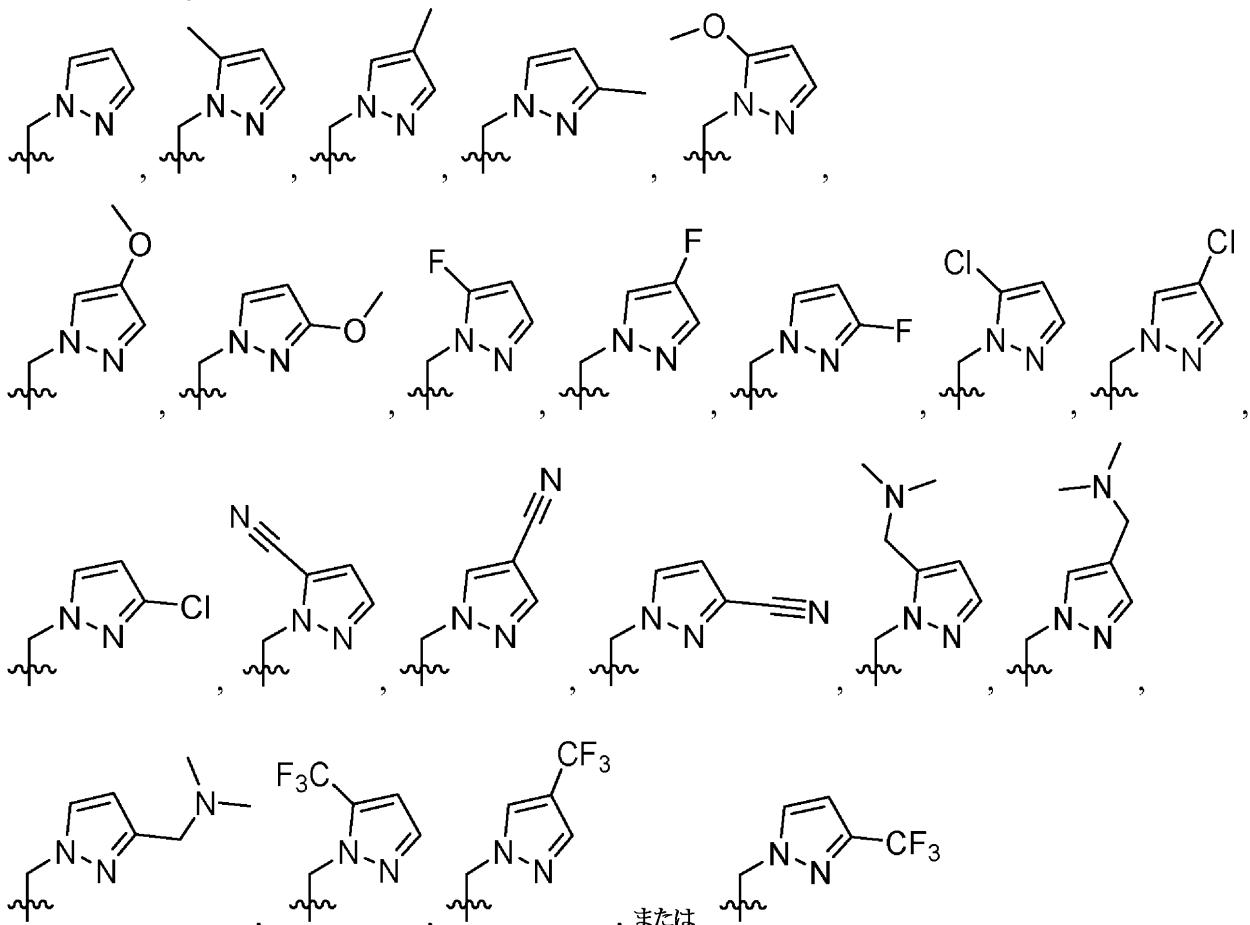


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項33】

R_3 が、1個または複数のピラゾリルで置換されたメチルであり、ここで該ピラゾリルが1個または複数のメチル、メトキシ、F、Cl、-CN、 $-CH_2-N(CH_3)_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

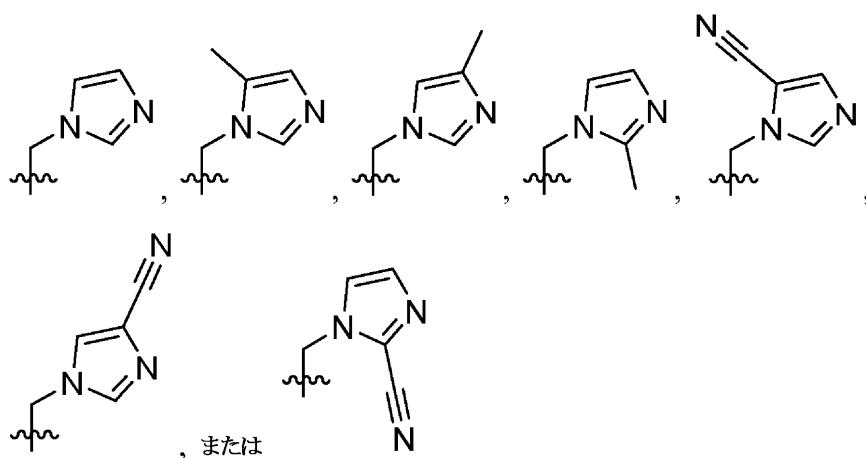


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項34】

R_3 が、1個または複数のイミダゾリルで置換されたメチルであり、ここで該イミダゾリルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

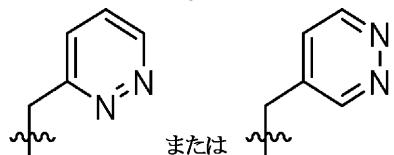


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項35】

R_3 が、1個または複数のピリダジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリダジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6\text{アルキル})_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

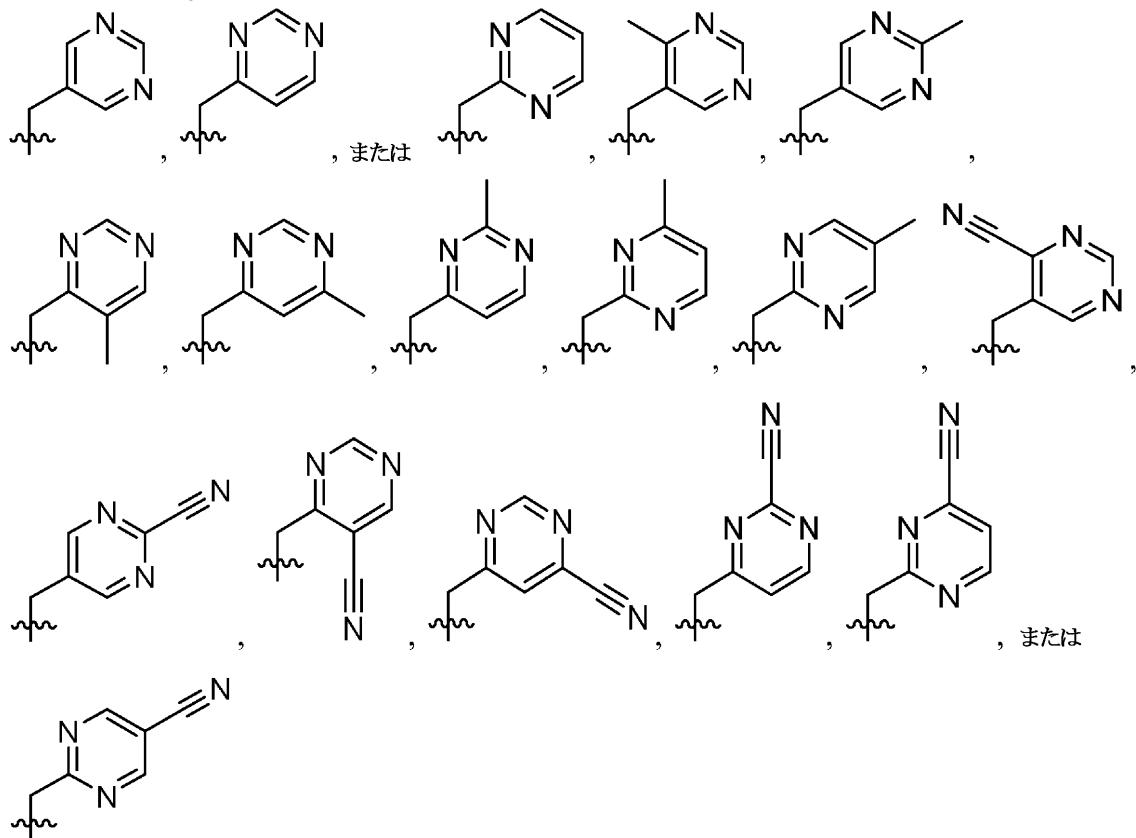


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項36】

R_3 が、1個または複数のピリミジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリミジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6\text{アルキル})_2$ 、または $-CF_3$ で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

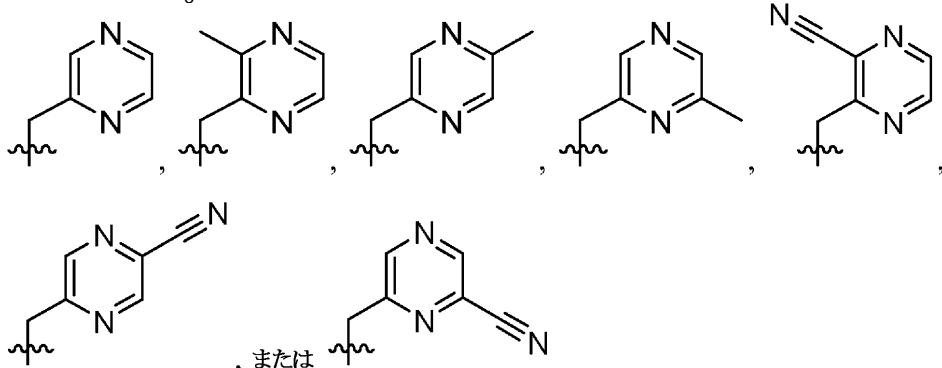


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項37】

R_3 が、1個または複数のピラジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピラジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

