

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和5年9月25日(2023.9.25)

【公開番号】特開2023-21268(P2023-21268A)

【公開日】令和5年2月10日(2023.2.10)

【年通号数】公開公報(特許)2023-027

【出願番号】特願2022-198452(P2022-198452)

【国際特許分類】

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

10

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

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

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

A 6 1 P 3 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

20

【 F I 】

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

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 / 1 0

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 6

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 9 / 0 0

A 6 1 P 3 1 / 1 2

A 6 1 P 3 5 / 0 2

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

C 0 7 D 4 1 3 / 1 4

30

【手続補正書】

【提出日】令和5年9月14日(2023.9.14)

【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】

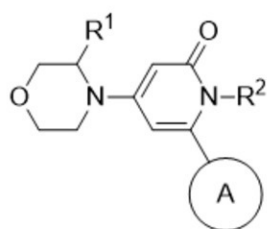
40

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化 1】



I

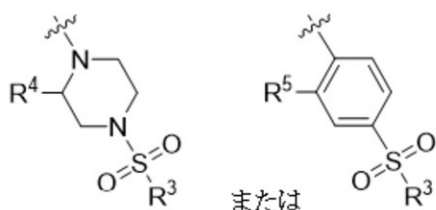
10

〔式中、

R¹ は、C₁～C₃アルキルまたはシクロプロピルであり；R² は、水素、C₁～C₃ハロアルキルおよびC₁～C₃アルキルから選択され；

A は、

【化 2】



または

20

〔式中、

R³ は、R⁶、C₁～C₆アルキル、アミノ、N-C₁～C₃アルキルアミノ、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノおよびC₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキルから選択され、前記C₁～C₆アルキルおよび前記C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキルは、任意で1つのR⁶および/または1つ以上のハロにより置換され；

30

R⁴ は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルおよびフェニルから選択され、前記フェニルは、任意で独立してフルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、ジメチルアミノ、トリフルオロメチルメトキシ、トリフルオロメチル、およびシクロプロピルのうちの1つ以上により置換され；

R⁵ は、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルキルおよびC₃～C₆シクロアルキルから選択され；

R⁶ は、各々が任意で1つ以上のR⁷により置換された、フェニル、単環式ヘテロアリール、C₃～C₆シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され；

R⁷ は、ハロゲン、アミノ、N-C₁～C₃アルキルアミノ、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノ、C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルおよびC₁～C₃アルキルから選択される」」

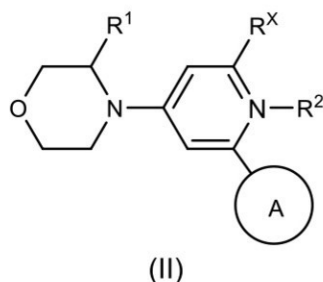
40

によって表される化合物またはその薬学的に許容可能な塩を調製するための方法であって、当該方法が、

(i) 式 (II)：

50

【化3】



10

[式中、

A、R¹、およびR²は、式(I)に関して上記のように定義され、R^Xは、F、OCH₃、OC(CH₃)₃、およびOSiR'R''R'''からなる群から選択され、

R'、R''、およびR'''は、各々独立して、アリールまたはアルキルである]

を提供する工程、及び

(ii) 前記式(II)によって表される化合物を前記式(I)によって表される化合物

に変換する工程、

を含む、方法。

20

【請求項2】

R²は、水素およびC₁~C₃アルキルから選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

R⁷は、フルオロ、シクロプロピルおよびメチルから選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項4】

R⁴は、メチル、トリフルオロメチル、シクロプロピルおよびフェニルから選択され、前記フェニルは、任意でフルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、ジメチルアミノ、トリフルオロメチルメトキシ、トリフルオロメチルおよびシクロプロピルのうちの1つによりメタで置換され；R⁵は、クロロ、シクロプロピル、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される、請求項1に記載の方法。

30

【請求項5】

R⁴は、メチル、トリフルオロメチルおよびシクロプロピルから選択され；R⁵は、クロロ、シクロプロピル、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項6】

R³は、R⁶、C₁~C₃アルキル、N,N-ジC₁~C₃アルキルアミノおよびメトキシC₁~C₃アルキルから選択され、前記C₁~C₃アルキルは、任意で1つのR⁶により置換されている、請求項1に記載の方法。

