

【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6年7月17日(2024.7.17)

【国際公開番号】WO2022/015988
 【公表番号】特表2023-534803(P2023-534803A)
 【公表日】令和5年8月14日(2023.8.14)
 【年通号数】公開公報(特許)2023-151
 【出願番号】特願2023-502593(P2023-502593)

【国際特許分類】

10

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

20

【F I】

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

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年7月8日(2024.7.8)

【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

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

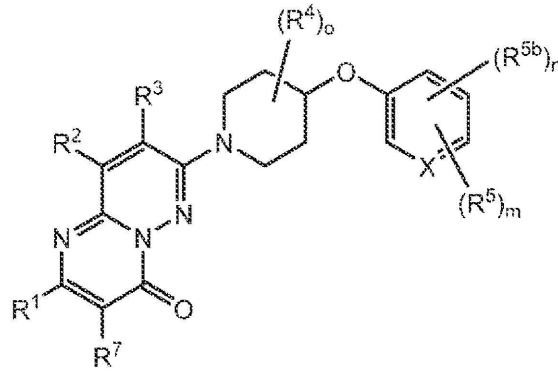
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

50

【化 1】



(I)

10

(式中、

Xは、C^{R^{5a}}若しくはNであり；

R¹は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₁~C₄-ヒドロキシアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、-L¹-C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L¹OR^a及びOR^aから選択され；

R²は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L²OR^b、OR^b、NHR^b、及びN(R^b)₂から選択され；

20

R³は、C₁~C₄-アルキル、水素、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L³OR^c、及びOR^cから選択され；

各R⁴は、C₁~C₄-アルキル、OR^d、-L⁴OR^d、及びハロから独立に選択され；

mは、2、0若しくは1であり；

2つのR⁵は、それらが結合する炭素原子と一緒に、O、N、及びSから独立に選択される2個若しくは1個のヘテロ原子を含む5~8員縮合単環式複素環を形成し、前記縮合単環式複素環は、1~4個のR⁶で置換されていてもよい；又は

各R⁵は、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、OR^e、-L⁵OR^e、5若しくは6員ヘテロアリアル、フェニル、C₃~C₆-シクロアルキル、及びハロから独立に選択され；

30

R^{5a}は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、OR^e、-L⁵OR^e、及びハロから選択され；

各R^{5b}は、C₁~C₂-アルキル、C₁~C₂-フルオロアルキル、C₃~C₄-シクロアルキル、-OC₁~C₂-アルキル、-OC₁~C₂-フルオロアルキル、シアノ、及びハロから独立に選択され；

各R⁶は、オキソ、C₁~C₄-アルキル、OR^f、-L⁶OR^f、及びハロから独立に選択され；

R⁷は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L²OR^b、OR^b、NHR^b、及びN(R^b)₂から選択され；

40

oは、0、1若しくは2であり；

nは、0、1若しくは2であり；

L¹、L²、L³、L⁴、L⁵、及びL⁶は、出現毎に、各々独立して、C₁~C₃-アルキレンであり；

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、及びR^fは、出現毎に、各々独立して、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、及びC₃~C₆-シクロアルキルから選択され、ここで、2つのR^bは、それらが結合する窒素原子と一緒に、任意選択で4~7員単環式ヘテロシクリルを形成し、前記ヘテロシクリルは、ハロ、C₁~C₄-アルキル、及びC₁~C₄-ハロアルキルから独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよい)

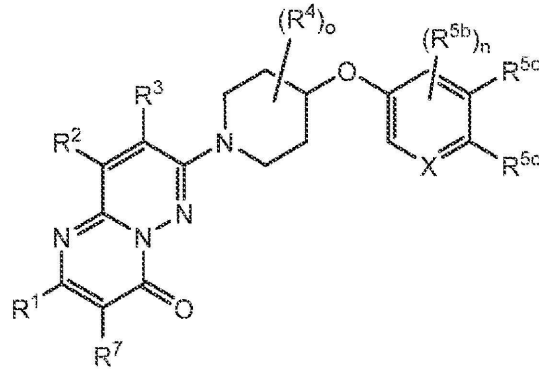
50

の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

式 (I - A)

【化 2】



(I-A)

10

(式中、

2つの R^{5c} は、それらが結合する炭素原子と一緒に、O、N、及びSから独立に選択される2個又は1個のヘテロ原子を含む5～8員縮合単環式複素環を形成し、前記縮合単環式複素環は、1～4個の R^6 で置換されていてもよい；又は

20

各 R^{5c} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 OR^e 、 $-L^5$ 、 OR^e 、5若しくは6員ヘテロアリール、フェニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、及びハロから独立に選択される)

の請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

2つの R^5 又は R^{5c} が、それらが結合する炭素原子と一緒に、5～8員縮合単環式複素環を形成する、請求項 1 若しくは 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

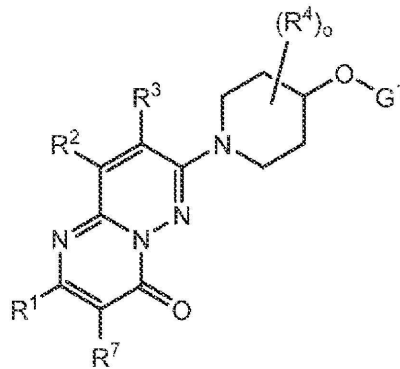
R^5 又は R^{5c} と共に形成される前記5～8員縮合単環式複素環が、O及びNから独立に選択される2個又は1個のヘテロ原子を含み、1～2個の R^6 で置換されていてもよい、請求項 1～3のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

30

【請求項 5】

式 (I - B)

【化 3】



(I-B)

