

【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 0 7 K 5/062 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 5/062

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 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

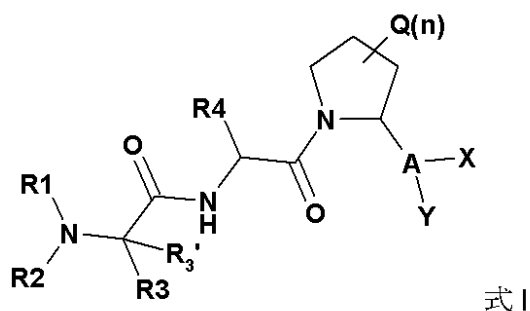
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



〔式中、

R_1 は、H またはメチルであり；

R_2 は、H またはメチルであり；

R_3 および R_3' の一方は H であり、他方はメチルであり；

R_4 は、シクロヘキシ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、Cl、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]ジオキサリル、ベンゾフラニル、ナフチリジン、ピロロ[2, 3b]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】

R₁ が、メチルであり；
R₂ が、H であり；
R₃ および R₃' の一方が H であり、他方がメチルであり；
R₄ 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]ジオキサリル、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дол - 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 - プロピオンアミド；
2 - メチルアミノ - N - (2 - メチル - 1 - {2 - [2 - (3 - メチル - インдол - 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) - プロピオンアミド；
N - (1 - シクロヘキシル - 2 - {2 - [2 - (5 - フルオロ - インдол - 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 - プロピオンアミド；
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 - プロピオンアミド；
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 - プロピオンアミド；
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 - プロピオンアミド；
N - {2 - [2 - (5 - ベンゾ[1, 3]ジオキサール - 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；
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；
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 - プロピオンアミド；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 - プロピオンアミド
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

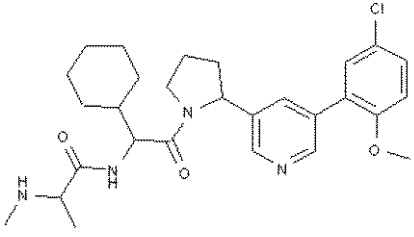
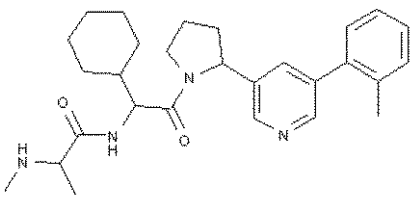
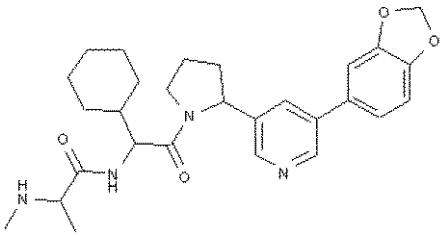
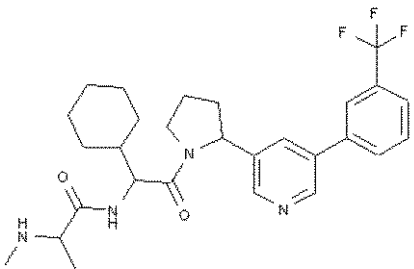
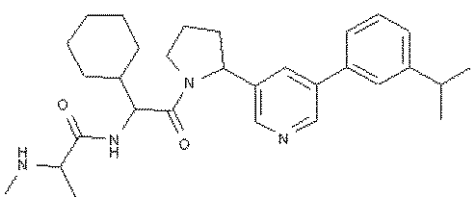
【補正対象項目名】００４４

