

【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 3 年 9 月 30 日 (2021.9.30)

【公表番号】特表 2020-531487 (P2020-531487A)

【公表日】令和 2 年 11 月 5 日 (2020.11.5)

【年通号数】公開・登録公報 2020-045

【出願番号】特願 2020-510099 (P2020-510099)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/43	(2006.01)
A 6 1 K	38/22	(2006.01)
A 6 1 K	38/21	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	471/04	C S P
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	38/43	
A 6 1 K	38/22	
A 6 1 K	38/21	
A 6 1 K	39/395	T
A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/5377	

A 6 1 K 31/4545  
 C 0 7 D 471/04 1 0 6 C  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/496

## 【手続補正書】

【提出日】令和3年8月20日(2021.8.20)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

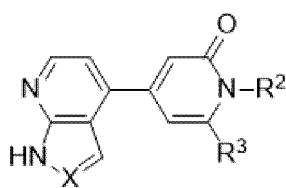
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



I

の化合物であって、前記式 (I) 中、

X は、N または C R<sup>1</sup> であり；

R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、シアノ、フェニル、単環式ヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立してハロ、N - C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、N, N - ジ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルから選択される 1 つ以上の置換基により置換されていてもよく；

R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキルおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルから選択され；

R<sup>3</sup> は、A、フェニルおよび単環式ヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して 1 つ以上の R<sup>4</sup> により置換されていてもよく；

R<sup>4</sup> は、独立して、C O R<sup>5</sup>、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、アミノ、N - C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、N, N - ジ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、1 - ピロリジニル、1 - ピペリジニル、1 - アゼチジニル、N H S O<sub>2</sub> R<sup>6</sup>、S O<sub>2</sub> R<sup>7</sup>、ヒドロキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキルおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルから選択され；

R<sup>5</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、N - C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、N, N - ジ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> 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 - アゼチジニルから選択され；

R<sup>6</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルであり；

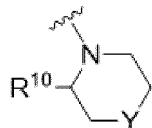
R<sup>7</sup> は、R<sup>8</sup>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、N - C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノ、N, N - ジ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルから選択され、前記 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルおよび前記 C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルは任意で 1 つの R<sup>8</sup> 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；

$R^8$  は、各々任意で 1 つ以上の  $R^9$  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選択され；

$R^9$  は、ハロ、 $N-C_1 \sim C_3$  アルキルアミノ、 $N, N$ -ジ $C_1 \sim C_3$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ $C_1 \sim C_3$  アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルおよび  $C_1 \sim C_3$  アルキルから選択され；

A は、

【化 2】



であり；

$R^{10}$  は、水素、ハロゲン、 $COR^{11}$ 、 $C_1 \sim C_6$  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、フェニルおよびヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して 1 つ以上の  $R^{12}$  により置換されていてもよく、但し、 $R^{10}$  がフェニルまたはヘテロアリールである場合、X は N または CH であり；

$R^{11}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、 $N-C_1 \sim C_3$  アルキルアミノ、 $N, N$ -ジ $C_1 \sim C_3$  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-アゼチジニルから選択され；

Y は、 $CH_2$ 、S、SO、 $SO_2$ 、 $HR^{13}$ 、 $NCOR^7$ 、 $NCOOR^{14}$ 、 $NSO_2R^7$ 、 $NCOCH_2R^7$ 、O、または結合であり；

$R^{12}$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、ハロゲン、 $N-C_1 \sim C_3$  アルキルアミノ、 $N, N$ -ジ $C_1 \sim C_3$  アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシおよび  $C_1 \sim C_3$  アルコキシから選択され；

$R^{13}$  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選択され；

$R^{14}$  は、 $R^8$ 、 $C_1 \sim C_6$  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  $R^8$  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化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 2】

$R^2$  は、水素または  $C_1 \sim C_3$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 3】

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、シアノ、フェニル、ヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して  $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、ハロ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルおよび  $C_1 \sim C_3$  アルキルから選択される 1 つ以上の置換基により置換されていてもよい、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

