

【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4月17日 (2008.4.17)

【公表番号】特表2007-526284(P2007-526284A)

【公表日】平成19年9月13日 (2007.9.13)

【年通号数】公開・登録公報2007-035

【出願番号】特願2007-501292(P2007-501292)

【国際特許分類】

C 0 7 D 221/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (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)

【 F I 】

C 0 7 D 221/12

C 0 7 D 401/10 C S P

C 0 7 D 417/10

C 0 7 D 413/10

A 6 1 K 31/473

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/04
 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 37/06
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 13/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月28日(2008.2.28)

【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

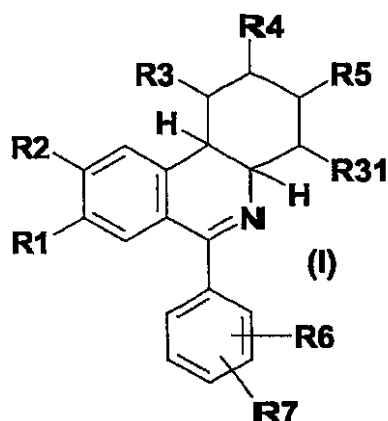
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



[式中、

R 1 は、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -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、2, 2-ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 2 は、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -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、2, 2-ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであるか、又は

R 1 及び R 2 は、一緒になって $C_1 \sim C_2$ -アルキレンジオキシ基であり、

R 3 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 3 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

本発明による第一の実施態様（実施態様 a）においては、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_7$ -アルキルカルボニル又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、かつ

R 5 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

本発明による第二の実施態様（実施態様 b）においては、

R 4 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、かつ

R 5 は、- O - R 5 1 であり、その際、

R 5 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_7$ -アルキルカルボニル又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 7 は、Het 1、Het 2、Har 1、Het 3 又は Har 2 であり、その際、

Het 1 は、R 7 1 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を有する単環式の 3 員ないし 7 員の完全飽和の複素環基であり、その際、

R 7 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

Het 2 は、R 7 2 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により、窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 又は 2 個の更なるヘテロ原子とを有する単環式の 5 員ないし 7 員の飽和又は不飽和の複素環基であり、その環に 1 又は 2 個のオキソ置換基が結合されており、その際、

R 7 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

Har 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子を有する単環式の 5 員の完全不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

Het 3 は、R 7 4 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される更なる 1 個のヘテロ原子とを有する単環式の 5 員又は 6 員の部分不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

Har 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつ 1 ～ 3 個の窒素原子を有する単環式の 6 員の完全不飽和の複素環基を表し、その際、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 7 6 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ又はモノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノである] で示される化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 2】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -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、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -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、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換され

た $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 3 は、水素であり、

R 3 1 は、水素であり、

本発明による第一の実施態様（実施態様 a）においては、

R 4 は、 $-O-R 4 1$ であり、その際、

R 4 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルであり、かつ

R 5 は、水素であるか、又は

本発明による第二の実施態様（実施態様 b）においては、

R 4 は、水素であり、かつ

R 5 は、 $-O-R 5 1$ であり、その際、

R 5 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニルであり、

R 6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 は、Het 1、Het 2、Har 1、Het 3 又は Har 2 であり、その際、

Het 1 は、R 7 1 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する単環式の 3 員ないし 7 員の完全飽和の複素環基であり、その際、

R 7 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Het 2 は、R 7 2 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により、窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 又は 2 個の更なるヘテロ原子とを有する単環式の 5 員ないし 7 員の飽和又は不飽和の複素環基であり、その環に 1 又は 2 個のオキソ置換基が結合されており、その際、

R 7 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Har 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する単環式の 5 員の完全不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Het 3 は、R 7 4 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される更なる 1 個のヘテロ原子とを有する単環式の 5 員又は 6 員の部分不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Har 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつ 1 ~ 3 個の窒素原子を有する単環式の 6 員の完全不飽和の複素環基を表し、その際、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 7 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ又はモノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノである、請求項 1 記載の化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 3】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ - 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、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ - 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、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 3 は、水素であり、

R 3 1 は、水素であり、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルカルボニル又は水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、水素であり、

R 7 は、Het 1、Har 1、Het 3 又は Har 2 であり、その際、

Het 1 は、R 7 1 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により、窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 又は 2 個の更なるヘテロ原子とを有する単環式の 3 員ないし 7 員の完全飽和の複素環基であり、その際、

R 7 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Har 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により、窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 3 個までの更なるヘテロ原子とを有する単環式の 5 員の完全不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Het 3 は、R 7 4 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される更なる 1 個のヘテロ原子とを有する単環式の 5 員の部分不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