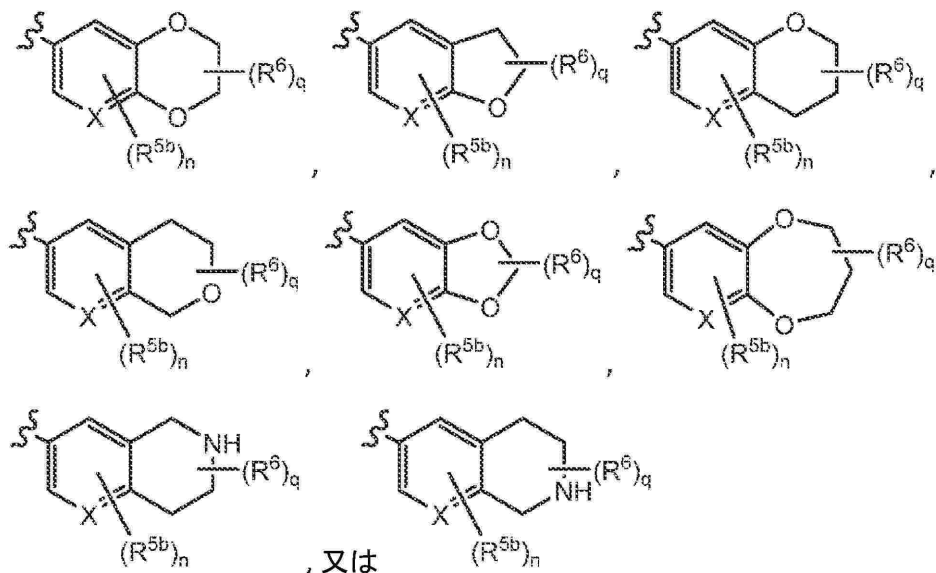
40

(式中、

G^1 は、

50

【化4】



であり；

各 q は、独立して、0、1、2、3、若しくは4である）

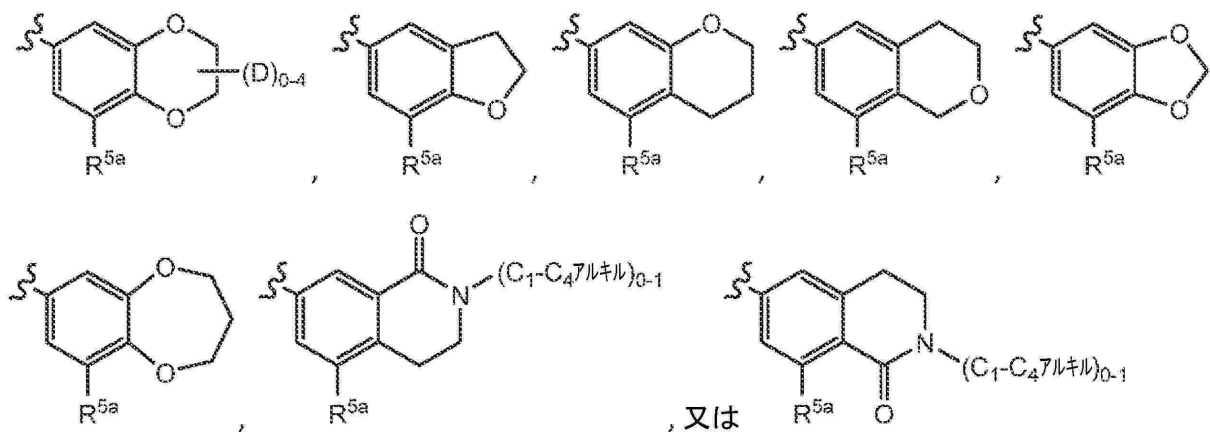
20

の請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項6】

G¹が、

【化5】



であり；

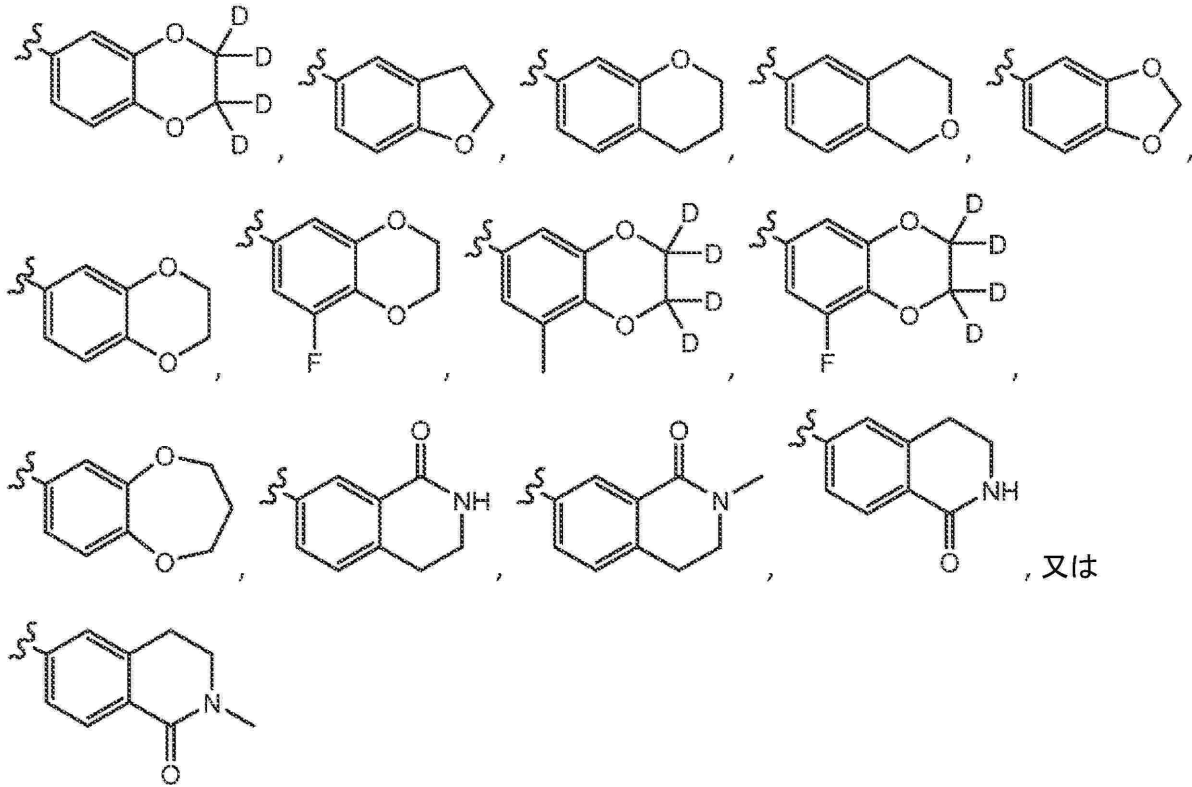
R^{5a}が、水素、C₁～C₄-アルキル、又はハロである、請求項5に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

40

【請求項7】

G¹が、

【化 6】



10

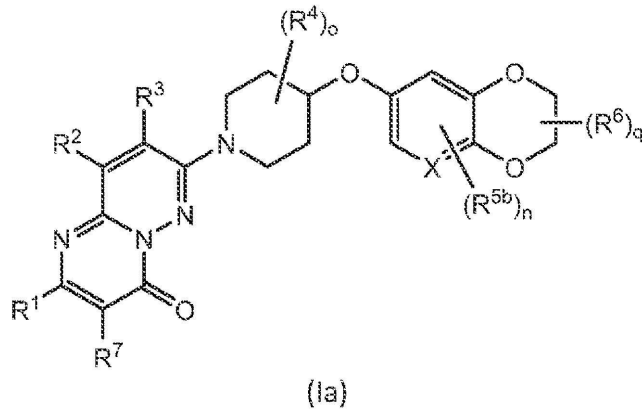
20

である、請求項 6 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

式 (I a)

【化 7】



30

40

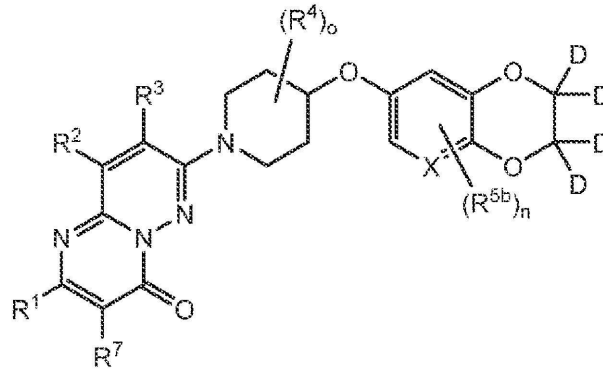
の請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

式 (I b)

50

【化 8】



(ib)

10

の請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

n が 0 である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

各 R^5 又は R^{5c} が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 OR^e 、 $-L^5OR^e$ 、5 若しくは 6 員ヘテロアリール、フェニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、及びハロから独立に選択される、請求項 1 若しくは 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

20

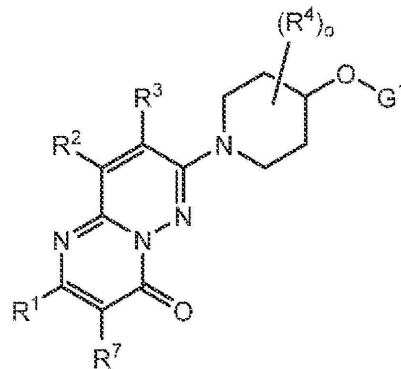
【請求項 12】

各 R^5 又は R^{5c} が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 OR^e 、 $-L^5OR^e$ 、及びハロから独立に選択される、請求項 1、2、若しくは 11 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

式 (I-B)