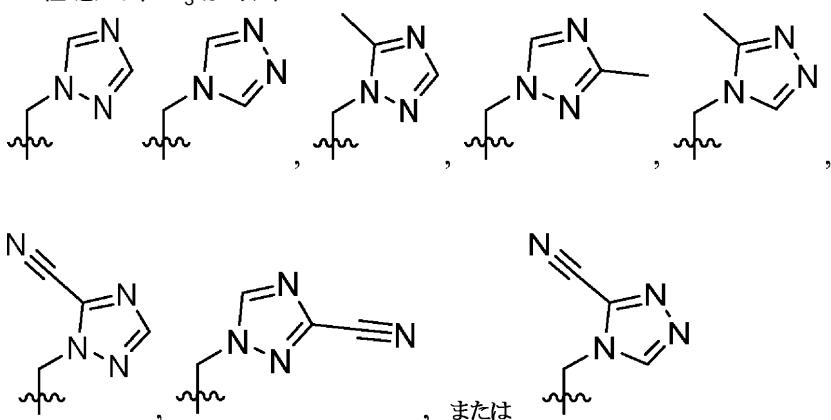


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項38】

R_3 が、1個または複数のトリアゾリルで置換されたメチルであり、ここで該トリアゾリルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

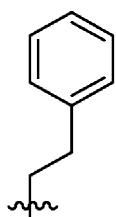


である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項39】

R_3 が、1個または複数の $C_5 \sim C_{10}$ アリールで置換されたエチルであり；

任意で、 R_3 が以下：



である、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物。

【請求項40】

R_4 がHである、請求項1～39のいずれか一項記載の化合物。

【請求項41】

R_4 が $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 3-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、または $-(CH_2)_0 \sim 3-C_5 \sim C_6$ アリールである、請求項1～39のいずれか一項記載の化合物。

【請求項42】

R_4 が $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

任意で、 R_4 がメチル、エチル、プロピル、またはブチルである、請求項1～39のいずれか一項記載の化合物。

【請求項43】

R_4 が $-(CH_2)_0 \sim 3-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)であり；

任意で、 R_4 が以下：

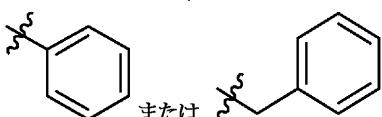


である、請求項1～39のいずれか一項記載の化合物。

【請求項44】

R_4 が $-(CH_2)_0 \sim 3-C_5 \sim C_6$ アリールであり；

任意で、 R_4 が以下：



である、請求項1～39のいずれか一項記載の化合物。

【請求項45】

少なくとも1個の R_6 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである、請求項1～44のいずれか一項記載の化合物。

【請求項46】

少なくとも1個の R_6 が、ハロ、オキソ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、請求項1～44のいずれか一項記載の化合物。

【請求項47】

少なくとも1個の R_7 が $-OR_8$ であり；

任意で、少なくとも1個の R_7 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；あるいは、少なくとも1個の R_7 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい $-O-(5 \sim 7$ 員ヘテロシクロアルキル)である、請求項1～46のいずれか一項記載の化合物。

【請求項48】

少なくとも1個の R_7 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい $C_5 \sim C_{10}$ アリールである、請求項1～46のいずれか一項記載の化合物。

【請求項49】

少なくとも1個の R_7 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい5～10員ヘテロアリールである、請求項1～46のいずれか一項記載の化合物。

【請求項50】

少なくとも1個の R_{7S} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または5～10員ヘテロアリールである、請求項1～49のいずれか一項記載の化合物。

【請求項51】

少なくとも1個の R_{7S} が、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_0 \sim 3-NH_2$ 、 $-(CH_2)_0 \sim 3-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ である、請求項1～49のいずれか一項記載の化合物。

【請求項52】

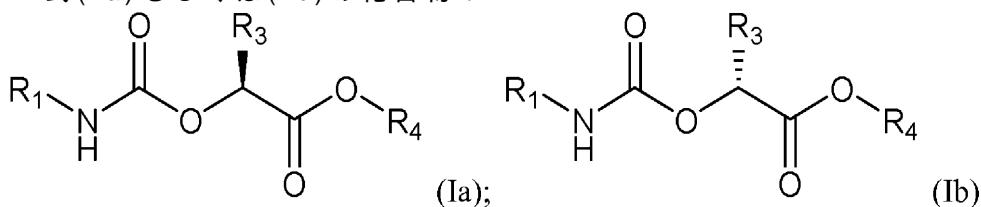
R_8 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項1～51のいずれか一項記載の化合物。

【請求項53】

R_8 が、1個または複数の R_{7S} で置換されていてもよい5～7員ヘテロシクロアルキルである、請求項1～51のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 5 4】

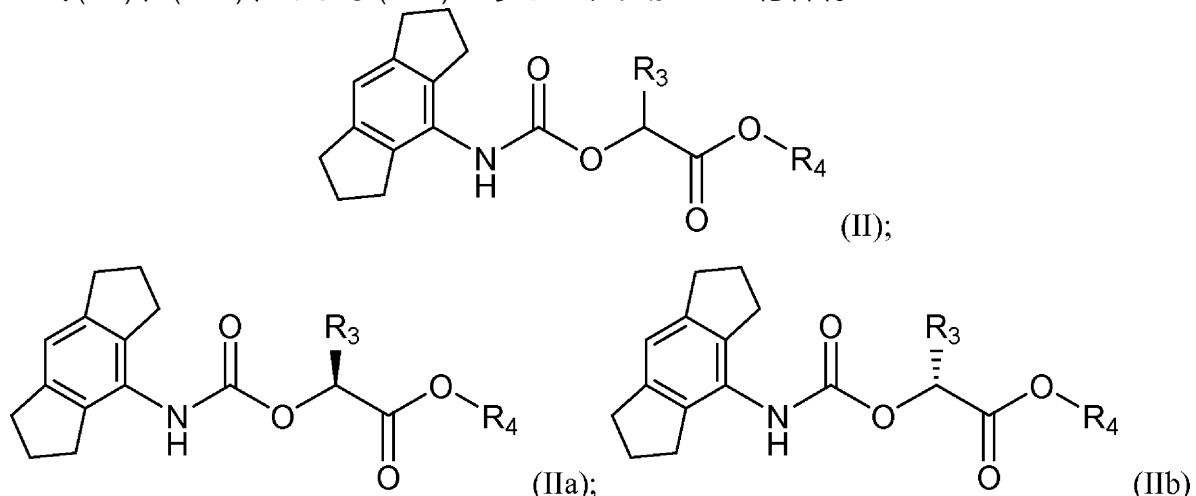
式(Ia)もしくは(Ib)の化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 5 5】

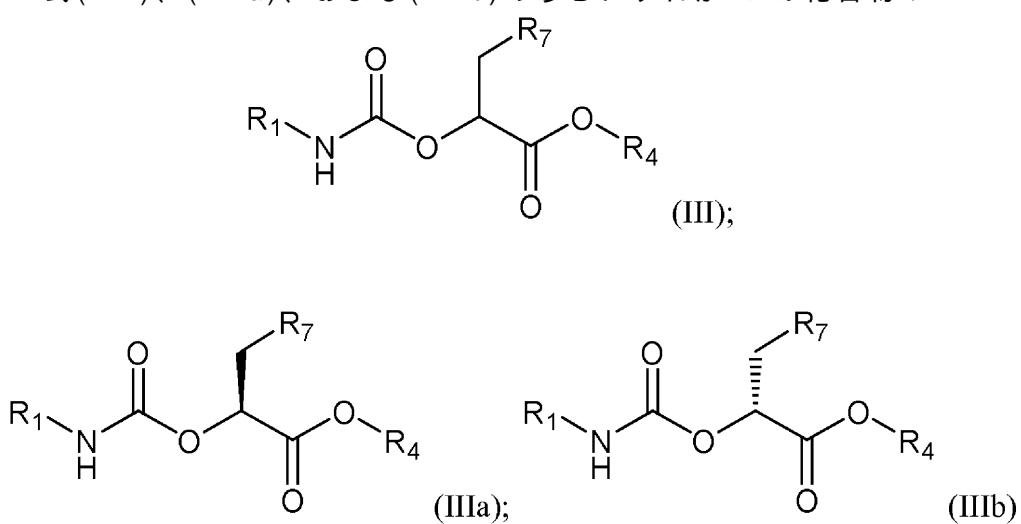
式(II)、(IIa)、および(IIb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 5 6】

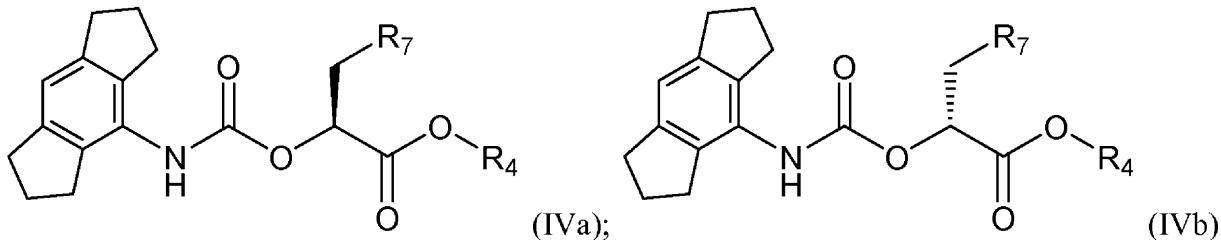
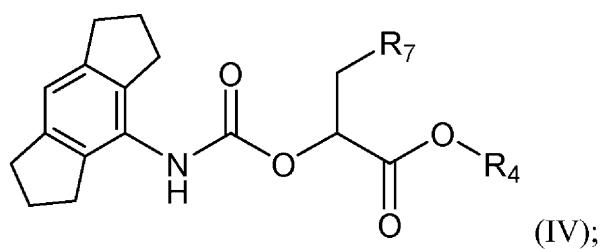
式(III)、(IIIa)、および(IIIb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 5 7】

