

【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5月1日(2008.5.1)

【公表番号】特表2007-529485(P2007-529485A)

【公表日】平成19年10月25日(2007.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2007-041

【出願番号】特願2007-503402(P2007-503402)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 6 C

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/437

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年3月12日(2008.3.12)

【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

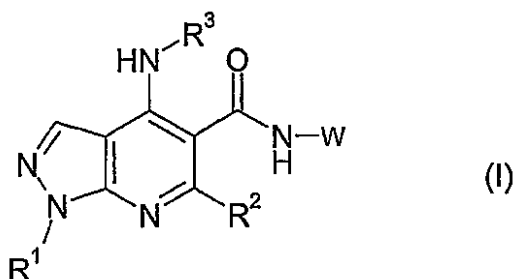
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)の化合物またはその塩(特に、薬剤として許容できるその塩):

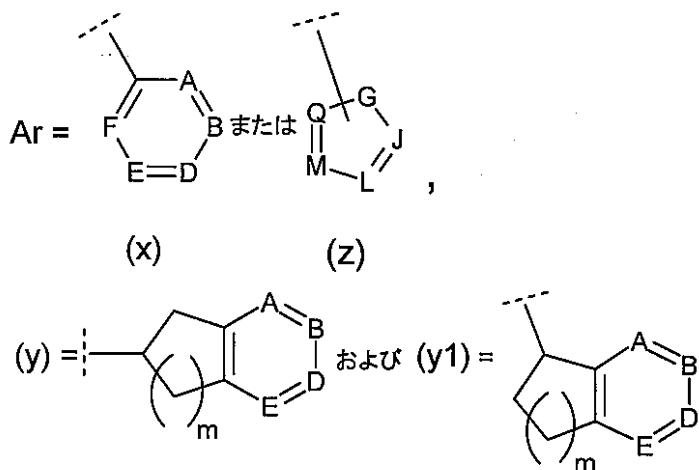
【化 1】



[式中、

Wは、Ar、-CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>Ar、または基(y)もしくは(y1)(式中、

## 【化 2】



式中、m=1または2

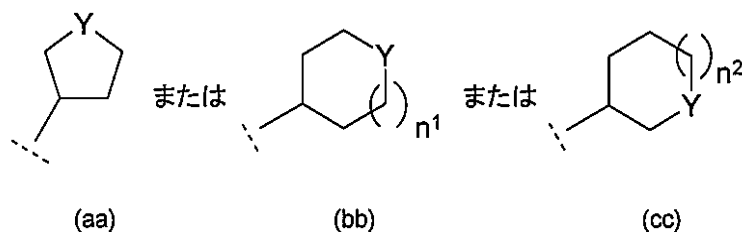
)であり、

$R^1$  は、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 3$  フルオロアルキル、または  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$  であり；

$R^2$  は、 $C_2 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、または  $-(\text{CH}_2)_{n^4}C_3 \sim 6$  シクロアルキル (式中、 $n^4$  は1または2である) であり；

$R^3$  は、場合によっては置換されていてもよい  $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、または場合によっては置換されていてもよいモノ-不飽和  $C_5 \sim 7$  シクロアルケニル、または場合によっては置換されていてもよい下位式(aa)、(bb)、もしくは(cc)の複素環基であり；

## 【化 3】



式中、 $n^1$  および  $n^2$  は独立に、1または2であり；かつ式中、YはO、S、 $\text{SO}_2$ 、または  $\text{NR}^{10}$  であり、式中、 $R^{10}$  は、水素原子(H)、 $C_1 \sim 2$  アルキル、 $C_1 \sim 2$  フルオロアルキル、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$ 、 $\text{C}(\text{O})-C_1 \sim 2$  アルキル、 $\text{C}(\text{O})-C_1$  フルオロアルキル、または  $-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2\text{O}-C_1 \sim 2$  アルキルであり；

