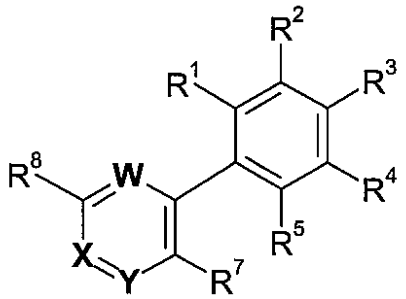
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成26年4月10日(2014.4.10)

【公表番号】特表2013-520425(P2013-520425A)
【公表日】平成25年6月6日(2013.6.6)
【年通号数】公開・登録公報2013-028
【出願番号】特願2012-553968(P2012-553968)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 237/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/08 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 455/02 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 453/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/501 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/50 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/06 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/10 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 237/14
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 17/00

Ａ６１Ｐ　37/08
Ａ６１Ｐ　29/00
Ａ６１Ｐ　 3/10
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　11/06
Ａ６１Ｐ　11/00
Ａ６１Ｐ　13/12
Ａ６１Ｐ　 9/10
Ａ６１Ｐ　25/00
Ａ６１Ｐ　 9/00
Ａ６１Ｐ　25/28
Ａ６１Ｐ　37/06
Ａ６１Ｐ　 1/02
Ａ６１Ｐ　17/02
Ａ６１Ｐ　27/02
Ａ６１Ｐ　15/10
Ａ６１Ｐ　35/00
Ｃ０７Ｄ 401/12
Ｃ０７Ｄ 403/12
Ｃ０７Ｄ 413/14
Ｃ０７Ｄ 401/14
Ｃ０７Ｄ 405/14
Ｃ０７Ｄ 471/08
Ｃ０７Ｄ 417/14
Ｃ０７Ｄ 455/02
Ｃ０７Ｄ 453/00
Ａ６１Ｋ　31/501
Ａ６１Ｋ　31/50
Ａ６１Ｋ　31/5377
Ｃ０７Ｄ 413/06
Ｃ０７Ｄ 413/12
Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
Ａ６１Ｐ　35/04
Ａ６１Ｐ　19/10

【手続補正書】
【提出日】平成26年2月17日(2014.2.17)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：

【化１】



(I)

［式中、ＷはＣ－Ｒ^{6}であり、ＸおよびＹはＮであり、Ｒ^{6}は－Ｈであり；

Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{4}、及びＲ^{5}は、－Ｈ、－ハロゲン、－シアノ、－ＮＯ$_{2}$、－ＯＲ^{9}、－ＳＲ^{9}、－Ｓ（Ｏ）$_{s}$Ｒ^{9}、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＯＲ^{9}、－Ｓ（Ｏ）$_{s}$ＮＲ^{9}Ｒ^{10}、－ＮＲ^{9}Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ^{10}、－ＮＨＣ（Ｏ）ＮＨＲ^{9}、－ＮＲ^{9}Ｃ（Ｏ）Ｒ^{10}、－（ＣＲ^{11}Ｒ^{12}）$_{t}$ＮＲ^{9}Ｒ^{10}、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{9}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{9}、－Ｃ（Ｏ）Ｏ（ＣＲ^{11}Ｒ^{12}）$_{t}$ＣＯＮＲ^{9}Ｒ^{10}、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^{9}Ｒ^{10}、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{10}$）アルキル、－（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{10}$）アルケニル、－（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{10}$）アルキニル、－フェニル、－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、－ピラゾリル、－イソオキサゾリル、－テトラゾリル、－オキサゾリル、－ジヒドロ－オキサゾリルからなる群より独立して選択され、ここで該アルキル、アルケニル、フェニル、シクロアルキル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、及びジヒドロ－オキサゾリル基は、Ｒ^{39}より独立して選択される置換基で１回以上置換されていてもよく、ここで

Ｒ^{9}とＲ^{10}は、－Ｈ、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、－フェニル、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、及び－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－フェニル（ここでＲ^{9}及びＲ^{10}のアルキル、アルキレン、シクロアルキル、フェニル基は、Ｒ^{39}より独立して選択される置換基で１回以上置換されていてもよい）からなる群より独立して選択されるか又はＲ^{9}とＲ^{10}は、それらが付く原子と一緒に、酸素、イオウ、及び窒素より独立して選択される０～２の追加ヘテロ原子を含有する５～７員環を形成して、該環は、Ｒ^{39}より独立して選択される置換基で１回以上置換されていてもよい、そして

