

【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7年5月19日(2025.5.19)

【公開番号】特開2025-23868(P2025-23868A)

【公開日】令和7年2月17日(2025.2.17)

【年通号数】公開公報(特許)2025-029

【出願番号】特願2024-174701(P2024-174701)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 5 / 2 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 9 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 7 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 9 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

A 6 1 P 2 5 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 1 3 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 4 1 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 0 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

30

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 6

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

A 6 1 P 9 / 0 0

A 6 1 P 3 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 2 8

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 1 9 / 0 2

A 6 1 P 1 7 / 0 0

40

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 9 / 1 0 1 0 1

A 6 1 P 1 / 1 6

A 6 1 P 2 5 / 1 6

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 7

C 0 7 D 4 1 3 / 0 4 C S P

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

50

A 6 1 K 31/541  
 A 6 1 K 31/5386  
 A 6 1 K 31/502  
 C 0 7 D 405/04  
 C 0 7 D 413/04

【手続補正書】

【提出日】 令和7年5月9日(2025.5.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】 特許請求の範囲

10

【補正対象項目名】 全文

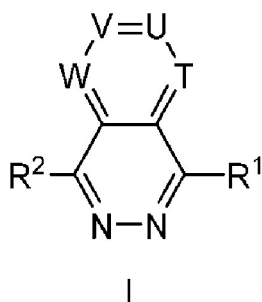
【補正方法】 変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

本発明は、下記構造式 I の化合物又は薬学的に許容されるその塩。



20

〔式中

T は、独立に群：C R<sup>3</sup>、及び、N から選択され；

30

ただし、T、U、V 及び W の 1 個又は 2 個が N であり；

U は、独立に群：

1) C R<sup>4</sup>、及び

2) N

から選択され；

V は、独立に群：

1) C R<sup>5</sup>、及び

2) N

から選択され；

W は、独立に群：

40

1) C R<sup>6</sup>、及び

2) N

から選択され；

R<sup>1</sup> は、群：

1) モルホリン、

2) チオモルホリン、

3) ピペリジン、

4) ピロリジン、

5) テトラヒドロピラン、

6) オクタヒドロ-1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン、

50

- 7) 3-アザビシクロ [3. 1. 0] ヘキサン、
- 8) 5-アザスピロ [2. 4] ヘプタン、
- 9) 1-オキサ-7-アザスピロ [4. 4] ノナン、
- 10) 1-オキサ-8-アザスピロ [4. 5] デカン、
- 11) 3-オキサ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン、
- 12) 2, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン、
- 13) 1-オキサ-3, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン、
- 14) 2-オキサ-8-アザスピロ [4. 5] デカン、
- 15) 1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン、及び
- 16) 1-オキサ-4, 9-ジアザスピロ [5. 5] ウンデカン

10

から選択され、

ここで、 $R^1$  は、置換されていないか、 $R^a$  から選択される 1～6 個の置換基によって置換されており；

$R^2$  は、群：

- 1) アリール、及び
- 2) ヘテロアリール

から選択され、

ここで、 $R^2$  は、置換されていないか、 $R^b$  から選択される 1～5 個の置換基によって置換されており；

$R^3$  は、群：

20

- 1) 水素、
- 2) OH、
- 3) CN、
- 4)  $CF_3$ 、
- 5)  $CF_2H$ 、
- 6)  $-C_{1-6}$  アルキル、
- 7)  $-O-C_{1-6}$  アルキル、
- 8) ハロゲン、及び
- 9)  $-C_{1-6}$  アルキル- $O-C_{1-6}$  アルキル

から選択され、

30

ここで、 $R^3$  は、置換されていないか、 $R^d$  から選択される 1～5 個の置換基によって置換されており；

$R^4$  は、群：

- 1) 水素、
- 2) OH、
- 3) CN、
- 4)  $CF_3$ 、
- 5)  $CF_2H$ 、
- 6)  $-C_{1-6}$  アルキル、
- 7)  $-O-C_{1-6}$  アルキル、
- 8) ハロゲン、
- 9)  $-C_{3-6}$  シクロアルキル、
- 10)  $-C_{2-6}$  複素環アルキル、及び
- 11)  $-C_{1-6}$  アルキル- $O-C_{1-6}$  アルキル