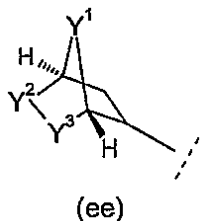
かつ式中、 $R^3$  において、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、または下位式(aa)、(bb)、もしくは(cc)の複素環基は、独立にオキソ(=O)；OH； $C_1 \sim 2$  アルコキシ； $C_1 \sim 2$  フルオロアルコキシ； $\text{NHR}^{21}$  (式中、 $R^{21}$  は、水素原子(H)または  $C_1 \sim 4$  直鎖アルキルである)； $C_1 \sim 2$  アルキル； $C_1 \sim 2$  フルオロアルキル； $-\text{CH}_2\text{OH}$ ； $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ； $-\text{CH}_2\text{NHR}^{22}$  (式中、 $R^{22}$  は、Hまたは  $C_1 \sim 2$  アルキルである)； $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{23}$  (式中、 $R^{23}$  は、Hまたは  $C_1 \sim 2$  アルキルである)； $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{24}$  (式中、 $R^{24}$  は、Hまたは  $C_1 \sim 2$  アルキルである)； $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{25}$  (式中、 $R^{25}$  は  $C_1 \sim 2$  アルキルである)；フルオロ；ヒドロキシイミノ(=N-OH)；または( $C_1 \sim 4$  アルコキシ)イミノ(=N- $\text{OR}^{26}$ 、式中、 $R^{26}$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルである)である1または2個の置換基で環炭素において場合によっては置換されていてもよく；かつ式中、OH、アルコキシ、フルオロアルコキシ、または  $\text{NHR}^{21}$  置換基はどれも、式(I)の-NH-基に付いている(結合している) $R^3$ 環炭素において置換しておらず、かつ複素環基(aa)、(bb)、または(cc)のY基に結合しているどの  $R^3$ 環炭素においても置換しておらず；

かつ式中、 $R^3$  が、場合によっては置換されていてもよいモノ-不飽和  $C_5 \sim 7$  シクロアルケニルである場合は、シクロアルケニルは、フルオロもしくは  $C_1 \sim 2$  アルキルである1個の置換基、または独立にフルオロもしくはメチルである2個の置換基で場合によっては置換さ

れていてもよく、かつ式(1)の-NH-基に結合している $R^3$ 環炭素は、シクロアルケニル二重結合に関与せず；

あるいは $R^3$ は、下位式(ee)の二環系基であり：

【化4】



式中、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ のうちの1個以下が酸素(O)であることを条件として、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ は独立に、 $CH_2$ または酸素(O)であり；

かつ式中：

$R^4$ および $R^5$ は独立に、水素原子(H)、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、 $C_1 \sim 2$ フルオロアルキル、シクロプロピル、 $-CH_2OR^{4a}$ 、 $-CH(Me)OR^{4a}$ 、または $-CH_2CH_2OR^{4a}$ であり、式中、 $R^{4a}$ は、水素原子(H)、メチル(Me)、または $CF_3$ もしくは $CHF_2$ などの $C_1$ フルオロアルキルであり、

かつ式中、下位式(x)、(y)、および(y1)において：

Aは、 $C-R^{6A}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Bは、 $C-R^{6B}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Dは、 $C-R^{6D}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Eは、 $C-R^{6E}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Fは、 $C-R^{6F}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

式中、 $R^{6A}$ 、 $R^{6B}$ 、 $R^{6D}$ 、 $R^{6E}$ 、および $R^{6F}$ は独立に、水素原子(H)、ハロゲン原子； $C_1 \sim 6$ アルキル； $C_1 \sim 4$ フルオロアルキル； $C_3 \sim 6$ シクロアルキル； $C_1 \sim 4$ アルコキシ； $C_1 \sim 2$ フルオロアルコキシ； $C_3 \sim 6$ シクロアルキルオキシ； $-C(O)R^{16a}$ ； $-C(O)OR^{30}$ ； $-S(O)_2-R^{16a}$ ； $R^{16a}-S(O)_2-NR^{15a}$ ； $R^7R^8N-S(O)_2$ ； $C_1 \sim 2$ アルキル- $C(O)-R^{15a}N-S(O)_2$ ； $C_1 \sim 4$ アルキル- $S(O)-$ 、 $Ph-S(O)-$ 、 $R^7R^8N-CO-$ ； $-NR^{15}-C(O)R^{16a}$ ； $R^7R^8N$ ；ニトロ( $-NO_2$ )；OH(その互変異性体を含めて)； $C_1 \sim 4$ アルコキシメチル； $C_1 \sim 4$ アルコキシエチル； $C_1 \sim 2$ アルキル- $S(O)_2-CH_2-$ ； $R^7R^8N-S(O)_2-CH_2-$ ； $C_1 \sim 2$ アルキル- $S(O)_2-NR^{15a}-CH_2-$ ； $-CH_2-OH$ ； $-CH_2CH_2-OH$ ； $-CH_2-NR^7R^8$ ； $-CH_2-CH_2-NR^7R^8$ ； $-CH_2-C(O)OR^{30}$ ； $-CH_2-C(O)-NR^7R^8$ ； $-CH_2-NR^{15a}-C(O)-C_1 \sim 3$ アルキル； $-(CH_2)_n^{14}-Het^1$ (式中、 $n^{14}$ は0または1である)；シアノ( $-CN$ )； $Ar^{5b}$ ；またはフェニル、ピリジニル、もしくはピリミジニル(式中、フェニル、ピリジニル、またはピリミジニルは独立に、フルオロ、クロロ、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシのうちの1または2個で場合によっては置換されていてもよい)であり；

