

【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 12 月 18 日(2023.12.18)

【公開番号】特開 2021-98692(P2021-98692A)

【公開日】令和 3 年 7 月 1 日(2021.7.1)

【年通号数】公開・登録公報 2021-029

【出願番号】特願 2020-209927(P2020-209927)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14(2006.01)

10

A 61 P 43/00(2006.01)

A 61 K 45/00(2006.01)

A 61 P 29/00(2006.01)

A 61 P 3/00(2006.01)

A 61 P 35/00(2006.01)

A 61 P 37/06(2006.01)

A 61 P 11/06(2006.01)

A 61 P 9/10(2006.01)

A 61 P 31/04(2006.01)

A 61 P 37/08(2006.01)

20

A 61 P 11/02(2006.01)

A 61 P 27/14(2006.01)

A 61 P 1/12(2006.01)

A 61 P 17/00(2006.01)

A 61 P 25/00(2006.01)

A 61 P 19/02(2006.01)

A 61 P 19/08(2006.01)

A 61 P 17/06(2006.01)

A 61 P 3/06(2006.01)

A 61 P 1/16(2006.01)

30

A 61 P 37/02(2006.01)

A 61 P 5/14(2006.01)

A 61 P 1/18(2006.01)

A 61 P 3/10(2006.01)

A 61 P 27/02(2006.01)

A 61 P 1/04(2006.01)

A 61 P 25/02(2006.01)

A 61 P 21/04(2006.01)

A 61 P 3/04(2006.01)

A 61 P 17/10(2006.01)

40

A 61 P 11/00(2006.01)

A 61 K 31/5377(2006.01)

A 61 K 31/506(2006.01)

C 07 D 413/14(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 K 45/00

A 61 P 29/00

A 61 P 3/00

50

A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 9/10 1 0 1	
A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 11/02	
A 6 1 P 27/14	
A 6 1 P 1/12	
A 6 1 P 17/00	10
A 6 1 P 43/00 1 0 5	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 29/00 1 0 1	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 19/08	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 1/16	
A 6 1 P 37/02	
A 6 1 P 5/14	20
A 6 1 P 1/18	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 25/02 1 0 1	
A 6 1 P 21/04	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 17/10	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 K 31/5377	30
A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 413/14 C S P	
A 6 1 P 43/00 1 1 1	

【手続補正書】

【提出日】令和5年12月8日(2023.12.8)

【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

【補正方法】変更

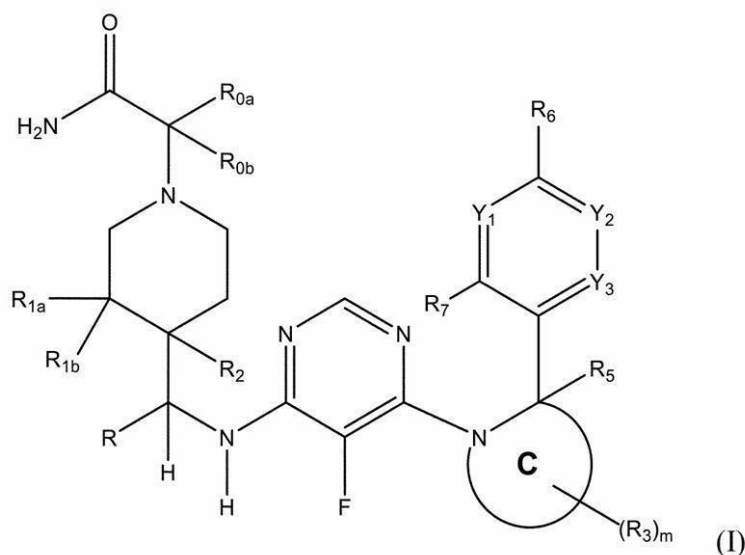
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)による化合物

【化 1】



10

、その立体異性体、又は前記化合物若しくは立体異性体の薬学的に許容される塩（式中、
Y₁、Y₂及びY₃は、独立して、-N-又は-CR₈-であり；

mは、0、1、及び2から独立して選択され；

20

Rは、水素、C₁～6アルキル及びC₁～4ヒドロキシアルキルからなる群から選択され；
R_{0a}及びR_{0b}は独立して、水素、C₁～4アルキル、C₁～4ヒドロキシアルキル、及び
C₁～4ハロアルキルからなる群から選択され；