40

から選択され、

ここで、 $R^4$  は、置換されていないか、 $R^e$  から選択される 1～5 個の置換基によって置換されており；

$R^5$  は、群：

- 1) 水素、
- 2) OH、

50

- 3)  $\text{CN}$ 、
- 4)  $\text{CF}_3$ 、
- 5)  $\text{CF}_2\text{H}$ 、
- 6)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 7)  $-\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 8) ハロゲン、
- 9)  $-\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、
- 10)  $-\text{C}_{2-6}$  複素環アルキル、及び、
- 11)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキル

から選択され、

ここで、 $\text{R}^5$  は、置換されていないか、 $\text{R}^f$  から選択される 1 ～ 5 個の置換基によって置換されており；

$\text{R}^6$  は、群：

- 1) 水素、
- 2)  $\text{OH}$ 、
- 3)  $\text{CN}$ 、
- 4)  $\text{CF}_3$ 、
- 5)  $\text{CF}_2\text{H}$ 、
- 6)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 7)  $-\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 8) ハロゲン、
- 9)  $-\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、
- 10)  $-\text{C}_{2-6}$  複素環アルキル、及び
- 11)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル- $\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキル

から選択され、

ここで、 $\text{R}^6$  は、置換されていないか、 $\text{R}^g$  から選択される 1 ～ 5 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^a$  は、独立に群：

- 1)  $\text{CN}$ 、
- 2) オキソ、
- 3)  $-\text{OH}$ 、
- 4) ハロゲン、
- 5)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 6)  $-\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキル、
- 7)  $-\text{C}_{2-6}$  アルケニル、
- 8)  $-\text{C}_{2-6}$  アルキニル、
- 9)  $-\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、
- 10)  $-\text{C}_{2-6}$  複素環アルキル、
- 11) アリール、
- 12) ヘテロアリール、及び
- 13)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{1-6}$  アルキル

から選択され、

ここで、各  $\text{R}^a$  は、置換されていないか、ハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OH}$ 、 $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、及び  $-\text{O}-\text{C}_{1-6}$  アルキルから選択される 1 ～ 6 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^b$  は、独立に群：

- 1)  $\text{CN}$ 、
- 2)  $-\text{OH}$ 、
- 3)  $-\text{CH}_3$ 、
- 4)  $-\text{CF}_3$ 、
- 5)  $-\text{CF}_2\text{H}$ 、

6)  $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、及び

7) シクロプロパン

から選択され、

ここで、各  $\text{R}^b$  は、置換されていないか、ハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～6 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^d$  は、独立に群：

1)  $\text{CF}_3$ 、

2) ハロゲン、及び

3)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル

10

から選択され、

ここで、アルキルは、置換されていないか、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{OH}$  及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～3 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^e$  は、独立に群：

1)  $\text{CF}_3$ 、

2) ハロゲン、及び

3)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル

から選択され、

ここで、アルキルは、置換されていないか、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{OH}$  及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～3 個の置換基によって置換されており；

20

各  $\text{R}^f$  は、独立に群：

1)  $\text{CF}_3$ 、

2) ハロゲン、及び

3)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、

から選択され、

ここで、アルキルは、置換されていないか、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{OH}$  及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～3 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^g$  は、独立に群：

1)  $\text{CF}_3$ 、

2) ハロゲン、及び

3)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、

30

から選択され、

ここで、アルキルは、置換されていないか、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{OH}$  及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～3 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^h$  は、独立に群：

1) 水素、

2)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、

3)  $-\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、及び

4)  $-\text{C}_{2-6}$  複素環アルキル

から選択され、

40

ここで、アルキル、シクロアルキル及び複素環アルキルは、置換されていないか、 $-\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{OH}$  及び  $-\text{OC}_{1-6}$  アルキルから選択される 1～3 個の置換基によって置換されており；

