

【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19年3月1日(2007.3.1)

【公表番号】特表2002-534507(P2002-534507A)

【公表日】平成14年10月15日(2002.10.15)

【出願番号】特願2000-593587(P2000-593587)

【国際特許分類】

C 07 D 221/12	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
C 07 D 409/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 221/12	
A 61 K 31/4709	
A 61 P 11/00	
A 61 P 11/06	
A 61 P 17/00	
A 61 P 17/06	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/28	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 37/00	
A 61 P 37/08	
A 61 P 43/00	1 1 1
C 07 D 401/04	
C 07 D 403/04	
C 07 D 405/04	
C 07 D 409/04	

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月10日(2007.1.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

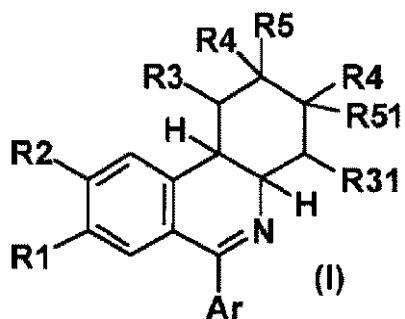
【補正方法】変更

【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、1~4Cアルコキシ、3~7Cシクロアルコキシ、3~7Cシクロアルキルメトキシまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1~4Cアルコキシであり、

R<sub>2</sub>はヒドロキシル、1～4Cアルコキシ、3～7Cシクロアルコキシ、3～7Cシクロアルキルメトキシまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1～4Cアルコキシであるか、

または

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は一緒に 1 ~ 2 C アルキレンジオキシ基であり、

R<sub>3</sub>は水素または1~4Cアルキルであり、

R 3 1 は水素または 1 ~ 4 C アルキルであるか、

または

R<sub>3</sub>およびR<sub>3</sub>1は一緒に1~4Cアルキレン基であり、

R<sub>4</sub>は水素または1～4Cアルキルであり、

R 5 は水素であり、

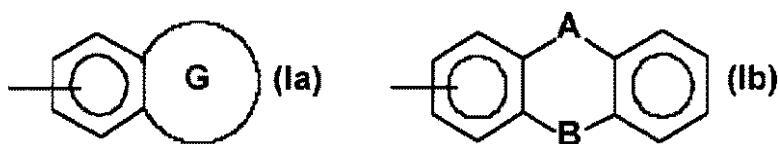
R 5 1 は水素であるか、

または

R 5 および R 5-1 は一緒に付加的結合を表し、

$A_r$  は式 I-a または I-b

【化 2】



(ここでGは、随意に0またはNからなる群から選択された同じかまたは異なる3個までのヘテロ原子を含有しうる5員環または6員環であり、

A は単結合、 $\text{C}=\text{H}_2$  - 、 $\text{C}=\text{H}_2$  -  $\text{C}=\text{H}_2$  - 、 $\text{C}=\text{H}_2$  - O - 、O - C H<sub>2</sub> - 、C (O) - 、O - 、N (H) - 、N = 、C H = 、C H = C H - 、N = C H - または C H = N - であり。

B は単結合、-CH<sub>2</sub>-、-C(=O)-、-O-、-N(H)-、-N=、-CH=または-S(O)<sub>2</sub>である)の非置換またはR<sub>6</sub>および/またはR<sub>7</sub>置換の二環式または三環式基であり)

R<sub>6</sub> はヒドロキシル、ハロゲン、カルボキシル、ニトロ、シアノ、アミノ、アミノカルボニル、モノ- またはジ- 1 ~ 4 C アルキルアミノ、モノ- またはジ- 1 ~ 4 C アルキルアミノカルボニル、1 ~ 4 C アルキル、トリフルオロメチル、1 ~ 4 C アルコキシ、1 ~ 4 C

C アルコキシカルボニル、1～4 C アルキルカルボニルオキシ、1～4 C アルキルカルボニル、1～4 C アルコキシカルボニルアミノまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1～4 C アルコキシであり、および

R 7 はヒドロキシリ、ハロゲン、ニトロ、1～4 C アルキルまたは1～4 C アルコキシである]の化合物、

またはこの化合物の塩、N-オキシドおよびN-オキシドの塩。

【請求項 2】 R 1 が1～2 C アルコキシ、3～5 C シクロアルコキシ、3～5 C シクロアルキルメトキシまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1～2 C アルコキシであり、

R 2 が1～2 C アルコキシ、3～5 C シクロアルコキシ、3～5 C シクロアルキルメトキシまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1～2 C アルコキシであり、

R 3 が水素であり、

R 3 1 が水素であり、

R 4 が水素または1～2 C アルキルであり、

R 5 が水素であり、

R 5 1 が水素であるか、

または

R 5 およびR 5 1 が一緒に付加的結合を表し、

A r がインダニル、ナフタレニル、フルオレニル、9-オキソ-9 H - チオキサンテニル-10, 10-ジオキシド、フェナントレニル、アントラセニル、ベンゾフラニル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、インドリル、1 H - ベンゾイミダゾリル、1 H - ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサゾリル、フルオレン-9-オニル、アントラキノニル、ジベンゾフラニル、クロマニル、2, 3-ジヒドロインドリル、2, 3-ジヒドロベンゾフラニル、2, 3-ジヒドロベンゾ[1, 4]ジオキシニルおよびベンゾ[1, 3]ジオキソリルからなる群から選択された、非置換またはR 6 および/またはR 7 置換の二環式基または三環式基であり、ここで

R 6 がヒドロキシリ、ハロゲン、カルボキシリ、ニトロ、アミノ、アミノカルボニル、1～4 C アルキル、1～4 C アルコキシ、1～4 C アルキルカルボニルオキシ、1～4 C アルコキシカルボニルまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1～2 C アルコキシであり、および