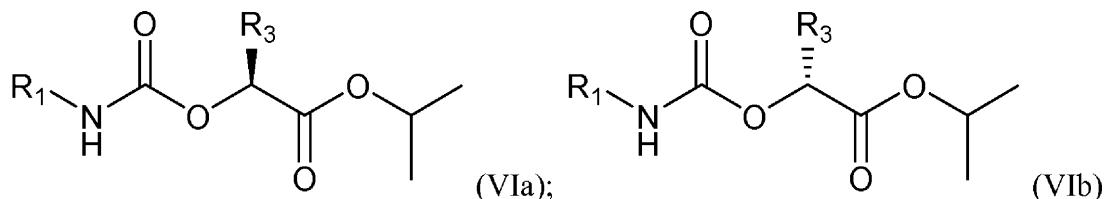
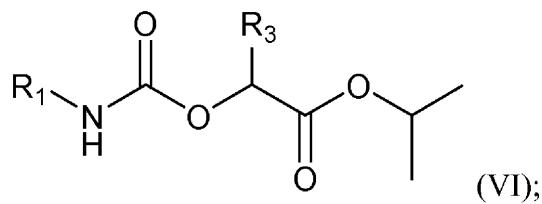
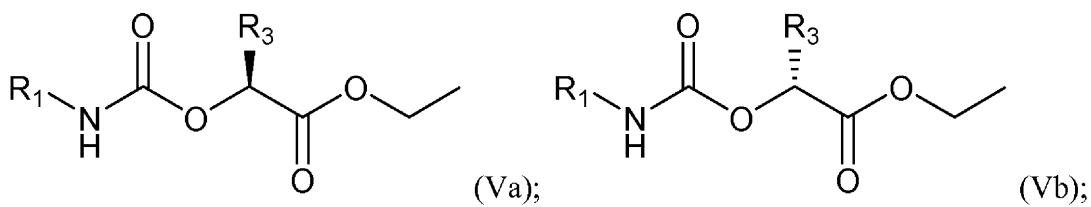
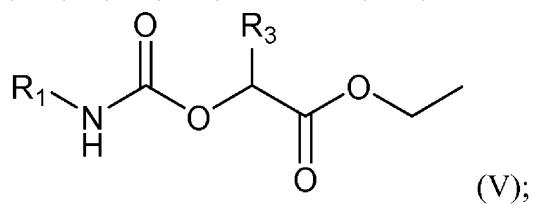
式(IV)、(IVa)、および(IVb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 5 8】

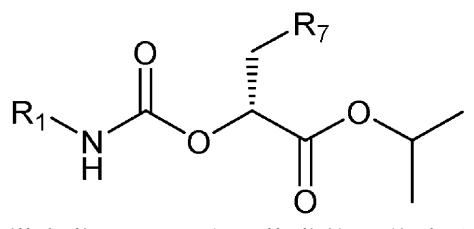
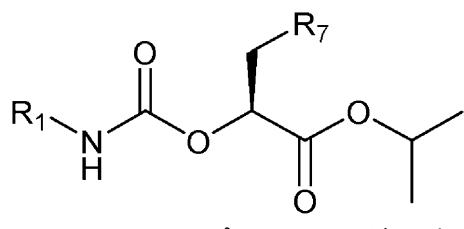
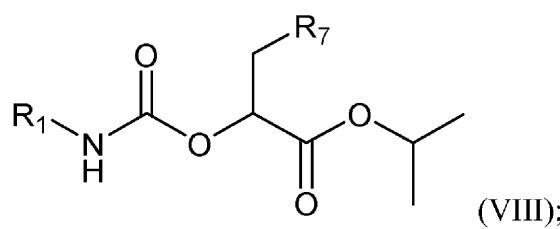
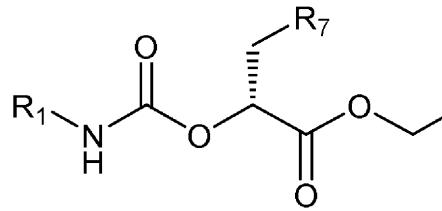
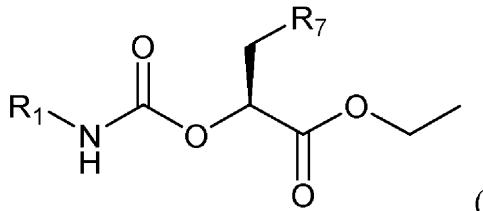
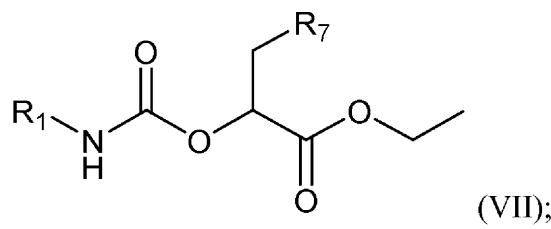
式(V)、(Va)、(Vb)、(VI)、(VIa)、および(VIb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 5 9】

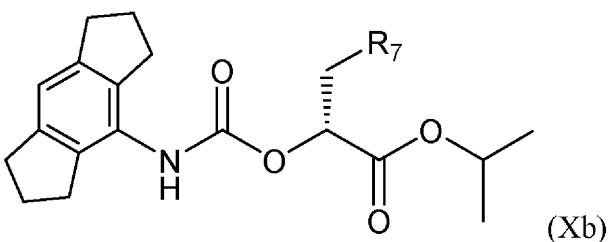
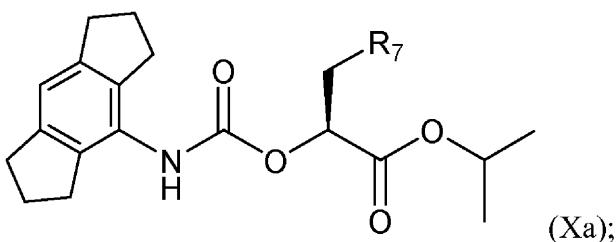
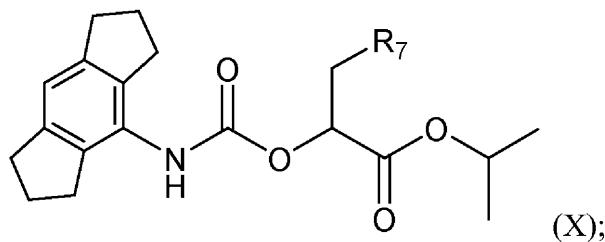
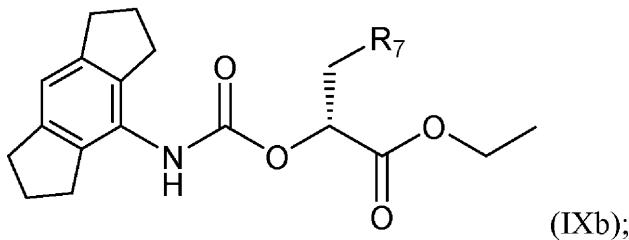
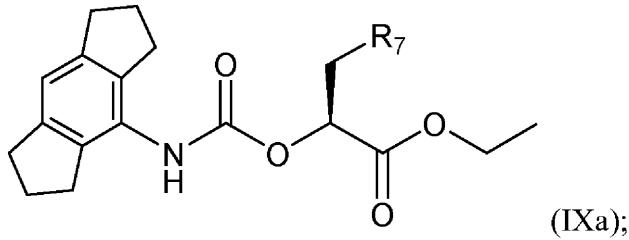
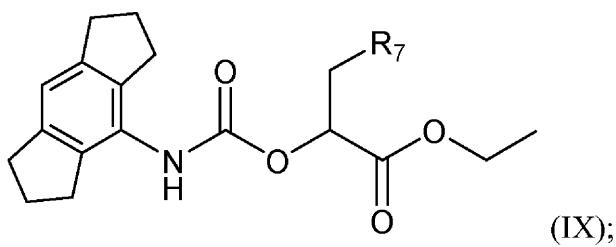
式(VII)、(VIIa)、(VIIb)、(VIII)、(VIIIa)、および(VIIIb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 6 0】

式(IX)、(IXa)、(IXb)、(X)、(Xa)、および(Xb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項 6 1】

化合物番号1～130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、
請求項1～60のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 6 2】

化合物番号1～130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1～61のい
ずれか一項記載の化合物。

【請求項 6 3】

化合物番号1～130より選択される、請求項1～62のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 6 4】

請求項1～63のいずれか一項記載の化合物の同位体誘導体である化合物。

【請求項 6 5】

重水素標識化合物である、請求項64記載の化合物。

【請求項 6 6】

化合物番号1～130のうちいずれか1つの重水素標識化合物、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である、請求項65記載の化合物。

【請求項 6 7】

化合物番号1～130のうちいずれか1つの重水素標識化合物である、請求項66記載の化合物。

【請求項 6 8】

本明細書に記載され、任意でスキーム1～5に記載の1つまたは複数の工程を含む、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。

【請求項 6 9】

請求項1記載の化合物を調製するための方法によって得られる中間体による化合物であって、任意で該中間体が、実施例1～126に記載の中間体より選択される、化合物。

【請求項 7 0】

請求項1～69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。

【請求項 7 1】

化合物が化合物番号1～130より選択される、請求項70記載の薬学的組成物。

【請求項 7 2】

有効量の請求項1～69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を含む、インフラマソーム活性を阻害するための薬学的組成物。

【請求項 7 3】

それを必要とする対象における疾患または障害を処置または予防するための、治療有効量の請求項1～69のいずれか一項記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩を含む薬学的組成物、または請求項70もしくは71記載の薬学的組成物。

【請求項 7 4】

疾患または障害が、インフラマソーム活性の関与を伴う、請求項73記載の薬学的組成物。

【請求項 7 5】

疾患または障害が、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、請求項73または74記載の薬学的組成物。

【請求項 7 6】

自己炎症性障害または自己免疫障害が、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)、家族性地中海熱および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、ならびに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、請求項75記載の薬学的組成物。

【請求項 7 7】

神経変性疾患が、パーキンソン病またはアルツハイマー病である、請求項75記載の薬学的組成物。

【請求項 7 8】

がんが、転移性がん、胃腸がん、皮膚がん、非小細胞肺がん、または結腸直腸腺がんである、請求項75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】 0 0 2 1

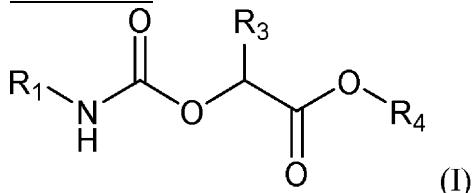
【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 2 1 】

[本発明1001]

式(I)の化合物、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩：



式中、

R_1 は、 C_3 ～ C_7 単環式シクロアルキル、多環式シクロアルキル、 C_5 ～ C_{10} アリール、8～12員ヘテロシクロアルキル、または5～6員ヘテロアリールであり、ここで該 C_3 ～ C_7 単環式シクロアルキル、多環式シクロアルキル、8～12員ヘテロシクロアルキル、または5～6員ヘテロアリールは1個または複数の R_6 で置換されていてもよく；