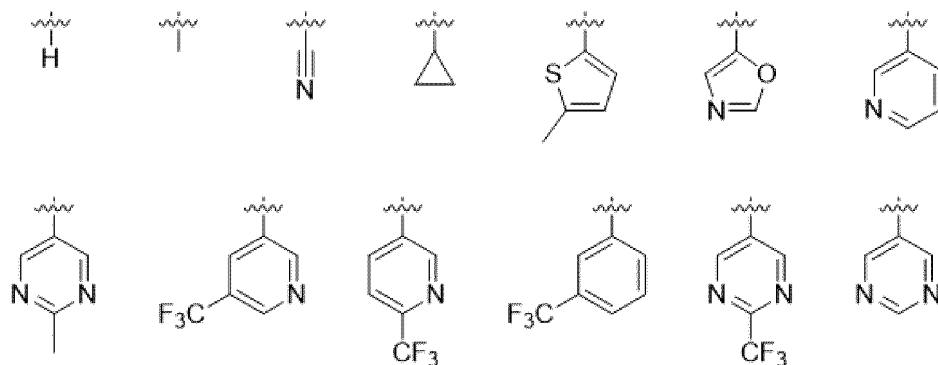
【請求項 4】

$R^1$  における前記ヘテロアリールは、ピリジル、オキサゾリル、チエニル、およびピリミジニルから選択され、各々は任意で独立してハロ、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_3$  フルオロアルキルおよび  $C_1 \sim C_3$  アルキルから選択される 1 つ以上の置換基により置換されていてもよい、請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 5】

R<sup>1</sup> は、

## 【化 3】

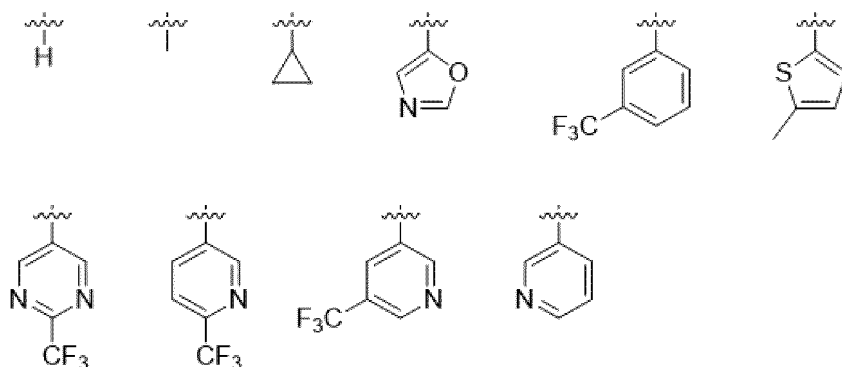


から選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 6】

R<sup>1</sup> は、

## 【化 4】



から選択される、請求項 1、2 または 5 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 7】

R<sup>3</sup> 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単環式ヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して 1 つまたは 2 つの R<sup>4</sup> により置換されていてもよい、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 8】

R<sup>3</sup> は、A、フェニルならびにピリジル、チエニルおよびピラゾリルから選択される単環式ヘテロアリールから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して 1 つまたは 2 つの R<sup>4</sup> により置換されていてもよい、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 9】

R<sup>3</sup> は、A、フェニルならびにピリジルから選択され、前記フェニルおよび前記ピリジルは任意で独立して 1 つまたは 2 つの R<sup>4</sup> により置換されていてもよい、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 10】

R<sup>4</sup> は、フルオロ、クロロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> フルオロアルキルおよび SO<sub>2</sub> R<sup>7</sup> から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 11】

Y は、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{NSO}_2\text{R}^7$ 、O または結合である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 12】

$\text{R}^{10}$  は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$  シクロアルキル、フェニル、単環式ヘテロアリールおよび  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  ハロアルキルから選択され、前記フェニルおよび前記ヘテロアリールは任意で独立して 1 つの  $\text{R}^{12}$  により置換されていてもよく；ならびに

$\text{R}^{12}$  は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキル、シクロプロピル、 $\text{CF}_3$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  ハロアルコキシおよび  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルコキシから選択される、

請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 13】

$\text{R}^7$  は、 $\text{R}^8$ 、N, N - ジ  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキルアミノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキルおよびメトキシ  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキルから選択され、前記  $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキルは任意で 1 つの  $\text{R}^8$  により置換されていてもよい、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 14】

$\text{R}^7$  は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$  アルキルおよびフルオロフェニルから選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

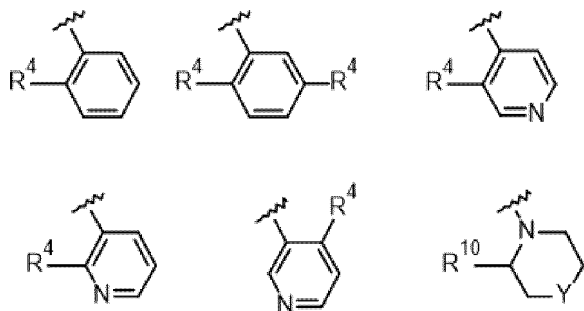
【請求項 15】

$\text{R}^8$  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選択され、各々は任意でシクロプロピル、メチルおよびフルオロから選択される 1 つ以上の置換基により置換されていてもよい、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 16】