【補正方法】変更

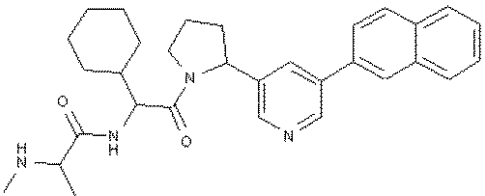
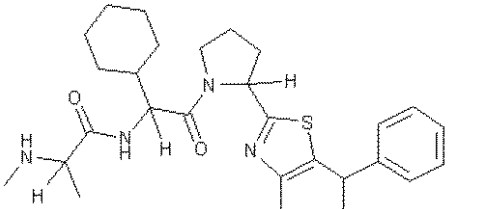
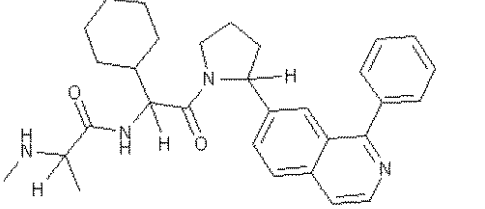
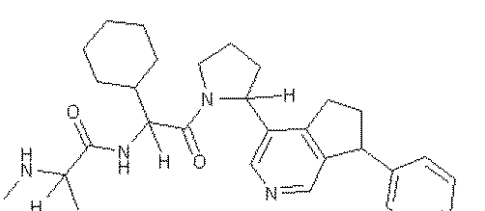
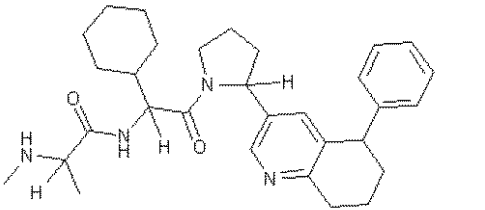
【補正の内容】

【００４４】

【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-オトリル-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 | 463.64 |
|  | 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 1 4】

| | | | |
|---|----|--|--------|
|  | 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

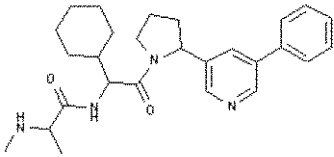
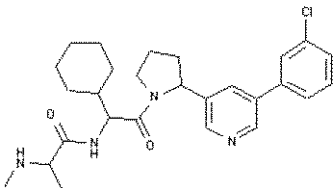
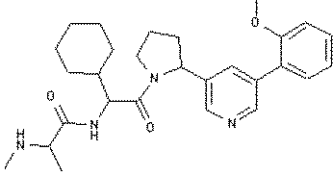
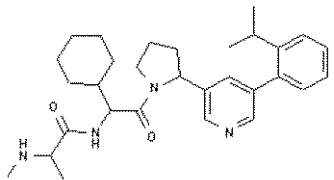
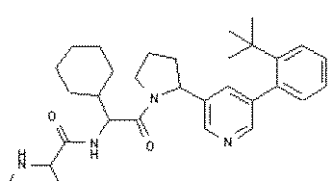
【補正方法】 変更

【補正の内容】

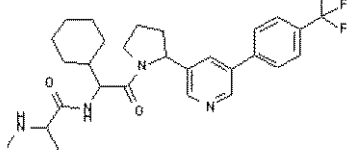
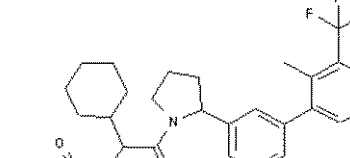
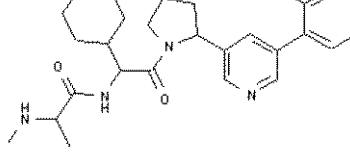
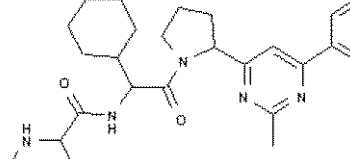
【 0 0 5 0 】

表 2

【表 2 6】

| 構造 | 実施例 | 名前 | MS ESI (M+H) ⁺ |
|---|-----|--|------------------------------|
|  | 104 | N- { 1-シクロヘキシル-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-シクロヘキシル-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-シクロヘキシル-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-シクロヘキシル-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-シクロヘキシル-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-オキソ-2- {2- [5- (4-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 | 517.28 |
|  | 110 | N- (1-シクロヘキシル-2- {2- [5- (2-メチル-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} -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 |