

【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22年12月16日(2010.12.16)

【公表番号】特表2010-506847(P2010-506847A)

【公表日】平成22年3月4日(2010.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2010-009

【出願番号】特願2009-532544(P2009-532544)

【国際特許分類】

C 07 K 5/062 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 K 5/062

A 61 K 37/02

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年10月5日(2010.10.5)

【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

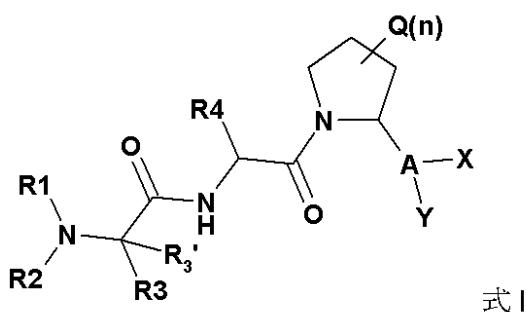
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

【化1】



〔式中、

R<sub>1</sub>は、Hまたはメチルであり；

R<sub>2</sub>は、Hまたはメチルであり；

R<sub>3</sub>およびR<sub>3'</sub>の一方はHであり、他方はメチルであり；

R<sub>4</sub>は、シクロヘキシリルまたはイソプロピルであり；

Aは、非置換であるか、またはメチルもしくはハロで置換されていてもよい、ピリジル、ピリミジニル、インドリル、ベンゾチアゾリルまたはキノリニルであり；

QおよびYは、独立して、H、F、C1、メチル、エチル、t-ブチルまたはイソプロピルであり；

それぞれのnは、独立して、0、1、2、3、4、5、6または7であり；

Xは、非置換であるか、またはハロ、メチル、トリフルオロメチルおよびメトキシから成

る群から独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換されているキノリニル、イソキノリル、ベンゾチアゾリル、ピリジニル、インドリル、2, 3 - ジヒドロインドリル、ベンゾイミダゾリル、ナフチル、ベンゾ [ 1, 3 ] ジオキソリル、ベンゾフラニル、ナフチリジン、ピロロ [ 2, 3 b ] ピリジニル、インダンゾリル (indanzolyl) 、ベンゾトリアゾリル、インダゾリル、2 - オキソベンゾ - オキサゾリルまたはフェニルである] で示される化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R<sub>1</sub> が、メチルであり；  
R<sub>2</sub> が、H であり；  
R<sub>3</sub> および R<sub>3'</sub> の一方が H であり、他方がメチルであり；  
R<sub>4</sub> が、シクロヘキシルまたはイソプロピルであり；  
A が、ピリジルまたはピリミジニルであり；  
n が、0 であり；  
Y が、H、メチルまたは F であり；  
Z が、非置換であるか、またはハロ、メチル、トリフルオロメチルおよびメトキシから成る群から独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換されているベンゾイミダゾリル、ナフチル、ベンゾ [ 1, 3 ] ジオキソリル、2, 3 - ジヒドロインドリル、インドリル、インダゾリルまたはフェニルである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 2 - ( 2, 3 - ジヒドロ - インドル - 1 - イル ) - ピリジン - 4 - イル ] - ピロリジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
2 - メチルアミノ - N - ( 2 - メチル - 1 - { 2 - [ 2 - ( 3 - メチル - インドル - 1 - イル ) - ピリジン - 4 - イル ] - ピロリジン - 1 - カルボニル } - プロピル ) - プロピオニアミド；  
N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - フルオロ - インドル - 1 - イル ) - ピリジン - 4 - イル ] - ピロリジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - { 1 - シクロヘキシル - 2 - [ 2 - ( 5 - インダゾール - 1 - イル - ピリジン - 3 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 - オキソ - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - { 2 - [ 2 - ( 2 - ベンゾイミダゾール - 1 - イル - 3 - フルオロ - ピリジン - 4 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - シクロヘキシル - 2 - オキソ - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - { 1 - [ 2 - ( 2 - ベンゾイミダゾール - 1 - イル - ピリジン - 4 - イル ) - ピロリジン - 1 - カルボニル ] - 2 - メチル - プロピル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - { 2 - [ 2 - ( 5 - ベンゾ [ 1, 3 ] ジオキソール - 5 - イル - ピリジン - 3 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - シクロヘキシル - 2 - オキソ - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - { 1 - シクロヘキシル - 2 - [ 2 - ( 5 - ナフタレン - 2 - イル - ピリジン - 3 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 - オキソ - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド；  
N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 5 - ( 3, 5 - ジメチル - フェニル ) - ピリジン - 3 - イル ] - ピロリジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド； および  
N - { 1 - シクロヘキシル - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 5 - p - トリル - ピリジン - 3 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオニアミド  
から選択される化合物またはそれらの薬学的に許容される塩。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

