

【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 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 17/14	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 11/02	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)
A 61 P 15/10	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 13/02	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04	C S P
A 61 K 31/501	
A 61 K 31/5377	
C 07 D 401/14	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 11/00	
A 61 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

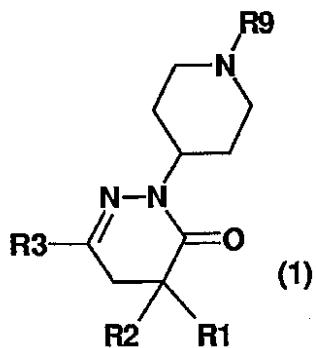
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1

【化1】

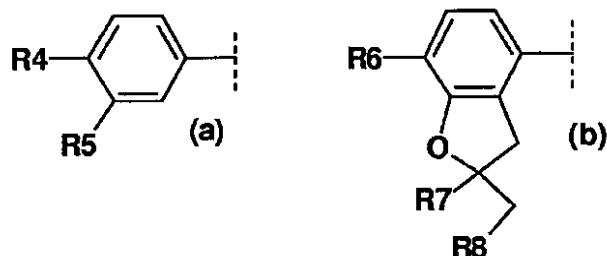


[式中、

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、

R4は、C₁～C₄-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R5は、C₁～C₈-アルコキシ、C₃～C₇-シクロアルコキシ、C₃～C₇-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R6は、C₁～C₄-アルコキシ、C₃～C₅-シクロアルコキシ、C₃～C₅-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R7は、C₁～C₄-アルキルであり、かつ

R8は、水素又はC₁～C₄-アルキルであるか、又は

R7及びR8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、

R9は、-C(=O)R10、-S(=O)₂-R14、-(CH₂)_n-C(=O)-R18又は-C(=O)-(CH₂)_m-R21であり、

R10は、C₁～C₄-アルキル、-N(R11)R12、フェニル又は、R13により置換されたフェニルであり、

R11は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R12は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであるか、又は

R11及びR12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-(C₁～C₄-アルキル)-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼビニル環、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、

R13は、ヒドロキシリル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、C₁～C₄-アルキル、トリフルオロメチル、C₁～C₄-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C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-アルコキシカルボニル、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニルアミノ又はC₁～C₄-アルキルカルボニルオキシであり、

R14は、C₁～C₄-アルキル、-N(R15)R16、フェニル又は、R17により置換されたフェニルであり、

R15は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R16は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであるか、又は

R15及びR16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 - (C₁ ~ C₄ - 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 17は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、C₁～C₄-アルキル、トリフルオロメチル、C₁～C₄-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C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-アルコキシカルボニル、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニルアミノ又はC₁～C₄-アルキルカルボニルオキシであり、

R18は、-N(R19)R20であり、

R 19は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R₂Oは、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであるか、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 - (C₁ ~ C₄ - 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、

R₂2は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R₂3は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-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-(C₁-C₄-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】

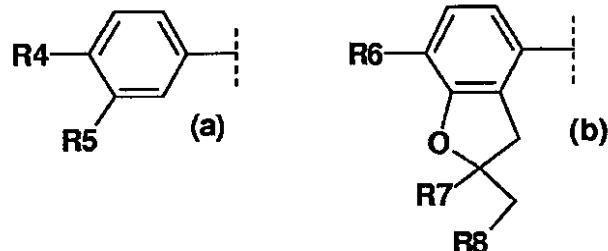
式 1 で示され、その式中、

R-1は、C₁～C₄-アルキルであり、

R-2は、C₁～C₄-アルキルであり、

R₃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、C₁～C₂-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C₁～C₂-アルコキシであり、

R 5 は、C₁～C₂-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C₁～C₂-アルコキシであり、

R 6 は、C₁～C₂-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C₁～C₂-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ヘキサン環、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、-(CH₂)_n-C(=O)-R 18
又は-C(=O)-(CH₂)_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、C₁～C₄-アルキル又はC₁～C₄-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C₁～C₄-アルキルであり、

R 16 は、水素又はC₁～C₄-アルキルであり、

R 17 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-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C₁～C₄-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C₁～C₄-アルキルであり、

