

【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2020-531485(P2020-531485A)

【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2020-510087(P2020-510087)

【国際特許分類】

C 07 D 413/04	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 35/00	(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 9/00	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 413/04	C S P
C 07 D 413/14	
A 61 K 31/5377	
A 61 P 35/00	
A 61 P 3/10	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/02	
A 61 P 25/00	
A 61 P 9/00	
A 61 P 31/12	
A 61 K 45/00	
A 61 P 43/00	1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月23日(2021.8.23)

【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

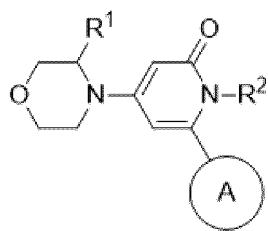
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



I

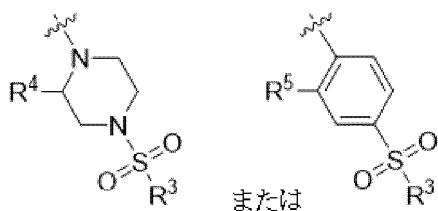
の化合物であって、前記式(I)中、

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】



であり；

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ていてもよく；

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、シクロプロピルの1つ以上により置換されていてもよく；

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、任意で各々1つ以上のR⁷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、C₃～C₆シクロアルキル、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；

化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【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に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項3】

R¹は、メチルである、請求項1または2に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 4】

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 1～3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 5】

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 1 つによりメタ置換されていてもよい；

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 1～4 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 6】

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 1～5 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 7】

R⁴ および R⁵ は、トリフルオロメチルである、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物；またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 8】

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、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 9】

R⁶ は、任意で各々 1 つ以上の R⁷ により置換されていてもよいフェニル、ピリジル、モルホリニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、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 1～8 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 10】

R⁶ は、任意で各々 1 つ以上の R⁷ により置換されていてもよいフェニル、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 1～9 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

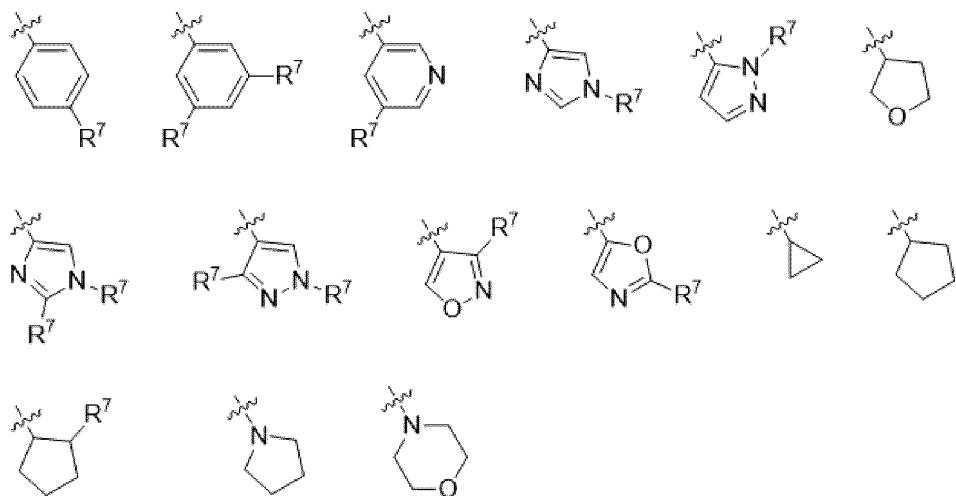
【請求項 11】

R⁶ は、任意で各々 1 つ以上の R⁷ により置換されていてもよいフェニル、ピリジル、ピロリジニル、ピラゾリル、テトラヒドロフリルから選択される、請求項 1～10 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 12】