かつ/あるいは $R^{6A}$ 、 $R^{6B}$ 、 $R^{6D}$ 、 $R^{6E}$ 、および $R^{6F}$ から選択された隣接する2個の基は一緒になって、 $-CH=CH-CH=CH_2-$ 、 $-(CH_2)_n^{14a}$ (式中、 $n^{14a}$ は、3、4、または5である)、 $-O-(CMe_2)-O-$ 、 $-O-(CH_2)_n^{14b}-O-$ (式中、 $n^{14b}$ は1または2である)； $-CH=CH-NR^{15b}-$ ； $-N=CH-NR^{15b}-$ ； $-CH=N-NR^{15b}-$ ； $-N=N-NR^{15b}-$ ； $-CH=CH-O-$ ； $-N=CH-O-$ ； $-CH=CH-S-$ ；または $-N=CH-S-$ ；(式中、 $R^{15b}$ は、Hまたは $C_1 \sim 2$ アルキルである)であり；

ただし、

A、B、D、E、およびFのうちの2個以上は独立に、C-H(炭素-水素)、C-F(炭素-フッ素)、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり；

かつA、B、D、E、およびFのうちの2個以下は独立に、窒素または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

かつA、B、D、E、およびFの1個以下は、窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であることを条件とし；

かつ式中、下位式(z)において、

Gは、OまたはSまたは $NR^9$ (式中、 $R^9$ は、水素原子(H)、 $C_1 \sim 4$ アルキル、または $C_1 \sim 2$ フルオロアルキルである)であり；

Jは、 $C-R^{6J}$ 、 $C$ -[式(1)への接続点]、または窒素(N)であり、

Lは、 $C-R^{6L}$ 、 $C$ -[式(1)への接続点]、または窒素(N)であり、

Mは、 $C-R^{6M}$ 、 $C$ -[式(1)への接続点]、または窒素(N)であり、

Qは、 $C-R^{6Q}$ 、 $C$ -[式(1)への接続点]、または窒素(N)であり、

式中、 $R^{6J}$ 、 $R^{6L}$ 、 $R^{6M}$ 、および $R^{6Q}$ は独立に、水素原子(H)、ハロゲン原子; $C_1 \sim 4$ アルキル; $C_1 \sim 3$ フルオロアルキル; $C_3 \sim 6$ シクロアルキル; $C_1 \sim 4$ アルコキシ; $C_1 \sim 2$ フルオロアルコキシ; $C_3 \sim 6$ シクロアルキルオキシ;OH(その互変異性体を含めて);または独立にフルオロ、クロロ、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、もしくは $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

ただし、

J、L、M、およびQのうちの2個以上は独立に、 $C-H$ 、 $C-F$ 、 $C-C_1 \sim 2$ アルキル、 $C$ -[式(1)への接続点]、または窒素(N)であり;

かつJ、L、M、およびQのうちの3個以下は窒素(N)であることを条件とし;

かつ式中、

$R^7$ および $R^8$ は独立に、水素原子(H); $C_1 \sim 4$ アルキル; $C_3 \sim 6$ シクロアルキル;または独立にフルオロ、クロロ、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、もしくは $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

あるいは $R^7$ および $R^8$ は一緒になって、 $-(CH_2)_n^{n^6}$ -または $-C(O)-(CH_2)_n^{n^7}$ -または $-C(O)-(CH_2)_n^{n^{10}}-C(O)-$ または $-(CH_2)_n^{n^8}-X^7-(CH_2)_n^{n^9}$ -または $-C(O)-X^7-(CH_2)_n^{n^{10}}-$ (式中、 $n^6$ は、3、4、5、または6であり、 $n^7$ は、2、3、4、または5であり、 $n^8$ および $n^9$ および $n^{10}$ は独立に、2または3であり、かつ $X^7$ はOまたは $NR^{14}$ である)であり;

$R^{7a}$ は、水素原子(H)または $C_1 \sim 4$ アルキルであり;

$R^{8a}$ は、水素原子(H)またはメチルであり;