各  $\text{R}^i$  は、独立に群：

1) 水素、

2)  $-\text{C}_{1-6}$  アルキル、

3)  $-\text{C}_{3-6}$  シクロアルキル、及び

4)  $-\text{C}_{2-6}$  複素環アルキル、

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル及び複素環アルキルは、置換されていないか、 $\text{C}$

50

F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

各R<sup>j</sup>は、独立に群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 3) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 4) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル及び複素環アルキルは、置換されていないか、C F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

10

各R<sup>k</sup>は、独立に群：

- 1) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 2) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 3) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル、及び複素環アルキルは、置換されていないか、-C F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

20

各R<sup>l</sup>は、独立に群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 3) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 4) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル、及び複素環アルキルは、置換されていないか、-C F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

各R<sup>m</sup>は、独立に

- 1) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 2) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 3) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

30

であり；

ここで、アルキル、シクロアルキル及び複素環アルキルは、置換されていないか、-C F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

各R<sup>n</sup>は、独立に群：

- 1) 水素、
- 2) C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 3) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 4) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

40

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル、及び複素環アルキルは、置換されていないか、-C F<sub>3</sub>、ハロゲン、OH及び-O C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

各R<sup>o</sup>は、独立に群：

- 1) OH、
- 2) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 3) -C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、及び
- 4) -C<sub>2-6</sub>複素環アルキル

50

から選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル及び複素環アルキルは、置換されていないか、 $-CF_3$ 、ハロゲン、OH及び $-OC_{1-6}$ アルキルから選択される1～3個の置換基によって置換されており；

r は、0、1、2、3、4、5又は6であり；

s は、0、1、2、3、4、5又は6であり；

t は、0、1、2、3、4、5又は6であり；

u は、0、1、2、3、4、5又は6であり；

p は、0、1、2、3、4、5又は6であり；そして、

q は、0、1、2、3、4、5又は6である。】、

但し、以下の化合物又は薬学的に許容されるその塩を除く；

1) (S) - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 1 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール；

2) (S) - 1 - (1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [3, 4 - d] - ピリダジン - 4 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール；

3) (シス) - 4 - (5 - (2 - (ジフルオロメトキシ) - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 2, 6 - ジメチルモルホリン；

4) 2 - (4 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 1 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

5) 2 - (1 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 4 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

6) 2 - (5 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

7) (シス) - 4 - (1 - (2 - (ジフルオロメトキシ) - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 4 - イル) - 2, 6 - ジメチルモルホリン；

8) 2 - (8 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) ピリダジノ [4, 5 - c] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - フェノール；

9) 2 - (4 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) ピリダジノ [4, 5 - d] ピリダジン - 1 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - フェノール；

10) (S) - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - メチルピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール；

11) (シス) - 4 - (1 - (ベンゾフラン - 5 - イル) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 4 - イル) - 2, 6 - ジメチルモルホリン；

12) (S) - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - (トリフルオロメチル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール；

13) (3S, 4s, 5R) - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリダジノ [4, 5 - d] ピリダジン - 1 - イル) - 3, 4, 5 - トリメチルピペリジン - 4 - オール；

14) 2 - (4 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) - 5 - メチルフタラジン - 1 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

15) 2 - (4 - ((シス) - 2, 6 - ジメチルモルホリノ) - 8 - メチルフタラジン - 1 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

16) (3S, 4s, 5R) - 1 - (1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [3, 4 - d] ピリダジン - 4 - イル) - 3, 4, 5 - トリメチルピペリジン - 4 - オール；

17) (3S, 4s, 5R) - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチ

10

20

30

40

50

ル) フェニル) ピリド [3, 4-d] ピリダジン-1-イル) -3, 4, 5-トリメチル  
 ピペリジン-4-オール;

18) (3S, 4r, 5R) -1- (1- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル)  
 フェニル) ピリド [3, 4-d] ピリダジン-4-イル) -3, 5-ジメチルピペリ  
 ジン-4-オール;

19) (3S, 4r, 5R) -1- (4- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル)  
 フェニル) ピリド [3, 4-d] ピリダジン-1-イル) -3, 5-ジメチルピペリ  
 ジン-4-オール;

20) 2- (4- ( (シス) -2, 6-ジメチルモルホリノ) -6-メチルフタラジン  
 -1-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノール;