R 7 がヒドロキシリ、ハロゲン、1～4 C アルキルまたは1～4 C アルコキシである、請求項 1 に記載の式 I の化合物、

またはこの化合物の塩、N-オキシドおよびN-オキシドの塩。

【請求項 3】 R 1 が1～2 C アルコキシであり、

R 2 が1～2 C アルコキシであり、

R 3 が水素であり、

R 3 1 が水素であり、

R 4 が水素または1～2 C アルキルであり、

R 5 が水素であり、

R 5 1 が水素であるか、

または

R 5 およびR 5 1 が一緒に付加的結合を表し、

A r がインダニル、ナフタレニル、9-オキソ-9 H - チオキサンテニル-10, 10-ジオキシド、フルオレニル、アントラセニル、ベンゾフラニル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、インドリル、インダゾリル、1 H - ベンゾイミダゾリル、1 H - ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサゾリル、フルオレン-9-オニル、アントラキノニル、ジベンゾフラニル、2, 3-ジヒドロベンゾ[1, 4]ジオキシニルおよびベンゾ[1, 3]ジオキソリルからなる群から選択された、非置換またはR 6 および/またはR 7 置換の二環式基または三環式基であり、ここで

R 6 がヒドロキシル、ハロゲン、カルボキシル、ニトロ、アミノ、アミノカルボニル、1 ~ 4 C アルキル、1 ~ 4 C アルコキシ、1 ~ 4 C アルキルカルボニルオキシ、1 ~ 4 C アルコキシカルボニルまたは完全にまたは大部分フッ素置換された1 ~ 2 C アルコキシであり、

R 7 が1 ~ 4 C アルキルである、請求項1に記載の式Iの化合物、またはこの化合物の塩、またはN - オキシドおよびN - オキシドの塩。

【請求項4】 R 1 が1 ~ 2 C アルコキシであり、

R 2 が1 ~ 2 C アルコキシであり、

R 3 が水素であり、

R 3 1 が水素であり、

R 4 が水素または1 ~ 2 C アルキルであり、

R 5 が水素であり、

R 5 1 が水素であるか、

または

R 5 およびR 5 1 が一緒に付加的結合を表し、

A r がインダニル、ナフタレニル、9 - オキソ - 9 H - チオキサンテニル - 1 0 , 1 0 - ジオキシド、フルオレニル、アントラセニル、ベンゾフラニル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、シンノリニル、インドリル、インダゾリル、1 H - ベンゾイミダゾリル、1 H - ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサゾリル、フルオレン - 9 - オニル、アントラキノニル、ジベンゾフラニル、2 , 3 - ジヒドロベンゾ[1 , 4]ジオキシニルおよびベンゾ[1 , 3]ジオキソリルからなる群から選択された、非置換またはR 6 置換の二環式基または三環式基であり、ここで

R 6 がヒドロキシル、ハロゲン、カルボキシル、ニトロ、アミノ、アミノカルボニル、1 ~ 4 C アルキル、1 ~ 4 C アルコキシ、1 ~ 4 C アルキルカルボニルオキシまたは1 ~ 4 C アルコキシカルボニルである、請求項1に記載の式Iの化合物、およびこれら化合物の塩、N - オキシドおよびN - オキシドの塩。

【請求項5】 R 1 がメトキシであり、

R 2 がメトキシであり、

R 3 、 R 3 1 、 R 4 、 R 5 およびR 5 1 が水素であり、

A r が7 - ジフルオロメトキシ - 2 - イソプロピル - ベンゾフラン - 4 - イル、ナフタレン - 2 - イル、キノリン - 6 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル、2 - メチルベンゾイミダゾール - 5 - イル、1 H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル、2 , 3 - ジヒドロベンゾ[1 , 4]ジオキシン - 6 - イル、ベンゾ[1 , 3]ジオキソール - 5 - イル、1 0 , 1 0 - ジオキソチオキサンテン - 9 - オン - 3 - イル、フルオレン - 9 - オン - 2 - イルおよびアントラキノン - 2 - イルからなる群から選択された基である、請求項1に記載の式Iの化合物、

およびこれら化合物の塩、N - オキシドおよびN - オキシドの塩。

【請求項6】 R 1 がメトキシであり、

R 2 がメトキシであり、

R 3 、 R 3 1 、 R 4 、 R 5 およびR 5 1 が水素であり、

A r がナフタレン - 2 - イル、キノリン - 6 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル、2 - メチルベンゾイミダゾール - 5 - イル、1 H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル、2 , 3 - ジヒドロベンゾ[1 , 4]ジオキシン - 6 - イル、ベンゾ[1 , 3]ジオキソオール - 5 - イル、1 0 , 1 0 - ジオキソチオキサンテン - 9 - オン - 3 - イル、フルオレン - 9 - オン - 2 - イルおよびアントラキノン - 2 - イルからなる群から選択された基である、請求項1に記載の式Iの化合物、

またはこの化合物の塩、N - オキシドおよびN - オキシドの塩。

【請求項7】 出発物質として使用することのできる、旋光 [ ]<sup>2 0</sup><sub>D</sub> = - 5 8 . 5 ° (c = 1、エタノール) を有する化合物 (-) - シス - 1 , 2 - ジメトキシ - 4 - (2 - アミノシクロヘキシル) ベンゼンと位置4 a および1 0 b で同じ絶対配置を有する、

請求項 1 から 6 までのいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 8】 製薬的付形剤および／またはビヒクルと一緒に請求項 1 から 7 までの  
いずれか 1 項に記載の式 I の少なくとも 1 種の化合物を包含する、気道障害を治療するた  
めの薬剤。