

【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3月21日 (2008.3.21)

【公表番号】特表2007-520528(P2007-520528A)

【公表日】平成19年7月26日 (2007.7.26)

【年通号数】公開・登録公報2007-028

【出願番号】特願2006-551846(P2006-551846)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/14
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 13/02
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/02 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月29日(2008.1.29)

【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

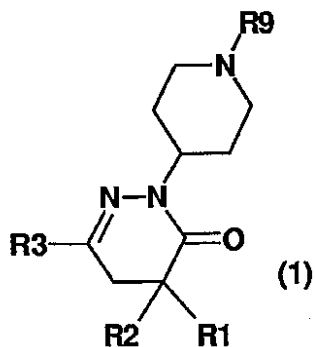
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1

【化1】

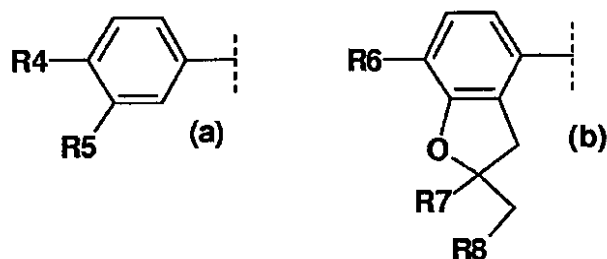


〔式中、

R1は、C₁～C₄-アルキルであり、かつR2は、C₁～C₄-アルキルであり、

R3は、式(a)又は(b)

【化 2】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 5 は、 $C_1 \sim C_8$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、かつ

R 8 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、酸素原子もしくは硫黄原子によって中断されていてよい、スピロ結合した 5 員、6 員又は 7 員の炭化水素環を形成し、

R 9 は、 $-C(O)R10$ 、 $-S(O)_2-R14$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)-R18$ 又は $-C(O)-(CH_2)_m-R21$ であり、

R 10 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $-N(R11)R12$ 、フェニル又は、R 13 により置換されたフェニルであり、

R 11 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 12 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 11 及び R 12 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1, 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 13 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルアミノ又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルオキシであり、

R 14 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $-N(R15)R16$ 、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、

R 15 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 16 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 15 及び R 16 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリ

ジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 1 7 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルアミノ又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルオキシであり、

R 1 8 は、- N (R 1 9) R 2 0 であり、

R 1 9 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 2 0 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 1 9 及び R 2 0 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 2 1 は、- N (R 2 2) R 2 3 であり、

R 2 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 2 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 2 2 及び R 2 3 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環、チオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環、ピロリジン - 2 , 5 - ジオン - 1 - イル環、モルホリン - 3 , 5 - ジオン - 4 - イル環、ピペリジン - 2 , 6 - ジオン - 1 - イル環、4 , 4 - ジメチル - ピペリジン - 2 , 6 - ジオン - 1 - イル環又は 1 - メチル - イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン - 3 - イル環又はイソインドール - 1 , 3 - ジオン - 2 - イル環系を形成し、
n は、1 ~ 4 の整数であり、
m は、1 ~ 4 の整数である] で示される化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 2】

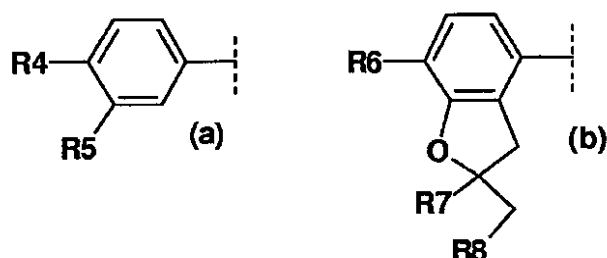
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 3】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 5 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、

R 9 は、 $-C(O)-R 10$ 、 $-S(O)_2-R 14$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)-R 18$ 又は $-C(O)-(CH_2)_m-R 21$ であり、

R 10 は、フェニル又は、R 13 により置換されたフェニルであり、

R 13 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 14 は、 $-N(R 15)R 16$ 、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、

R 15 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 16 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 17 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 18 は、 $-N(R 19)R 20$ であり、

R 19 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 20 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 19 及び R 20 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環又は 4 - チオモルホリニル環を形成し、