21) 2- (4- ( (シス) -2, 6-ジメチルモルホリノ) -7-メチルフタラジン  
 -1-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノール;

22) (S) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル)  
 ピリド [2, 3-d] -

ピリダジン-8-イル) -3-メチルピロリジン-3-オール;

23) 2- (8- ( (3aS, 7aR) -6-メチルオクタヒドロ-1H-ピロロ [2,  
 3-c] ピリジン-1-イル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) -5- (トリフル  
 オロメチル) フェノール;

24) (3S, 4s, 5R) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル)  
 フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) -3, 4, 5-トリメチル  
 ピペリジン-4-オール;

25) 8- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2,  
 3-d] ピリダジン-8-イル) -3-オキソ-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デ  
 カン-2-オン;

26) (シス) -4- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル)  
 ) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) -2, 6-ジメチルチオモルホリン1,  
 1-ジオキシド;

27) (R) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル)  
 ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) -3- (トリフルオロメチル) ピロリジン  
 -3-オール;

28) (S) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル)  
 ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) -3- (トリフルオロメチル) ピロリジン  
 -3-オール;

29) (R) -3- (ジフルオロメチル) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリ  
 フルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-  
 3-オール;

30) (S) -3- (ジフルオロメチル) -1- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリ  
 フルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-  
 3-オール;

31) (R) -2- (8- (1-オキソ-7-アザスピロ [4. 4] ノナン-7-イル)  
 ) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノ  
 ール;

32) (S) -2- (8- (1-オキソ-7-アザスピロ [4. 4] ノナン-7-イル)  
 ) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノ  
 ール;

33) 2- (8- (1-オキソ-8-アザスピロ [4. 5] デカン-8-イル) ピリド  
 [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノール;

34) 2- (8- (2-オキソ-8-アザスピロ [4. 5] デカン-8-イル) ピリド  
 [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェノール;

35) 9- (5- (2-ヒドロキシ-4- (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [

10

20

30

40

50

2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 1-オキソ-4, 9-ジアザスピロ [5. 5] ウンデカン-3-オン;

36) 2-(8-(シス)-4, 4-ジフルオロ-3, 5-ジメチルピペリジン-1-イル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) - 5-(トリフルオロメチル) フェノール;

37) 1-(8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-1-イル) エタン-1-オン;

38) 1-(8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 2, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-2-イル) エタン-1-オン;

39) 8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] -ピリダジン-8-イル) - 3-メチル-1-オキソ-3, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-2-オン;

40) 2-(8-(4, 4-ジメチル-1-オキソ-8-アザスピロ [4. 5] デカン-8-イル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) - 5-(トリフルオロメチル) フェノール;

41) (R) - 1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 3-フェニルピロリジン-3-オール;

42) (S) - 1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 3-フェニルピロリジン-3-オール;

43) 8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 1-メチル-1, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-2-オン;

44) 8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 1-オキソ-3, 8-ジアザスピロ [4. 5] デカン-2-オン;

45) 2-(8-(6, 6-ジフルオロ-3-アザビシクロ [3. 1. 0] ヘキサン-3-イル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-5-イル) - 5-(トリフルオロメチル) フェノール;

46) 8-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 1-オキソ-8-アザスピロ [4. 5] デカン-2-オン;

47) (R) - 4, 4-ジフルオロ-1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-3-オール;

48) (S) - 4, 4-ジフルオロ-1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-3-オール;

49) (R) - 5-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 5-アザスピロ [2. 4] ヘプタン-7-オール;

50) (S) - 5-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) - 5-アザスピロ [2. 4] ヘプタン-7-オール;

51) (R) - 3-シクロプロピル-1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-3-オール;

52) (S) - 3-シクロプロピル-1-(5-(2-ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3-d] ピリダジン-8-イル) ピロリジン-3-オール;

10

20

30

40

50

ール；

53) (R) - 3 - ( (ジメチルアミノ) メチル) - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド - [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) ピロリジン - 3 - オール；

54) (S) - 3 - ( (ジメチルアミノ) メチル) - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド - [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) ピロリジン - 3 - オール；