R_{1a}及びR_{1b}は、独立して、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、アミノ、C₁～4アル
キル、C₁～4ヒドロキシアルキル、及びC₁～4ハロアルキルからなる群から選択され；
R₂は、水素、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、ハロゲン、C₁～4アルキル、C₁～4
ハロアルキル、C₁～4ヒドロキシアルキル、-C(=O)NH₂、-C(=O)OH、
-C(=O)O-C₁～4アルキル、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から
選択され；

環Cは、式Iの化合物においてC環に示される1個のN原子に加えて、N、O及びSから
独立して選択される0、1、又は2個のヘテロ原子を含有する3～10員ヘテロアリシク
リル(heteroalicyclic)環系であり；

30

各R₃は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアルキル、C
1～4ヒドロキシアルキル；及びC₁～4ヒドロキシハロアルキルからなる群から独立し
て選択され；

R₅は存在しないか、水素又はC₁～4アルキルであり；

R₆は、水素、-CN、ハロゲン、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4ヒ
ドロキシアルキル、C₁～4ヒドロキシハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロ
アルコキシ、及び置換又は非置換ヘテロアリールからなる群から選択され；

R₇は、水素、ヒドロキシル、-CN、ハロゲン、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアル
キル、C₁～4ヒドロキシアルキル、C₁～4アルコキシ、及びC₁～4ハロアルコキシか
らなる群から選択され；

40

各R₈は、水素、ヒドロキシル、-CN、ハロゲン、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアル
キル、C₁～4ヒドロキシアルキル、C₁～4アルコキシ、及びC₁～4ハロアルコキシ
からなる群から独立して選択され；且つ

R₇が水素であり、且つ存在する各R₈が水素である場合は常に、R₆は、-CN、ハロ
ゲン、C₁～4アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4ヒドロキシアルキル、C₁～4
ヒドロキシハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、及び置換又は
非置換ヘテロアリールからなる群から選択され；且つ

置換される場合、ヘテロアリールは、C₁～4アルキル、C₁～4ヒドロキシアルキル、

50

C₂ ~ 4 アルケニル、C₂ ~ 4 アルキニル、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルコキシ、シアノ、ハロゲン、C₁ ~ 4 ハロアルキル、C₁ ~ 4 ハロアルコキシ及びC₁ ~ 6 ヒドロキシハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の基で置換される)。

【請求項 2】

R が、水素である、請求項 1 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 3】

R_{0a} が、水素、メチル、-CH₂OH、-CH₂CH₂OH、-CH₂F、及び -CHF₂ からなる群から選択され；且つ R_{0b} が、水素、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ヒドロキシアルキル、及び C₁ ~ 4 ハロアルキルからなる群から選択される、請求項 1 又は 2 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

10

【請求項 4】

R_{1a}、R_{1b} 及び R₂ の少なくとも 1 つが、水素ではない、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 5】

R_{1a} が、ヒドロキシル、フルオロ、及び -CF₃ からなる群から選択され；且つ R_{1b} が、水素、フルオロ、及びメチルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 6】

R_{1b} が、水素である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

20

【請求項 7】

R₂ が、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、-CH₂OH、-CH₂CH₂OH 及び -C(=O)O-C₁ ~ 2 アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 8】

環 C が、4 員ヘテロアリシクリル(heteroalicyclic)、5 員ヘテロアリシクリル(heteroalicyclic)、又は 6 員ヘテロアリシクリル(heteroalicyclic)である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 9】

30

m が、0 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 10】

各 R₃ が独立して、ハロゲン又はメチルであり、且つ m が、1 又は 2 である、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 11】

R₅ が、水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 12】

R₆ が、水素、ハロゲン、C₁ ~ 4 ハロアルキル、C₁ ~ 4 ハロアルコキシ、C₁ ~ 4 ヒドロキシアルキル、C₁ ~ 4 ヒドロキシハロアルキル、及び置換又は非置換 5 員ヘテロアリールからなる群から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

40

【請求項 13】

R₇ が、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、-CF₃、-OCHF₂、-CHF₂ 及び -OCF₃ からなる群から選択される、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 14】