R_3 は、H、または1個もしくは複数の R_7 で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

R_4 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 3-(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、または $-(CH_2)_0 \sim 3-C_5 \sim C_6$ アリールであり；

R_6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OH、-CN、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CH₂F、-CHF₂、または-CF₃であり：

R_7 は、 $-OR_8$ 、 $C_5 \sim C_{10}$ アリール、または 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、ここで該 $C_5 \sim C_{10}$ アリールまたは 5 ~ 10 員ヘテロアリールは 1 個または複数の R_{7S} で置換されていてもよく、ここで各 R_{7S} は独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、5 ~ 10 員ヘテロアリール、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 3}-NH_2$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 3}-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_{0 \sim 3}-N(C_1 \sim C_6$ アルキル)₂、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、または $-CF_3$ であり；

R_8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは5~7員ヘテロシクロアルキルであり、ここで該 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは5~7員ヘテロシクロアルキルは1個または複数の $R_{7,8}$ で置換されていてもよい

1

〔本發明10021〕

R₁ が C₃ ~ C₇ 単環式シクロアルキル、多環式シクロアルキル、または C₅ ~ C₁₀ アリールであり、ここで該 C₃ ~ C₇ 単環式シクロアルキル、多環式シクロアルキル、または C₅ ~ C₆ アリールが 1 個または複数の R₂ で置換されていてもよい、本発明 1001 の化合物。

〔本発明1003〕

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ 単環式シクロアルキルである、本発明1001または1002の化合物。

〔本発明1004〕

R₁がシクロペンチル、シクロヘキシル、またはシクロヘプチルであり、ここで該シクロペンチル、シクロヘキシル、またはシクロヘプチルが1個または複数のR₆で置換してもよい、本発明1001～1003のいずれかの化合物。

〔本発明1005〕

R₁が、1個または複数のR₆で置換されたC₈～C₁₆多環式シクロアルキルである、本発明1001または1002の化合物。

〔本発明1006〕

R_1 がアダマンチル、ノルボルニル、またはビシクロ[2.2.2]オクタニルであり、ここで該アダマンチル、ノルボルニル、またはビシクロ[2.2.2]オクタニルが1個または複数の R_6 で置換されていてもよい、本発明1001～1002および1005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_6 で置換されていてもよい $C_{12} \sim C_{16}$ 三環式飽和シクロアルキルである、本発明1001～1002および1005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_6 で置換されていてもよいヘキサヒドロインダセニルである、本発明1001～1002、1005、および1007のいずれかの化合物。

[本発明1009]

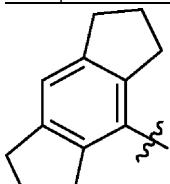
R_1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、オキソ、-OH、および $-CF_3$ より独立して選択される1、2、3、または4個の置換基で置換されていてもよいヘキサヒドロインダセニルである、本発明1001～1002、1005、および1007～1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

R_1 がヘキサヒドロインダセニルである、本発明1001～1002、1005、および1007～1009のいずれかの化合物。

[本発明1011]

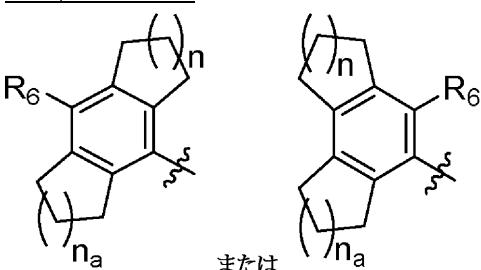
R_1 が以下：



である、本発明1001～1002、1005、および1007～1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

R_1 が以下：



であり、式中、nおよびnaがそれぞれ独立して0、1、2、または3である、本発明1001～1002、1005、および1007～1009のいずれかの化合物。

[本発明1013]

R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよい $C_5 \sim C_{10}$ アリールである、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1014]

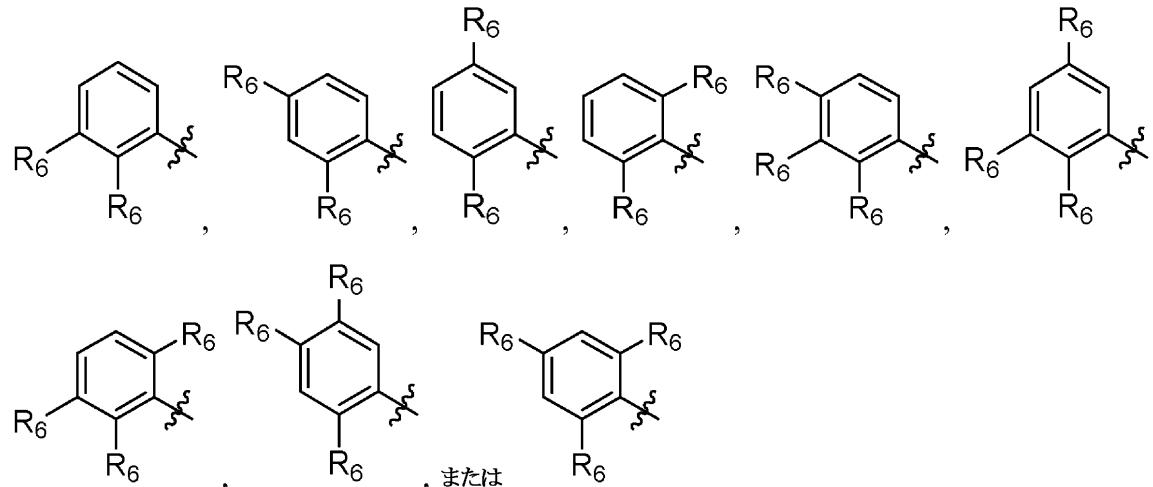
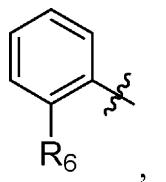
R_1 が、1個または複数の R_6 で置換されていてもよいフェニルである、本発明1001～1002および1013のいずれかの化合物。

[本発明1015]

フェニルが、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ハロ、-CN、および $-CF_3$ より独立して選択される1、2、または3個の置換基で置換されていてもよく、任意で、該1、2、または3個の置換基がClおよびFより独立して選択される、本発明1001～1002および1013～1014のいずれかの化合物。

[本発明1016]

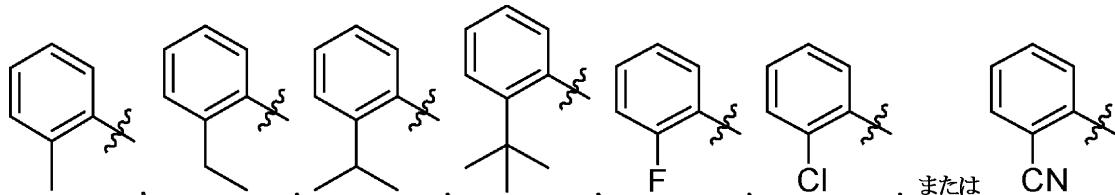
R_1 が以下：



である、本発明1001～1002および1013～1014のいずれかの化合物。

[本発明1017]

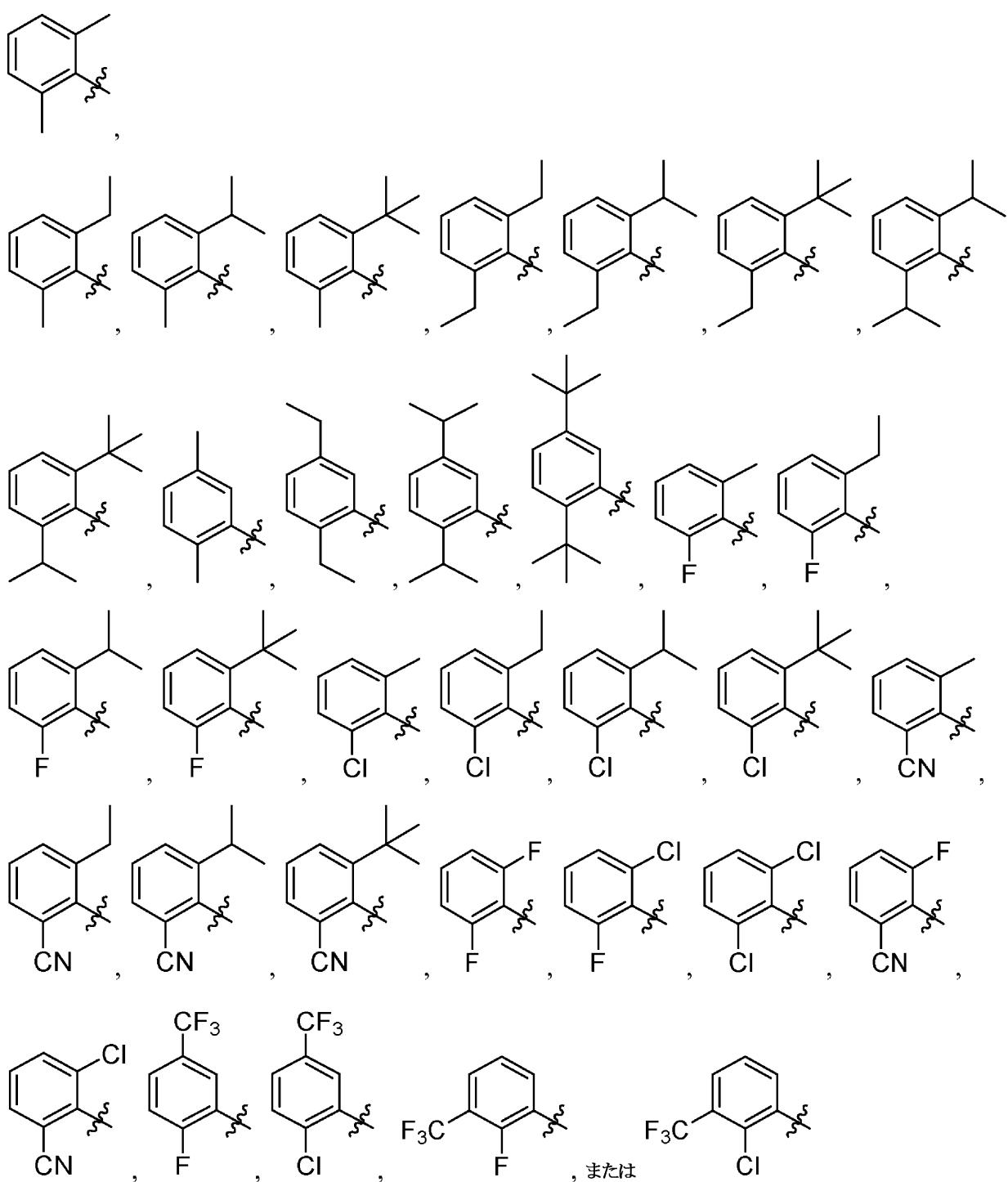
R₁が以下：



である、本発明1001～1002、1013～1014、および1016のいずれかの化合物。

[本発明1018]