R⁶ は、

【化 3】

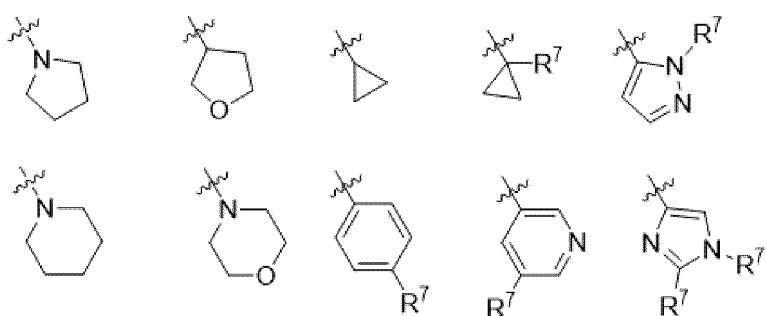


から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

R⁶ は、

【化 4】

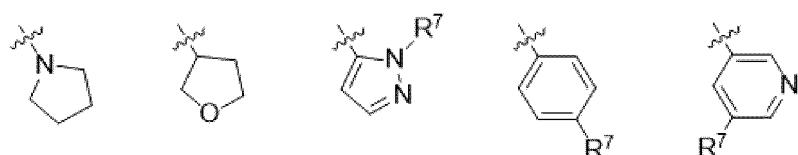


から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 1 4】

R⁶ は、

【化 5】

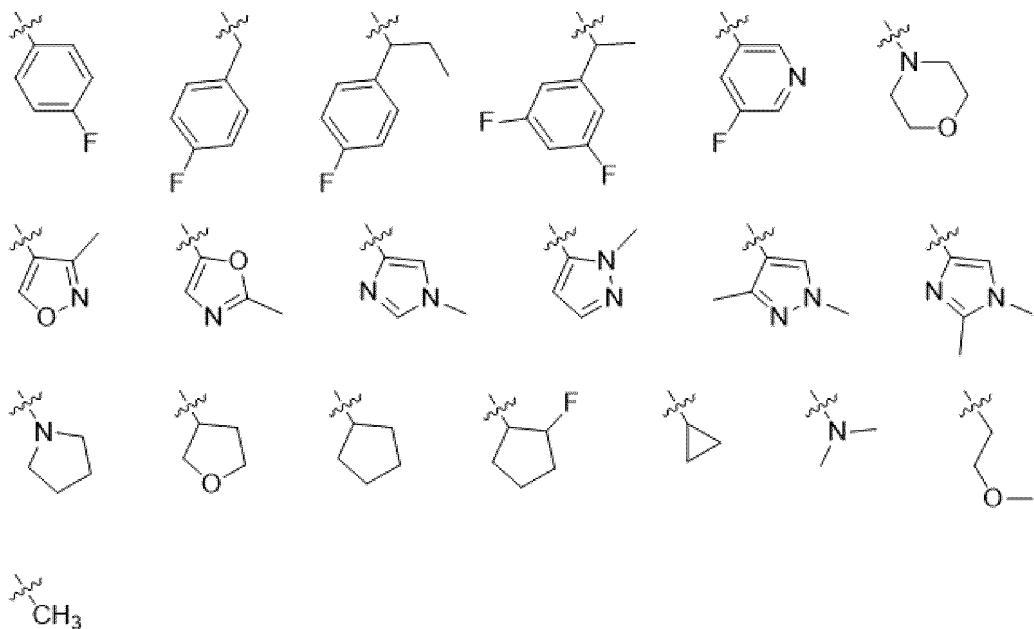


から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項または請求項 1 2 に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