Y₁、Y₂ 及び Y₃ が独立して、それぞれ -CH- であるか；又は Y₁ が -N- であり、且つ Y₂ 及び Y₃ が独立して、それぞれ -CH- であるか；又は Y₂ が -N- であり、且つ Y₁ 及び Y₃ が独立して、それぞれ -CH- であるか；又は

50

Y₃ が - N - であり、且つ Y₁ 及び Y₂ が独立して、それぞれ - C H - であるか；又は Y₃ が - C H - であり、且つ Y₁ 及び Y₂ がそれぞれ - N - である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 15】

Y₁ が - C H - であり、Y₂ 及び Y₃ が独立して、それぞれ - C R₈ - であり、且つ各 R₈ が独立して、水素、メチル、フルオロ、ヒドロキシル及び - C F₃ からなる群から選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 16】

各 R₈ が、水素である、請求項 15 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 17】

R₆ が水素であり、Y₂ 又は Y₃ の少なくとも 1 つが - C R₈ - であり、且つ R₈ が、- C N、ヒドロキシル、ハロゲン、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ハロアルキル、C₁ ~ 4 ヒドロキシアルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ、及び C₁ ~ 4 ハロアルコキシからなる群から選択される、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 18】

R が、水素であり；

R_{0a} 及び R_{0b} が独立して、水素又はメチルであり；

R_{1a} が、水素、フルオロ及びヒドロキシルからなる群から選択され；

R_{1b} が、水素又はフルオロであり；

R₂ が、水素、フルオロ及びヒドロキシルからなる群から選択され；

環 C が、アゼチジニル、ピロリジニル、モルホリニル、2 - アザピシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサニル及び 3 - アザピシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサニルからなる群から選択され；

m が、0、1 及び 2 からなる群から選択され；

R₃ が、水素、フルオロ及びメチルからなる群から選択され；

R₅ が、存在しないか又は水素であり；

R₆ が、水素、- C F₃、- O C F₃ 及び - C l からなる群から選択され；

R₇ が、水素又はフルオロであり；

Y₁、Y₂ 及び Y₃ がそれぞれ、- C H - であるか；又は

Y₁ が - C H - であり、Y₂ が - C H - であり、且つ Y₃ が - C (O H) - であるか；又は

Y₁ が - C H - であり、Y₂ が - C H - であり、且つ Y₃ が - N - であるか；又は

Y₁ が - C H - であり、Y₂ が - C (C F₃) - であり、且つ Y₃ が - C H - であるか；又は

Y₁ が - C H - であり、Y₂ が - N - であり、且つ Y₃ が - C H - である、請求項 1 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 19】

2 - (4 - (((5 - フルオロ - 6 - (3 - (5 - トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) モルホリノ) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロパンアミド、

2 - (4 - (((5 - フルオロ - 6 - (3 - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) モルホリノ) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) アセトアミド、

2 - (4 - (((5 - フルオロ - 6 - (3 - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) モルホリノ) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) - 2 - メチルプロパンアミド、

2 - (4 - フルオロ - 4 - (((5 - フルオロ - 6 - (3 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) モルホリノ) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) アセトアミド、

2 - (4 - (((5 - フルオロ - 6 - (3 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) モルホリノ) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) アセトアミ

10

20

30

40

50

2 - (4 - ((5 - フルオロ - 6 - (3 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル)

50

2 - (3 , 3 - ジフルオロ - 4 - ((5 - フルオロ - 6 - (3 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェニル)モルホリノ)ピリミジン - 4 - イル)アミノ)メチル)ピペリジン - 1 - イル)アセトアミド、

2 - (3 , 3 - ジフルオロ - 4 - (((5 - フルオロ - 6 - (2 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピロリジン - 1 - イル)ピリミジン - 4 - イル)アミノ)メチル)ピペリジン - 1 - イル)アセトアミド、及び

