

【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8月25日(2023.8.25)

【公開番号】特開2023-21276(P2023-21276A)

【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2022-198540(P2022-198540)

【国際特許分類】

C 07 D 213/75(2006.01)	10
A 61 P 35/00(2006.01)	
A 61 P 35/02(2006.01)	
A 61 P 3/10(2006.01)	
A 61 P 29/00(2006.01)	
A 61 P 37/02(2006.01)	
A 61 P 25/00(2006.01)	
A 61 P 31/12(2006.01)	
A 61 P 9/00(2006.01)	
A 61 K 45/00(2006.01)	
A 61 K 39/395(2006.01)	20
A 61 P 43/00(2006.01)	
A 61 K 38/21(2006.01)	
A 61 K 38/22(2006.01)	
A 61 K 38/43(2006.01)	
A 61 K 31/4545(2006.01)	
A 61 K 31/4745(2006.01)	
A 61 K 31/444(2006.01)	
A 61 K 31/496(2006.01)	
A 61 K 31/5377(2006.01)	
A 61 K 31/282(2006.01)	30
C 07 D 401/14(2006.01)	
C 07 D 213/73(2006.01)	
C 07 D 409/14(2006.01)	
C 07 D 413/14(2006.01)	

【F I】

C 07 D 213/75	C S P	
A 61 P 35/00		
A 61 P 35/02		
A 61 P 3/10		
A 61 P 29/00		40
A 61 P 37/02		
A 61 P 25/00		
A 61 P 31/12		
A 61 P 9/00		
A 61 K 45/00		
A 61 K 39/395	N	
A 61 P 43/00	1 2 1	
A 61 K 38/21		
A 61 K 38/22		
A 61 K 38/43		

A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/4745
A 6 1 K 31/444
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/282
C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 213/73
C 0 7 D 409/14
C 0 7 D 413/14

10

【手続補正書】

【提出日】令和5年8月16日(2023.8.16)

【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】

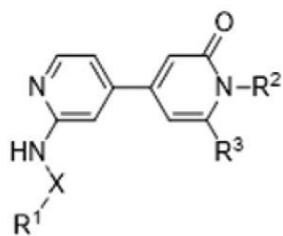
【特許請求の範囲】

【請求項1】

20

式(I)：

【化1】



30

式中、

Xは、C=Oまたは結合であり；

R¹は、H、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、C₃～C₆シクロアルコキシメチル、N-C₁～C₃アルキルアミノ、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノ、1-ピロリジニル、1-ピペリジニルおよび1-アゼチジニルからなる群から選択され、但し、R¹がC₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、N-C₁～C₃アルキルアミノ、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノ、1-ピロリジニル、1-ピペリジニルまたは1-アゼチジニルである場合、XはC=Oであり；

R²は、水素、C₁～C₃ハロアルキルおよびC₁～C₃アルキルからなる群から選択され；

R³は、A、フェニルおよび単環式ヘテロアリールからなる群から選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で1つ以上のR⁴、R⁵、R⁶およびR⁷により置換されていてもよく；

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、独立して、ハロ、C₁～C₆アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノ、N-C₁～C₃アルキルアミノ、1-アゼチジニル、C₁～C₆ハロアルキル、アミノ、NH₂、SO₂R⁸、SO₂R⁹およびヒドロキシから選択され；

40

50

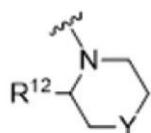
R^8 は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；
 R^9 は、 R^{10} 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、 $N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ、 $N - N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から選択され、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび前記 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキルは任意で 1 つの R^{10} および / または 1 つ以上のハロにより置換されていてもよく；

R^{10} は、各々任意で 1 つ以上の R^{11} により置換されていてもよいフェニル、単環式ヘテロアリール、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、ヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^{11} は、ハロ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、アミノ、 $N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ、 $N - N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から選択され；

A は、

【化 2】



であり；

R^{12} は、水素、ハロ、 COR^{13} 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択され；

R^{13} は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ、 $N - N - C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ、1-ピロリジニル、1-ペペリジニルおよび1-アゼチジニルからなる群から選択され；

Y は、 CH_2 、S、 SO 、 SO_2 、 NR^{14} 、 $NCOR^9$ 、 $NCOOR^{15}$ 、 NSO_2R^9 、 $NCOC_2H_2R^9$ 、O、または結合であり；