【請求項7】

R⁶は、各々が任意で1つ以上のR⁷により置換された、フェニル、ピリジル、モルホリニル、イミダゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、シクロプロピル、シクロペンチル、ピロリジニルおよびテトラヒドロフリルから選択される、請求項1に記載の方法。

40

【請求項8】

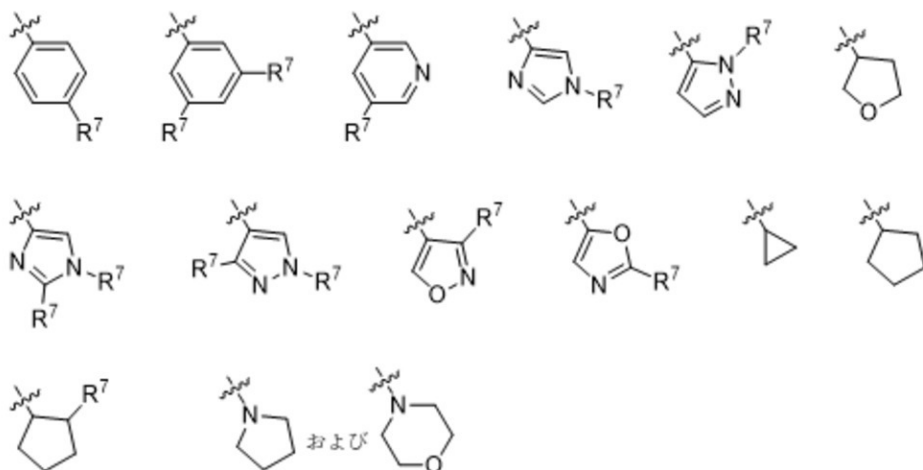
R⁶は、各々が任意で1つ以上のR⁷により置換された、フェニル、ピリジル、モルホリニル、イミダゾリル、ピラゾリル、シクロプロピル、ピロリジニル、ピペリジニル、およびテトラヒドロフリルから選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項9】