R 21 は、 $-N(R 22)R 23$ であり、

R 22 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 23 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 22 及び R 23 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、ピロリジン - 2, 5 - ジオン - 1 - イル環、モルホリン - 3, 5 - ジオン - 4 - イル環、ピペリジン - 2, 6 - ジオン - 1 - イル環、4, 4 - ジメチル - ピペリジン - 2, 6 - ジオン - 1 - イル環又は 1 - メチル - イミダゾリジン - 2, 4 - ジオン - 3 - イル環又はイソインドール - 1, 3 - ジオン - 2 - イル環系を形成し、

n は、1 ~ 4 の整数であり、

m は、1 ~ 4 の整数である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 3】

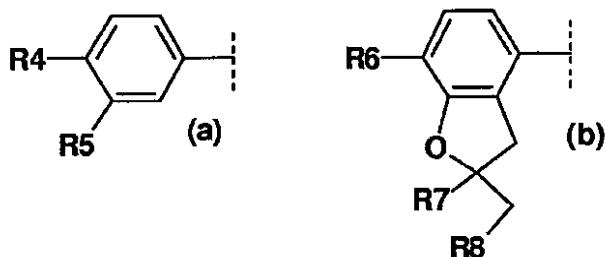
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 4】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 5 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 6 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、

R 9 は、 $-C(O)-R 10$ であり、

R 10 は、フェニル又は、R 13 により置換されたフェニルであり、

R 13 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシである、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 4】

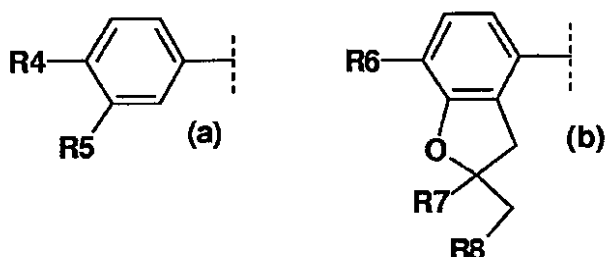
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 5】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 5 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 6 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、

R 9 は、 $-S(O)_2-R 14$ であり、

R 14 は、 $-N(R 15)R 16$ 、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、

R 1 5 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、
 R 1 6 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、
 R 1 7 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシである、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 5】

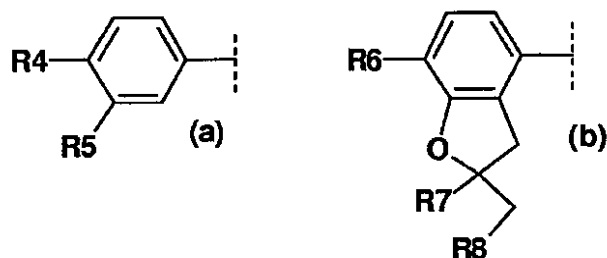
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 6】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 5 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 6 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、

R 9 は、 $-(CH_2)_n-C(O)-R 1 8$ であり、

R 1 8 は、 $-N(R 1 9)R 2 0$ であり、

R 1 9 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 2 0 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 1 9 及び R 2 0 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環又は 4 - チオモルホリニル環を形成し、

n は、1 又は 2 である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 6】

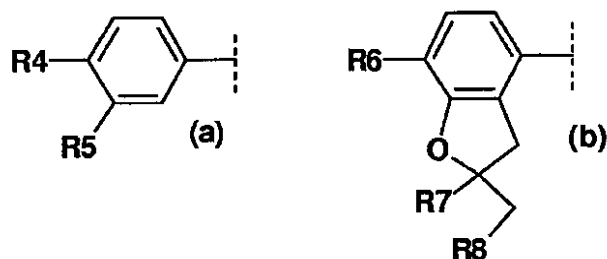
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 7】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 5 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 6 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、

R 9 は、 $-C(O)-(CH_2)_m-R 2 1$ であり、

R 2 1 は、 $-N(R 2 2)R 2 3$ であり、

R 2 2 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 2 3 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R 2 2 及び R 2 3 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1-ピロリジニル環、1-ピペリジニル環、1-ピペラジニル環、1-メチル-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼピニル環、4-モルホリニル環、4-チオモルホリニル環、ピロリジン-2,5-ジオン-1-イル環、モルホリン-3,5-ジオン-4-イル環、ピペリジン-2,6-ジオン-1-イル環、4,4-ジメチル-ピペリジン-2,6-ジオン-1-イル環又は1-メチル-イミダゾリジン-2,4-ジオン-3-イル環又はイソインドール-1,3-ジオン-2-イル環系を形成し、

m は、1 である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 7】

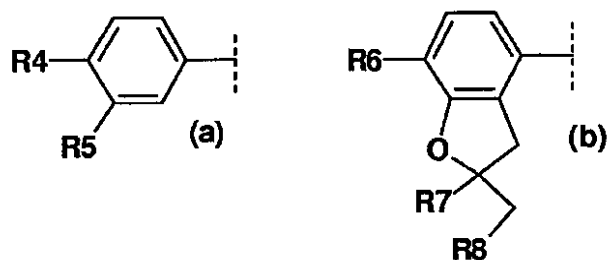
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 8】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 5 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 6 は、メトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は水素であり、