【化 9】



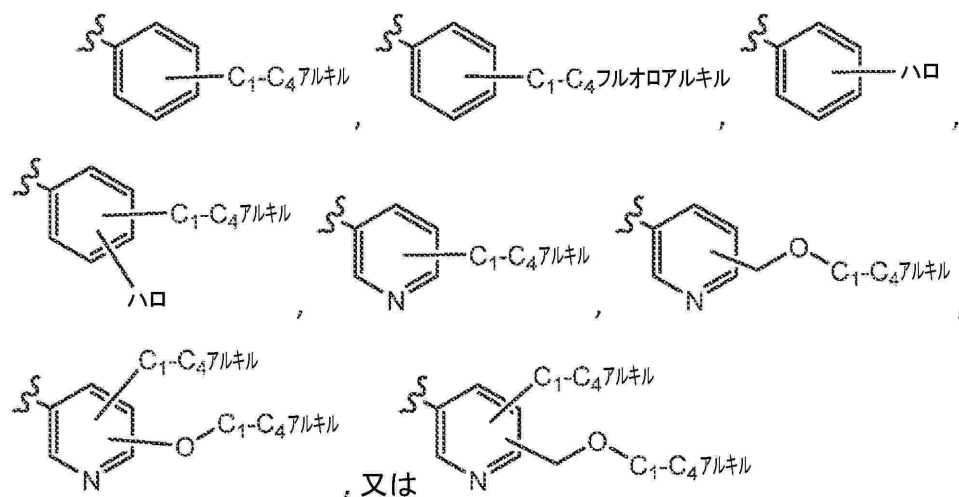
(I-B)

40

(式中、
 G^1 は、

50

【化 1 0】



10

である)

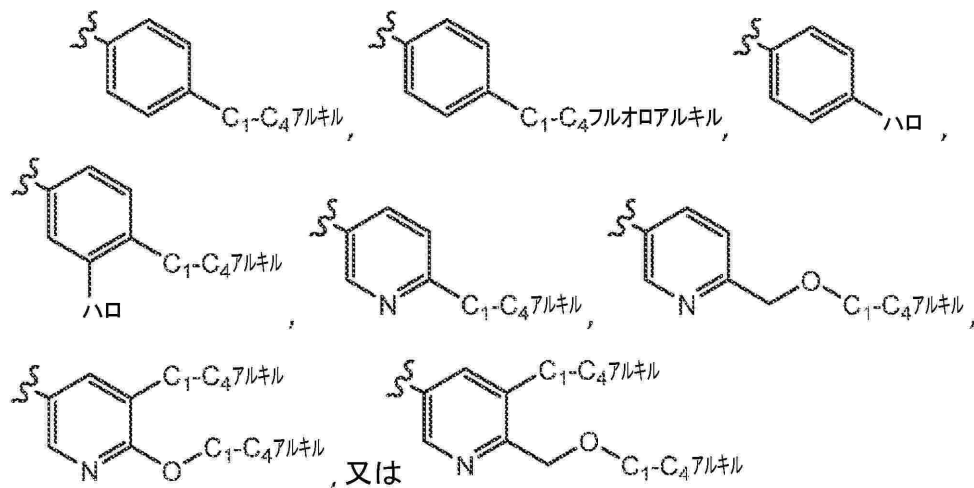
の請求項 1 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

G¹ が、

20

【化 1 1】



30

である、請求項 1 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

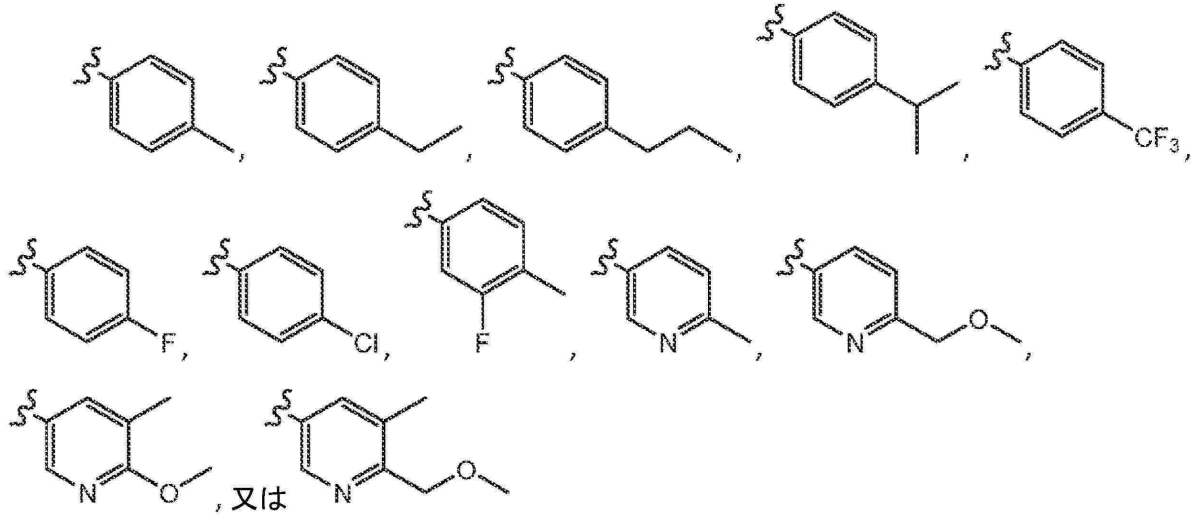
【請求項 1 5】

G¹ が、

40

50

【化 1 2】



10

である、請求項 1 4 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

R^3 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、水素、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、又は $-L^3OR^c$ である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 1 7】

R^3 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルである、請求項 1 6 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 8】

R^3 が、メチルである、請求項 1 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 9】

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $-L^1-C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、又は $-L^1OR^a$ である、請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

30

【請求項 2 0】

R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルである、請求項 1 9 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 1】

R^1 が、水素である、請求項 1 9 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 2】

R^1 が、 $C_1 \sim C_4$ -フルオロアルキルである、請求項 1 9 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 3】

R^1 が、トリフルオロメチルである、請求項 2 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

40

【請求項 2 4】

R^1 が、ジフルオロメチルである、請求項 2 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 5】

R^2 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $-L^2OR^b$ 、 OR^b 、 NHR^b 、及び $N(R^b)_2$ から選択される、請求項 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 6】

R^2 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルである、請求項 2 5 に記載の化合物、又はその薬学的に

50

許容される塩。

【請求項 27】

R² が、水素である、請求項 25 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 28】

R² が、メチルである、請求項 25 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 29】

R⁴ が、C₁ ~ C₄ - アルキル又はハロである、請求項 1 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 30】

o が、0 である、請求項 1 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。 10

【請求項 31】

o が、1 である、請求項 1 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 32】

R⁷ が、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₆ - シクロアルキル、ハロ、及び N (R^b)₂ から選択される、請求項 1 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 33】

R⁷ が、水素、メチル、シクロプロピル、フルオロ、クロロ、及びアゼチジン - 1 - イルから選択される、請求項 32 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。 20

【請求項 34】

R⁷ が、水素である、請求項 33 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 35】

X が、N である、請求項 1 ~ 5 若しくは 8 ~ 34 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 36】

X が、C R^{5a} である、請求項 1 ~ 34 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 37】

R^{5a} が、水素である、請求項 36 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。 30

【請求項 38】

以下：

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

3 - クロロ - 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン； 40

8 - メチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

3 - クロロ - 8 - メチル - 7 - (4 - ((8 - メチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] 50

- ン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 3 - フルオロ - 4 - (イソクロマン - 6 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (クロマン - 7 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 3 , 8 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1, 3] ジオキソール - 5 - イル オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン; 10
- 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシ - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2, 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン; 20
- 2, 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2, 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - ((6 - メトキシ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル)ピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン; 30
- 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - (4 - クロロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン; 40
- 2, 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペ 50

- リジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (4 - エチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (4 - イソプロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 8 - メチル - 7 - (4 - (4 - プロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 8 - メチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル) - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - エチル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - イソプロピル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 8 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 9 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - イソプロピル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 9 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - エチル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - イソプロピル - 8 , 9 - ジメ

- 6 - イル) オキシ) - 3 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミ
ド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル) オキシ) - 3 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミ
ド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル) オキシ) - 3 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミ
ド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((2 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミ 10
ド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 20
- 7 - ((3 S , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン
- 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン
- 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 30
2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン
- 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキ
シ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 9 - (メチルアミノ) - 4 H - ピリミド [1
, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン
- 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ 40
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
2 - (メトキシメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 -
オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキ
シ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メトキシ - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b
] ピリダジン - 4 - オン ;
- 9 - (アゼチジン - 1 - イル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 ,
4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリ
ミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ 50

- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 2 , 2 , 6 , 6 - d 4) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 39】

化合物が、2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 38 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 40】

化合物が、3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 38 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 41】

化合物が、7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 38 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 42】

化合物が、7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 38 に記載の化合物、又はその薬学的に

10

20

30

40

50

許容される塩。

【請求項 4 3】

化合物が、7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - (メトキシメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 3 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 4】

化合物が、7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 3 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 4 5】

化合物が、7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オンである、請求項 3 8 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 6】

請求項 1 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

【請求項 4 7】

神経障害及び / 又は精神障害の治療用の、請求項 1 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

20

【請求項 4 8】

前記障害が、アルツハイマー病、統合失調症、睡眠障害、境界性パーソナリティ障害、トゥレット症候群、双極性障害、遅発性ジスキネジア、ハンチントン病、疼痛性障害、及び認知障害から選択される、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

前記障害が、精神病、統合失調症、行為障害、破壊的行動障害、双極性障害、不安の精神病エピソード、精神病に関連する不安、精神病性障害に関連する気分障害、急性躁病、双極性障害に関連するうつ病、統合失調症に関連する気分障害、精神遅滞の行動的徴候、自閉症性障害、運動障害、トゥレット症候群、無動性硬直症候群、パーキンソン病に関連する運動障害、遅発性ジスキネジア、薬物誘発性及び神経変性に基づくジスキネジア、注意欠陥多動性障害、認知障害、認知症、及び記憶障害から選択される、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

30

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 0 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 0 1】

40

E 3 8 . 以下 :

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

50

- 8 - メチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 3 - クロロ - 8 - メチル - 7 - (4 - ((8 - メチル - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 10
- 8 - メチル - 7 - (4 - ((8 - メチル - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 3 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 20
- 3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 30
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 40
- 7 - ((3 S , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 3 - (アゼチジン - 1 - イル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン 50

- 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン
;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 ,
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリ
ミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 10
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H
- ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 S , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ
- 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) -
8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ
- 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリ 20
ミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - ((3 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ
- 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H
- ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 ,
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 3 , 8 - トリメチル - 4 H -
ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4]
ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 -
メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 30
- 2 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキ
シシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル
- 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 ,
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリ
フルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 ,
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 3 - フルオロ - 2 , 8 -
ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 40
2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 3 , 8 - トリメチル
- 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6
- イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル -
4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキ
シ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリ
ダジン - 4 - オン ;
- 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキ
シ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H 50

- ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 3 - フルオロ - 4 - (イソクロマン - 6 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (クロマン - 7 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 3 , 8 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;
 7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1

-イル - 4 - d) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - メトキシ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル)ピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - クロロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

4 - オン ;

10

20

30

40

50

2, 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 10

8, 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - エチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - イソプロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - メチル - 7 - (4 - (4 - プロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 20

8 - メチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル) - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - エチル - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - イソプロピル - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 30

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

9 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 40

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2, 8, 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8, 9 - ジメチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル - 2, 2, 3, 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - イソプロピル - 8, 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1, 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ; 50

オン；

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メトキシ - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

9 - (アゼチジン - 1 - イル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 2 , 2 , 6 , 6 - d 4) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン

からなる群から選択される、E 1 の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0320

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0320】

b . 例示される本発明の化合物

実施例 1 . 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン (化合物 1)

10

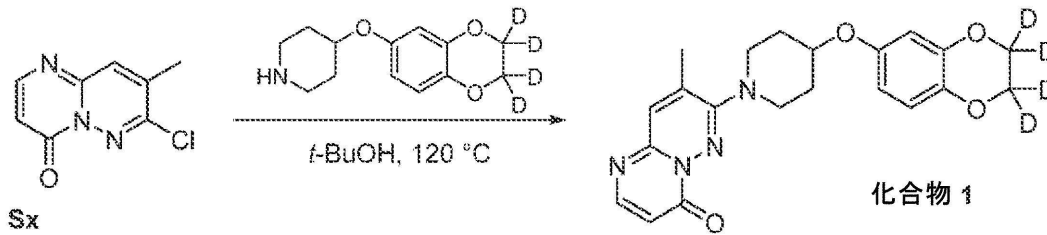
20

30

40

50

【化 8 0】



10

t - ブタノール (1 mL) 中の 7 - クロロ - 8 - メチル - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン (15 mg) の溶液に、N , N - ジイソプロピルエチルアミン (67 μ L) と 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン (28 mg) を添加した。反応混合物を 120 に 18 時間加熱した。粗生成物を DMSO (1 mL) に溶解させ、Gilson HPLC を用いた逆相クロマトグラフィー (30 \times 100 mm カラム、10 ~ 55 % ACN / 0 . 05 % 水性 NH₄OH、8 分のラン) により精製した。生成物を含有する画分を濃縮して、標題化合物を固体 15 mg として得た。

¹H NMR (400 MHz , DMSO) 8 . 11 (d , J = 6 . 3 Hz , 1 H) , 7 . 74 (q , J = 1 . 2 Hz , 1 H) , 6 . 76 (d , J = 8 . 8 Hz , 1 H) , 6 . 54 (d , J = 2 . 8 Hz , 1 H) , 6 . 49 (dd , J = 8 . 8 , 2 . 9 Hz , 1 H) , 6 . 40 (d , J = 6 . 3 Hz , 1 H) , 4 . 50 (hept , J = 3 . 8 Hz , 1 H) , 3 . 64 - 3 . 46 (m , 2 H) , 3 . 21 - 3 . 10 (m , 2 H) , 2 . 42 (d , J = 1 . 2 Hz , 3 H) , 2 . 10 - 2 . 01 (m , 2 H) , 1 . 84 - 1 . 71 (m , 2 H) . ES - MS [M + 1]⁺ : 399 .