R 20 は、水素又はC₁～C₄-アルキルであるか、又は

R 19 及び R 20 は、一緒にになって、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-(C₁～C₄-アルキル)-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼビニル環、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C₁～C₄-アルキルであり、

R 23 は、水素又はC₁～C₄-アルキルであるか、又は

R 22 及び R 23 は、一緒にになって、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-(C₁～C₄-アルキル)-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼビニル環、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】

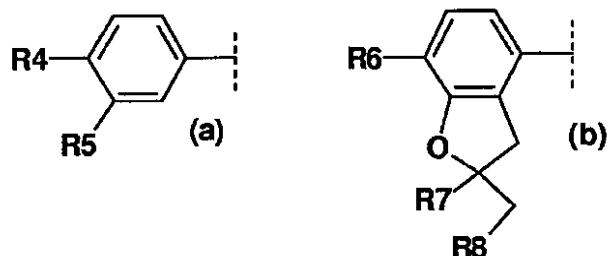
式 1 で示され、その式中、

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、

R4は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R5は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R6は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R7は、メチルであり、かつ

R8は、水素であるか、又は

R7及びR8は、一緒にになって、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 pentan 環、シクロ hekisan 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、

R9は、-C(O)-R10であり、

R10は、フェニル又は、R13により置換されたフェニルであり、

R13は、C₁~C₄-アルキル又はC₁~C₄-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】

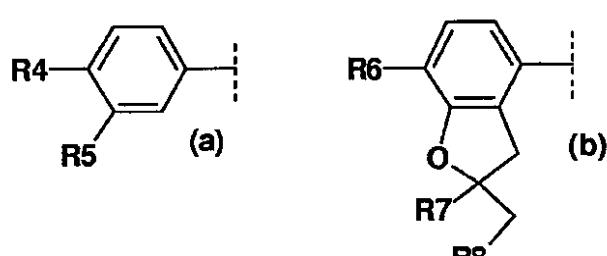
式1で示され、その式中、

R1は、メチル又はエチルであり、

R2は、メチル又はエチルであり、

R3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、

R4は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R5は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R6は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R7は、メチルであり、かつ

R8は、水素であるか、又は

R7及びR8は、一緒にになって、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 pentan 環、シクロ hekisan 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、

R9は、-S(O)₂-R14であり、

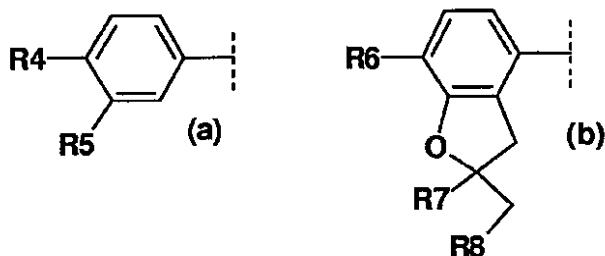
R14は、-N(R15)R16、フェニル又は、R17により置換されたフェニルであり、

R 15 は、水素又はC₁ ~ C₄-アルキルであり、
 R 16 は、水素又はC₁ ~ C₄-アルキルであり、
 R 17 は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₄-アルキル、C₁ ~ C₄-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C₁ ~ C₄-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、-(CH₂)_n-C(O)-R 18 であり、

R 18 は、-N(R 19)R 20 であり、

R 19 は、水素又はC₁ ~ C₄-アルキルであり、

R 20 は、水素又はC₁ ~ C₄-アルキルであるか、又は

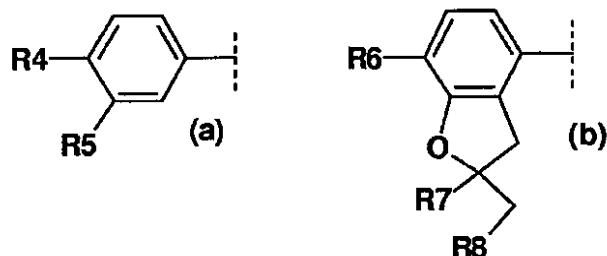
R 19 及び R 20 は、一緒になって、これらが結合される窒素原子を含んで、1-ピロリジニル環、1-ピペリジニル環、1-ピペラジニル環、1-(C₁ ~ C₄-アルキル)-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼビニル環、4-モルホリニル環又は4-チオモルホリニル環を形成し、