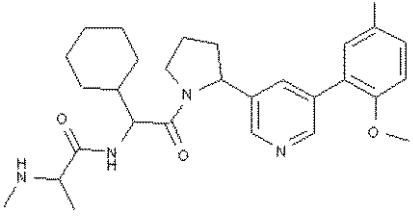
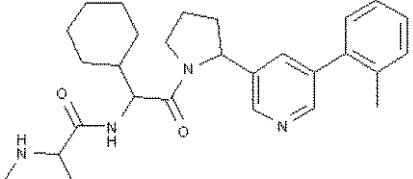
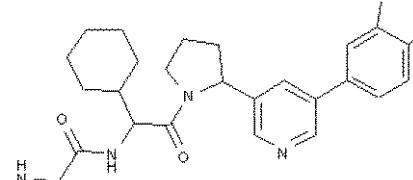
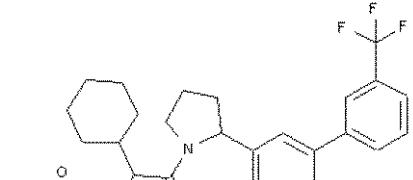
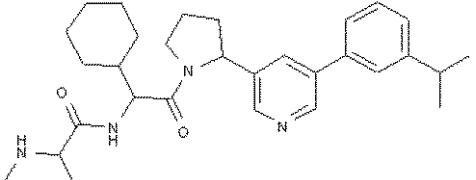
【補正対象項目名】0 0 4 4

【補正方法】変更

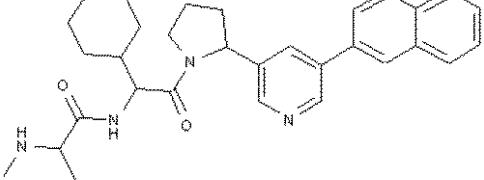
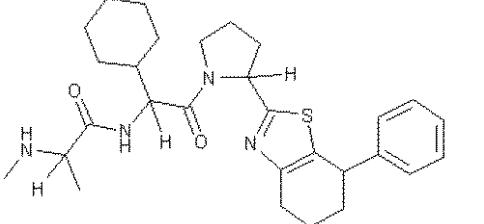
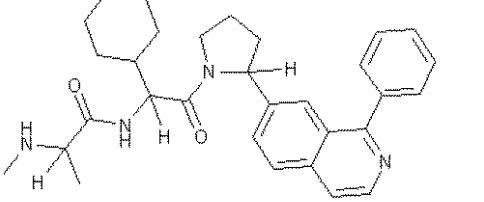
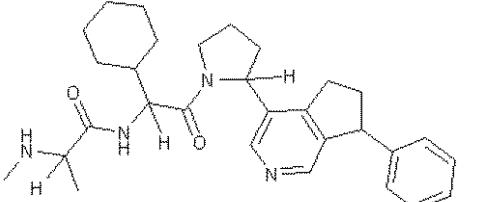
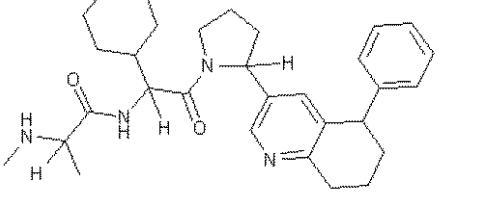
【補正の内容】

【0 0 4 4】

【表13】

	52	N-(2-{2-[5-(5-クロロ-2-メトキシフェニル)-ピリジン-3-イル]-ピロリジン-1-イル}-1-シクロヘキシル-2-オキソエチル)-2-メチルアミノ-プロピオンアミド	514.09
	53	N-{1-シクロヘキシル-2-オキソ-2-[2-(5-0-トリル-ピリジン-3-イル)-ピロリジン-1-イル]-エチル}-2-メチルアミノ-プロピオンアミド	463.84
	54	N-[2-[2-(5-ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イル-ピリジン-3-イル)-ピロリジン-1-イル]-1-シクロヘキシル-2-オキソエチル]-2-メチルアミノ-プロピオンアミド	493.62
	55	N-(1-シクロヘキシル-2-オキソ-2-[2-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-ピリジン-3-イル]-ピロリジン-1-イル]-エチル)-2-メチルアミノ-プロピオンアミド	517.61
	56	N-(1-シクロヘキシル-2-{2-[5-(3-イソプロピルフェニル)-ピリジン-3-イル]-ピロリジン-1-イル}-2-オキソエチル)-2-メチルアミノ-プロピオンアミド	491.69