$\text{R}^3$  は、

【化 5】

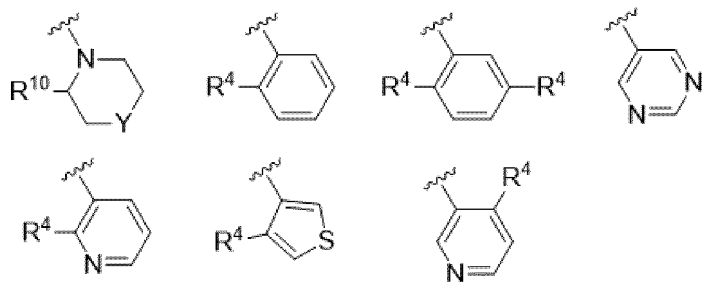


から選択される、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【請求項 17】

$\text{R}^3$  は、

## 【化 6】



から選択され；

Y は、 $\text{CH}_2$ 、O および結合から選択され；

$\text{R}^4$  は、 $\text{CF}_3$ 、フルオロおよびクロロ、シクロプロピルおよびメチルから選択され；  
ならびに

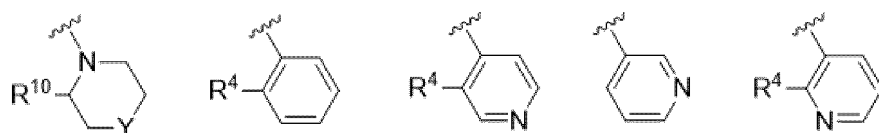
$\text{R}^{10}$  は、シクロプロピル、メチル、フルオロフェニル、クロロフェニル、メトキシフェニルおよび  $\text{CF}_3$  から選択される、

請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 18】

$\text{R}^3$  は、

## 【化 7】



から選択され；

Y は、 $\text{CH}_2$ 、O、 $\text{NSO}_2\text{R}^7$  および結合から選択され；

$\text{R}^4$  は、 $\text{CF}_3$ 、フルオロ、シクロプロピルおよびメチルから選択され；ならびに

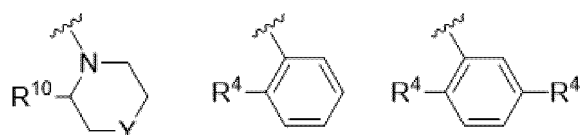
$\text{R}^{10}$  は、水素、フェニル、シクロプロピル、メチルおよび  $\text{CF}_3$  から選択される、