$R^{14}$ 、 $R^{17}$ 、および $R^{17a}$ は独立に、水素原子(H); $C_1 \sim 4$ アルキル; $C_1 \sim 2$ フルオロアルキル(例えば、 $CF_3$ );シクロプロピル; $-C(O)-C_1 \sim 4$ アルキル; $-C(O)NR^{7a}R^{8a}$ ;または $-S(O)_2-C_1 \sim 4$ アルキルであり;

$R^{15a}$ は、他の $R^{15a}$ とは独立に、水素原子(H)または $C_1 \sim 4$ アルキルであり;

$R^{16a}$ は、

$C_1 \sim 6$ アルキル;

1個のオキソ(=O)、OH、または $C_1 \sim 2$ アルキル置換基で場合によっては置換されていてもよい $C_3 \sim 6$ シクロアルキル;

$C_3 \sim 6$ シクロアルキル- $CH_2-$ ;

環炭素原子においてハロゲン原子、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシのうちの1個で場合によっては置換されていてもよいピリジニル;

$Ar^{5c}$ ;

独立にハロゲン原子、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニル;

その環において独立にハロゲン原子、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいベンジル;あるいは

環炭素において連結し、かつO、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含有する4、5、6、または7員の飽和複素環(式中、存在する環窒素は、 $NR^{27}$ (式中、 $R^{27}$ は、H、 $C_1 \sim 2$ アルキル、または $-C(O)Me$ である)として存在し;かつ式中、オキソ(=O)置換基が、環窒素に結合している環炭素原子に置換していることを条件として、環は、炭素において1個の $C_1 \sim 2$ アルキルまたはオキソ(=O)置換基で場合によっては置換されている)であり;

$R^{30}$ は、他の $R^{30}$ とは独立に、水素原子(H)、 $C_1 \sim 4$ アルキル、または $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり;

$Ar^{5b}$ および $Ar^{5c}$ は独立に、5員環に1個のO、S、または $NR^{15a}$ を含有する5員芳香族複素環(式中、5員環は、さらに1または2個のN原子を場合によっては含有することができ、かつ複素環は、環炭素原子においてハロゲン原子、 $C_1 \sim 2$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2-OC_1 \sim 2$ アルキル、OH(そのケト互変異性体を含む)、または $-CH_2-NR^{28}R^{29}$ (式中、 $R^{28}$ および $R^{29}$ は独立に、Hまたはメチルである)のうちの1個で場合によっては置換されている)であり;かつ

$Het^1$ は、環炭素において連結し、かつO、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含有する4、5、6、または7員の飽和複素環(式中、存在する環窒素は、 $N^{R^{31}}$ (式中、 $R^{31}$ は、H、 $C_1 \sim 2$ アルキル、または $-C(O)Me$ である)として存在し;かつ式中、オキシ(=O)置換基は、環窒素に結合している環炭素原子に置換していることを条件として、環は、炭素において1個の $C_1 \sim 2$ アルキルまたはオキシ(=O)置換基で場合によっては置換されている)である]。

【請求項2】

$R^1$ が、 $C_2 \sim 3$ アルキル、 $C_2$ フルオロアルキル、または $-CH_2CH_2OH$ である請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

$R^1$ が、エチル、*n*-プロピル、または $-CH_2CH_2OH$ である請求項2に記載の化合物または塩。

【請求項4】

$R^1$ がエチルである請求項3に記載の化合物または塩。

【請求項5】

$R^2$ が、 $C_2 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル、または $-CH_2$ シクロプロピルである請求項1、2、3、または4に記載の化合物または塩。

【請求項6】

$R^2$ が、エチル、プロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロプロピルメチルである請求項5に記載の化合物または塩。

【請求項7】

$R^3$ において、1または0個の置換基がある請求項1～6のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項8】

$R^3$ が、場合によっては置換されている $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、または場合によっては置換されている下位式(aa)、(bb)、もしくは(cc)の複素環基である請求項1～7のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項9】

$R^3$ が、場合によっては置換されている $C_3 \sim 8$ シクロアルキルである場合、場合によっては置換されているシクロヘキシルである請求項1～8のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項10】

$R^3$ が、場合によっては置換されている $C_3 \sim 8$ シクロアルキルである場合、 $R^3$ は、独立にオキシ(=O);OH; $NHR^{21}$ (式中、 $R^{21}$ は水素原子(H)である);メチル; $-CH_2F$ ;  $-CHF_2$ ;  $-C(O)OR^{23}$ (式中、 $R^{23}$ はHである);  $-C(O)NHR^{24}$ (式中、 $R^{24}$ はHである);フルオロ;ヒドロキシイミノ(=N-OH);またはメトキシイミノ(=N- $OR^{26}$ 、式中、 $R^{26}$ はメチルである)である1または2個の置換基で場合によっては置換されている $C_6 \sim 7$ シクロアルキルである請求項1～9のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項11】