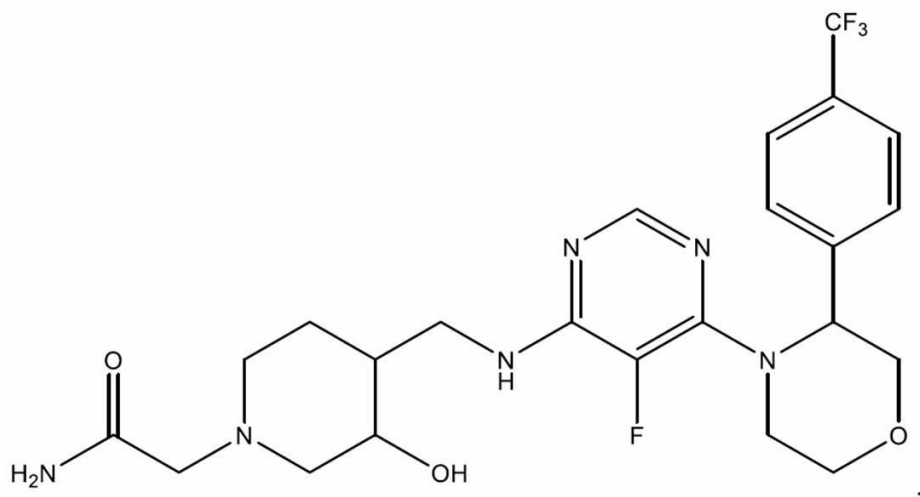
2 - (4 - (((6 - (4 , 4 - ジフルオロ - 2 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピロリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル)アミノ)メチル) - 3 , 3 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル)アセトアミド