Ｒ^{11}とＲ^{12}は、－Ｈ、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、－フェニル、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、及び－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－フェニル（ここでＲ^{11}及びＲ^{12}のアルキル、アルキレン、シクロアルキル、フェニル基は、Ｒ^{39}より独立して選択される置換基で１回以上置換されていてもよい）からなる群より独立して選択されるか又はＲ^{11}とＲ^{12}は、それらが付く炭素と一緒に、酸素、イオウ、及び窒素より独立して選択される０～２のヘテロ原子を含有する５～７員の複素環式環を形成して、該環は、Ｒ^{39}より独立して選択される置換基で１回以上置換されていてもよい；

Ｒ^{3}は、－Ｘ^{1}－Ｌ^{1}－Ｒ^{13}と－Ｌ^{1}－Ｘ^{1}－Ｒ^{13}からなる群より選択され、ここで、

Ｘ^{1}は、直結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＨ－、－ＮＨＳ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－、及び－ＮＨＣ（Ｏ）－からなる群より選択され、

Ｌ^{1}は、直結合と－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－からなる群より選択され、そして

Ｒ^{13}は、－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル、－（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルキル、－（Ｃ$_{5}$－Ｃ$_{10}$）シクロアルケニル、－フェニル、－ピリジル、－ピリダジニル、－ピペリジニル、及び－テトラヒドロピラニルからなる群より選択され、ここでＲ^{13}のアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピペリジニル、

テトラヒドロピラニル基は、R^{14}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{14}は、R^{39}基より独立して選択される）；

R^{7}は、基：－L^{2}－X^{2}－R^{15}であり、ここで、

L^{2}は、直結合と－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－からなる群より選択され、

X^{2}は、直結合と－Ｏ－からなる群より選択され、そして

R^{15}は、R^{16}で１回以上置換されていてもよい－（C_{1}－C_{6}）アルキルであり、ここでR^{16}はそれぞれ独立に、ハロゲン及び－（C_{1}－C_{3}）ハロアルキルからなる群から選択され；または

R^{15}は、R^{16}で１回以上置換されていてもよい－（C_{3}－C_{6}）シクロアルキルであり、ここでR^{16}はそれぞれ独立に、ハロゲン、－（C_{1}－C_{3}）アルキル、－（C_{1}－C_{3}）ハロアルキル、－Ｏ－（C_{1}－C_{3}）アルキル、及び－Ｏ－（C_{1}－C_{3}）ハロアルキルからなる群から選択され；

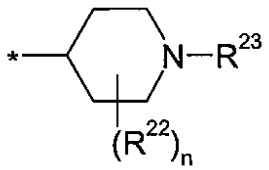
R^{8}は、－X^{3}－L^{3}－R^{17}であり、そしてここで、

X^{3}は、直結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^{18}）－、－ＮＨＣ（Ｏ）－、及び－Ｎ（R^{18}）Ｃ（Ｏ）－からなる群より選択され、ここでR^{18}は、－（C_{1}－C_{6}）アルキル、－（C_{3}－C_{6}）シクロアルキル、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－Ｏ－（C_{1}－C_{6}）アルキル、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－（C_{3}－C_{6}）シクロアルキルからなる群より選択され、

L^{3}は、直結合と－（C_{1}－C_{6}）アルキレンからなる群より選択され、ここで該アルキレン基は、R^{19}で１回以上置換されていてもよく、ここでそれぞれのR^{19}は、－ＯＨ、－NH_{2}、－Ｏ－（C_{1}－C_{6}）アルキル、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－NH_{2}、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－ＮＨ（（C_{1}－C_{6}）アルキル）、及び－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－Ｎ（（C_{1}－C_{6}）アルキル）$_{2}$からなる群より独立して選択され、ここでR^{19}のアルキル及びアルキレン基は、－ハロゲンで１回以上置換されていてもよく、

R^{17}は、

【化２】



で表され、式中：

それぞれのR^{22}は、R^{17}の環炭素原子のいずれに付いてもよく、そしてここで

それぞれのR^{22}は、－シアノ、－ハロゲン、－X^{4}－R^{24}、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－R^{24}、－X^{4}－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－R^{24}、－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－X^{5}－R^{24}、－X^{4}－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－X^{5}－R^{24}、及び－X^{4}－（C_{1}－C_{6}）アルキレン－ＮR^{25}R^{26}からなる群より独立して選択され、ここで

