

【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】平成23年7月7日(2011.7.7)

【公表番号】特表2010-530380(P2010-530380A)
 【公表日】平成22年9月9日(2010.9.9)
 【年通号数】公開・登録公報2010-036
 【出願番号】特願2010-512555(P2010-512555)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 207/337 (2006.01)
 A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/727 (2006.01)
 A 6 1 K 31/616 (2006.01)
 A 6 1 P 7/02 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 C 0 7 D 403/12 (2006.01)
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)
 C 0 7 D 405/04 (2006.01)
 C 0 7 D 401/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 C 0 7 D 207/34 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 207/337 C S P
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 31/727
 A 6 1 K 31/616
 A 6 1 P 7/02
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 31/496
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 405/04
 C 0 7 D 401/06
 A 6 1 K 31/454
 C 0 7 D 207/34
 A 6 1 K 31/4025
 C 0 7 D 401/12

【手続補正書】
 【提出日】平成23年5月23日(2011.5.23)
 【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

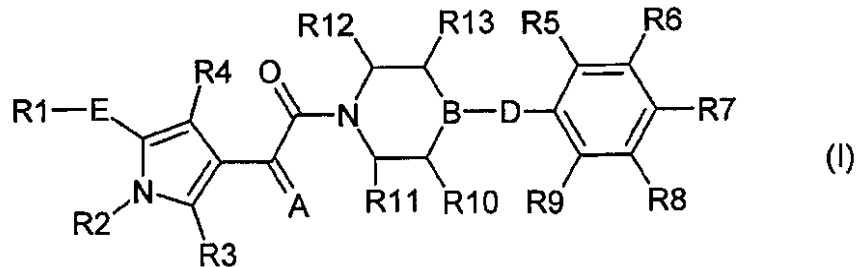
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

全ての立体異性体の形態、および任意の比率のそれらの混合物の、式 I の化合物

【化 1】



[式中、

R 1 は、 1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₈) - アルキル、

3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル (ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または互いに独立して、ハロゲンで一、二もしくは三置換されている)、

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、非置換であるか、または互いに独立して、R 15 で一、二もしくは三置換されている)、または

5) - (C₀ - C₄) - アルキレン - ヘテロシクリル (ここで、ヘテロシクリルは、単環式または二環式であり、3 ~ 15 個の環炭素原子を含み、ここで該環炭素原子のうち 1 つまたはそれ以上が窒素、硫黄または酸素から選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子によって置換されており、またここで該ヘテロシクリルは、非置換であるか、または互いに独立して、R 14 で一、二もしくは三置換されている) であり；

E は、 1) 共有結合、

2) - NH - C (O) - または

3) - O - C (O) - であり、

R 2 は、 1) 水素原子または

2) - (C₁ - C₈) - アルキルであり、

R 3 は、 1) - (C₁ - C₈) - アルキル、

2) - C F₃、または

3) - (C₁ - C₈) - アルキレン - C (O) - O - R 16 であり、

R 4 は、 1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₈) - アルキル、

3) - (C₁ - C₈) - アルキレン - C (O) - O - R 16、

4) - (C₂ - C₆) - アルケニレン - C (O) - O - R 16、

5) - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - C (O) - O - R 16、または

6) ハロゲンであり、

A は、酸素原子または N - OH から選択され、

B は、窒素原子または CH から選択され、

D は、 1) 共有結合、

2) - C (O) - または

3) - CH₂ - であり、

R 5、R 6、R 7、R 8 および R 9 は、互いに独立して以下から選択され：

- 1) 水素原子、
- 2) - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または互いに独立して、ハロゲンで一、二もしくは三置換されている)、
- 3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - O - R 1 6、
- 4) ハロゲン、
- 5) - (C₀ - C₄) - アルキレン - O - (C₁ - C₈) - アルキレン - O - R 1 6、
- 6) - NO₂、
- 7) - CN、
- 8) - (C₀ - C₄) - アルキレン - N (R 1 6) - R 1 7、
- 9) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - R 1 6、
- 10) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - O - R 1 6、
- 11) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - N (R 1 6) - R 1 7、
- 12) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - O - R 1 6、
- 13) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - N (R 1 6) - R 1 7、
- 14) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₁₅) - ヘテロシクリル (ここで、ヘテロシクリルは、非置換であるか、または互いに独立して、R 1 4で一、二もしくは三置換されている)、もしくは

15) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₁₅) - ヘテロシクリル (ここで、ヘテロシクリルは、非置換であるか、または互いに独立して、R 1 4で一、二もしくは三置換されている) であるか、または、

R 5とR 6もしくはR 6とR 7は、それらが結合している原子と一緒に5員、6員または7員の炭素環 (ここで、該炭素環は、芳香族であって部分的に不飽和であるかまたは飽和している)、もしくは該5～7個の環炭素原子のうち1つ、2つもしくは3つは、窒素、酸素もしくは硫黄のようなヘテロ原子によって置換されている炭素環を形成し、かつここで炭素環は非置換であるか、もしくはR 1 5で1、2、3もしくは4回置換されており、