R 9 は、 $-C(O)-R 10$ であり、

R 10 は、フェニル又は、R 13 により置換されたフェニルであり、

R 13 は、メトキシである、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 8】

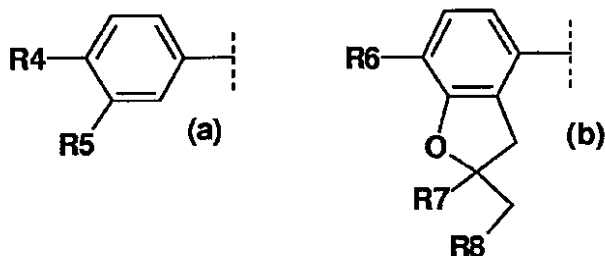
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 9】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 5 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 6 は、メトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であり、

R 9 は、 $-S(O)_2-R 14$ であり、

R 14 は、 $-N(R 15)R 16$ 、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、

R 15 は、メチルであり、

R 16 は、メチルであり、

R 17 は、シアノ、メチル、メトキシ又はトリフルオロメトキシである、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 9】

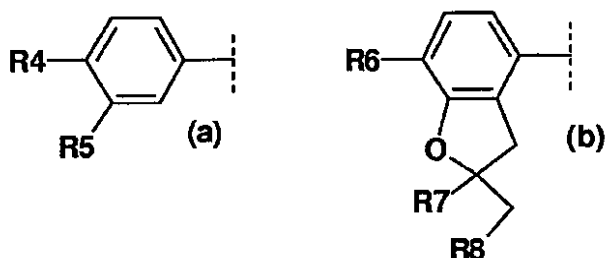
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 10】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 5 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 6 は、メトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であり、

R 9 は、 $-(CH_2)_n-C(O)-R 18$ であり、

R 18 は、 $-N(R 19)R 20$ であり、

R 19 は、水素であり、

R 20 は、水素であるか、又は

R 19 及び R 20 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、4 - モルホリニル環を形成し、

n は、1 又は 2 である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 10】

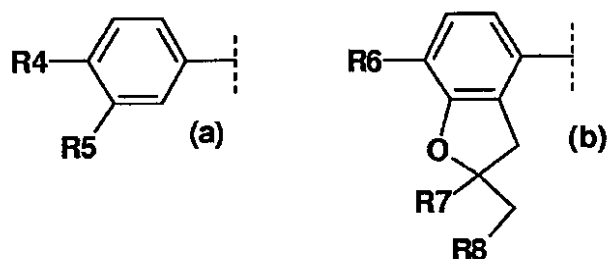
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチル又はエチルであり、

R 2 は、メチル又はエチルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 11】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 5 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 6 は、メトキシであり、

R 7 は、メチルであり、かつ

R 8 は、水素であり、

R 9 は、 $-C(O)-(CH_2)_m-R 21$ であり、

R 21 は、 $-N(R 22)R 23$ であるか、又は

R 22 及び R 23 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - メチル - ピペラジン - 4 - イル環、ピロリジン - 2, 5 - ジオン - 1 - イル環又はモルホリン - 3, 5 - ジオン - 4 - イル環又はイソインドール - 1, 3 - ジオン - 2 - イル環系であり、

m は、1 である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 11】

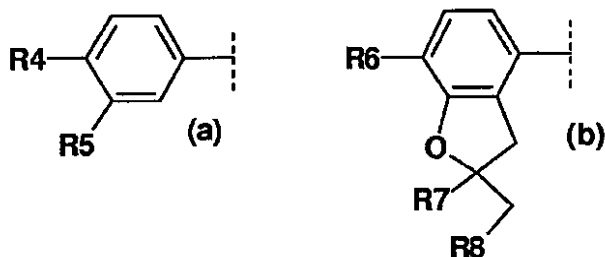
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、かつ