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、

R4は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R5は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R6は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R7は、メチルであり、かつ

R8は、水素であるか、又は

R7及びR8は、一緒にになって、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 pentan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、

R9は、-C(O)- (CH₂)_m-R21であり、

R21は、-N(R22)R23であり、

R22は、水素又はC₁~C₄-アルキルであり、

R23は、水素又はC₁~C₄-アルキルであるか、又は

R22及びR23は、一緒にになって、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-ヘキサヒドロアゼビニル環、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】

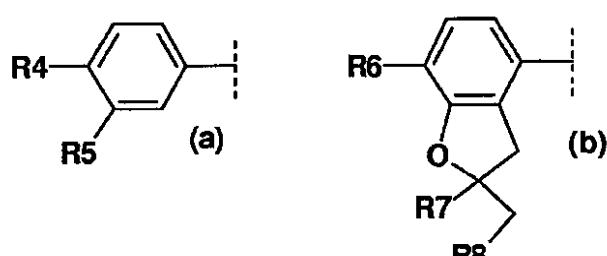
式1で示され、その式中、

R1は、メチル又はエチルであり、

R2は、メチル又はエチルであり、

R3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、

R4は、メトキシ又はエトキシであり、

R5は、メトキシ又はエトキシであり、

R6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 1 0 であり、

R 1 0 は、フェニル又は、R 1 3 により置換されたフェニルであり、

R 1 3 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】

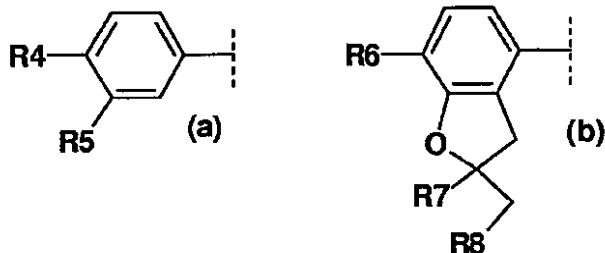
式 1 で示され、その式中、

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 1 4 であり、

R 1 4 は、- N (R 1 5) R 1 6 、フェニル又は、R 1 7 により置換されたフェニルであり、

R 1 5 は、メチルであり、

R 1 6 は、メチルであり、

R 1 7 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】

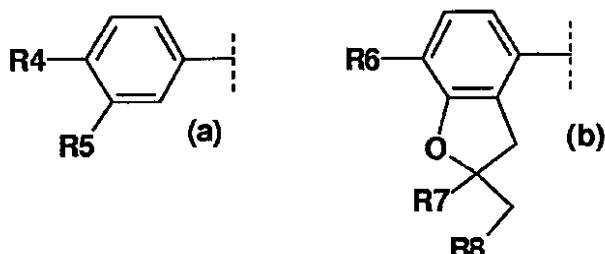
式 1 で示され、その式中、

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 1 0】



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、 $- (\text{C H}_2)_n - \text{C}(\text{O}) - \text{R}18$ であり、

R 18 は、 $- \text{N}(\text{R}19) \text{R}20$ 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】

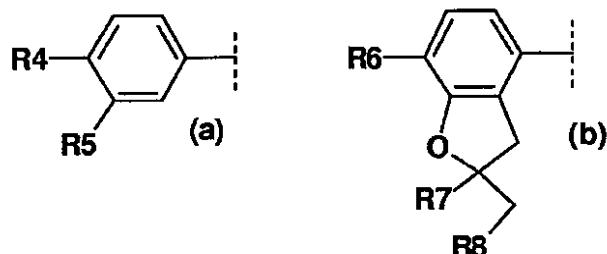
式 1 で示され、その式中、

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、 $- \text{C}(\text{O}) - (\text{C H}_2)_m - \text{R}21$ であり、

R 21 は、 $- \text{N}(\text{R}22) \text{R}23$ 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】

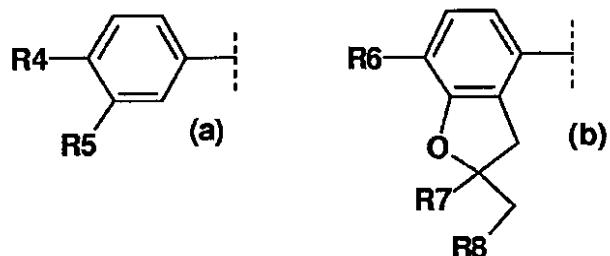
式 1 で示され、その式中、

R 1 は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ - アルキルであり、かつ

R 2 は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ - アルキルであり、

R 3 は、式 (a) 又は (b)