20

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0341

【補正方法】変更

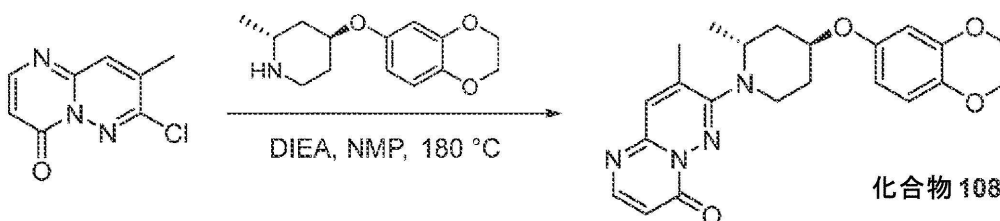
【補正の内容】

30

【0341】

実施例 22 . 7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン (化合物 108)

【化 101】



40

NMP (1 mL) 中の (2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン (50 mg) の溶液に、7 - クロロ - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン (43 mg) 及び DIEA (156 mg) を添加した。混合物を、180 のマイクロ波照射に 2 時間付した。反応混合物を EtOAc (10 mL) で希釈し、H₂O (10 mL \times 3) で抽出した。合わせた有機層をブライン (10 mL) で洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残留物を基本的な分取 HPLC により精製して、7 - ((2 R , 4 S

50

) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ)
- 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリ
ダジン - 4 - オン (16 mg) を取得した。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz , CDCl_3)
8 . 11 (d , $J = 6 . 4 \text{ Hz}$, 1 H) , 7 . 51 (s , 1 H) , 6 . 78 (d , J
= 8 . 8 Hz , 1 H) , 6 . 54 (d , $J = 6 . 4 \text{ Hz}$, 1 H) , 6 . 51 - 6 . 42 (m , 2 H) , 4 . 62 - 4 . 47 (m , 1 H) , 4 . 29 - 4 . 20 (m , 4 H) , 4 .
19 - 4 . 11 (m , 1 H) , 3 . 62 - 3 . 56 (m , 1 H) , 3 . 40 - 3 . 33 (m , 1 H) , 2 . 45 (s , 3 H) , 2 . 18 - 2 . 15 (m , 1 H) , 2 . 07 - 1 .
99 (m , 2 H) , 1 . 95 - 1 . 82 (m , 1 H) , 1 . 27 (d , $J = 6 . 4 \text{ Hz}$, 3 H) ; ES - MS [$M + 1$] $^+$: 409 . 1 .

10

【 手続補正 5 】

【 補正対象書類名 】 明細書

【 補正対象項目名 】 0370

【 補正方法 】 変更

【 補正の内容 】

【 0370 】

20

30

40

50

【表 1 - 2 5】

化合物番号	名称	構造	ES-MS [M+1] ⁺
107	7-((2 <i>S</i> ,4 <i>R</i>)-4-((2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル)オキシ)-2-メチルピペリジン-1-イル)-8-メチル-4 <i>H</i> -ピリミド[1,2- <i>b</i>]ピリダジン-4-オン		409.1
109	7-(4-((2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル-2,2,3,3- <i>d</i> 4)オキシ)ピペリジン-1-イル-4- <i>d</i>)-2-(メトキシメチル)-8-メチル-4 <i>H</i> -ピリミド[1,2- <i>b</i>]ピリダジン-4-オン		444.2
110	7-(4-((2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル-2,2,3,3- <i>d</i> 4)オキシ)ピペリジン-1-イル-4- <i>d</i>)-2-(メトキシメチル)-8,9-ジメチル-4 <i>H</i> -ピリミド[1,2- <i>b</i>]ピリダジン-4-オン		458.2
111	7-((3 <i>S</i> ,4 <i>R</i>)-4-((2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル-2,2,3,3- <i>d</i> 4)オキシ)-3-フルオロピペリジン-1-イル)-8-メチル-4 <i>H</i> -ピリミド[1,2- <i>b</i>]ピリダジン-4-オン	キラル 	417.3

10

20

30

40

【 手 続 補 正 6 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 補 正 対 象 項 目 名 】 0 3 8 8

【 補 正 方 法 】 変 更

【 補 正 の 内 容 】

【 0 3 8 8 】

開示された実施形態に対する様々な変更形態及び改変形態は、当業者に明らかであろう。限定はされないが、本発明の化学構造、置換基、誘導体、中間体、合成物、組成物、製剤又は使用の方法に関するものを含めたこうした変更形態及び改変形態は、その趣旨及び

50

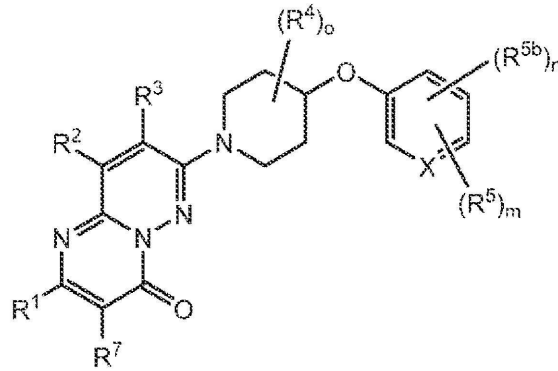
範囲から逸脱することなくなされ得る。

本発明は以下の態様を含み得る。

[1]

式 (I)

【化 1】



(I)

10

(式中、

X は、C₁~C₄-アルキル若しくはNであり；

R¹ は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₁~C₄-ヒドロキシアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、-L¹-C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L¹-OR^a及びOR^aから選択され；

R² は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L²-OR^b、OR^b、NHR^b、及びN(R^b)₂から選択され；

R³ は、C₁~C₄-アルキル、水素、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L³-OR^c、及びOR^cから選択され；

各R⁴ は、C₁~C₄-アルキル、OR^d、-L⁴-OR^d、及びハロから独立に選択され；

m は、2、0若しくは1であり；

2つのR⁵ は、それらが結合する炭素原子と一緒に、O、N、及びSから独立に選択される2個若しくは1個のヘテロ原子を含む5~8員縮合単環式複素環を形成し、前記縮合単環式複素環は、1~4個のR⁶で置換されていてもよい；又は

各R⁵ は、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、OR^e、-L⁵-OR^e、5若しくは6員ヘテロアリール、フェニル、C₃~C₆-シクロアルキル、及びハロから独立に選択され；

R^{5a} は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、OR^e、-L⁵-OR^e、及びハロから選択され；

各R^{5b} は、C₁~C₂-アルキル、C₁~C₂-フルオロアルキル、C₃~C₄-シクロアルキル、-OC₁~C₂-アルキル、-OC₁~C₂-フルオロアルキル、シアノ、及びハロから独立に選択され；

各R⁶ は、オキソ、C₁~C₄-アルキル、OR^f、-L⁶-OR^f、及びハロから独立に選択され；

R⁷ は、水素、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-ハロアルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、-L²-OR^b、OR^b、NHR^b、及びN(R^b)₂から選択され；

o は、0、1若しくは2であり；

n は、0、1若しくは2であり；

L¹、L²、L³、L⁴、L⁵、及びL⁶ は、出現毎に、各々独立して、C₁~C₃-アルキレンであり；

R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、及びR^f は、出現毎に、各々独立して、C₁~C₄-ア

20

30

40

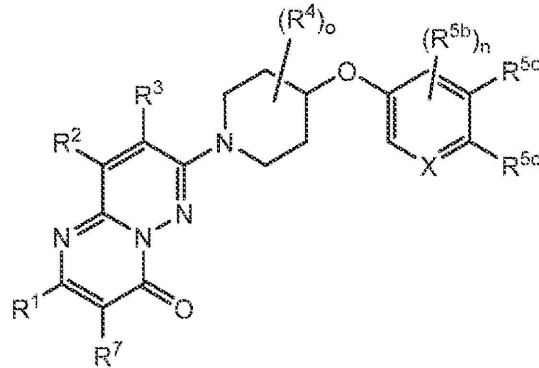
50

ルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルから選択され、ここで、2つの R^b は、それらが結合する窒素原子と一緒に、任意選択で4~7員単環式ヘテロシクリルを形成し、前記ヘテロシクリルは、ハロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルから独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよい)の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2]

式 (I - A)

【化 2】



(I-A)

(式中、

2つの R^{5c} は、それらが結合する炭素原子と一緒に、O、N、及びSから独立に選択される2個又は1個のヘテロ原子を含む5~8員縮合単環式複素環を形成し、前記縮合単環式複素環は、1~4個の R^6 で置換されていてもよい；又は

各 R^{5c} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 OR^e 、 $-L^5$ 、 OR^e 、5若しくは6員ヘテロアリール、フェニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、及びハロから独立に選択される)