R⁶は、

50

【化 4】



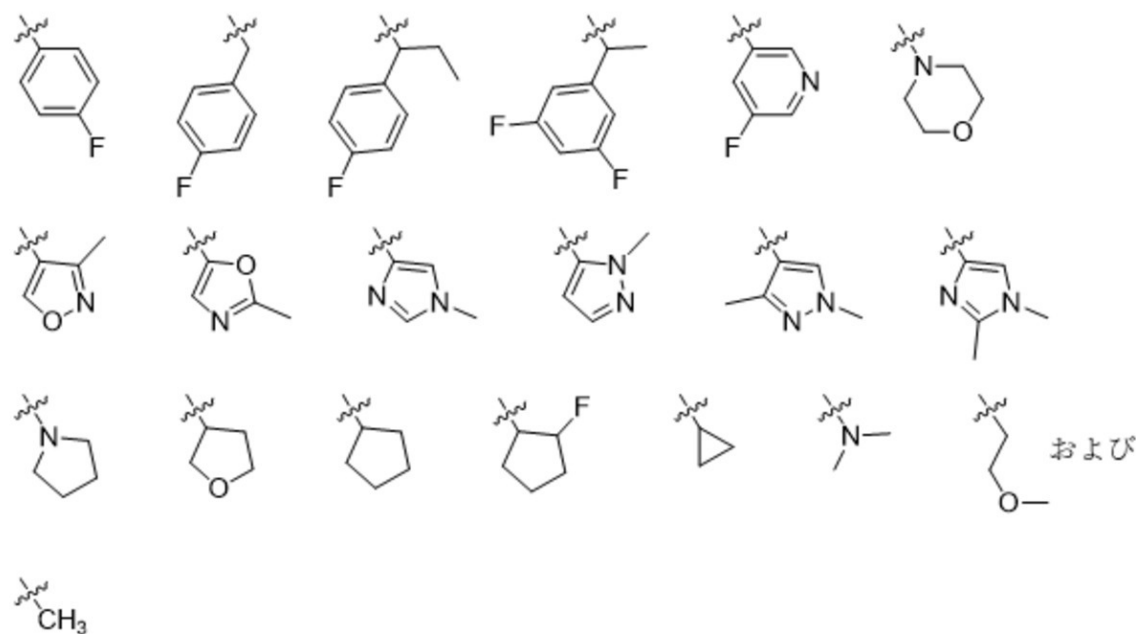
10

から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

R³は、

【化 5】



20

30

から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 11】

R¹は、メチルまたはシクロプロピルであり；

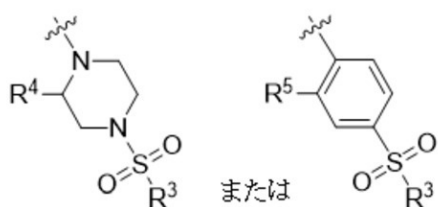
R²は、水素であり；

Aは、

40

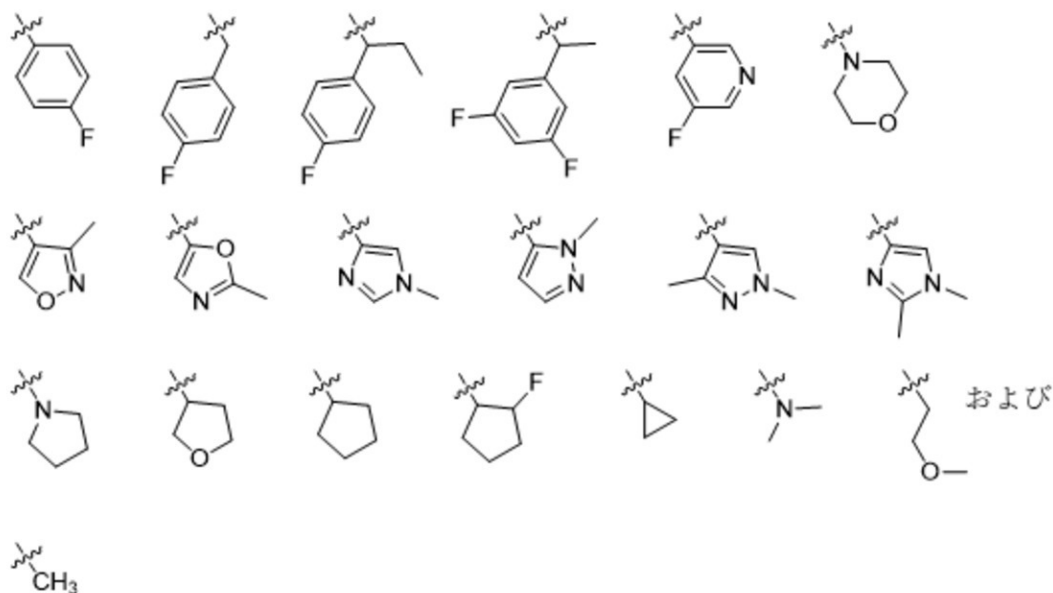
50

【化6】



であり、
R³は、
【化7】

10



20

30

から選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項12】

- R¹は、メチルであり；
- R²は、水素であり；
- R⁴およびR⁵は、CF₃であり；
- Aは、

【化8】

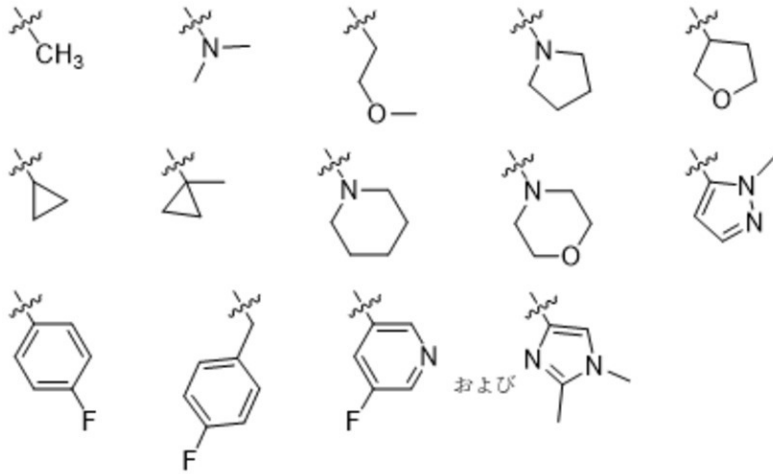


40

であり、
R³は、

50

【化 9】



10

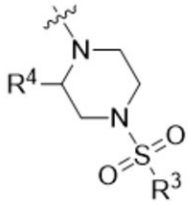
から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 1 3】