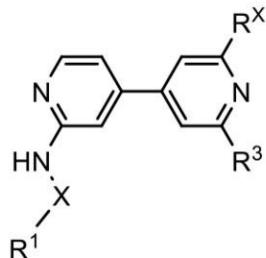
R^{14} は、H、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルからなる群から選択され；かつ

R^{15} は、 R^{10} 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から選択され、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび前記 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキルは任意で 1 つの R^{10} および / または 1 つ以上のハロにより置換されていてもよい、

で表される化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩を製造するプロセスであって、当該プロセスが、

(i) 式 (I I I)

【化 3】



式中、

R^1 、 R^3 及び X は、式 (I) の化合物において規定した通りであり；かつ

R^X は、F、 OCH_3 、 $OC(CH_3)_3$ 、及び $OSiR' R'' R'''$ からなる群から選択

10

20

30

40

され；かつ

R'、R''およびR'''は、それぞれ独立してアリールまたはアルキルである；
で表される化合物を調製する工程；及び
(i) 当該式(I)で表される化合物を(I)へ転化する工程；
を含む、プロセス。

【請求項2】

R²は、水素またはC₁～C₃アルキルである、請求項1に記載のプロセス。

【請求項3】

R¹は、H、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ
 、C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキル、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノ、1
 -ピロリジニルおよびC₃～C₆シクロアルキルからなる群から選択される、請求項1に
 記載のプロセス。
10

【請求項4】

R¹は、H、メチル、メトキシ、メトキシメチル、N,N-ジメチルアミノ、1-ピロ
 リジニルおよびシクロプロピルからなる群から選択される、請求項1に記載のプロセス。

【請求項5】

R¹は、H、メチル、メトキシメチル、N,N-ジメチルアミノ、1-ピロリジニルお
 よびシクロプロピルからなる群から選択される、請求項1に記載のプロセス。

【請求項6】

R³は、A、フェニルならびにピリジル、チエニル、フリル、ピリミジニルおよびピラ
 ゾリルから選択される单環式ヘテロアリールからなる群から選択され、前記フェニルおよ
 び前記ヘテロアリールは任意でR⁴および/またはR⁵により置換されていてもよい、請
 求項1に記載のプロセス。
20

【請求項7】

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、独立して、フルオロ、クロロ、C₁～C₃アルキル、
 C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₃フルオロアルキルおよびSO₂R⁹から選択され
 る、
 請求項1に記載のプロセス。

【請求項8】

R¹は、水素、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキル、C₁
 ～C₃ハロアルキルおよびC₃～C₆シクロアルキルからなる群から選択される、請求項
 1に記載のプロセス。
30

【請求項9】

R⁹は、R¹⁰、N,N-ジC₁～C₃アルキルアミノおよびメトキシC₁～C₃アル
 キルからなる群から選択され、前記C₁～C₃アルキルは任意で1つのR¹⁰により置換
 セス。され、各々は任意で1つ以上のメチルおよび/またはフルオロにより置換されていてもよ
 い、請求項1に記載のプロセス。

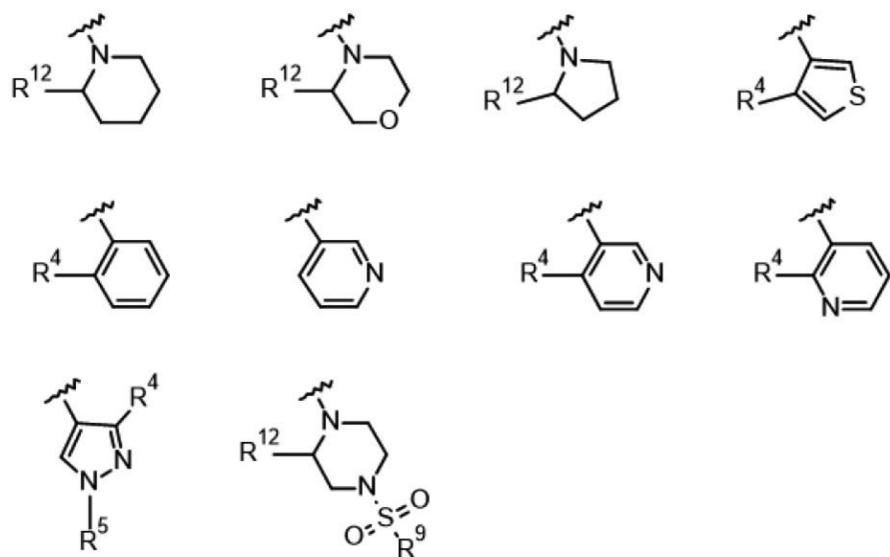
【請求項10】

R¹⁰は、フェニル、ピリジル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、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、テトラヒドロフリルからなる群から選択
 され、各々は任意で1つ以上のメチルおよび/またはフルオロにより置換されていてもよ
 い、請求項1に記載のプロセス。
40