の請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3]

2つの R^5 又は R^{5c} が、それらが結合する炭素原子と一緒に、5~8員縮合単環式複素環を形成する、請求項1若しくは2に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[4]

R^5 又は R^{5c} と共に形成される前記5~8員縮合単環式複素環が、O及びNから独立に選択される2個又は1個のヘテロ原子を含み、1~2個の R^6 で置換されていてもよい、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[5]

式 (I - B)

10

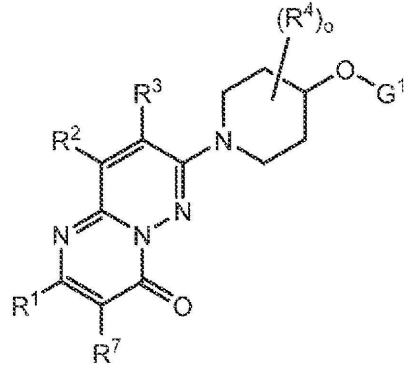
20

30

40

50

【化 3】



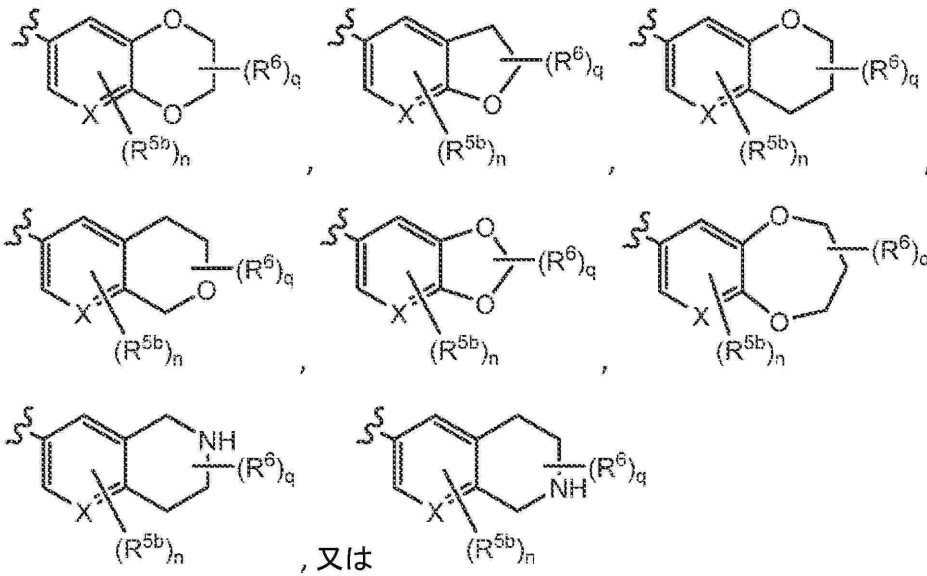
(I-B)

10

(式中、

G¹は、

【化 4】



20

30

であり；

各 q は、独立して、0、1、2、3、若しくは 4 である）

の請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

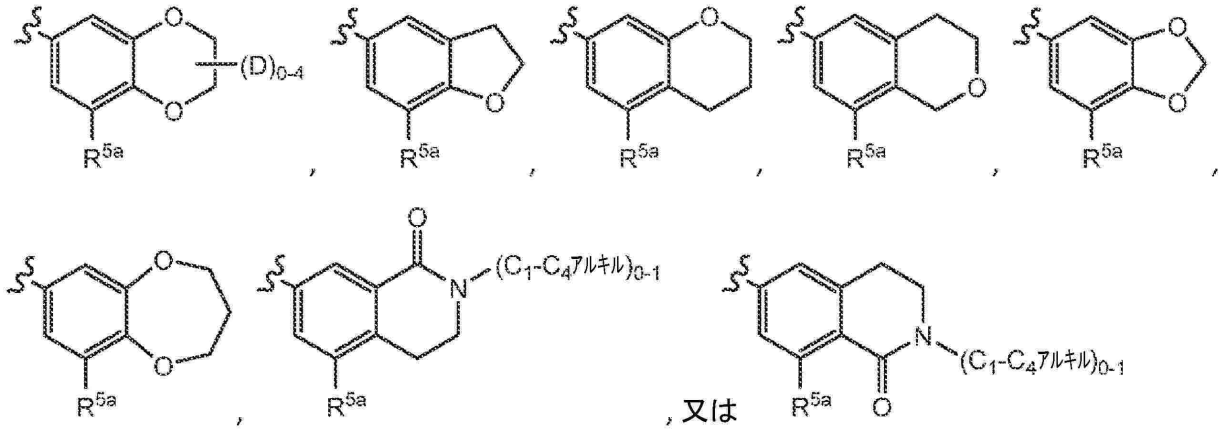
[6]

G¹が、

40

50

【化5】



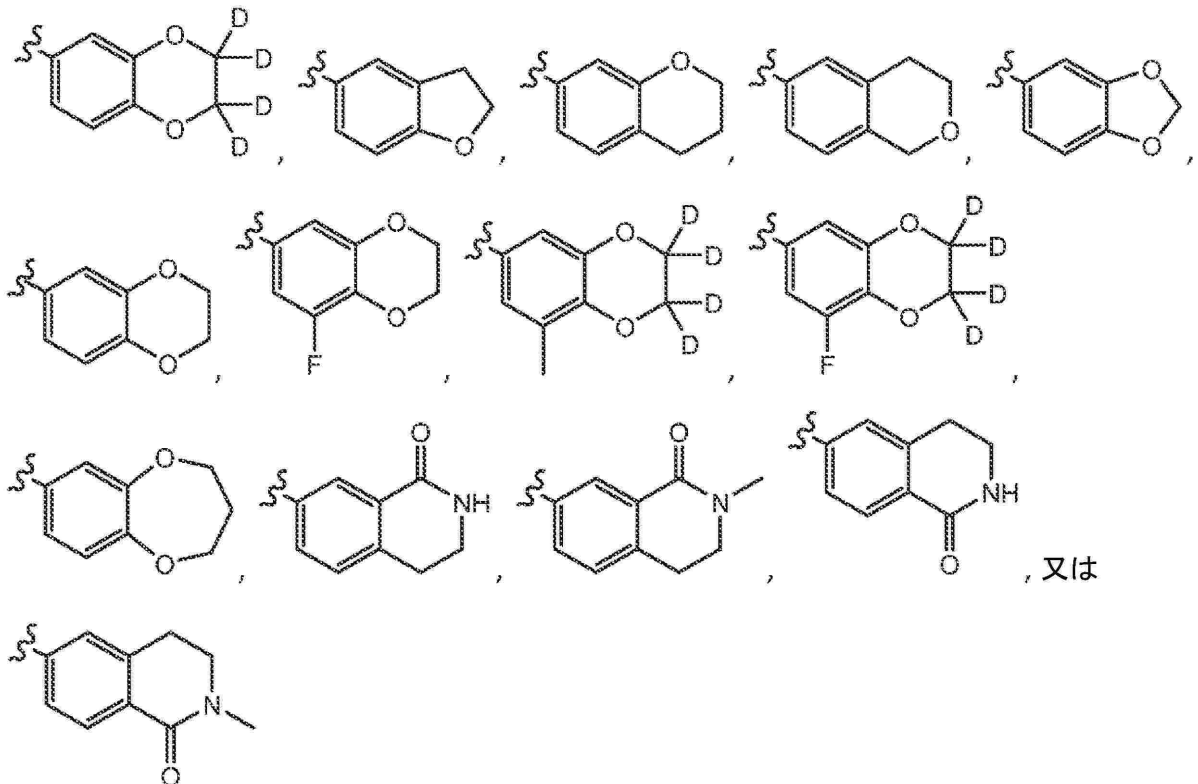
であり；

R^{5a}が、水素、C₁~C₄-アルキル、又はハロである、請求項5に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[7]