R 1 0、R 1 1、R 1 2およびR 1 3は、互いに独立して以下：

- 1) 水素原子、
- 2) - (C₁ - C₈) - アルキル、
- 3) = O、または
- 4) - OH、から選択され、

R 1 4は、ハロゲン、- OH、= O、- (C₁ - C₈) - アルキル、- O - (C₁ - C₈) - アルキル、- CF₃、- O - CF₃、- NO₂、- CNまたは- NH₂であり、

R 1 5は、ハロゲン、- OH、- (C₁ - C₈) - アルキル、- O - (C₁ - C₈) - アルキル、- CF₃、- O - CF₃、- NO₂、- CN、- C (O) OH、- C (O) O - (C₁ - C₈) - アルキル、- C (O) NH₂または- NH₂であり、

R 1 6は、水素原子、- (C₁ - C₈) - アルキルもしくは- (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキルであり、

R 1 7は、水素原子もしくは- (C₁ - C₈) - アルキルであるか、または

R 1 7とR 1 6は、それらが結合する窒素原子と一緒に5員、6員もしくは7員の炭素環 (ここで、該炭素環は、不飽和であるかもしくは飽和している)、もしくは該5～7個の環炭素原子のうち1つ、2つもしくは3つが窒素、酸素もしくは硫黄のようなヘテロ原子で置換されている炭素環を形成し、かつここで炭素環は非置換であるか、もしくはR 1 5で1、2、3もしくは4回置換されている]

およびこれらの生理学的に許容される塩。

【請求項2】

請求項1に記載の式Iの化合物であって、ここで式Iの化合物は以下である：

- 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタン - 1, 2 - ジオン、
- 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - (4 - フェニル

(2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] ジオキシ - 6 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 3 - (3 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 2 - イル) - プロピオン酸、
 2 - (3 - { 4 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペラジン - 1 - イル } - フェノキシ) - アセトアミド、
 (3 - { 4 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペラジン - 1 - イル } - フェノキシ) - 酢酸エチルエステル、
 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - { 4 - [3 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - ピペラジン - 1 - イル } - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - { 4 - [3 - (2 - メトキシ - エトキシ) - フェニル] - ピペラジン - 1 - イル } - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [2 - メチル - 5 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イル) - 1 H - ピロール - 3 - イル] - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタン - 1, 2 - ジオン、
 3 - { 4 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペラジン - 1 - イル } - 安息香酸エチルエステル、
 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - (4 - m - トリル - ピペリジン - 1 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル] - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル] - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (3 - アミノ - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 3 - { 1 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - ベンゾニトリル、
 3 - { 1 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - 安息香酸メチルエステル、
 1 - [4 - (3 - プロモ - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (4 - フルオロ - 3 - ニトロ - フェニル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 3 - { 1 - [2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - オキソ - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - 安息香酸、
 1 - [4 - (4 - メトキシ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (4 - フルオロ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (2, 4 - ジクロロ - ベンジル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (4 - クロロ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、
 1 - [4 - (4 - メチル - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1, 2 - ジオン、

- 1 - [4 - (3 - メチル - ベンゾイル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチル - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - [4 - (3 - メチル - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - [4 - (4 - プロモ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - [4 - (3 - クロロ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 2 - (2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - (2 - メチル - 5 - ピリジン - 2 - イル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 1 - (2 - メチル - 5 - ピリジン - 3 - イル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタン - 1 , 2 - ジオン、
- 3 , 5 - ジメチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸エチルエステル、
- 3 , 5 - ジメチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸、
- [(3 , 5 - ジメチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 1 H - ピロール - 2 - カルボニル) - アミノ] - 酢酸エチルエステル、
- 4 - { 2 - [4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 (フラン - 2 - イルメチル) - アミド、
- 4 - { 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 (フラン - 2 - イルメチル) - アミド、
- 4 - { 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸シクロプロピルメチル - アミド、
- 4 - { 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸プロピルアミド、
- 4 - { 2 - [4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸シクロプロピルメチル - アミド、
- 4 - { 2 - [4 - (3 - クロロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸シクロプロピルアミド、
- 4 - { 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 (ピリジン - 3 - イルメチル) - アミド、
- 3 , 5 - ジメチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸プロピルアミド、
- 3 , 5 - ジメチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 (フラン

- 2 - イルメチル) - アミド、

4 - { 2 - [4 - (3 - クロロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 (フラン - 2 - イルメチル) - アミド、

4 - { 2 - [4 - (3 - クロロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - アセチル } - 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸シクロプロピルメチル - アミド、

1 - (4 - ブロモ - 2 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エタン - 1 , 2 - ジオン、

(E) - 3 - (5 - メチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 2 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - アクリル酸メチルエステル、または

(E) - 3 - (5 - メチル - 4 - { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - アセチル } - 2 - フェニル - 1 H - ピロール - 3 - イル) - アクリル酸。