X^{4}とX^{5}は、直結合、－Ｏ－、－Ｎ（R^{27}）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^{27}）－、－Ｎ（R^{27}）Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（R^{27}）－、－Ｎ（R^{27}）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、及び－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^{27}）－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－からなる群より独立して選択され（ここでR^{27}は、－Ｈと－（C_{1}－C_{6}）アルキルからなる群より選択される）、

R^{24}は、－Ｈ、－（C_{1}－C_{6}）アルキル、－フェニル、及び－（C_{3}－C_{10}）シクロアルキルからなる群より選択され、ここでR^{24}のアルキル、フェニル、及びシクロアルキル基は、R^{28}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{28}は、R^{39}より独立して選択される）、

R^{25}とR^{26}は、－Ｈ、－（C_{1}－C_{6}）アルキル、及び－（C_{1}－C_{6}）ハロアルキルからなる群より独立して選択され、

ここでR^{22}のアルキレン基は、R^{29}で１回以上置換されていてもよく、ここでそれぞれのR^{29}は、－ハロゲン、－ＯＨ、－NH_{2}、－Ｏ－（C_{1}－C_{6}）アルキル、－（

C_1－C_6）アルキレン－NH_2、－（C_1－C_6）アルキレン－NH（（C_1－C_6）アルキル）、及び－（C_1－C_6）アルキレン－N（（C_1－C_6）アルキル）$_2$からなる群より独立して選択され、ここでR^{29}のアルキル及びアルキレン基は、ハロゲンで１回以上置換されていてもよい；

R^{23}は、－H、－R^{30}、－（C_1－C_6）アルキレン－R^{31}、－（C_1－C_6）アルキレン－$NR^{32}R^{33}$、－X^6－（C_2－C_6）アルキレン－$NR^{32}R^{33}$、及び－（C_1－C_6）アルキレン－X^7－R^{31}からなる群より選択され、ここで

X^6は、－C（O）－、－C（O）O－、－S（O）$_2$－、－C（O）N（R^{34}）－、及び－S（O）$_2$N（R^{34}）－からなる群より選択され（ここでR^{34}は、－H、－（C_1－C_6）アルキル、及び－（C_1－C_6）ハロアルキルからなる群より選択される）、

X^7は、－O－、－N（R^{35}）－、－C（O）－、－C（O）O－、－O－C（O）－、－C（O）N（R^{35}）－、－N（R^{35}）C（O）－、－S（O）$_2$N（R^{35}）－、及び－N（R^{35}）S（O）$_2$－からなる群より選択され（ここでR^{35}は、－H、－（C_1－C_6）アルキル、及び－（C_1－C_6）ハロアルキルからなる群より選択される）、

R^{30}は、－H、－（C_1－C_6）アルキル、－フェニル、及び－（C_3－C_{10}）シクロアルキルからなる群より選択され、ここでR^{30}のアルキル、フェニル、及びシクロアルキル基は、R^{36}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{36}は、R^{39}より独立して選択される）、

R^{31}は、－H、－（C_1－C_6）アルキル、－フェニル、－（C_3－C_{10}）シクロアルキル、－テトラゾリル、－１，３－ジオキサニル、１，３，４－オキサジアゾリル、及びピペリジニルからなる群より選択され、ここでR^{31}のアルキル、フェニル、シクロアルキル、テトラゾリル、１，３－ジオキサニル、１，３，４－オキサジアゾリル、及びピペリジニル基は、R^{37}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{37}は、R^{39}より独立して選択される）、

R^{32}とR^{33}は、－H、－（C_1－C_6）アルキル、及び－（C_1－C_6）ハロアルキルからなる群より独立して選択され、

ここでR^{23}のアルキレン基は、R^{38}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{38}は、ハロゲン、－OH、－NH_2、－O－（C_1－C_6）アルキル、－（C_1－C_6）アルキレン－NH_2、－（C_1－C_6）アルキレン－NH（（C_1－C_6）アルキル）、及び－（C_1－C_6）アルキレン－N（（C_1－C_6）アルキル）$_2$からなる群より独立して選択され、ここでR^{38}のアルキル及びアルキレン基は、ハロゲンで１回以上置換されていてもよい）；

