

【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20年10月30日 (2008.10.30)

【公表番号】特表2008-516952(P2008-516952A)

【公表日】平成20年5月22日 (2008.5.22)

【年通号数】公開・登録公報2008-020

【出願番号】特願2007-536740(P2007-536740)

【国際特許分類】

C 07 D 409/14 (2006.01)

A 61 K 31/4025 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

C 07 D 405/14 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

A 61 K 31/4245 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/36 (2006.01)

A 61 P 1/08 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 5/50 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 409/14 C S P

A 61 K 31/4025

C 07 D 417/14

A 61 K 31/427

C 07 D 405/14

C 07 D 413/14

A 61 K 31/4245

A 61 P 43/00 1 1 3

A 61 P 25/00

A 61 P 3/04

A 61 P 25/28

A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 1/08
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 5/50
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月10日(2008.9.10)

【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

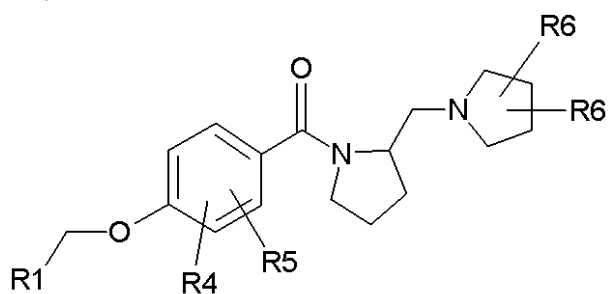
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

【化1】

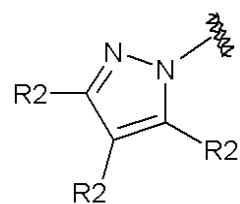


(I)