請求項 1 ～ 16 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 19】

$\text{R}^3$  は、

## 【化 8】



から選択され；

Y は、 $\text{CH}_2$ 、O および結合から選択され；

$\text{R}^4$  は、 $\text{CF}_3$ 、シクロプロピル、フルオロおよびクロロから選択され；ならびに

$\text{R}^{10}$  は、 $\text{CF}_3$  またはシクロプロピルである、

請求項 1 ～ 17 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

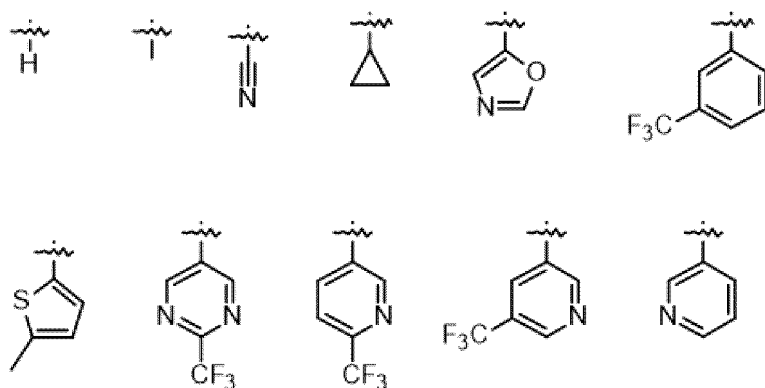
## 【請求項 20】

X は、N である、請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

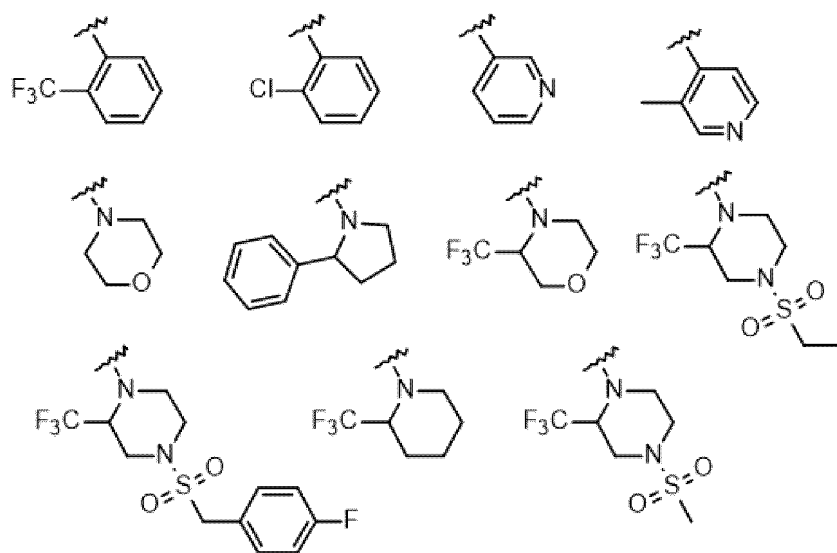
## 【請求項 21】

X は、 $\text{CR}^1$  である、請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

【化 9】

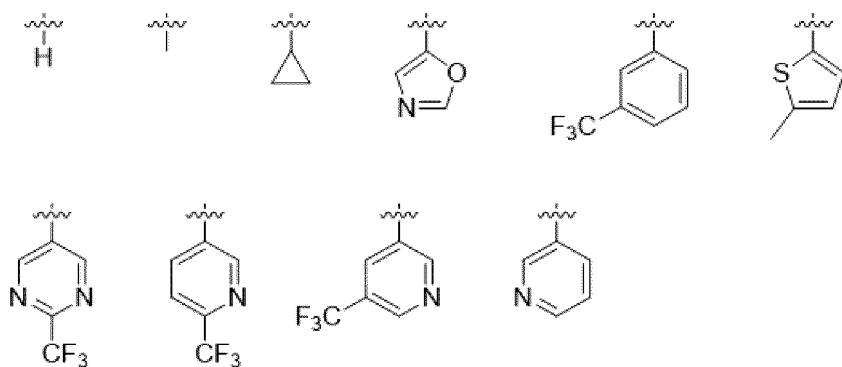


【化 1 0】



$R^1$  は、

## 【化 1 1】

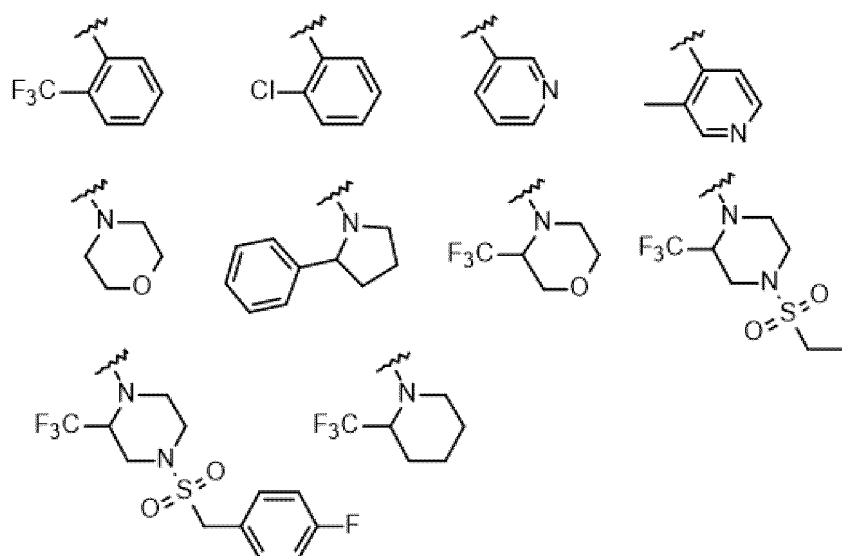


から選択され、

$R^2$  は、水素であり；および

$R^3$  は、

## 【化 1 2】



から選択される、

請求項 1 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

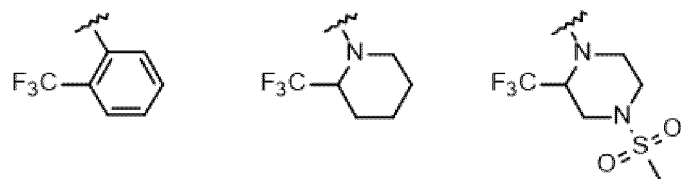
## 【請求項 2 4】

X は、N であり、

$R^2$  は、水素であり；および

$R^3$  は、

## 【化 1 3】



から選択される、

請求項 1 に記載の化合物；またはその薬剂的に許容可能な塩。

## 【請求項 2 5】

前記化合物は、

- 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - ( 3 - メチル - 4 - ピリジル ) - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - ( 2 - フェニルピロリジン - 1 - イル ) - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - ( 3 - ピリジル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - モルホリノ - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 - オキサゾール - 5 - イル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - [ 2 - ( 3 - ピリジル ) - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 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 - 2 - オン ;
- 6 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) モルホリン - 4 - イル ] - 4 - [ 2 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - [ 2 - ( 5 - メチル - 2 - チエニル ) - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 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 - 2 - オン ;
- 4 - ( 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) ピリミジン - 5 - イル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 4 - ( 2 - シクロプロピル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 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 ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - [ 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 ] - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - 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 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;
- 6 - [ 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 ] - 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

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 ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 2 - カルボニトリル ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

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 ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 2 - カルボニトリル ;

4 - ( 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

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 ] - 4 - ( 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

またはその薬剂的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

前記化合物は、