R³ は、

【化6】

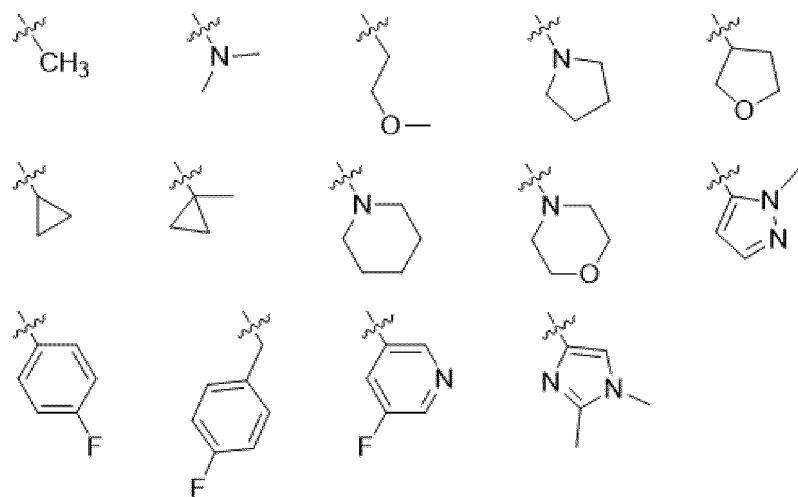


から選択される、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項16】

R^3 は、

【化7】

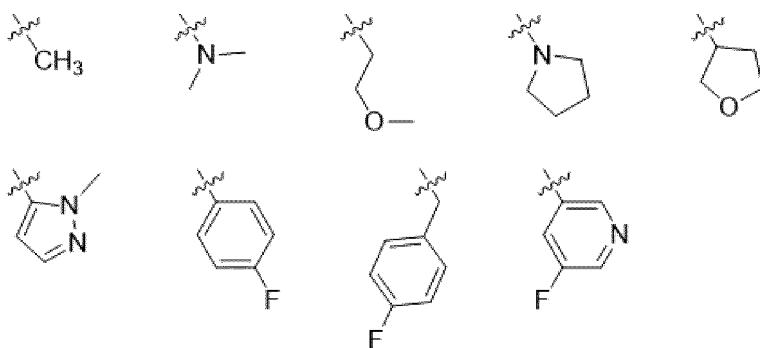


から選択される、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項17】

R^3 は、

【化 8】

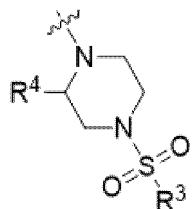


から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 18】

A は、

【化 9】

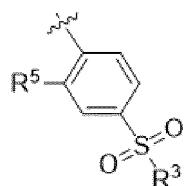


である、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 19】

A は、

【化 10】



である、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

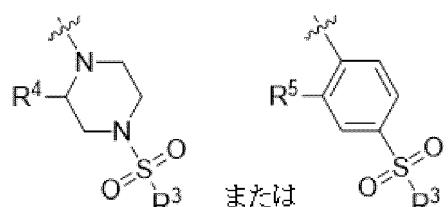
【請求項 20】

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；

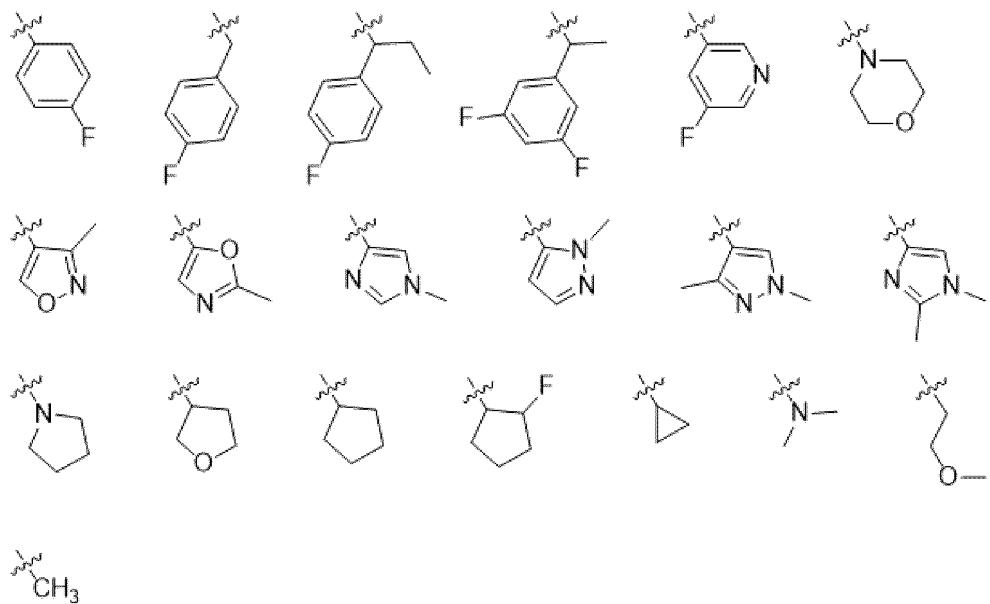
A は、

【化 11】



であり、

R^3 は、
【化 1 2】



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

【請求項 2 1】

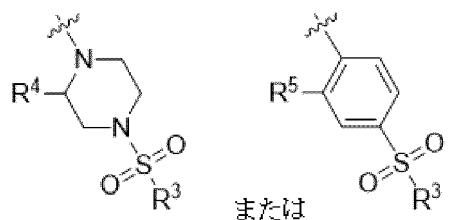
R^1 は、メチルであり；

R^2 は、水素であり；

R^4 および R^5 は、 CF_3 であり；

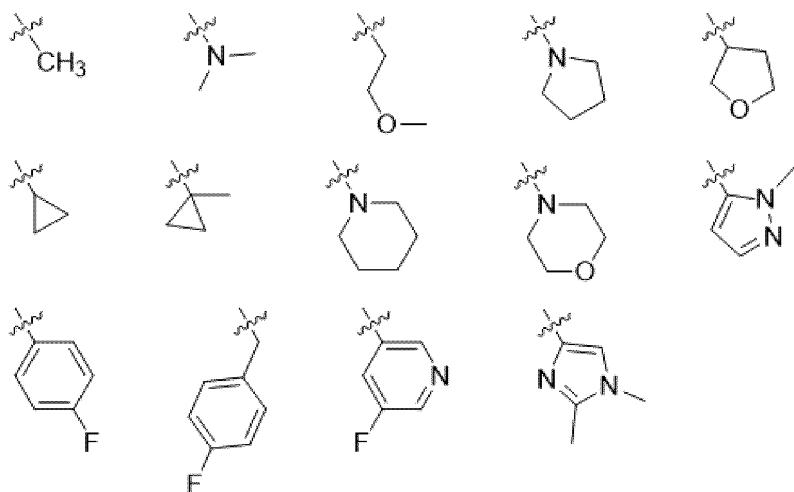
A は

【化 1 3】



であり、 R^3 は、

【化14】



から選択される、請求項1に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項22】

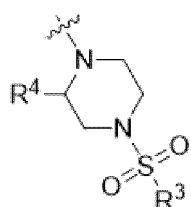
R¹は、メチルであり；

R²は、水素であり；

R⁴は、CF₃であり；

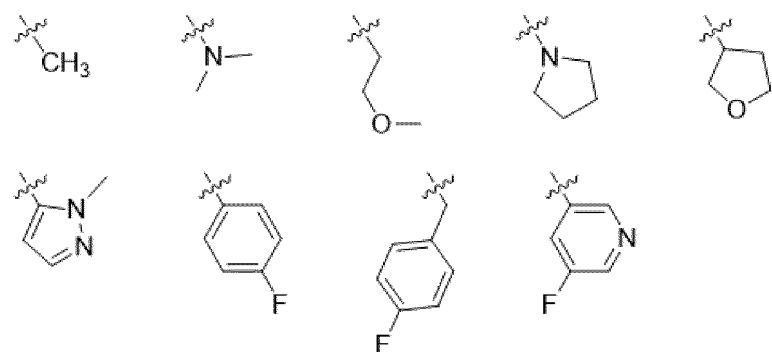
Aは

【化15】



であり、R³は、

【化16】



から選択される、請求項1に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項23】

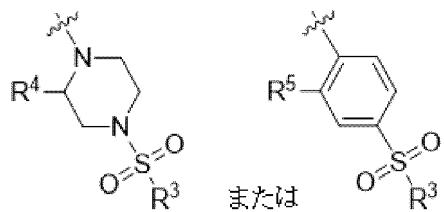
R¹は、メチルまたはシクロプロピルであり；

R²は、水素であり；

R⁴およびR⁵は、CF₃であり；

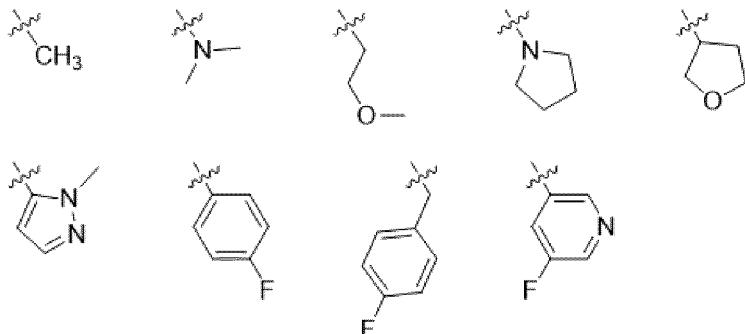
Aは

【化17】



であり、R³は、

【化18】



から選択される、請求項1に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項24】

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；

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 - デメチル - 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；

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 - 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；
 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である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 25】

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；
 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；
 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 - 2 - オン；
 である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩。

【請求項 26】

疾病を治療または予防するための組成物であって、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項 27】

がんを治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤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1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤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、肺がん、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29】

がんを治療するための組成物であって、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤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30】

2型糖尿病を治療するための組成物であって、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項31】

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、疾病を治療するための組成物であって、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項32】

酸素欠乏腫瘍を治療するための組成物であって、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩を含有する、組成物。

【請求項33】

がん治療のための薬物の製剤における、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の使用。

【請求項34】

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、肺がん、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選択される、がん治療のための薬物の製剤における、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の使用。

【請求項35】

2型糖尿病治療のための薬物の製剤における、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の使用。

【請求項36】

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患の治療のための薬物の製剤における、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の使用。

【請求項37】

請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩、ならびに薬剤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38】

請求項1に記載の化合物、またはその薬剤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。