$R^3$ が、場合によっては置換されている $C_3 \sim 8$ シクロアルキルである場合、 $R^3$ は、独立にOH; $-C(O)NHR^{24}$ (式中、 $R^{24}$ はHである);オキシ(=O)、またはヒドロキシイミノ(=N-OH)である1または2個の置換基で場合によっては置換されている $C_6 \sim 7$ シクロアルキル

である請求項 10 に記載の化合物または塩。

【請求項 12】

$R^3$  について、オプションの  $R^3$  置換基が 1 または 2 個存在する場合それは、

(a)  $R^3$  のシクロブチル環の 3 位、または

(b)  $R^3$  のシクロペンチルもしくはシクロペンテニル環の 3 位および/もしくは 4 位、または

(c)  $R^3$  のシクロヘキシルもしくはシクロヘキセニル環の 3、4、および/もしくは 5 位、または

(d)  $R^3$  のシクロヘプチルもしくはシクロヘプテニル環の 3、4、5、および/もしくは 6 位、または

(e)  $R^3$  のシクロオクチル環の 3、4、5、6、および/もしくは 7 位、

かつ/または

(f) アルキルもしくはフルオロアルキル置換基の場合、 $R^3$  のシクロアルキルもしくはシクロアルケニル環の 1、2、および/もしくは最高位、かつ/または

(g)  $NHR^{21}$  置換基の場合、 $R^3$  のシクロアルキルもしくはシクロアルケニル環の 2 位および/もしくは最高位における置換基である請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 13】

$R^3$  が下位式(aa)、(bb)、または(cc)の複素環基である場合、YはOまたは $NR^{10}$ である請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 14】

$R^{10}$  が、H、 $C(O)NH_2$ 、または $C(O)$ メチルである請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 15】

$R^{10}$  が $C(O)NH_2$ である請求項 14 に記載の化合物または塩。

【請求項 16】

$R^3$  が下位式(aa)、(bb)、または(cc)の複素環基である場合、 $R^3$  は、下位式(bb)の複素環基であり、かつ $n^1$ は1である請求項 1 ~ 15 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 17】

$R^3$  において、下位式(aa)、(bb)、または(cc)の複素環基が、環炭素において置換されていない請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 18】