【表14】

	57	N- { 1 - シクロヘキ シル - 2 - [ 2 - ( 5 - ナフタレン - 2 - イ ル - ピリジン - 3 - イ ル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 - オキソ - エチル } - 2 - メチ ルアミノ - プロピオン アミド	499.67
	58	N- { 1 - シクロヘキ シル - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 7 - フェニ ル - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - ベンゾ チアゾル - 2 - イル ) - ピロリジン - 1 - イ ル ] - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピ オンアミド	509.73
	59	N- { 1 - シクロヘキ シル - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 1 - フェニ ル - イソキノリン - 7 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド	499.67
	60	N- { 1 - シクロヘキ シル - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 7 - フェニ ル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - [ 2 ] ピリ ンジン - 4 - イル ) - ピ ロリジン - 1 - イル ] - エチル } - 2 - メチ ルアミノ - プロピオン アミド	489.68
	61	N- { 1 - シクロヘキ シル - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 5 - フェニ ル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - キノリ ン - 3 - イル ) - ピロ リジン - 1 - イル ] - エチル } - 2 - メチ ルアミノ - プロピオン アミド	503.71

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 5 0

【補正方法】 変更

【補正の内容】

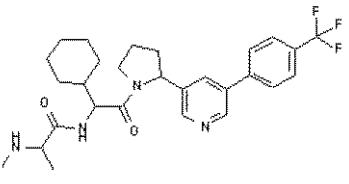
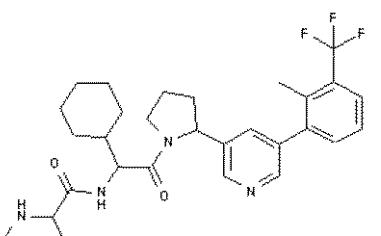
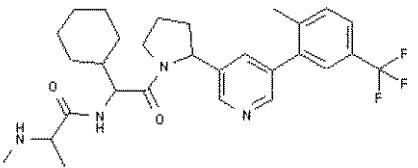
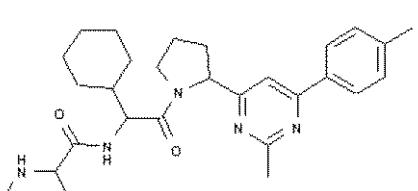
【0 0 5 0】

表 2

【表 2 6】

構造	実 施 例	名前	MS ESI (M+H) <sup>+</sup>
	104	N - { 1 - シクロヘキシリ - 2 - オキソ - 2 - [ 2 - ( 5 - フェニル - ピリジン - 3 - イル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - エチル } - 2 - メチルアミノ - プロピ オンアミド	449.29
	105	N - ( 2 - { 2 - [ 5 - ( 3 - クロロ - フェニル ) - ピリジン - 3 - イル ] - ピ ロリジン - 1 - イル } - 1 - シクロヘキシリ - 2 - オ キソ - エチル ) - 2 - メチ ルアミノ - プロピオンアミ ド	483.25
	106	N - ( 1 - シクロヘキシリ - 2 - { 2 - [ 5 - ( 2 - メトキシ - フェニル ) - ピ リジン - 3 - イル ] - ピロ リジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メ チルアミノ - プロピオンア ミド	479.3
	107	N - ( 1 - シクロヘキシリ - 2 - { 2 - [ 5 - ( 2 - イソプロピル - フェニル ) - ピリジン - 3 - イル ] - ピロリジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プロピオ ンアミド	491.34
	108	N - ( 2 - { 2 - [ 5 - ( 2 - tert - ブチル - フ ェニル ) - ピリジン - 3 - イル ] - ピロリジン - 1 - イル } - 1 - シクロヘキシリ - 2 - オキソ - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プロ ピオンアミド	505.35

【表27】

	109 N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 5 - ( 4 - トリフォルオロ メチル - フェニル ) - ピリ ジン - 3 - イル ] - ピロリ ジン - 1 - イル } - エチル ) - 2 - メチルアミノ - プ ロピオンアミド	517.28
	110 N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 5 - ( 2 - メチル - 3 - トリフォルオロ メチル - フェニル ) - ピリ ジン - 3 - イル ] - ピロリ ジン - 1 - イル } - 2 - オ キソ - エチル ) - 2 - メチ ルアミノ - プロピオンアミ ド	531.29
	111 N - ( 1 - シクロヘキシル - 2 - { 2 - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - トリフォルオロ メチル - フェニル ) - ピリ ジン - 3 - イル ] - ピロリ ジン - 1 - イル } - 2 - オ キソ - エチル ) - 2 - メチ ルアミノ - プロピオンアミ ド	531.29
	112 N - { 1 - シクロヘキシル - 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - 6 - p - トリフォル - ピリミ ジン - 4 - イル ) - ピロリ ジン - 1 - イル ] - 2 - オ キソ - エチル } - 2 - メチ ルアミノ - プロピオンアミ ド	478.32