【請求項11】

R³は、

【化4】



10

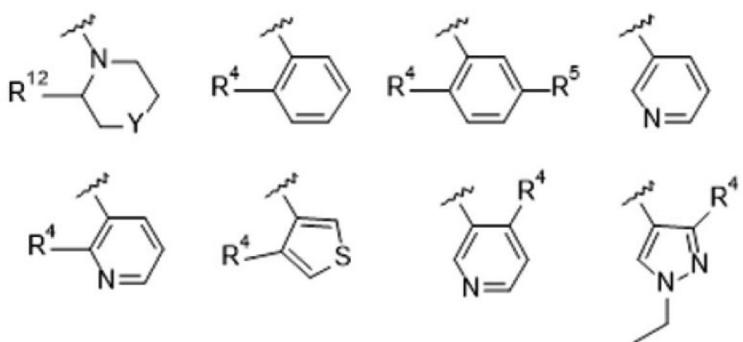
からなる群から選択される、請求項1に記載のプロセス。

【請求項12】

20

R³は、

【化5】



30

からなる群から選択され、

式中、

Yは、CH₂、Oおよび結合からなる群から選択され；

R⁴は、CF₃、クロロ、シクロプロピルおよびメチルからなる群から選択され；

R⁵は、フルオロであり；ならびに

R¹²は、水素、シクロプロピル、メチル、1-メトキシ-1-メチル-エチルおよびCF₃からなる群から選択される、

40

請求項1に記載のプロセス。

【請求項13】

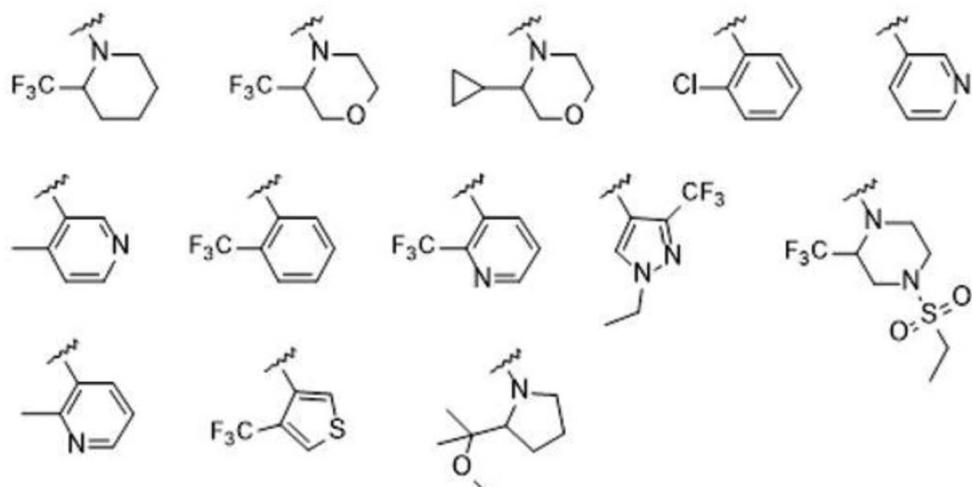
R¹は、H、メチル、メトキシ、メトキシメチル、N,N-ジメチルアミノ、1-ピロリジニルおよびシクロプロピルからなる群から選択され；