G¹が、

【化6】

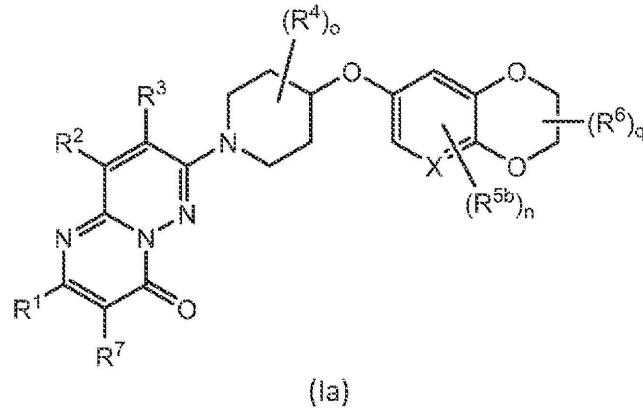


である、請求項6に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[8]

式(Ia)

【化7】



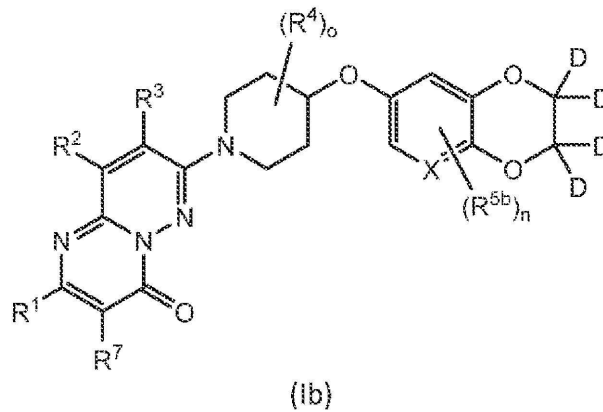
10

の請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[9]

式 (I b)

【化8】



20

30

の請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[10]

nが0である、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[11]

各R⁵又はR^{5c}が、水素、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、OR^e、-L⁵OR^e、5若しくは6員ヘテロアリール、フェニル、C₃～C₆-シクロアルキル、及びハロから独立に選択される、請求項1若しくは2に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

40

[12]

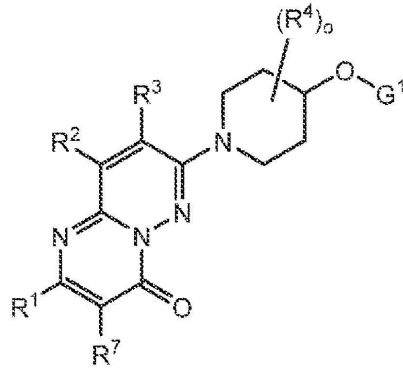
各R⁵又はR^{5c}が、水素、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、OR^e、-L⁵OR^e、及びハロから独立に選択される、請求項1、2、若しくは11に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[13]

式 (I - B)

50

【化 9】

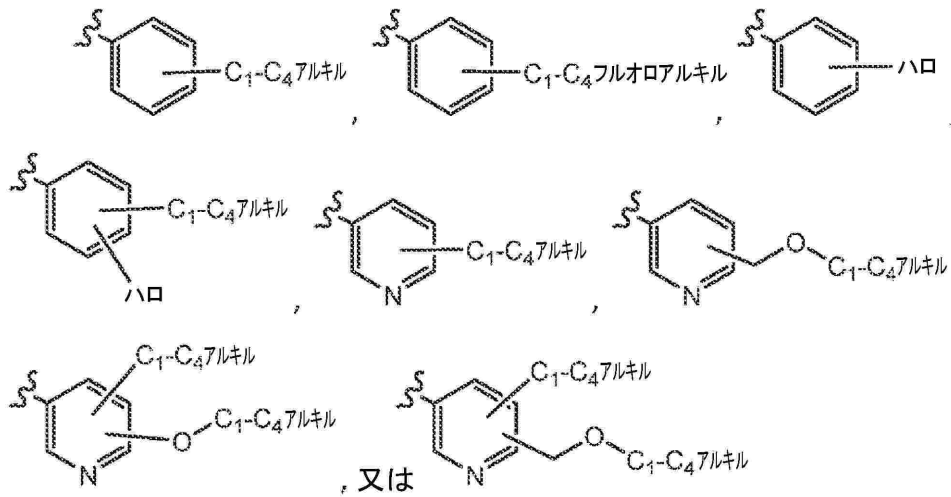


(I-B)

10

(式中、
G¹は、

【化 10】



20

30

である)

の請求項 1 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

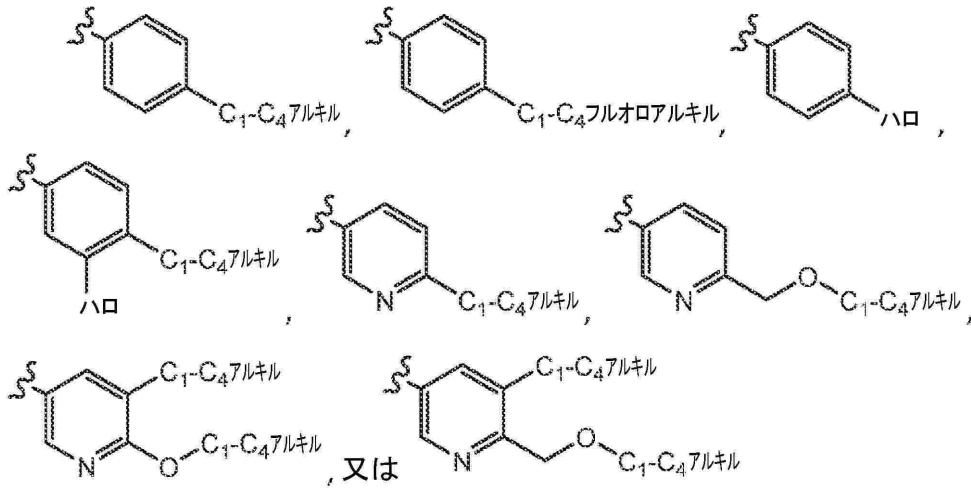
[1 4]

G¹が、

40

50

【化 1 1】



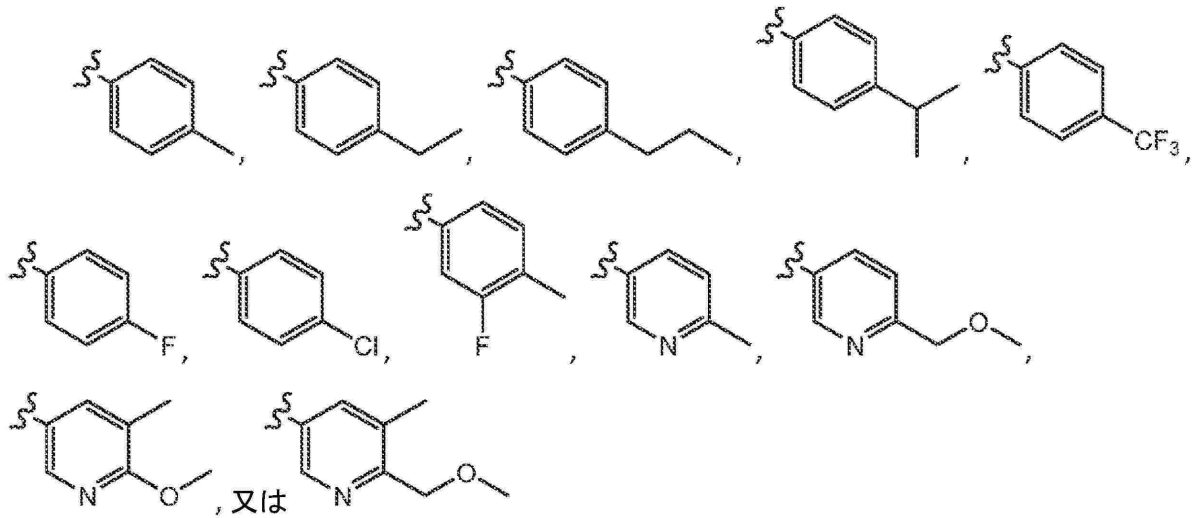
10

である、請求項 1 3 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[1 5]