R 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 1 2】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 5 は、 $C_1 \sim C_8$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、かつ

R 8 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、酸素原子もしくは硫黄原子によって中断されていてよい、スピロ結合した 5 員、6 員又は 7 員の炭化水素環を形成し、

R 9 は、 $-C(O)R10$ 、 $-S(O)_2-R14$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)-R18$ 又は $-C(O)-(CH_2)_m-R21$ であり、

R 10 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $-N(R11)R12$ 、フェニル又は、R 13 により置換されたフェニルであり、

R 11 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 12 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 11 及び R 12 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1, 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 13 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルアミノ又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルオキシであり、

R 14 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $-N(R15)R16$ 、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、

R 15 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 16 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 15 及び R 16 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリ

ジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 1 7 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルアミノ又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルオキシであり、

R 1 8 は、- N (R 1 9) R 2 0 であり、

R 1 9 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 2 0 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 1 9 及び R 2 0 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環又はチオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環を形成し、

R 2 1 は、- N (R 2 2) R 2 3 であり、

R 2 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであり、

R 2 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R 2 2 及び R 2 3 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環、チオモルホリン - 1 - オキシド - 4 - イル環、チオモルホリン - 1 , 1 - ジオキシド - 4 - イル環又はピロリジン - 2 , 5 - ジオン - 1 - イル環を形成し、

n は、1 ~ 4 の整数であり、

m は、1 ~ 4 の整数である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 1 2】

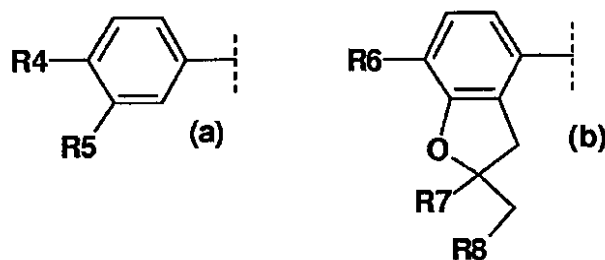
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化 1 3】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

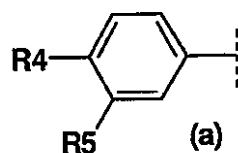
R 5 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、
 R 6 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素により置換されている $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、
 R 7 は、メチルであり、かつ
 R 8 は、水素であるか、又は
 R 7 及び R 8 は、一緒になって、これらが結合される 2 個の炭素原子を含んで、スピロ結合したシクロペンタン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環を形成し、
 R 9 は、 $-S(O)_2-R 14$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)-R 18$ 又は $-C(O)-(CH_2)_m-R 21$ であり、
 R 14 は、フェニル又は、R 17 により置換されたフェニルであり、
 R 17 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、
 R 18 は、 $-N(R 19)R 20$ であり、
 R 19 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、
 R 20 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は
 R 19 及び R 20 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環又は 4 - チオモルホリニル環を形成し、
 R 21 は、 $-N(R 22)R 23$ であり、
 R 22 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、
 R 23 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は
 R 22 及び R 23 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジニル環、1 - ピペリジニル環、1 - ピペラジニル環、1 - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼピニル環、4 - モルホリニル環、4 - チオモルホリニル環又はピロリジン - 2, 5 - ジオン - 1 - イル環を形成し、
 n は、1 ~ 4 の整数であり、
 m は、1 ~ 4 の整数である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 13】

式 1 で示され、その式中、

R 1 は、メチルであり、
 R 2 は、メチルであり、
 R 3 は、式 (a)

【化 14】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R 4 は、メトキシ又はエトキシであり、
 R 5 は、メトキシ又はエトキシであり、
 R 9 は、 $-S(O)_2-R 14$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)-R 18$ 又は $-C(O)-(CH_2)_m-R 21$ であり、
 R 14 は、2 - シアノフェニルであり、
 R 18 は、アミノ又は 4 - モルホリニルであり、
 R 21 は、ピロリジン - 2, 5 - ジオン - 1 - イルであり、
 n は、1 又は 2 であり、

m は、1 である、請求項 1 記載の化合物並びにこれらの化合物の塩。

【請求項 1 4】

請求項 1 記載の式 1 の 1 種以上の化合物と一緒に通常の医薬品助剤及び / 又は賦形剤を含有する、気道疾患の治療用の医薬品組成物。

【請求項 1 5】

気道疾患の治療用の医薬品組成物の製造のための、請求項 1 記載の化合物の使用。