55) (R) - 3 - エチル - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - ピロリジン - 3 - オール；

56) (S) - 3 - エチル - 1 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - ピロリジン - 3 - オール；

57) (R) - 2 - (8 - (3 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メチルピロリジン - 1 - イル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

58) (S) - 2 - (8 - (3 - (ヒドロキシメチル) - 3 - メチルピロリジン - 1 - イル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

59) (R) - 2 - (8 - (3 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) ピロリジン - 1 - イル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

60) (S) - 2 - (8 - (3 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) ピロリジン - 1 - イル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

61) 2 - (8 - ( (2 R, 6 R) - 2 - (ヒドロキシメチル) - 6 - メチルモルホリノ) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

62) 2 - (8 - ( (2 S, 6 S) - 2 - (ヒドロキシメチル) - 6 - メチルモルホリノ) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

63) 2 - (8 - ( (2 S, 6 S) - 2 - (ヒドロキシメチル) - 6 - メチルモルホリノ) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

64) 2 - (8 - ( (2 R, 6 R) - 2 - (ヒドロキシメチル) - 6 - メチルモルホリノ) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 5 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) フェノール；

65) 1 - ( (2 R, 4 r, 6 S) - 2, 6 - ジメチルテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) - 4 - (2 - メチル - 4 (トリフルオロメチル) - フェニル) フタラジン；

66) (2 R, 4 s, 6 S) - 4 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] - ピリダジン - 8 - イル) - 2, 6 - ジメチルテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - オール；

67) (2 R, 4 r, 6 S) - 4 - (5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] - ピリダジン - 8 - イル) - 2, 6 - ジメチルテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - オール；

68) (S) - 1 - (2 - (ジフルオロメチル) - 5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール；及び

69) (S) - 1 - (3 - (ジフルオロメチル) - 5 - (2 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリド [2, 3 - d] ピリダジン - 8 - イル) - 3 - メチルピロリジン - 3 - オール。

【請求項 2】

10

20

30

40

50

WがC R<sup>6</sup>である、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項3】

R<sup>1</sup>が、群：

- 1) モルホリン、
- 2) ピペリジン、
- 3) ピロリジン、
- 4) テトラヒドロピラン、及び
- 5) オクタヒドロ-1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン

から選択され、ここで、R<sup>1</sup>は、置換されていないか、R<sup>a</sup>から選択される1～6個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

10

【請求項4】

R<sup>1</sup>が、群：

- 1) モルホリン、
- 2) ピペリジン、
- 3) テトラヒドロピラン、及び
- 4) オクタヒドロ-1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン、

から選択され、

ここで、R<sup>1</sup>は、置換されていないか、R<sup>a</sup>から選択される1～6個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

20

【請求項5】

R<sup>2</sup>がヘテロアリールであり、ここで、該ヘテロアリールは、置換されていないか、R<sup>b</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項6】

R<sup>2</sup>がアリールであり、ここで、該アリールは、R<sup>b</sup>から選択される2～5個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項7】

R<sup>3</sup>が、群：

- 1) 水素、及び
- 2) -C<sub>1-6</sub>アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>3</sup>は、置換されていないか、R<sup>d</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

30

【請求項8】

R<sup>3</sup>が水素である、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項9】

R<sup>4</sup>が、群：

- 1) 水素、
- 2) OH、
- 3) CN、
- 4) CF<sub>3</sub>、
- 5) CF<sub>2</sub>H、
- 6) -C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 7) -O-C<sub>1-6</sub>アルキル、
- 8) ハロゲン、及び
- 9) -C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>4</sup>は、置換されていないか、R<sup>e</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

40

【請求項10】

50

R<sup>4</sup> が、群：

- 1) 水素、及び
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>4</sup> は、置換されていないか、R<sup>e</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されている、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 1】

R<sup>5</sup> が、群：

- 1) 水素、
- 2) OH、
- 3) CN、
- 4) CF<sub>3</sub>、
- 5) CF<sub>2</sub>H、
- 6) -C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 7) -O-C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 8) ハロゲン、及び
- 9) -C<sub>1-6</sub> アルキル-O-C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>5</sup> は、置換されていないか、R<sup>f</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されている、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 2】