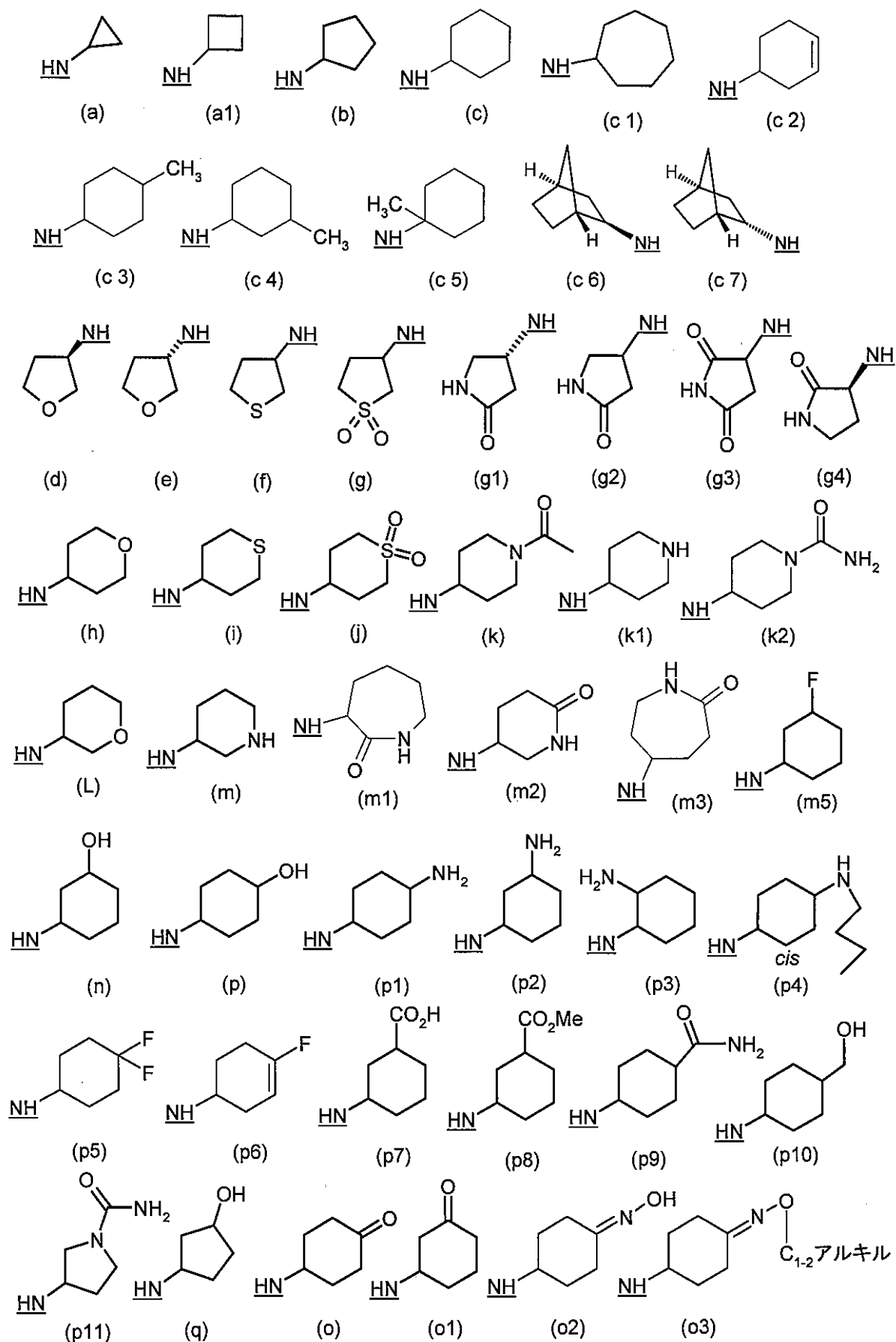
$R^3$  が、場合によっては置換されていてもよいモノ-不飽和 $C_5 \sim 7$ シクロアルケニルである場合、独立にフルオロまたはメチルである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいモノ-不飽和シクロヘキセニルであり、

かつ $R^3$  が下位式(ee)の二環系基である場合、 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ はすべて $CH_2$ である請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 19】

$NHR^3$  が、下位式(a)、(a1)、(b)、(c)、(c1)、(c2)、(c3)、(c4)、(c5)、(c6)、(c7)、(d)、(e)、(f)、(g)、(g1)、(g2)、(g3)、(g4)、(h)、(i)、(j)、(k)、(k1)、(k2)、(L)、(m)、(m1)、(m2)、(m3)、(m5)、(n)、(o)、(o1)、(o2)、(o3)、(p)、(p1)、(p2)、(p3)、(p4)、(p5)、(p6)、(p7)、(p8)、(p9)、(p10)、(p11)、または(q)を有する請求項 1 ~ 18 のいずれかに記載の化合物または塩：

## 【化 5】



## 【請求項 20】

NHR<sup>3</sup>が、下位式(c)、(c1)、(c4)、(c5)、(h)、(i)、(j)、(k)、(k2)、(m1)、(m2)、(n)

、(o)、(o2)、(o3)、(p2)、(p5)、(p6)、(p9)、(p11)、または(q)を有する請求項19に記載の化合物または塩。

【請求項21】

NHR<sup>3</sup>が、下位式(c)、(p11)、(h)、(k2)、(n)、(o)、(o2)、または(p9)を有する請求項19に記載の化合物または塩。

【請求項22】

NHR<sup>3</sup>が、下位式(n)を有する場合、シス配置であり、すなわちシス-(3-ヒドロキシシクロヘキサン-1-イル)アミノ基であり；かつ

NHR<sup>3</sup>が、下位式(p9)を有する場合、シス配置であり、すなわちシス-[4-(アミノカルボニル)シクロヘキサン-1-イル]アミノ基である請求項19、20、または21に記載の化合物または塩。

【請求項23】

NHR<sup>3</sup>が、下位式(h)または(k2)であり、すなわちR<sup>3</sup>が、テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルまたは1-(アミノカルボニル)-4-ピペリジニルである請求項19に記載の化合物または塩。

【請求項24】

R<sup>4</sup>が、水素原子(H)；メチル、エチル、C<sub>1</sub>フルオロアルキル、-CH<sub>2</sub>OH、-CH(Me)OH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、または-CH<sub>2</sub>OMeである請求項1～23のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項25】