それぞれのR^{39}は、－ハロゲン、－（C_1－C_6）ハロアルキル、－C（O）OH、－（C_1－C_6）アルキル、－O－（C_1－C_6）アルキル、－O－（C_1－C_6）ハロアルキル、－C（O）－（C_1－C_6）アルキル、－（C_3－C_{10}）シクロアルキル、－O－（C_3－C_{10}）シクロアルキル、－OH、－NH_2、－（C_1－C_6）アルキレン－OH、－（C_1－C_6）アルキレン－NH_2、－NH（（C_1－C_6）アルキル）、－N（（C_1－C_6）アルキル）$_2$、－（C_1－C_6）アルキレン－NH（（C_1－C_6）アルキル）、－（C_1－C_6）アルキレン－N（（C_1－C_6）アルキル）$_2$、－フェニル、－O－フェニル、－（C_1－C_6）アルキレン－フェニル、－O－（C_1－C_6）アルキレン－フェニル、－C（O）NH_2、－C（O）NH－（C_1－C_6）アルキル、－C（O）N（（C_1－C_6）アルキル）$_2$、－S（O）$_2$－（C_1－C_6）アルキル、－C（O）O－（C_1－C_6）アルキル、及び－C（O）O－（C_1－C_6）アルキレン－フェニルからなる群より独立して選択され、

ｎは、０～５の整数であり、

ｓは、１～２の整数であり、そして

ｔは、１～１０の整数である］の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項２】

R^1、R^2、R^4、およびR^5が－Ｈである、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項３】

R^3が基：－X^1－L^1－R^{13}であり、ここで

X^1は、直結合、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＨ－、－ＮＨＳ（Ｏ）$_2$－、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－、及び－ＮＨＣ（Ｏ）－からなる群より選択され、

L^1は、直結合と－（C_1－C_6）アルキレン－からなる群より選択され、そして

R^{13}は、－（C_1－C_6）アルキル、－（C_3－C_6）シクロアルキル、－（C_5－C_6）シクロアルケニル、－フェニル、－ピリジル、－ピリダジニル、－ピペリジニル、及び－テトラヒドロピラニルからなる群より選択され、ここでR^{13}のアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル基は、R^{14}で１回以上置換されていてもよい（ここでそれぞれのR^{14}は、R^{39}基より独立して選択される）、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項４】

X^1が－Ｏ－である、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項５】

L^1が直結合である、請求項３または４に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項６】

R^{13}が、R^{14}で１回以上置換されていてもよい－（C_3－C_6）シクロアルキルであり、ここでそれぞれのR^{14}は、R^{39}基より独立して選択される、請求項３～５のいずれか１項に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項７】

X^2が直結合である、請求項１～６のいずれか１項に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項８】

R^{15}が、R^{16}で１回以上置換されていてもよい－（C_1－C_6）アルキルであり、ここでそれぞれのR^{16}は、ハロゲンと－（C_1－C_3）ハロアルキルからなる群より独立して選択される、請求項７に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項９】

R^{15}が－$CH_2CH_2CH_2CH_3$である、請求項８に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項１０】

X^3が－Ｏ－である、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項１１】

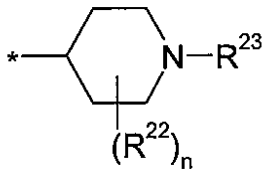
L^3が直結合である、請求項１０に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項１２】

それぞれのR^{22}が、－ハロゲン、－X^4－R^{24}、－（C_1－C_6）アルキレン－R^{24}、－X^4－（C_1－C_6）アルキレン－R^{24}、－（C_1－C_6）アルキレン－X^5－R^{24}、－X^4－（C_1－C_6）アルキレン－X^5－R^{24}、及び－X^4－（C_1－C_6）アルキレン－$NR^{25}R^{26}$からなる群より独立して選択され、ここで

X^4とX^5は、直結合、－Ｏ－、－Ｎ（R^{27}）－、－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^{27}）－、－Ｎ（R^{27}）Ｃ（Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（R^{27}）－、－Ｎ（R^{27}）Ｓ（Ｏ）$_2$－、及び－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^{27}）－Ｓ（Ｏ）$_2$－からなる群より独立して選択され（ここでR^{27}は、－Ｈと－（Ｃ