R<sup>5</sup> が、群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル、及び
- 3) ハロゲン

から選択され、

ここで、R<sup>5</sup> は、置換されていないか、R<sup>f</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されている、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 3】

R<sup>6</sup> が、群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル、及び
- 3) -O-C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>6</sup> は、置換されていないか、R<sup>g</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されている、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 4】

R<sup>6</sup> が水素である、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 5】

R<sup>2</sup> がヘテロアリアルであり、ここで、R<sup>2</sup> は、置換されていないか、R<sup>b</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されており；

R<sup>3</sup> が、群：

- 1) 水素、及び
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>3</sup> は、置換されていないか、R<sup>d</sup> から選択される 1～5 個の置換基によって置換されており；

R<sup>4</sup> が、群：

- 1) 水素、
- 2) OH、

- 3) C N、
- 4) C F<sub>3</sub>、
- 5) C F<sub>2</sub> H、
- 6) -C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 7) -O-C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 8) ハロゲン、及び
- 9) -C<sub>1-6</sub> アルキル-O-C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>4</sup>は、置換されていないか、R<sup>e</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されており；

R<sup>5</sup>が、群：

- 1) 水素、
- 2) O H、
- 3) C N、
- 4) C F<sub>3</sub>、
- 5) C F<sub>2</sub> H、
- 6) -C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 7) -O-C<sub>1-6</sub> アルキル、
- 8) ハロゲン、及び
- 9) -C<sub>1-6</sub> アルキル-O-C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>5</sup>は、置換されていないか、R<sup>f</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されており；そして、

R<sup>6</sup>が、群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル、及び
- 3) -O-C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>6</sup>は、置換されていないか、R<sup>g</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されている、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項16】

WがC R<sup>6</sup>であり；

R<sup>2</sup>がアリールであり、ここで、該アリールは、R<sup>b</sup>から選択される2～5個の置換基によって置換されており；

R<sup>3</sup>が水素であり；

R<sup>4</sup>が、群：

- 1) 水素、及び
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル

から選択され、

ここで、R<sup>4</sup>は、置換されていないか、R<sup>e</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されており；

R<sup>5</sup>が、群：

- 1) 水素、
- 2) -C<sub>1-6</sub> アルキル、及び
- 3) ハロゲン

から選択され、

ここで、R<sup>5</sup>は、置換されていないか、R<sup>f</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されており；そして、

R<sup>6</sup>が水素である、請求項1に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項17】

10

20

30

40

50

請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩、及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 18】

処置を必要とする哺乳動物における、NLRP3 の阻害に対して応答する障害、症状又は疾患の治療に有用な医薬品の製造のための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 19】

炎症性障害、線維性障害、心血管障害、代謝性障害及び神経変性障害の治療、予防又は制御用の医薬品の製造のための、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項 20】

10

前記障害が炎症性障害である、請求項 19 に記載の使用。

【請求項 21】

前記炎症性障害が自己免疫障害、自己炎症性障害、炎症性関節障害、炎症性皮膚障害、及び神経炎症性障害から選択される、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 22】

前記障害がアテローム性動脈硬化症、非アルコール性脂肪肝炎、アルツハイマー病及びパーキンソン病から選択される、請求項 19 に記載の使用。

【請求項 23】

治療法での使用のための、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 24】

20

処置を必要とする患者における NLRP3 の阻害に応答する障害、症状又は疾患の治療又は予防用の、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記障害が、炎症性障害、線維性障害、心血管障害、代謝障害及び神経変性障害から選択される、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記障害が炎症性障害である、請求項 25 に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記炎症性障害が、自己免疫障害、自己炎症性障害、炎症性関節障害、炎症性皮膚障害及び神経炎症性障害から選択される、請求項 25 に記載の医薬組成物。

30

【請求項 28】

前記障害が、アテローム性動脈硬化症、非アルコール性脂肪肝炎、アルツハイマー病及びパーキンソン病から選択される、請求項 24 に記載の医薬組成物。

40

50