R<sup>4</sup>が、水素原子(H)、メチル、エチル、-CH<sub>2</sub>OH、または-CH<sub>2</sub>OMeである請求項24に記載の化合物または塩。

【請求項26】

R<sup>5</sup>が、水素原子(H)、メチル、エチル、n-プロピル、またはiso-プロピルである請求項1～25のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項27】

下位式(x)において、

A、B、D、E、およびFのうちの2個以上が、C-H(炭素-水素)であり、かつA、B、D、E、およびFのうちの他の1個または複数が独立に、C-H(炭素-水素)、C-F(炭素-フッ素)、C-Cl(炭素-塩素)、C-Me、C-OMe、または窒素(N)であり；

A、B、D、E、およびFのうちの1個以下が、窒素であり；かつ

A、B、D、E、およびFがどれも、窒素-オキシド(N<sup>+</sup>-O<sup>-</sup>)でない請求項1～26のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項28】

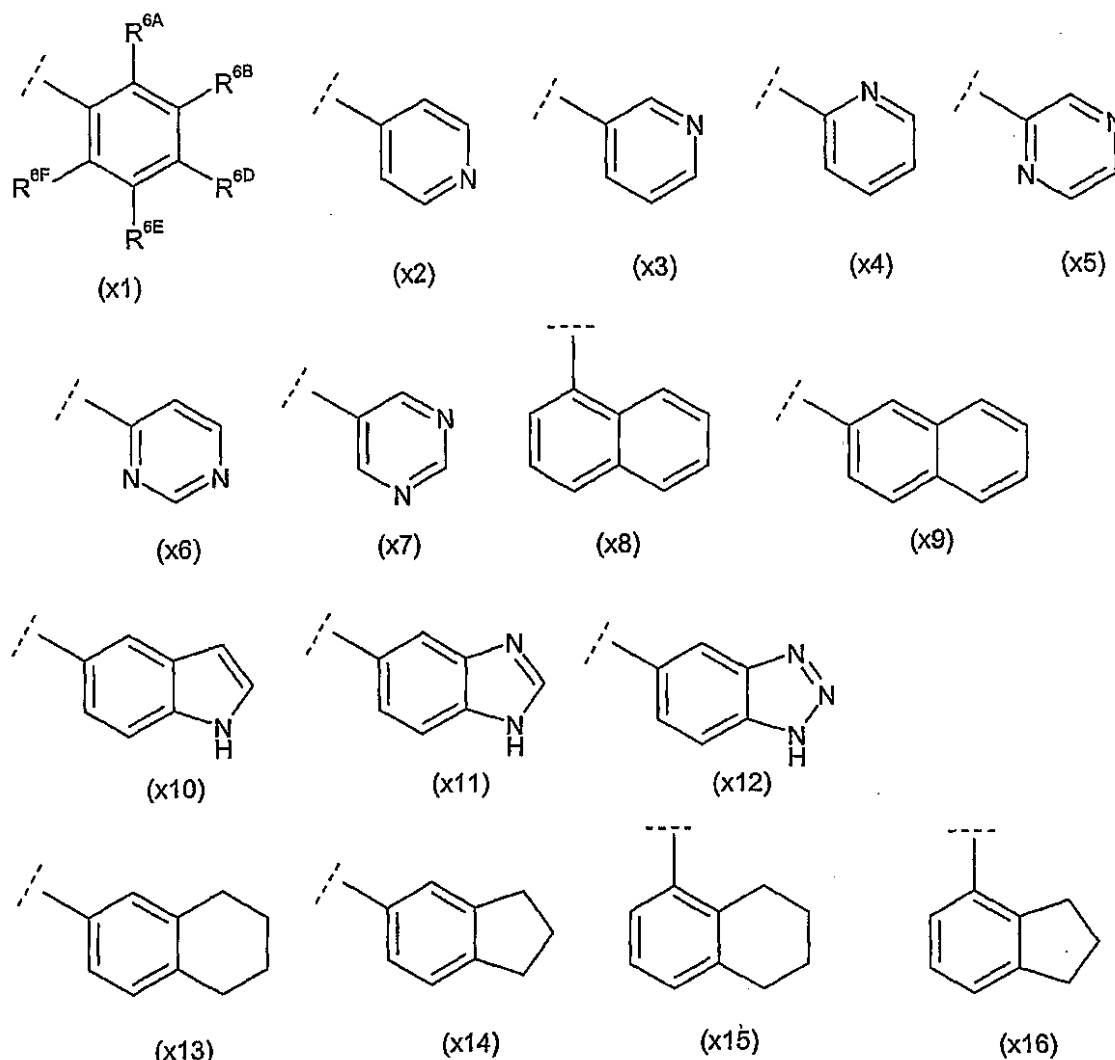
Arが下位式(x)を有する請求項1～27のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項29】