4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - ( 3 - メチル - 4 - ピリジル ) - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - ( 2 - フェニルピロリジン - 1 - イル ) - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - ( 3 - ピリジル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - モルホリノ - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 - オキサゾール - 5 - イル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - [ 2 - ( 3 - ピリジル ) - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 2 - メチル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 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 - 2 - オン ;

6 - [ 3 - (トリフルオロメチル) モルホリン - 4 - イル ] - 4 - [ 2 - [ 3 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - [ 2 - ( 5 - メチル - 2 - チエニル ) - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 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 - 2 - オン ;

4 - ( 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 2 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 5 - イル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1

H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - [ 2 - (トリフルオロメチル) - 1 - ピペリジル ] - 4 - [ 2 - [ 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル ] - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 6 - [ 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 ] - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

6 - [ 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 ] - 4 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - 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 - ( 1 H - ピロロ [ 2 , 3 - b ] ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

またはその薬剂的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

疾病を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 28】

がんを治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 29】

がんを治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有し、前記がんは、トリプルネガティブ乳がんなどの乳がん、膀胱がん、肝がん、子宮頸がん、膵がん、白血病、リンパ腫、腎がん、結腸がん、グリオーマ、前立腺がん、卵巣がん、メラノーマ、および肺がんならびに酸素欠乏腫瘍からなる群から選択される、組成物。

【請求項 30】

酸素欠乏腫瘍を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 31】

がんを治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有し、前記がん治療は、放射線療法を更に含む、組成物。

【請求項 32】

2 型糖尿病治療を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 33】

疾病を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩を含有し、前記疾病は、炎症性疾患、自己免疫疾患、神経変性疾患、心血管障害およびウイルス感染からなる群から選択される、組成物。

【請求項 34】

がん治療のための薬物の製剤における、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の使用。

【請求項 35】

がんは、トリプルネガティブ乳がんなどの乳がん、膀胱がん、肝がん、子宮頸がん、膵がん、白血病、リンパ腫、腎がん、結腸がん、グリオーマ、前立腺がん、卵巣がん、メラノーマ、および肺がんならびに酸素欠乏腫瘍である、前記がん治療のための薬物の製剤における、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の使用。

【請求項 36】

酸素欠乏腫瘍の治療のための薬物の製剤における、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記

載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の使用。

【請求項 37】

2 型糖尿病治療のための薬物の製剤における、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の使用。

【請求項 38】

炎症性疾患、自己免疫疾患、神経変性疾患、心血管障害およびウイルス感染から選択される、疾病の治療のための薬物の製剤における、請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の使用。

【請求項 39】

請求項 1 ~ 26 のいずれか一項に記載の化合物、もしくはその薬剂的に許容可能な塩、ならびに薬剂的に許容可能な希釈剤、担体および / または賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 40】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬剂的に許容可能な塩の治療有効量、ならびにアルキル化剤、代謝拮抗薬、抗がんカンプトテシン誘導体、植物由来抗がん薬、抗生物質、酵素、白金配位錯体、チロシンキナーゼ阻害薬、ホルモン、ホルモン拮抗薬、モノクローナル抗体、インターフェロン、および生物応答調節剤から選択される別の抗がん薬を含む医薬組成物。