Har 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつ 1 又は 2 個の窒素原子を有する単環式の 6 員の完全不飽和の複素環基を表し、その際、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 7 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ又はモノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノである、請求項 1 記載の化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 4】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 3 は、水素であり、

R 3 1 は、水素であり、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、水素であり、

R 7 は、Het 1、Har 1、Het 3 又は Har 2 であり、その際、

Het 1 は、ピロリジン - 1 - イル、ペペリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル又はチオモルホリン - 4 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ピペラジン - 1 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ホモピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 7 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

Har 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつ 1 個の窒素原子と、場合により、窒素、酸素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 3 個までの更なるヘテロ原子とを

有する単環式の 5 員の完全不飽和の複素環基であり、その際、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

H e t 3 は、1 - N - (R 7 4) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イルであり、その際、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

H a r 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつ 1 又は 2 個の窒素原子を有する単環式の 6 員の完全不飽和の複素環基を表し、その際、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_2$ - アルキルアミノ又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

R 7 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又はモノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_2$ - アルキルアミノである、請求項 1 記載の化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 5】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ、2 , 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ、2 , 2 - ジフルオロエトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 3 は、水素であり、

R 3 1 は、水素であり、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、水素であり、

R 7 は、H e t 1、H a r 1、H e t 3 又は H a r 2 であり、その際、

H e t 1 は、ピロリジン - 1 - イル、ペリリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル又はチオモルホリン - 4 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ピペラジン - 1 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ホモピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 7 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

H a r 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、1 , 2 , 4 - トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、1 , 2 , 3 - チアジアゾリル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル又は 1 , 3 , 4 - オキサジアゾリルであり、その際、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

H e t 3 は、1 - N - (R 7 4) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イルであり、その際、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は、完全にもしくは部分的にフッ素置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

H a r 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつピリジニル又はピリミジニルであり、その際、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシである、請求項 1 記載の化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 6】

式 I で示され、その式中、

R 1 及び R 2 の 1 つは、メトキシであり、かつそのほかメトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又は 2 , 2 - ジフルオロエトキシであり、かつ

R 3 及び R 3 1 は、両者とも水素であり、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、水素であり、

R 7 は、H e t 1、H a r 1 又は H a r 2 であり、その際、

H e t 1 は、モルホリン - 4 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 7 1 は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

H a r 1 は、R 7 3 によって置換されていてよく、かつ 2 H - テトラゾール - 5 - イル、1 , 2 , 3 - チアジアゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、チアゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル又は 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イルであり、その際、

R 7 3 は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

例えば、2 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - 2 H - テトラゾール - 5 - イル、例えば 2 - プロピル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル又は 2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル、1 , 2 , 3 - チアジアゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、2 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - チアゾール - 4 - イル、例えば 2 - メチル - チアゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル又は 5 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、例えば 5 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イルであり、

H a r 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつピリジニル又はピリミジニルであり、その際、

R 7 5 は、C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 7 6 は、C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

例えば 4 , 6 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イルである、請求項 1 記載の化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 7】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 2 は、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又は 2 , 2 - ジフルオロエトキシであり、

R 3 は、水素であり、

R 3 1 は、水素であり、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、水素であり、

R 6 は、水素であり、

R 7 は、フェニル環がフェナントリジン環系に結合されている結合位置に対してメタ位又はパラ位に結合されており、かつ H e t 1、H a r 1 又は H a r 2 であり、その際、

H e t 1 は、モルホリン - 4 - イル又は 4 - N - (R 7 1) - ピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 7 1 は、メチルであり、

H a r 1 は、2 - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - 2 H - テトラゾール - 5 - イル、例えば 2 - プロピル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル又は 2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル、1 , 2 , 3 - チアジアゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、2 - メチル - チアゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル又は 5 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イルであり、

H a r 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつピリジニル又はピリミジニルであり、その際、

R 7 5 は、メトキシであり、

R 7 6 は、メトキシであり、

例えば 4 , 6 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イルである、請求項 1 記載の化合物及びそのエナンチオマー、並びにそれらの塩、それらの N - オキシド及びこれらの化合物及びエナンチオマーの N - オキシドの塩。

【請求項 8】

請求項 1 から 7 までのいずれか 1 項記載の式 I の化合物であって、以下の

R 1 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 2 は、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又は 2 , 2 - ジフルオロエトキシであり、かつ