G^1 が、

【化 1 2】



20

30

である、請求項 1 4 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[1 6]

R^3 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、水素、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、又は $-L^3-OR^c$ である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩

40

[1 7]

R^3 が、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルである、請求項 1 6 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[1 8]

R^3 が、メチルである、請求項 1 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[1 9]

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $-L^1-C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、又は $-L^1-OR^a$ である、請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 0]

50

R¹が、C₁~C₄-アルキルである、請求項19に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 1]

R¹が、水素である、請求項19に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 2]

R¹が、C₁~C₄-フルオロアルキルである、請求項19に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 3]

R¹が、トリフルオロメチルである、請求項22に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 4]

R¹が、ジフルオロメチルである、請求項22に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 5]

R²が、水素、C₁~C₄-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、-L²-OR^b、OR^b、NHR^b、及びN(R^b)₂から選択される、請求項1~24のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 6]

R²が、C₁~C₄-アルキルである、請求項25に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 7]

R²が、水素である、請求項25に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 8]

R²が、メチルである、請求項25に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[2 9]

R⁴が、C₁~C₄-アルキル又はハロである、請求項1~28のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 0]

oが、0である、請求項1~29のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 1]

oが、1である、請求項1~29のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 2]

R⁷が、水素、C₁~C₄-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル、ハロ、及びN(R^b)₂から選択される、請求項1~31のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 3]

R⁷が、水素、メチル、シクロプロピル、フルオロ、クロロ、及びアゼチジン-1-イルから選択される、請求項32に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 4]

R⁷が、水素である、請求項33に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 5]

Xが、Nである、請求項1~5若しくは8~34のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 6]

Xが、CR^{5a}である、請求項1~34のいずれか1項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[3 7]

R^{5a}が、水素である、請求項36に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

10

20

30

40

50

[3 8]

以下:

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - メチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - クロロ - 8 - メチル - 7 - (4 - ((8 - メチル - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - メチル - 7 - (4 - ((8 - メチル - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 3 - フルオロ - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 S , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H

10

20

30

40

50

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 3 , 8 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

3 - クロロ - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 3 - フルオロ - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 3 - フルオロ - 4 - (イソクロマン - 6 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - (クロマン - 7 - イルオキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 , 8 , 9 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 3 , 8 - トリメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 , 8 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b

10

20

30

40

50

]ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキセピン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (ベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((2 - メチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - メトキシ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル) ピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H -

10

20

30

40

50

ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - クロロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 , 8 - ジメチル - 7 - (4 - ((1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 7 - (4 - (4 - フルオロフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

2 - (ジフルオロメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 , 9 - ジメチル - 7 - (4 - ((6 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - エチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - (4 - イソプロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - メチル - 7 - (4 - (4 - プロピルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - メチル - 7 - (4 - (p - トリルオキシ) ピペリジン - 1 - イル - 4 - d) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((6 - (メトキシメチル) - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - エチル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - イソプロピル - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

8 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシ - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン ;

9 - シクロプロピル - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキ

10

20

30

40

50

- 4 - オン；

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 9 - (メチルアミノ) - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 9 - メトキシ - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

9 - (アゼチジン - 1 - イル) - 7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((3 R , 4 R) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 3 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシメチル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - ((2 R , 4 S) - 4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 8 , 9 - ジメチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((8 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン；

7 - (4 - ((2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル - 2 , 2 , 3 , 3 - d 4) オキシ) ピペリジン - 1 - イル - 2 , 2 , 6 , 6 - d 4) - 8 - メチル - 4 H - ピリミド [1 , 2 - b] ピリダジン - 4 - オン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

10

20

30

40

50

[3 9]

請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

[4 0]

治療を必要とする患者における神経障害及び/又は精神障害を治療するための方法であって、治療有効量の請求項 1 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、若しくはその薬学的に許容される塩、又は医薬組成物を前記患者に投与することを含む方法。

[4 1]

前記障害が、アルツハイマー病、統合失調症、睡眠障害、境界性パーソナリティ障害、トゥレット症候群、双極性障害、遅発性ジスキネジア、ハンチントン病、疼痛性障害、及び認知障害から選択される、請求項 4 0 に記載の方法。

10

[4 2]

前記障害が、精神病、統合失調症、行為障害、破壊的行動障害、双極性障害、不安の精神病エピソード、精神病に関連する不安、精神病性障害に関連する気分障害、急性躁病、双極性障害に関連するうつ病、統合失調症に関連する気分障害、精神遅滞の行動的徴候、自閉症性障害、運動障害、トゥレット症候群、無動性硬直症候群、パーキンソン病に関連する運動障害、遅発性ジスキネジア、薬物誘発性及び神経変性に基づくジスキネジア、注意欠陥多動性障害、認知障害、認知症、及び記憶障害から選択される、請求項 4 0 に記載の方法。

[4 3]

前記障害が、ムスカリン性アセチルコリン受容体 M 4 機能不全に関連する、請求項 4 0 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

20

[4 4]

治療に使用するための請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

[4 5]

アルツハイマー病、統合失調症、睡眠障害、境界性パーソナリティ障害、トゥレット症候群、双極性障害、遅発性ジスキネジア、ハンチントン病、疼痛性障害、及び認知障害から選択される障害の治療に使用するための請求項 1 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、若しくはその薬学的に許容される塩、又は医薬組成物。

30

[4 6]

精神病、統合失調症、行為障害、破壊的行動障害、双極性障害、不安の精神病エピソード、精神病に関連する不安、精神病性障害に関連する気分障害、急性躁病、双極性障害に関連するうつ病、統合失調症に関連する気分障害、精神遅滞の行動的徴候、自閉症性障害、運動障害、トゥレット症候群、無動性硬直症候群、パーキンソン病に関連する運動障害、遅発性ジスキネジア、薬物誘発性及び神経変性に基づくジスキネジア、注意欠陥多動性障害、認知障害、認知症、及び記憶障害から選択される障害の治療に使用するための請求項 1 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、若しくはその薬学的に許容される塩、又は医薬組成物。

[4 7]

アルツハイマー病、統合失調症、境界性パーソナリティ障害、トゥレット症候群、双極性障害、遅発性ジスキネジア、ハンチントン病、睡眠障害、疼痛性障害、及び認知障害から選択される障害を治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物若しくは医薬組成物、又はその薬学的に許容される塩の使用。

40

[4 8]

精神病、統合失調症、行為障害、破壊的行動障害、双極性障害、不安の精神病エピソード、精神病に関連する不安、精神病性障害に関連する気分障害、急性躁病、双極性障害に関連するうつ病、統合失調症に関連する気分障害、精神遅滞の行動的徴候、自閉症性障害、運動障害、トゥレット症候群、無動性硬直症候群、パーキンソン病に関連する運動障害、遅発性ジスキネジア、薬物誘発性及び神経変性に基づくジスキネジア、注意欠陥多動性

50

障害、認知障害、認知症、及び記憶障害から選択される障害を治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 39 のいずれか 1 項に記載の化合物若しくは医薬組成物、又はその薬学的に許容される塩の使用。

10

20

30

40

50