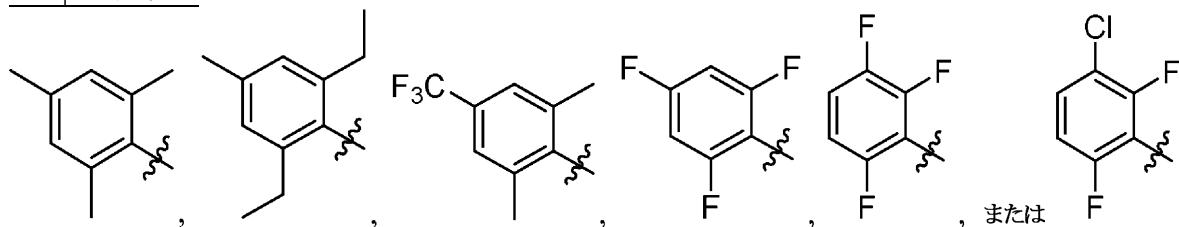
R₁が以下：



である、本発明1001～1002、1013～1014、および1016のいずれかの化合物。

[本発明1019]

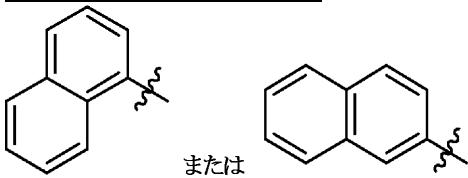
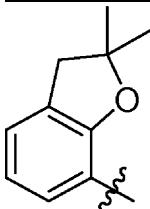
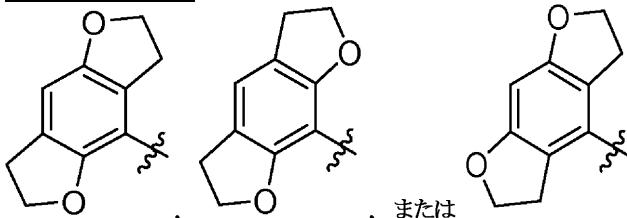
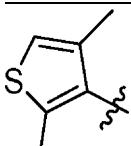
R_1 が以下：



である、本発明1001～1002、1013～1014、および1016のいずれかの化合物。

[本発明1020]

R₁が、1個または複数のR₆で置換されていてもよいナフタレンイルである、本発明1001～1002および1013のいずれかの化合物。

[本発明1021]R₁が非置換ナフタレンイルであり；任意で、R₁が以下：である、本発明1001～1002、1013、および1020のいずれかの化合物。[本発明1022]R₁が、1個または複数のR₆で置換されていてもよい8～12員ヘテロシクロアルキルである、本発明1001の化合物。[本発明1023]R₁がベンゾフラニルまたはジヒドロベンゾフラニルであり、ここで該ベンゾフラニルまたはジヒドロベンゾフラニルが1個または複数のR₆で置換されていてもよく；任意で、R₁が以下：である、本発明1001または1022の化合物。[本発明1024]R₁が以下：である、本発明1001または1022の化合物。[本発明1025]R₁が、1個または複数のR₆で置換されていてもよい5～6員ヘテロアリールである、本発明1001の化合物。[本発明1026]R₁が、1個または複数のR₆で置換されていてもよいチオフェニルであり；任意で、R₁が以下：である、本発明1001または1025の化合物。[本発明1027]R₃がHである、本発明1001～1026のいずれかの化合物。[本発明1028]R₃が、1個または複数のR₇で置換されていてもよいC₁～C₄アルキルである、本発明1001～1026のいずれかの化合物。[本発明1029]R₃がメチルまたはエチルである、本発明1001～1026および1028のいずれかの化合物。

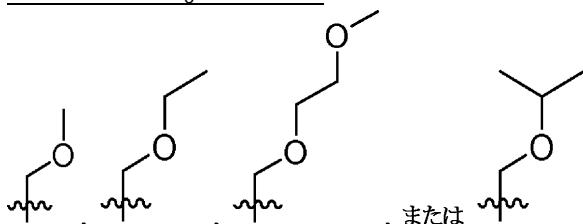
[本発明 1030]

R_3 が、1個または複数の R_7 で置換された $C_1 \sim C_4$ アルキルである、本発明1001～1026および1028のいずれかの化合物。

[本発明1031]

R_3 が、1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルコキシで置換されたメチルであり、ここで該 $C_1 \sim C_6$ アルコキシが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルコキシで置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

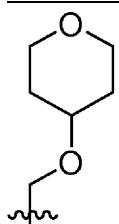


である、本発明1001～1026、1028、および1030のいずれかの化合物。

[本発明1032]

R_3 が、1個または複数の-O-(5~7員ヘテロシクロアルキル)で置換されたメチルであり。

任意で、 R_3 が以下：

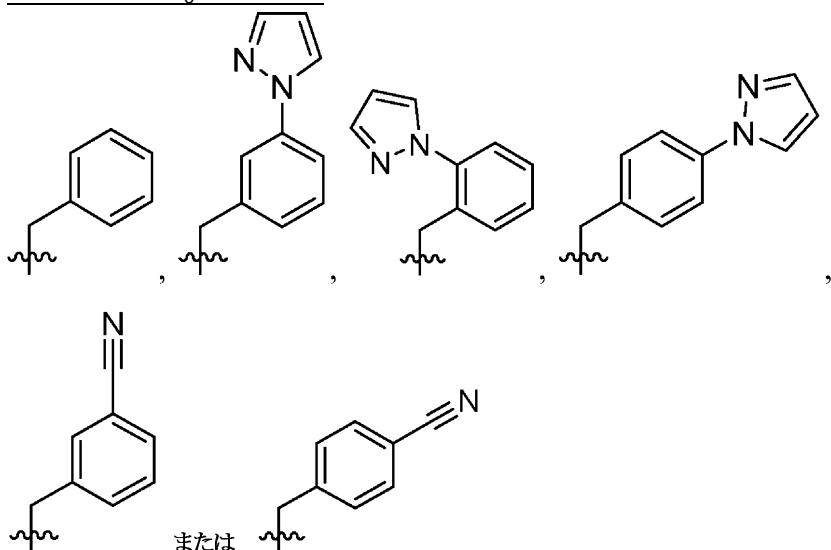


である、本発明1001～1026、1028、および1030のいずれかの化合物。

[本発明 1033]

いくつかの態様において、R₃が、1個または複数のC₅～C₁₀アリールを有するメチルであり、ここで該C₅～C₁₀アリールが1個または複数の5～10員ヘテロアリールまたは-CNで置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：



である、本発明1001～1026、1028、および1030のいずれかの化合物。

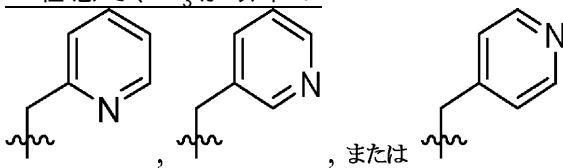
[本発明1034]

R₃が、1個または複数の5～10員ヘテロアリールで置換されたメチルであり、ここで該5～10員ヘテロアリールが1個または複数のC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、ハロ、-CN、-(CH₂)₀～₃-N(C₁～C₆アルキル)₂、または-CF₃で置換されていてもよい、本発明1001～1026、1028、および1030のいずれかの化合物。

[本発明1035]

R_3 が、1個または複数のピリジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6)$ アルキル₂、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

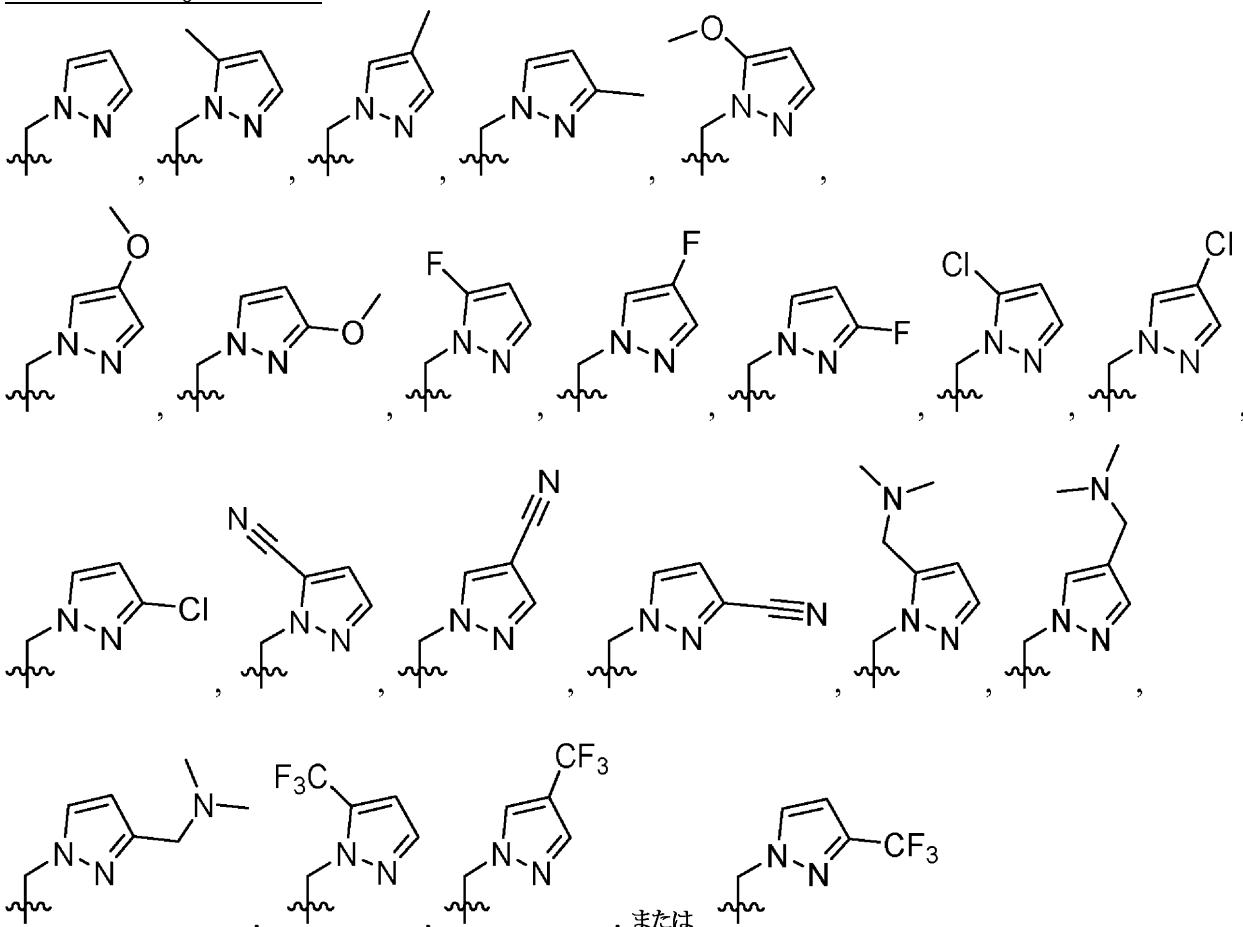


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明1036]