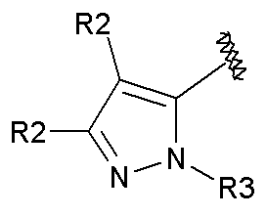
[式中、

R 1 は、独立して、

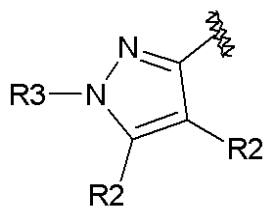
【化2】



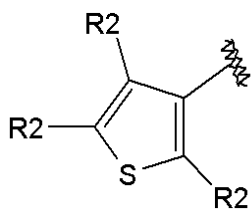
【化 3】



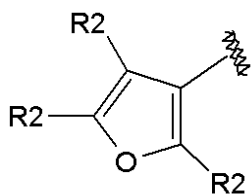
【化 4】



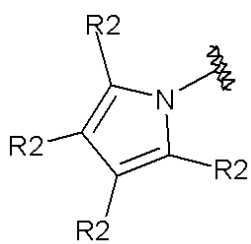
【化 5】



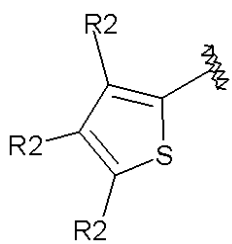
【化 6】



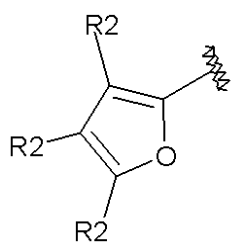
【化 7】



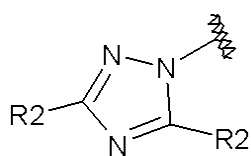
【化 8】



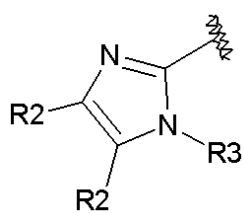
【化 9】



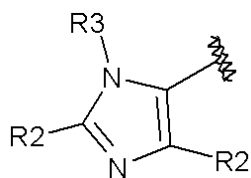
【化 1 0】



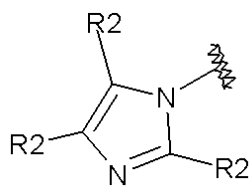
【化 1 1】



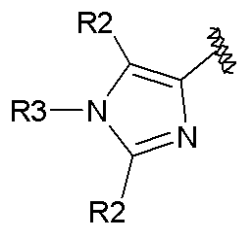
【化 1 2】



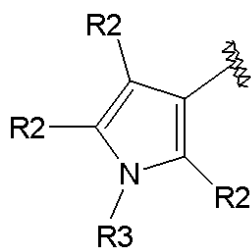
【化 1 3】



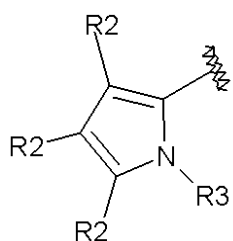
【化 1 4】



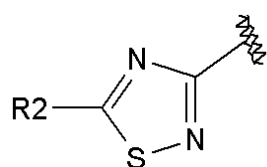
【化 1 5】



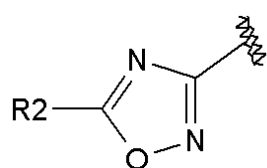
【化 1 6】



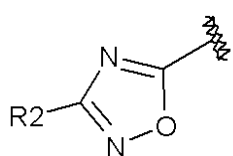
【化 1 7】



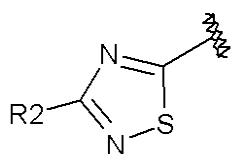
【化 1 8】



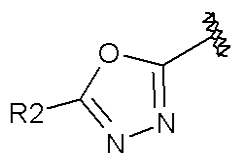
【化 1 9】



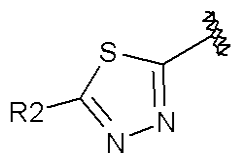
【化 2 0】



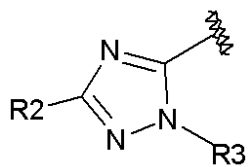
【化 2 1】



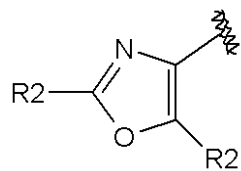
【化 2 2】



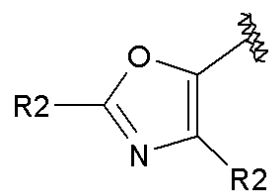
【化 2 3】



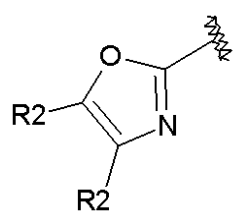
【化 2 4】



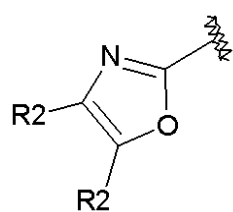
【化 2 5】



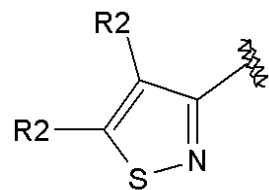
【化 2 6】



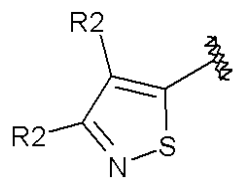
【化 2 7】



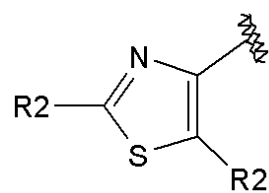
【化 2 8】



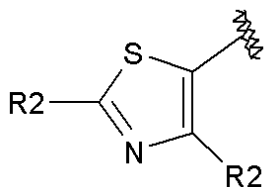
【化 2 9】



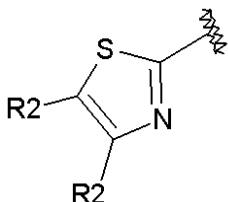
【化 3 0】



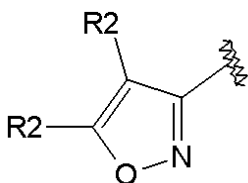
【化 3 1】



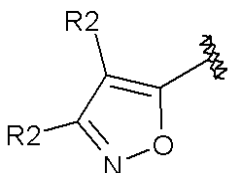
【化 3 2】



【化 3 3】

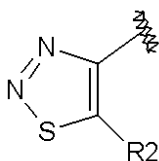


【化 3 4】



又は、

【化 3 5】



であり、

ジグザグラインに示される結合は、式 I における R 1 によって示される位置への付着位置を示し、