$_1$－C$_6$）アルキルからなる群より選択される）、
R^{24}は、－H、－（C$_1$－C$_6$）アルキル、－フェニル、及び－（C$_3$－C$_6$）シクロアルキルからなる群より選択され、ここでR^{24}のアルキル、フェニル、及びシクロアルキル基は、R^{28}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{28}は、R^{39}より独立して選択される）、
R^{25}とR^{26}は、－H、－（C$_1$－C$_6$）アルキル、及び－（C$_1$－C$_6$）ハロアルキルからなる群より独立して選択され、
ここでR^{22}のアルキレン基は、R^{29}で１回以上置換されていてもよく、ここでそれぞれのR^{29}は、－ハロゲン、－OH、－NH$_2$、－O－（C$_1$－C$_6$）アルキル、－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－NH$_2$、－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－NH（（C$_1$－C$_6$）アルキル）、及び－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－N（（C$_1$－C$_6$）アルキル）$_2$からなる群より独立して選択され、ここでR^{29}のアルキル及びアルキレン基は、ハロゲンで１回以上置換されていてもよい、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。
【請求項１３】
ｎが０である、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。
【請求項１４】
R^{3}は、基：－X^1－L^1－R^{13}であり、ここで
X^{1}は、直結合と－O－からなる群より選択され、
L^{1}は、直結合、－CH$_2$－、及び－CH$_2$CH$_2$－からなる群より選択され、そして
R^{13}は、－フェニルと－シクロヘキシルからなる群より選択され、ここでR^{13}のシクロヘキシル及びフェニル基は、R^{14}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{14}は、－ハロゲン、－（C$_1$－C$_6$）アルキル、及び－（C$_1$－C$_6$）ハロアルキルからなる群より独立して選択される）；
R^{7}は、基：－L^2－X^2－R^{15}であり、ここで
L^{2}は、－（C$_1$－C$_4$）アルキレン－であり、
X^{2}は、直結合と－O－からなる群より選択され、そして
R^{15}は、R^{16}で１回以上置換されていてもよい－（C$_1$－C$_4$）アルキルからなる群より選択され（ここでそれぞれのR^{16}は、－ハロゲンからなる群より独立して選択される）、
R^{8}は、基：－X^3－L^3－R^{17}であり、ここで
X^{3}は、直結合、－O－、及び－C（O）NH－からなる群より選択され、
L^{3}は、直結合と－CH$_2$－からなる群より選択され、
R^{17}は、
【化３】



｛式中、
それぞれのR^{22}は、R^{17}の環炭素原子のいずれに付いてもよく、そしてここで
それぞれのR^{22}は、－ハロゲン、－X^4－R^{24}、－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－R^{24}、－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－X^5－R^{24}、及び－X^4－（C$_1$－C$_6$）アルキレン－NR^{25}R^{26}からなる群より独立して選択され、ここで
X^{4}とX^{5}は、直結合、－O－、及び－N（R^{27}）－からなる群より独立して選択され（ここでR^{27}は、－Hと－（C$_1$－C$_6$）アルキルからなる群より選択される）、
R^{24}は、－H、－（C$_1$－C$_6$）アルキルからなる群より選択され、ここでR^{24}のアルキル基は、R^{28}で１回以上置換されていてもよく（ここでそれぞれのR^{28}は、ハロゲンからなる群より独立して選択される）、

R^{25}とR^{26}は、－Hと－（C_1－C_6）アルキルからなる群より独立して選択され、
R^{23}は、－Hと－（C_1－C_6）アルキルからなる群より選択され、そして
nは、０、１、２、又は３である｝により表される、請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項１５】

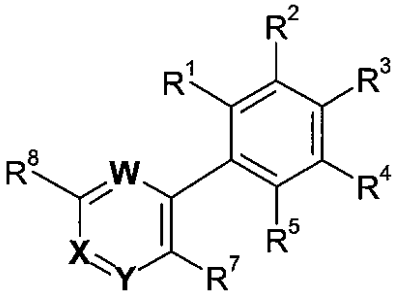
４－（４－ベンジルオキシ－フェニル）－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－３－プロピル－ピリダジン；
３－ブチル－４－［４－（４，４－ジフルオロ－シクロヘキシルオキシ）－フェニル］－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン；
シス－（＋）－４－［６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－イルオキシメチル］－１－メチル－ピペリジン－３－オール
シス－（＋）－３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（３－メトキシ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメトキシ）－ピリダジン
トランス－（＋）－３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（３－メトキシ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメトキシ）－ピリダジン
｛４－［６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－イルオキシ］－１－メチル－ピペリジン－３－イル｝－メタノール
トランス－（＋）－３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（３－フルオロ－１－メチルピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン；
シス－（＋）－３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（３－フルオロ－１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン；
３－ブチル－４－［４－（４－クロロ－ベンジルオキシ）－フェニル］－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン；
３－ブチル－４－［４－（２－シクロヘキシルエトキシ）－フェニル］－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン；
５－（４－ベンジルオキシ－フェニル）－６－ブチル－ピリダジン－３－カルボン酸（１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（１－メチル－ピペリジン－４－イル）－アミド；
６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
（±）－シス－６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（３－メトキシ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（３－メトキシ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（４－フルオロ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
（±）－シス－６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（３－フルオロ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；及び
（±）－シス－６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－カルボン酸（３－ヒドロキシ－１－メチル－ピペリジン－４－イルメチル）－アミド；
からなる群から選択される化合物、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。