R_3 が、1個または複数のピラゾリルで置換されたメチルであり、ここで該ピラゾリルが1個または複数のメチル、メトキシ、F、Cl、-CN、-CH₂-N(CH₃)₂、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

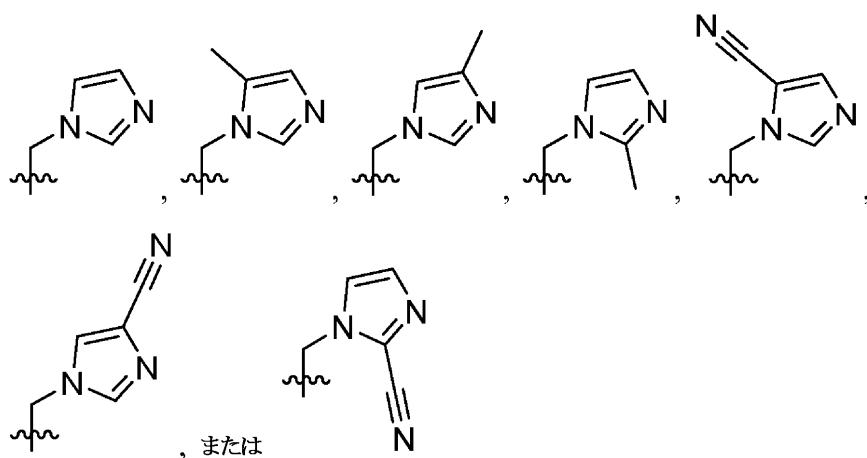


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明1037]

R_3 が、1個または複数のイミダゾリルで置換されたメチルであり、ここで該イミダゾリルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6)$ アルキル₂、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

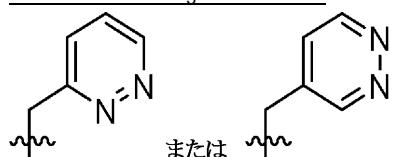


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明 1038]

R_3 が、1個または複数のピリダジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリダジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6$ アルキル)、または- CF_3 で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

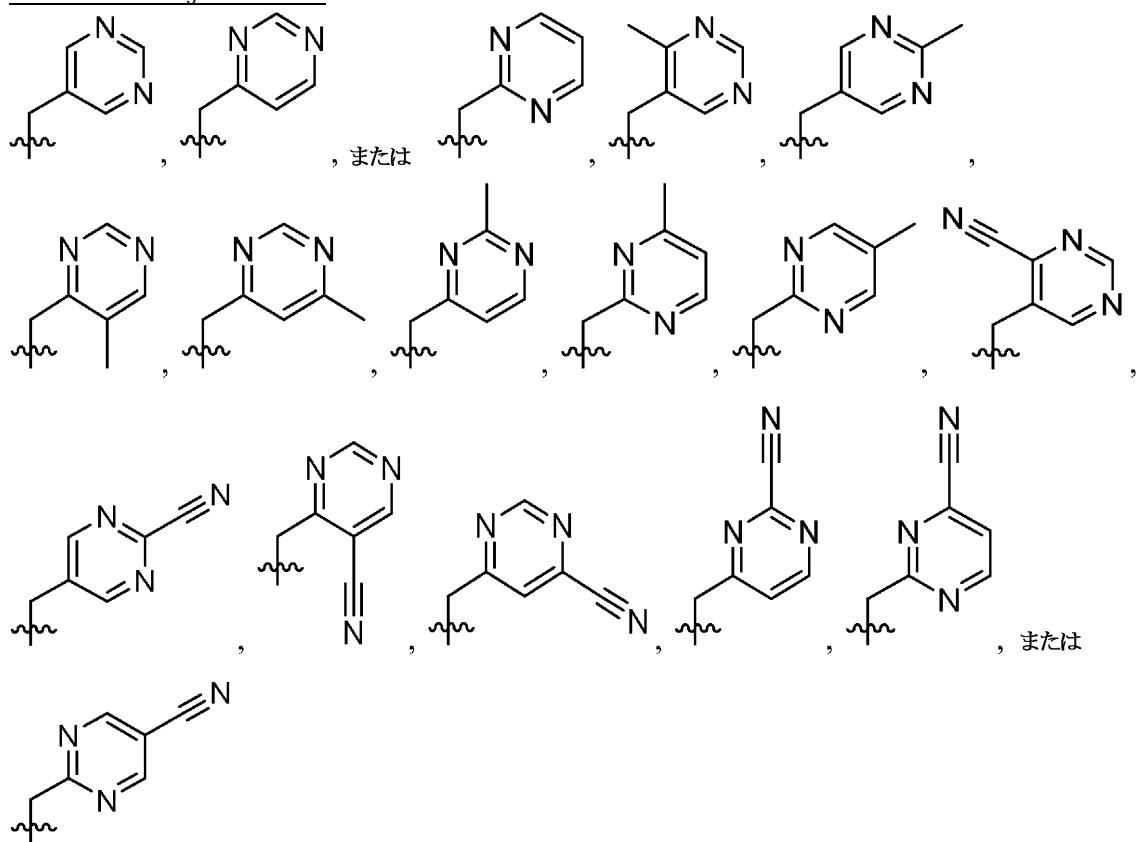


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本 発 明 1039]

R_3 が、1個または複数のピリミジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピリミジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3$ -N($C_1 \sim C_6$ アルキル)、または- CF_3 で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

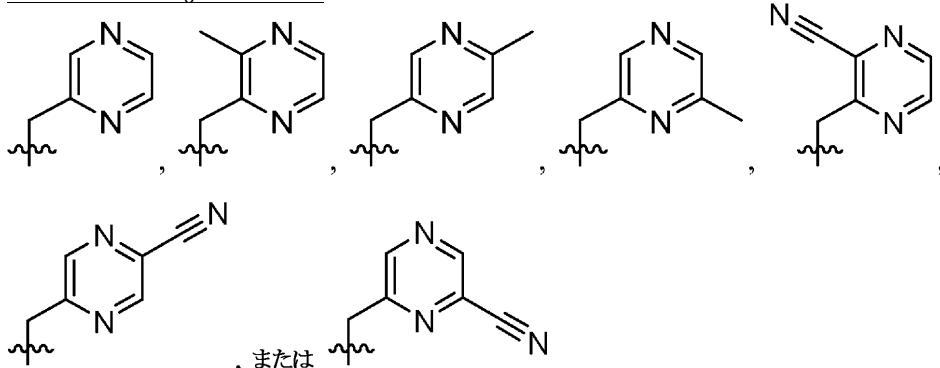


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明1040]

R_3 が、1個または複数のピラジニルで置換されたメチルであり、ここで該ピラジニルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6)$ アルキル)、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

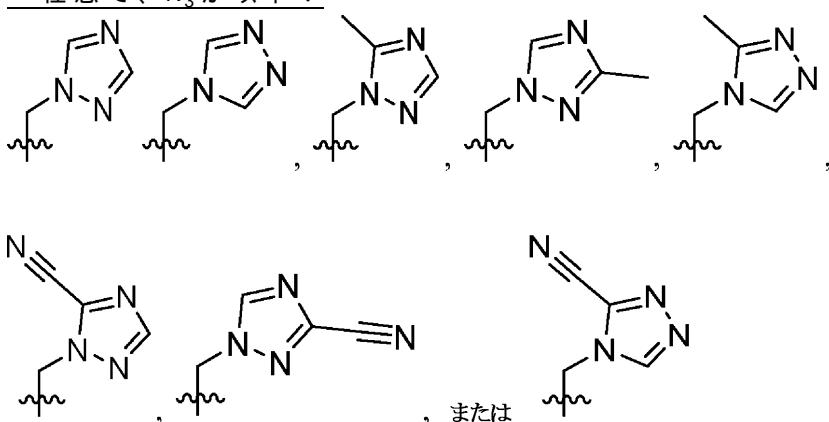


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明1041]

R_3 が、1個または複数のトリアゾリルで置換されたメチルであり、ここで該トリアゾリルが1個または複数の $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ、-CN、 $-(CH_2)_0 \sim 3-N(C_1 \sim C_6)$ アルキル)、または-CF₃で置換されていてもよく；

任意で、 R_3 が以下：

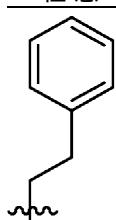


である、本発明1001～1026、1028、1030、および1034のいずれかの化合物。

[本発明1042]

R_3 が、1個または複数の $C_5 \sim C_{10}$ アリールで置換されたエチルであり；

任意で、 R_3 が以下：



である、本発明1001～1026、1028、および1030のいずれかの化合物。

[本発明1043]

R_4 がHである、本発明1001～1042のいずれかの化合物。

[本発明1044]

R_4 が $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(CH_2)_0 \sim 3-(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)、または $-(CH_2)_0 \sim 3-C_5 \sim C_6$ アリールである、本発明1001～1042のいずれかの化合物。