R 2 は、各々独立して、- H、- ハロゲン、- (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、- CN、- C (O) R 7、- C (O) OR 7、- CO (O) Li、- C (O) (C₃ - C₅) シクロアルキル、- C (O) NR 7 R 8、- OCF₃、- OR 7、- NO₂、- NR 7 R 8、- NR 9 SO₂ R 7、- NR 9 C (O) R 7、- NR 9 CO₂ R 7、- NR 9 C (O) NR 7 R 8、- SR 7、- SO₂ R 7、- SO₂CF₃、- SO₂NR 7 R 8、又は - S (O) R 7 であり、

R 3 は、各々独立して、- H、- (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、- SO₂ R 7、- C (O) R 7、- C (O) NR 7 R 8、又は - C (O) OR 7 であり、

R 4 及び R 5 は、独立して - H、- OH、- ハロゲン、- (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、又は - OR 9 であり、

R 6 は、各々独立して、- H、- ハロゲン、- (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、- NH₂、- NR 7 R 8、- OH、又は - OR 7 であり、

R 7 及び R 8 は、各々独立して、- H 又は - (C₁ - C₇) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される) であり、R 7 及び R 8 は、それらが付着する原子と結合して 4 ~ 6 員環を形成でき、

R 9 は、各々独立して、- H 又は - (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される) である]

で構造的に示される化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 2】

R 4 及び R 5 が - H である、請求項 1 記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 3】

R 4 がハロゲンであり、R 5 が - H である、請求項 1 記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

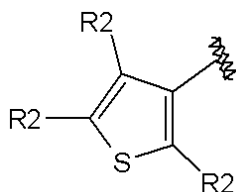
【請求項 4】

R 6 のうち一方が - H であり、他方が - H または - C H₃ である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

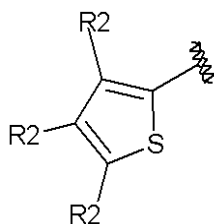
【請求項 5】

R 1 が、

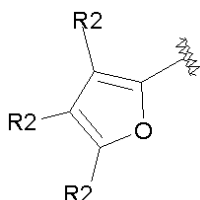
【化 3 6】



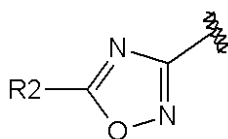
【化 3 7】



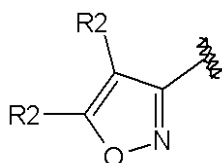
【化 3 8】



【化 3 9】

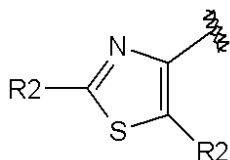


【化 4 0】



、又は、

【化 4 1】



であり、

ジグザグラインに示される結合が、式 I における R 1 によって示される位置への付着位置を示している、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 6】

R 2 が - H、- ハロゲン、- (C ₁ - C ₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、又は - C N である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

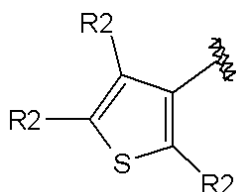
【請求項 7】

R 6 のうち一方が - H であり、他方が - C H ₃ である、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