【化12】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R4は、C₁～C₄-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R5は、C₁～C₈-アルコキシ、C₃～C₇-シクロアルコキシ、C₃～C₇-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R6は、C₁～C₄-アルコキシ、C₃～C₅-シクロアルコキシ、C₃～C₅-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C₁～C₄-アルコキシであり、

R7は、C₁～C₄-アルキルであり、かつ

R8は、水素又はC₁～C₄-アルキルであるか、又は

R7及びR8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、

R9は、-C(=O)R10、-S(=O)₂-R14、-(CH₂)_n-C(=O)-R18又は-C(=O)-(CH₂)_m-R21であり、

R10は、C₁～C₄-アルキル、-N(R11)R12、フェニル又は、R13により置換されたフェニルであり、

R11は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R12は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであるか、又は

R11及びR12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-(C₁～C₄-アルキル)-ピペラジン-4-イル環、1-ヘキサヒドロアゼビニル環、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、

R13は、ヒドロキシリル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、C₁～C₄-アルキル、トリフルオロメチル、C₁～C₄-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C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-アルコキシカルボニル、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニルアミノ又はC₁～C₄-アルキルカルボニルオキシであり、

R14は、C₁～C₄-アルキル、-N(R15)R16、フェニル又は、R17により置換されたフェニルであり、

R15は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであり、

R16は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₇-シクロアルキル又はC₃～C₇-シクロアルキルメチルであるか、又は

R15及びR16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 - (C₁ ~ C₄ - 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、

R17は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、C₁ ~ C₄ - アルキル、トリフルオロメチル、C₁ ~ C₄ - 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C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、アミノ、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニル又はC₁ ~ C₄ - アルキルカルボニルオキシであり、

R18は、-N(R19)R20であり、

R19は、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル又はC₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチルであり、

R20は、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル又はC₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R19及びR20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 - (C₁ ~ C₄ - 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、

R21は、-N(R22)R23であり、

R22は、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル又はC₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチルであり、

R23は、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル又はC₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチルであるか、又は

R22及びR23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 - (C₁ ~ C₄ - 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12】

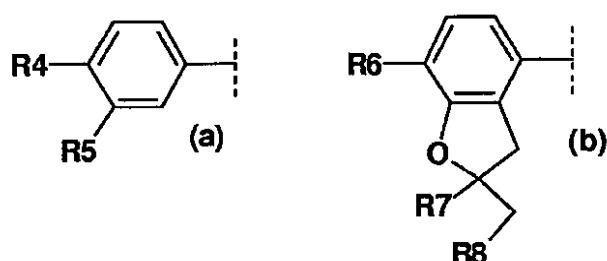
式1で示され、その式中、

R1は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R2は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R3は、式(a)又は(b)

【化13】



で示されるフェニル誘導体を表し、その際、

R4は、C₁ ~ C₂ - 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C₁ ~ C₂ - アルコキシであり、

R 5 は、C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 6 は、C₁ ~ C₂ - 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C₁ ~ C₂ - 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 pentan 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、-(CH₂)_n-C(=O)-R 18 又は-C(=O)-(CH₂)_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、C₁ ~ C₄ - アルキル又はC₁ ~ C₄ - 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C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 20 は、水素又はC₁ ~ C₄ - アルキルであるか、又は

R 19 及び R 20 は、一緒にになって、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 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼビニル環、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C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 23 は、水素又はC₁ ~ C₄ - アルキルであるか、又は

R 22 及び R 23 は、一緒にになって、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 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - ピペラジン - 4 - イル環、1 - ヘキサヒドロアゼビニル環、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】

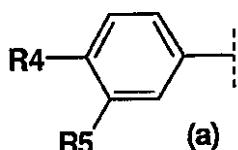
式 1 で示され、その式中、

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、-(CH₂)_n-C(=O)-R 18 又は-C(=O)-(CH₂)_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14】

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15】

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。