[本発明1045]

R₄がC₁～C₆アルキルであり；

任意で、R₄がメチル、エチル、プロピル、またはブチルである、本発明1001～1042および1044のいずれかの化合物。

[本発明1046]

R₄が-(CH₂)_{0～3}-(C₃～C₆シクロアルキル)であり；

任意で、R₄が以下：



である、本発明1001～1042および1044のいずれかの化合物。

[本発明1047]

いくつかの態様において、R₄が-(CH₂)_{0～3}-C₅～C₆アリールであり；

任意で、R₄が以下：



である、本発明1001～1042および1044のいずれかの化合物。

[本発明1048]

少なくとも1個のR₆が、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₁～C₆アルコキシ、またはC₃～C₈シクロアルキルである、本発明1001～1047のいずれかの化合物。

[本発明1049]

少なくとも1個のR₆が、ハロ、オキソ、-OH、-CN、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CH₂F、-CHF₂、または-CF₃である、本発明1001～1047のいずれかの化合物。

[本発明1050]

少なくとも1個のR₇が-OR₈であり；

任意で、少なくとも1個のR₇が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシであり；あるいは、少なくとも1個のR₇が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよい-O-(5～7員ヘテロシクロアルキル)である、本発明1001～1049のいずれかの化合物。

[本発明1051]

少なくとも1個のR₇が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよいC₅～C₁₀アリールである、本発明1001～1049のいずれかの化合物。

[本発明1052]

少なくとも1個のR₇が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよい5～10員ヘテロアリールである、本発明1001～1049のいずれかの化合物。

[本発明1053]

少なくとも1個のR_{7S}が、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、または5～10員ヘテロアリールである、本発明1001～1052のいずれかの化合物。

[本発明1054]

少なくとも1個のR_{7S}が、ハロ、-OH、-CN、-(CH₂)_{0～3}-NH₂、-(CH₂)_{0～3}-NH(C₁～C₆アルキル)、-(CH₂)_{0～3}-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CH₂F、-CHF₂、または-CF₃である、本発明1001～1052のいずれかの化合物。

[本発明1055]

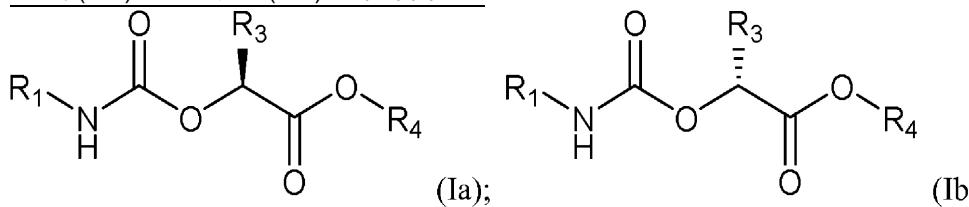
R₈が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルである、本発明1001～1054のいずれかの化合物。

[本発明1056]

R₈が、1個または複数のR_{7S}で置換されていてもよい5～7員ヘテロシクロアルキルである、本発明1001～1054のいずれかの化合物。

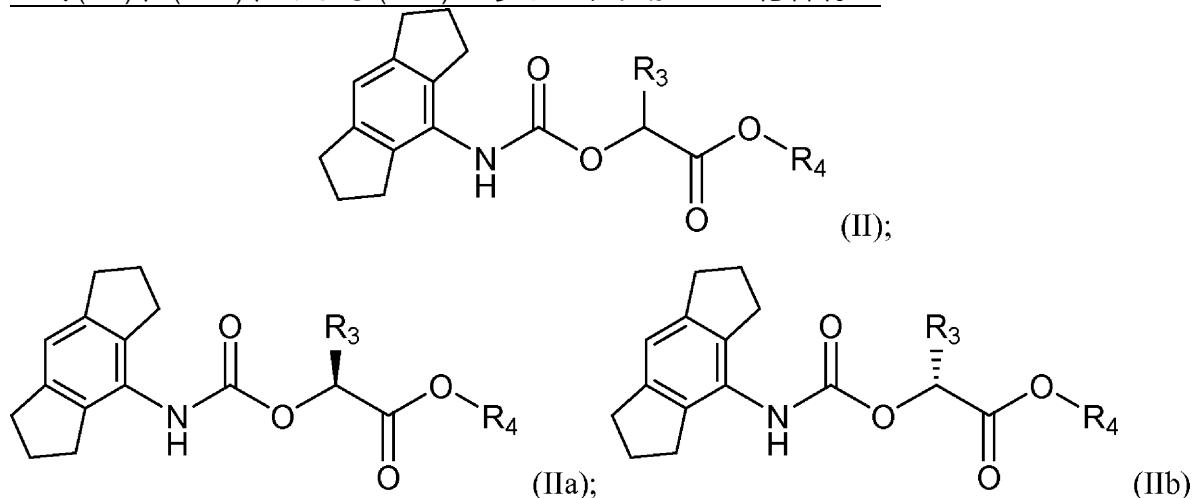
[本発明1057]

式(Ia)もしくは(Ib)の化合物：

、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056のいずれかの化合物。

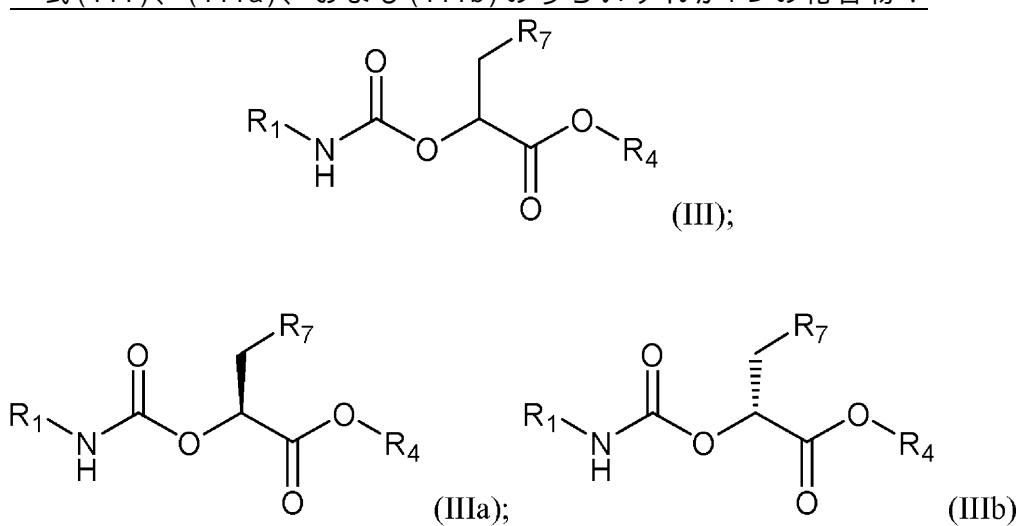
[本発明1058]

式(II)、(IIa)、および(IIb)のうちいずれか1つの化合物：

、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056のいずれかの化合物。

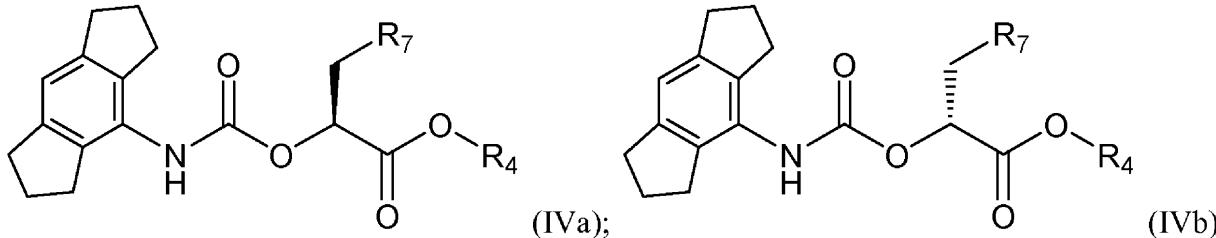
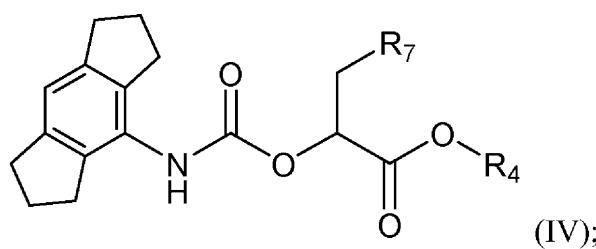
[本発明1059]

式(III)、(IIIa)、および(IIIb)のうちいずれか1つの化合物：

、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056のいずれかの化合物。

[本発明1060]

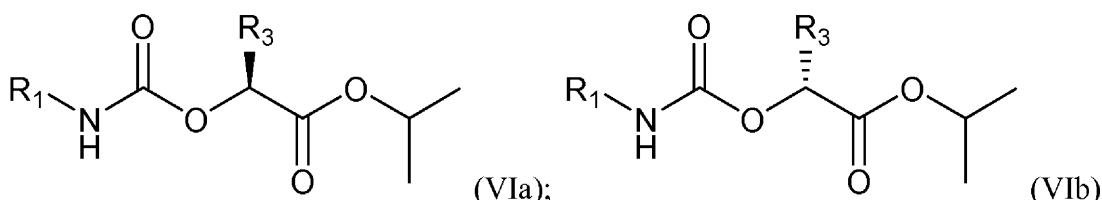
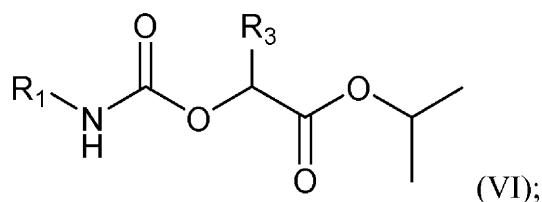
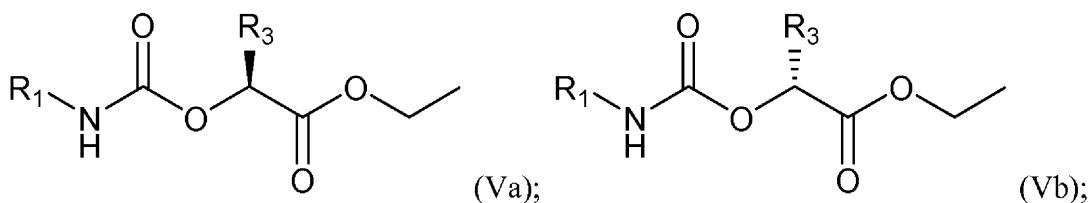
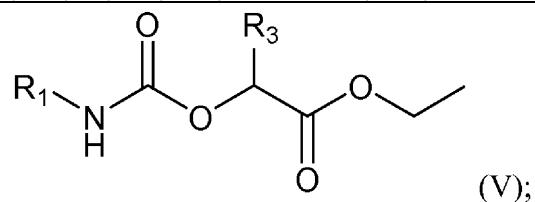
式(IV)、(IVa)、および(IVb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056および1058～1059のいずれかの化合物。