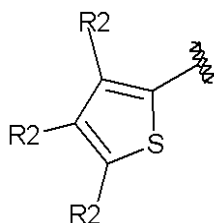
【請求項 8】

R 1 が、独立して、

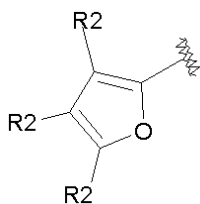
【化 4 2】



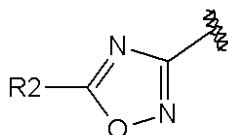
【化 4 3】



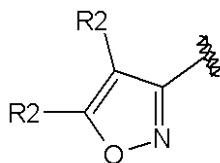
【化 4 4】



【化 4 5】

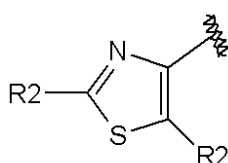


【化 4 6】



、又は、

【化 4 7】



であり、

ジグザグラインに示される結合が、式 I における R 1 によって示される位置への付着位置を示し、

R 2 が、各々独立して、- H、- ハロゲン、- (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される)、又は - CN であり、

R 4 及び R 5 が、独立して、- H 又は - ハロゲンであり、

R 6 のうち一方が - H であり、他方が独立して、- H、- ハロゲン、又は - (C₁ - C₃) アルキル (1 ~ 3 個のハロゲンで任意に置換される) である、請求項 1 に記載の化合物もしくはその立体異性体またはその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 9】

5 - [4 - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - カルボニル) - フェノキシメチル] - チオフェン - 2 - カルボニトリル、

(2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - [4 - (チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、

[4 - (フラン - 2 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、

5 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - カルボニル) - フェノキシメチル] - チオフェン - 2 - カルボニトリル、

[2 , 6 - ジフルオロ - 4 - (チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - [2 (S) - (2 - (R) メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジン - 1 - イル] - メタノン、

[2 , 6 - ジフルオロ - 4 - (チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジン - 1 - イル] - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (2 - メチル - チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S) - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (チオフェン - 3 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S)

- ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、
 [2 - フルオロ - 4 - (チオフエン - 3 - イルメトキシ) - フェニル] - [2 - (S)
 - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジン - 1 - イル] - メ
 タノン、

[2 - フルオロ - 4 - (チオフエン - 2 - イルメトキシ) - フェニル] - (2 - (S)
 - ピロリジン - 1 - イルメチル - ピロリジン - 1 - イル) - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (チオフエン - 2 - イルメトキシ) - フェニル] - [2 - (S)
 - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジン - 1 - イル] - メ
 タノン、

5 - { 3 - フルオロ - 4 - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イ
 ルメチル) - ピロリジン - 1 - カルボニル] - フェノキシメチル} - チオフエン - 2 - カ
 ルボニトリル、

[2 - フルオロ - 4 - (2 - メチル - チアゾール - 4 - イルメトキシ) - フェニル] -
 [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジン - 1
 - イル] - メタノン、

4 - { 3 - フルオロ - 4 - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イ
 ルメチル) - ピロリジン - 1 - カルボニル] - フェノキシメチル} - チオフエン - 2 - カ
 ルボニトリル、

[2 - フルオロ - 4 - ([1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イルメトキシ) - フェ
 ニル] - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリ
 ジン - 1 - イル] - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (5 - メチル - イソオキサゾール - 3 - イルメトキシ) - フェニ
 ル] - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジ
 ン - 1 - イル] - メタノン、

[2 - フルオロ - 4 - (5 - トリフルオロメチル - フラン - 2 - イルメトキシ) - フェ
 ニル] - [2 - (S) (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イルメチル) - ピロリジ
 ン - 1 - イル] - メタノン、及び

5 - { 3 - フルオロ - 4 - [2 - (S) - (2 - (R) - メチル - ピロリジン - 1 - イ
 ルメチル) - ピロリジン - 1 - カルボニル] - フェノキシメチル} - チオフエン - 3 - カ
 ルボニトリルからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬理学的に許
 容できる塩。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物と薬理学的に許容できる担体とを含む医薬組成
 物。