【請求項１６】

４－（４－ベンジルオキシ－フェニル）－３－ブチル－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記

載の化合物。
【請求項１７】
４－（４－ベンジルオキシ－フェニル）－３－ブチル－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルメトキシ）－ピリダジン、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項１８】
３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項１９】
３－ブチル－４－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－６－（ピペリジン－４－イルオキシ）－ピリダジン、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項２０】
２－｛４－［６－ブチル－５－（４－シクロヘキシルオキシ－フェニル）－ピリダジン－３－イルオキシ］－ピペリジン－１－イル｝－エタノール、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項２１】
５－（４－ベンジルオキシ－フェニル）－６－ブチル－ピリダジン－３－カルボン酸（１－メチル－ピペリジン－４－イル）－アミド、又はその医薬的に許容される塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項２２】
請求項１～２１のいずれか１項に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩と医薬的に許容される担体を含んでなる医薬組成物。
【請求項２３】
請求項１～２１のいずれか１項に記載の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩の、ＲＡＧＥ媒介性疾患を治療するための医薬品の製造のための使用。
【請求項２４】
ＲＡＧＥ媒介性疾患が、乾癬、アトピー性皮膚炎のような皮膚炎症、臓器、組織、又は細胞移植に関連した炎症、及び喘息と慢性閉塞性肺疾患が含まれる肺炎症が含まれる急性及び慢性の炎症、敗血症、糖尿病、糖尿病関連合併症、腎不全、糖尿病に関連した高脂血性アテローム性動脈硬化症、神経細胞障害、再狭窄、ダウン症候群、頭部外傷に関連した認知症、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、アミロイドーシス、自己免疫疾患、創傷治癒、歯周疾患、神経障害、神経変性、血管透過性、腎障害、アテローム性動脈硬化症、網膜障害、勃起不全、腫瘍浸潤及び／又は転移、及び骨粗鬆症からなる群より選択される、請求項２３の使用。
【請求項２５】
請求項１～２１のいずれか１項の式（Ｉ）の化合物又はその医薬的に許容される塩の、被検者の認知機能の喪失速度を遅らせるための医薬品の製造のための使用。
【請求項２６】
式（Ｉ）：

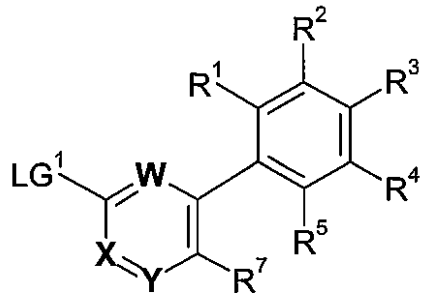
【化４】



(I)

の化合物又はその医薬的に許容される塩を合成する方法であって、塩基、式：ＨＯ－Ｌ^{3}－Ｒ^{17}の化合物、及び式（Ｉａ）：

【化５】



(Ia)

［式中、
Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{6}、Ｒ^{7}、Ｗ、Ｘ、及びＹは、請求項１～１２のいずれか１項に定義される通りであり、
Ｒ^{8}は、基：－Ｘ^{3}－Ｌ^{3}－Ｒ^{17}であり、
Ｘ^{3}は、－Ｏ－であり、
Ｌ^{3}は、直結合又は－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキレン－からなる群より選択され、
Ｒ^{17}は、請求項１３～２０のいずれか１項に定義される通りであり、そして
ＬＧ^{1}は、脱離基である］の化合物を混合する工程を含んでなる、前記方法。