- R¹ は、メチルであり；
- R² は、水素であり；
- R⁴ は、CF₃であり；
- A は、__

20

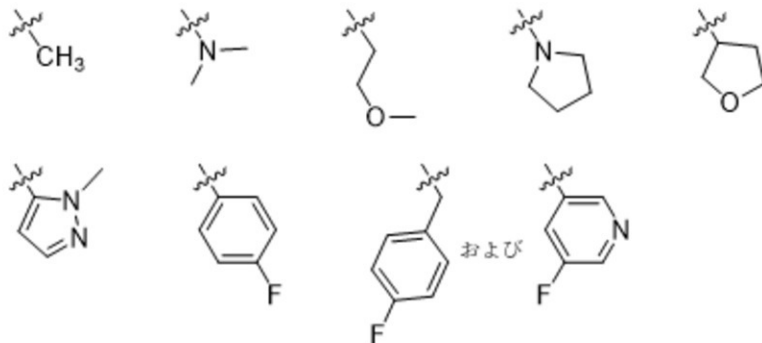
【化 1 0】



30

であり、R³ は、

【化 1 1】



40

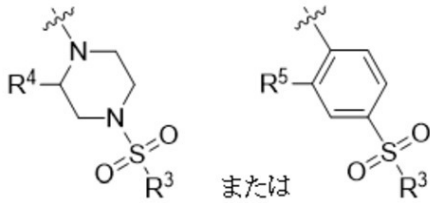
から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 1 4】

- R¹ は、メチルまたはシクロプロピルであり；
- R² は、水素であり；
- R⁴ および R⁵ は、CF₃であり；
- A は、__

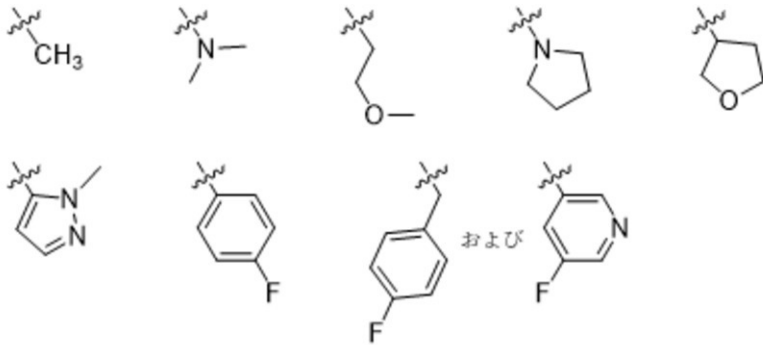
50

【化 1 2】



であり、
R³は、
【化 1 3】

10



20

から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 1 5】

前記化合物は、

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - メチルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

6 - [4 - [(4 - フルオロフェニル)メチルスルホニル] - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

30

6 - [4 - [(5 - フルオロ - 3 - ピリジル)スルホニル] - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - テトラヒドロフラン - 3 - イルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - ピロリジン - 1 - イルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

N, N - ジメチル - 4 - [4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 2 - イル] - 3 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - スルホンアミド；

40

6 - [4 - (2 - メトキシエチルスルホニル) - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

6 - [4 - (4 - フルオロフェニル)スルホニル - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン；

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - (2 - メチルピラゾール - 3 - イル)スルホニル - 2 - (トリフルオロメチル)ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン

50

ン - 2 - オン ;

6 - [4 - シクロプロピルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - (1 - ピペリジルスルホニル) - 2 - (トリフルオロメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - モルホリノスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - [4 - (1 , 2 - ジメチルイミダゾール - 4 - イル) スルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

10

6 - [4 - (1 - メチルシクロプロピル) スルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - [4 - メチルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ; および

N , N - ジメチル - 4 - [4 - (3 - メチルモルホリン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 2 - イル] - 3 - (トリフルオロメチル) ベンゼンスルホンアミド

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の方法。

20

30

40

50