

【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 0 7 D 221/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 221/12

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 405/04

C 0 7 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

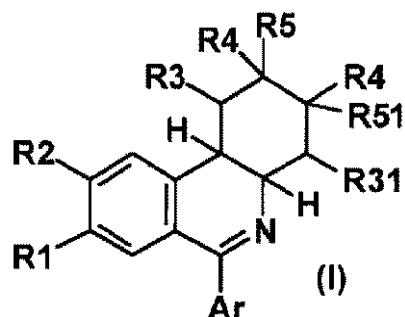
【補正方法】変更

【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、1～4 C アルコキシ、3～7 C シクロアルコキシ、3～7 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 1～4 C アルコキシであり、

R 2 はヒドロキシル、1～4 C アルコキシ、3～7 C シクロアルコキシ、3～7 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 1～4 C アルコキシであるか、

または

R 1 および R 2 は一緒に 1～2 C アルキレンジオキシ基であり、

R 3 は水素または 1～4 C 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 3 および R 3 1 は一緒に 1～4 C アルキレン基であり、

R 4 は水素または 1～4 C アルキルであり、

R 5 は水素であり、

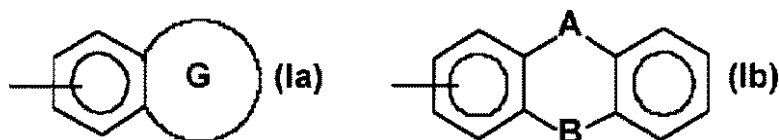
R 5 1 は水素であるか、

または

R 5 および R 5 1 は一緒に付加的結合を表し、

Ar は式 I a または I b

【化 2】



(ここで G は、随意に O 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、-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-CH₂-O-、-O-CH₂-、-C(O)-、-O-、-N(H)-、-N=、-CH=、-CH=CH-、-N=CH-または -CH=N- であり、

B は単結合、-CH₂-、-C(O)-、-O-、-N(H)-、-N=、-CH= または -S(O)₂ である) の非置換または R 6 および / または R 7 置換の二環式または三環式基であり、

R 6 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 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 はヒドロキシル、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、

Ar がインダニル、ナフタレニル、フルオレニル、9 - オキソ - 9 H - チオキサントニル - 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、フトラジニル、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、および

R 7 がヒドロキシル、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、

Ar がインダニル、ナフタレニル、9 - オキソ - 9 H - チオキサントニル - 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、フトラジニル、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 / 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、

Ar がインダニル、ナフタレニル、9 - オキソ - 9 H - チオキサントニル - 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 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、

Ar 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] ジオキシシ - 6 - イル、ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル、10 , 10 - ジオキソチオキサント - 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 - 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、

Ar 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] ジオキシシ - 6 - イル、ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル、10 , 10 - ジオキソチオキサント - 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 - 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 [α] ²⁰ _D = - 58 . 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10 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。