[本発明1061]

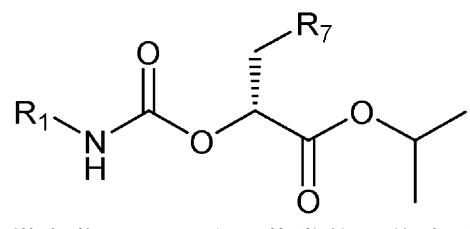
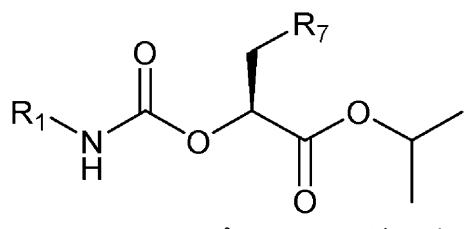
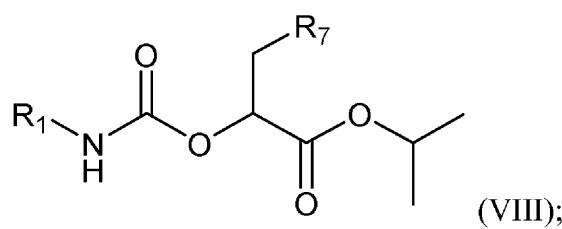
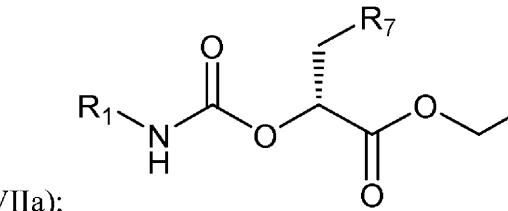
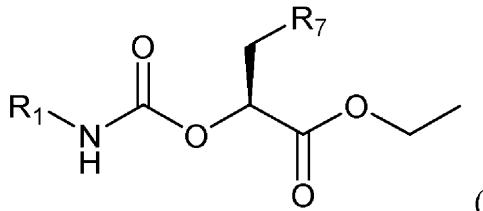
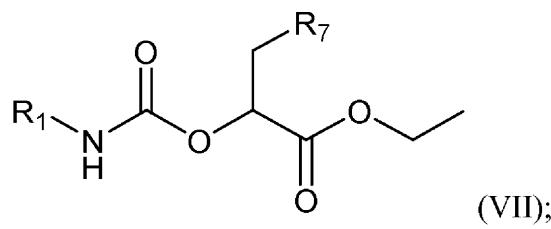
式(V)、(Va)、(Vb)、(VI)、(VIa)、および(VIb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056のいずれかの化合物。

[本発明1062]

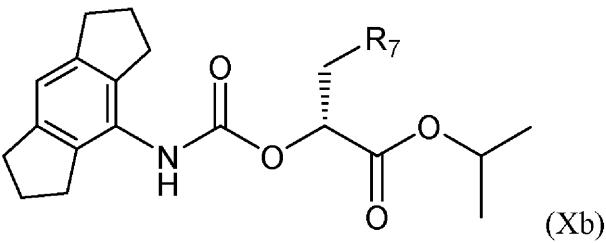
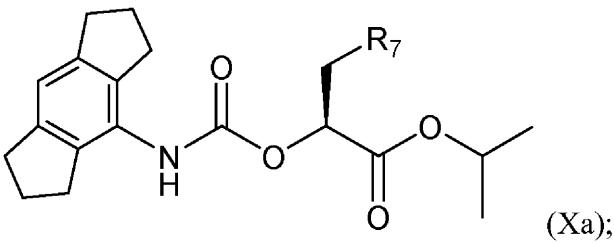
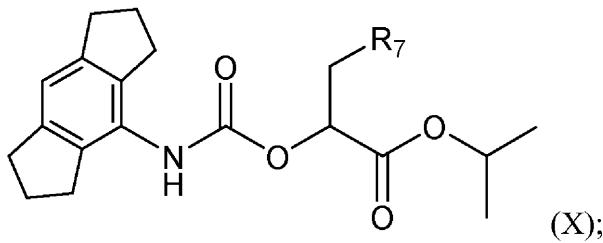
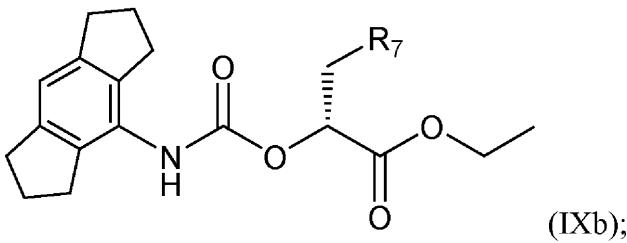
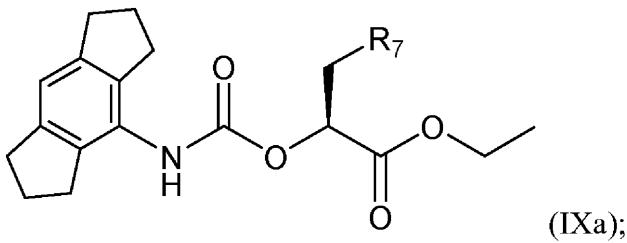
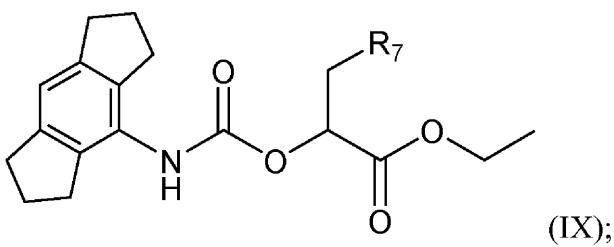
式(VII)、(VIIa)、(VIIb)、(VIIII)、(VIIIIa)、および(VIIIIb)のうちいずれか1つの化合
物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056、1059、および1061のいずれかの化合物。

[本発明1063]

式(IX)、(IXa)、(IXb)、(X)、(Xa)、および(Xb)のうちいずれか1つの化合物：



、またはそのプロドラッグ、水和物、溶媒和物、もしくは薬学的に許容される塩である、
本発明1001～1056および1058～1062のいずれかの化合物。

[本発明1064]

化合物番号1～130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1001～1063のいずれかの化合物。

[本発明1065]

化合物番号1～130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1001～1064
のいずれかの化合物。

[本発明1066]

化合物番号1～130より選択される、本発明1001～1065のいずれかの化合物。

[本発明1067]

本発明1001～1066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1068]

重水素標識化合物である、本発明1067の化合物。

[本発明1069]

化合物番号1～130のうちいずれか1つの重水素標識化合物、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である、本発明1068の化合物。

[本発明1070]

化合物番号1～130のうちいずれか1つの重水素標識化合物である、本発明1069の化合物。

[本発明1071]

本明細書に記載され、任意でスキーム1～5に記載の1つまたは複数の工程を含む、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。

[本発明1072]

本発明1001～1070のいずれかの化合物を調製するための方法によって得られる中間体による化合物であって、任意で該中間体が、実施例1～126に記載の中間体より選択される、化合物。

[本発明1073]

本発明1001～1072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1074]

化合物が化合物番号1～130より選択される、本発明1073の薬学的組成物。

[本発明1075]

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1001～1072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、活性がインピトロまたはインピボである、方法。

[本発明1076]

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1001～1072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1073もしくは1074の薬学的組成物を投与する段階を含む、方法。

[本発明1077]

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1076の方法。

[本発明1078]

疾患または障害が、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1076または1077の方法。

[本発明1079]

疾患または障害が、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)、家族性地中海熱および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、ならびにタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばブリオン病)において生じる神経炎症より選択される、本発明1076～1078のいずれかの方法。

[本発明1080]

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1076～1078のいずれかの方法。

[本発明1081]

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、皮膚がん、非小細胞肺がん、または結腸直腸腺がんである、本発明1076～1078のいずれかの方法。

[本発明1082]

任意で、インフラマソームがNLRP3インフラマソームであり、活性がインピトロまたはインピボである、

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1001～1072のいずれかの化合物、または本発明1069もしくは1070の薬学的組成物。

[本発明1083]

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1001～1072のいずれかの化合物、または本発明1069もしくは1070の薬学的組成物。

[本発明1084]

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1083の化合物または薬学的組成物。

[本発明1085]

疾患または障害が、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1083または1084の化合物または薬学的組成物。

[本発明1086]

疾患または障害が、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)、家族性地中海熱および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、ならびにタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばブリオン病)において生じる神経炎症より選択される、本発明1083～1085のいずれかの化合物または薬学的組成物。

[本発明1087]

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1083～1085のいずれかの化合物または薬学的組成物。

[本発明1088]

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、皮膚がん、非小細胞肺がん、または結腸直腸腺がんである、本発明1083～1085のいずれかの化合物または薬学的組成物。

[本発明1089]

任意で、インフラマソームがNLRP3インフラマソームであり、活性がインピトロまたはインピボである、

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1001～1072のいずれかの化合物またはその薬学的塩の使用。

[本発明1090]

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1001～1072のいずれかの化合物またはその薬学的塩の使用。

[本発明1091]

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1090の使用。

[本発明1092]

疾患または障害が、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1090または1091の使用。

[本発明1093]

疾患または障害が、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)、家族性地中海熱および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、ならびにタンパク質ミスフォールディング疾患(例えばブリオン病)において生じる神経炎症より選択される、本発明1090～1092のいずれかの使用。

[本発明1094]

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1090～1092のいずれかの使用。

[本発明1095]

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、皮膚がん、非小細胞肺がん、または結腸直腸腺がんである、本発明1090～1092のいずれかの使用。

本開示の他の特徴および利点は、以下の詳細な説明および特許請求の範囲から明らかであろう。