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

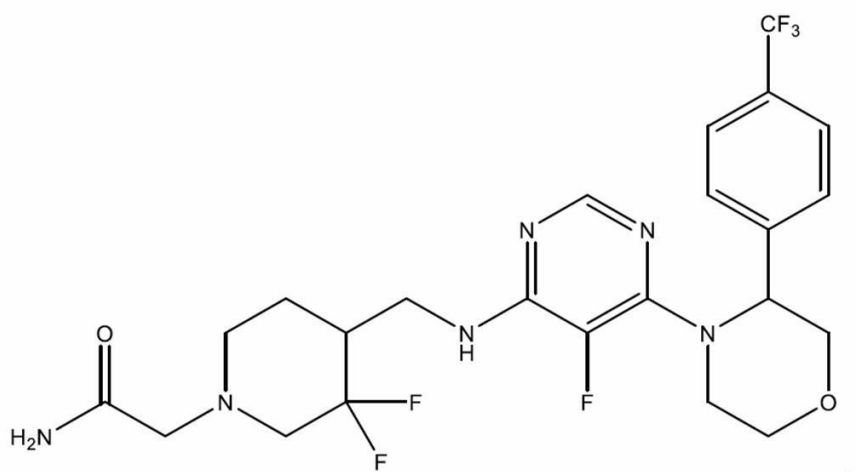
【請求項 20】

【化 3 - 1】

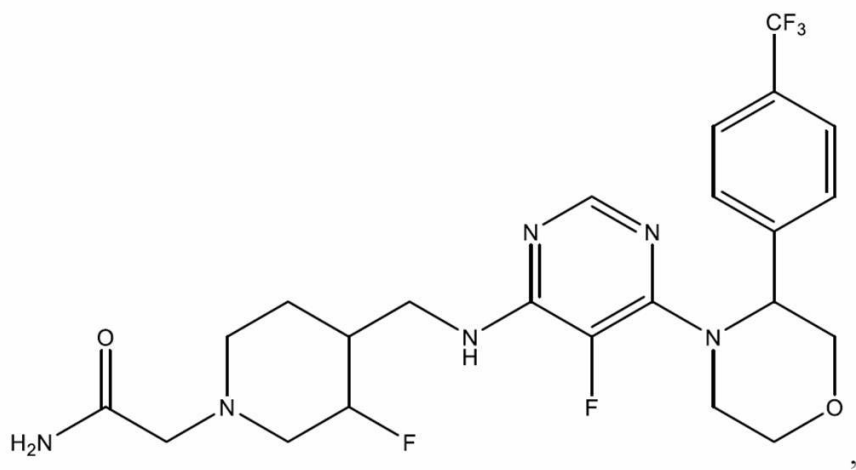
10



20



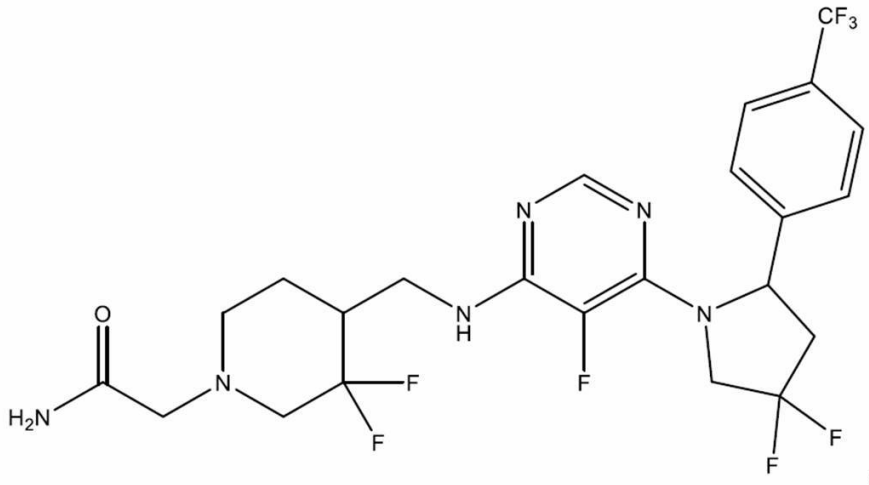
30



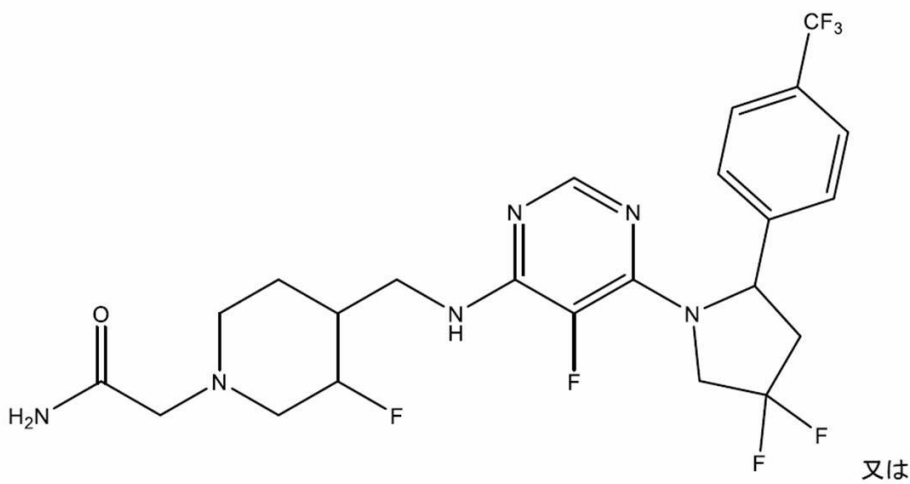
40

50

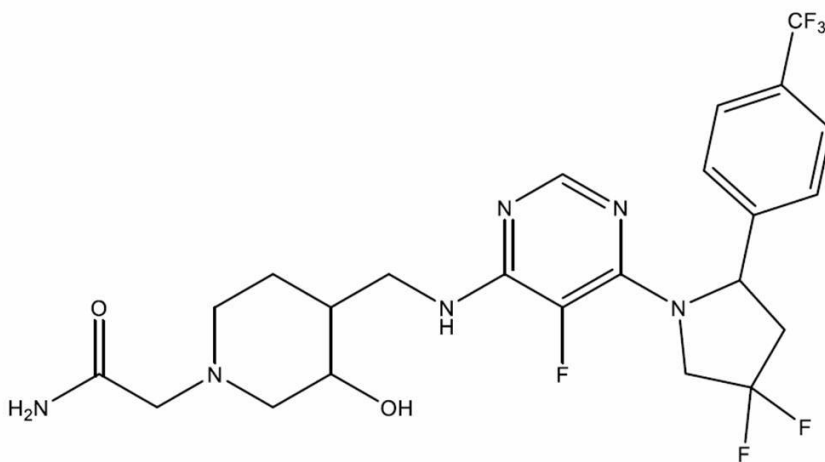
【化 3 - 2】



10



20



30

40

の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、立体異性体、又は塩。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物、立体異性体、若しくは塩を含む、炎症性、代謝性、腫瘍又は自己免疫疾患の治療及び / 又は予防における使用のための医薬組成物。