R²は、水素であり；ならびに

R³は、

50

【化6】



10

からなる群から選択される、
請求項1に記載のプロセス。

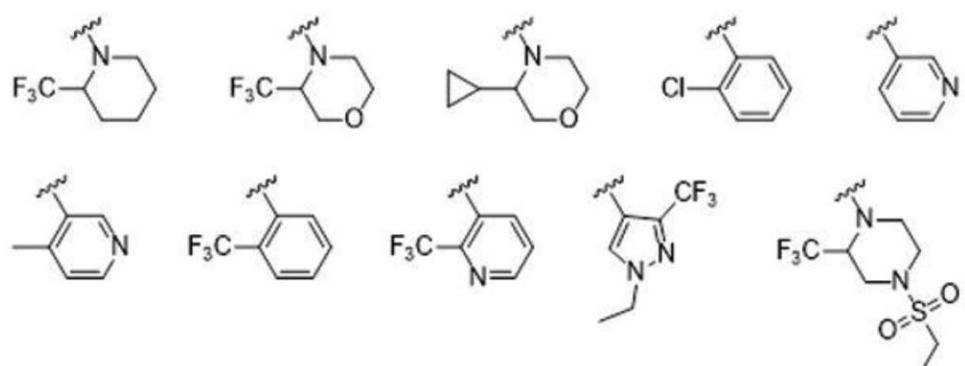
【請求項14】

R¹は、H、メチル、メトキシ、メトキシメチル、N,N-ジメチルアミノ、1-ピロリジニルおよびシクロプロビルからなる群から選択され；

R²は、水素であり；ならびに

R³は、

【化7】



30

からなる群から選択される、
請求項1に記載のプロセス。

【請求項15】

前記化合物は、

N-[4-[2-(2-クロロフェニル)-6-オキソ-1H-ピリジン-4-イル]-2-ピリジル]アセトアミド；
4-(2-アミノ-4-ピリジル)-6-(3-ピリジル)-1H-ピリジン-2-オン；
4-(2-アミノ-4-ピリジル)-6-(2-クロロフェニル)-1H-ピリジン-2-オン；
N-[4-[2-(2-クロロフェニル)-6-オキソ-1H-ピリジン-4-イル]-2-ピリジル]-2-メトキシ-アセトアミド；
N-[4-[2-オキソ-6-[2-(トリフルオロメチル)-1-ピペリジル]-1H-ピリジン-4-イル]-2-ピリジル]アセトアミド；

40

50

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] シクロプロパンカルボキサミド ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [3 - (トリフルオロメチル) モルホリン - 4 - イル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - (2 - クロロフェニル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - [1 - エチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 4 - イル] - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - (4 - メチル - 3 - ピリジル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - [1 - エチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 4 - イル] - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [3 - (トリフルオロメチル) モルホリン - 4 - イル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] カルバミン酸メチル ;

N - [4 - [2 - (3 - シクロプロピルモルホリン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - [4 - 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] - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - (2 - メチル - 3 - ピリジル) - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - チエニル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

1 , 1 - ジメチル - 3 - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] ウレア ;

N - [4 - [2 - オキソ - 6 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] ピロリジン - 1 - カルボキサミド ;

N - [4 - [2 - [2 - (1 - メトキシ - 1 - メチル - エチル) ピロリジン - 1 - イル] - 6 - オキソ - 1 H - ピリジン - 4 - イル] - 2 - ピリジル] アセトアミド ;

及びその薬剤的に許容可能な塩からなる群から選択される、請求項 1 に記載のプロセス。

【請求項 16】

請求項 1 に記載のプロセスであって：

(a) R^X が F である場合、式 (II) の化合物の転化が、式 (II) の化合物の酸性加水分解を実行することを含み；

(b) R^X が OCH₃ である場合、式 (II) の化合物の転化が、適切な溶媒中ヨウ化トリメチルシリルと式 (II) の化合物との反応、適切な溶媒中 HBr と式 (II) の化合物との反応、適切な溶媒中 BBr₃ と式 (II) の化合物との反応、を含み；

(c) R^X が O C (CH₃)₃ である場合、式 (II) の化合物の転化が、適切な溶媒中トリフルオロ酢酸と式 (II) の化合物との反応を含み；

(d) R^X が OSiR' R'' R''' である場合、式 (II) の化合物の転化が、適切な溶媒中 HCl と式 (II) の化合物との反応、又はテトラヒドロフラン中フッ化テトラブチル

10

20

30

40

50

アンモニウムと式(II)の化合物との反応を含む；
プロセス。

【請求項 17】

R'、R''及びR'''がそれぞれフェニル、メチル及びtert-ブチルからなる群から独立して選択される、請求項1に記載のプロセス。

10

20

30

40

50