R 3 及び R 3 1 は、両者とも水素であること、及び

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニル、例えばアセチルであり、かつ

R 5 は、水素であること

を 1 つ以上有する化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 9】

請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項記載の式 I の化合物であって、以下の

R 1 は、メトキシであり、

R 2 は、エトキシ、ジフルオロメトキシ又は 2 , 2 - ジフルオロエトキシであり、かつ

R 3 及び R 3 1 は、両者とも水素であること、

R 4 は、- O - R 4 1 であり、その際、

R 4 1 は、水素であり、かつ

R 5 は、水素であること、並びに

R 7 は、H a r 2 であり、その際、

H a r 2 は、R 7 5 及び / 又は R 7 6 によって置換されていてよく、かつピリジニル又はピリミジニルであること

を 1 つ以上有する化合物及びその塩、その N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 10】

以下の

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 6 - (4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル) - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 6 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 6 - [4 - (4 , 6 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル) - フェニル] - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 6 - (4 - [1 , 2 , 3] チアジアゾール - 4 - イル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 6 - (4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 8 , 9 - ジメトキシ - 6 - [4 - (2 - プロピル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサ

サヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 8 - (1 , 1 - ジフルオロ - メトキシ) - 6 - [4 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 9 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (1 , 1 - ジフルオロ - メトキシ) - 6 - [4 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 8 - メトキシ - 6 - [3 - (2 - メチル - チアゾール - 4 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 6 - [4 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 8 - メトキシ - 6 - (4 - オキサゾール - 5 - イル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 8 - メトキシ - 6 - (4 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 6 - (4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル) - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 6 - [3 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 8 - メトキシ - 6 - [4 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R S , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 6 - [3 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R , 4 a R , 1 0 b R) - 9 - エトキシ - 6 - (4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル) - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 S , 4 a S , 1 0 b S) - 9 - エトキシ - 6 - (4 - イミダゾール - 1 - イル - フェニル) - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R , 4 a R , 1 0 b R) - 9 - エトキシ - 6 - [3 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール

(2 R , 4 a R , 1 0 b R) - 9 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 6 - [4 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 2 - オール、及び

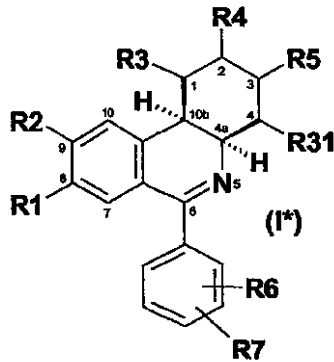
(3 S R , 4 a R S , 1 0 b R S) - 9 - エトキシ - 6 - [3 - (2 - エチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 8 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 , 4 a , 1 0 b - ヘキサヒドロフェナントリジン - 3 - オール

から選択される請求項 1 記載の式 I の化合物及びそのエナンチオマー、並びにそれらの塩、それらの N - オキシド及びこれらの化合物及びエナンチオマーの N - オキシドの塩。

【請求項 1 1】

4 a 位及び 1 0 b 位に関して式 I' :

【化 2】

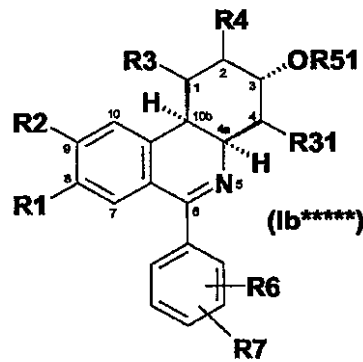
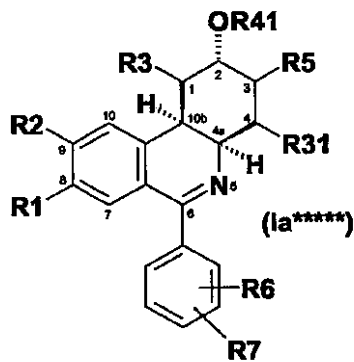


に示される立体配置を有する、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項記載の式 I の化合物及びそれらの塩、N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 12】

2 位、4 a 位及び 10 b 位に関して、式 I a ***** に示される立体配置を有するか、又は 3 位、4 a 位及び 10 b 位に関して、式 I b ***** に示される立体配置を有する、

【化 3】



請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項記載の式 I の化合物及びそれらの塩、N - オキシド及びこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 13】

請求項 1 記載の 1 種以上の式 I の化合物と一緒に慣用の医薬品賦形剤及び / 又はビヒクルを含有する、気道疾患又は皮膚病の治療用の医薬組成物。

【請求項 14】

呼吸器疾患の治療用の医薬組成物を製造するための、請求項 1 記載の式 I の化合物の使用。