Arが下位式(x)を有し、かつ下位式(x)が、下位式(x1)、(x2)、(x3)、(x4)、(x5)、(x6)、(x7)、(x8)、(x9)、(x10)、(x11)、(x12)、(x13)、(x14)、(x15)、または(x16)である請求項28に記載の化合物または塩：



## 【化 6】



## 【請求項 30】

Arが下位式(x)を有し、かつ下位式(x)が下位式(x1)である請求項29に記載の化合物または塩。

## 【請求項 31】

Arが下位式(x1)を有し、モノアルキル-フェニル-、モノ(フルオロアルキル)-フェニル-、モノハロ-フェニル-、モノアルコキシ-フェニル-、モノ(フルオロアルコキシ)-フェニル-、ジアルキル-フェニル-、モノアルキル-モノハロ-フェニル-、ジハロ-フェニル-、またはジハロ-モノアルキル-フェニル-である請求項30に記載の化合物または塩。

## 【請求項 32】

Arが、モノ $C_1 \sim 4$ アルキル-フェニル-;モノ $C_1$ フルオロアルキル-フェニル-;モノ $C_1 \sim 3$ アルコキシ-フェニル-;モノ( $C_1$ フルオロアルコキシ)-フェニル-;ジ $C_1 \sim 3$ アルキル-フェニル-;モノ $C_1 \sim 3$ アルキル-モノハロ-フェニル-;ジハロ-フェニル-;またはジハロ-モノ $C_1 \sim 2$ アルキル-フェニル-である請求項31に記載の化合物または塩。

## 【請求項 33】

下位式(x)において、 $R^{6A}$ 、 $R^{6B}$ 、 $R^{6D}$ 、 $R^{6E}$ 、および $R^{6F}$ が相互に独立に、水素原子(H)、フッ素、塩素、もしくは臭素原子、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、トリフルオロメチル、 $-CH_2OH$ 、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、ジフルオロメトキシ、OH、または $MeS(O)_2$ -である請求項1～32のいずれかに記載の化合物または塩。

## 【請求項 34】

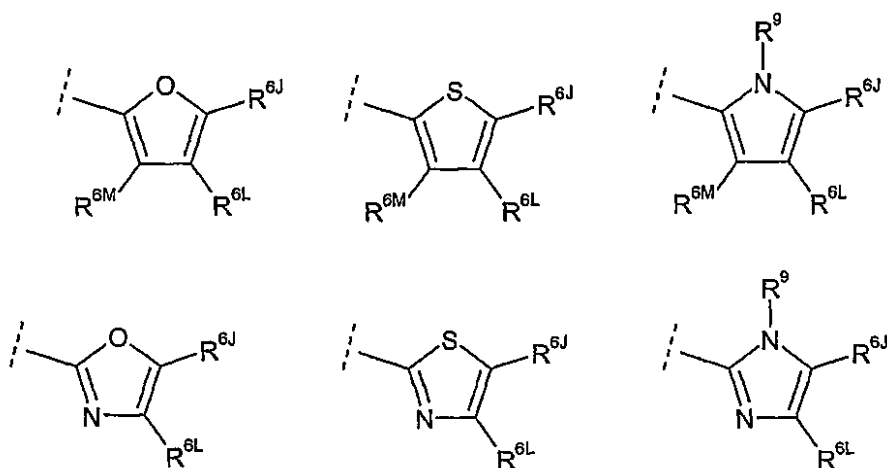
$R^9$ が、水素原子(H)またはメチルであり、

$R^{6J}$ 、 $R^{6L}$ 、 $R^{6M}$ 、および $R^{6Q}$ が独立に、H、OH(そのケト互変異性体を含む)、 $C_1 \sim 2$ アルキ

ル、またはC<sub>1</sub>フルオロアルキルであり；かつ

Arが下位式(z)を有する場合、下位式(z)が下記のうちの1つである

【化 7】



請求項 1 ~ 3 3 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 3 5】

化合物または薬剤として許容できるその塩としてのの、実施例1から29の1つである請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 3 6】

哺乳類における活性治療物質としての使用のための請求項 1 ~ 3 5 のいずれかに記載の化合物または塩。

【請求項 3 7】

請求項 1 ~ 3 5 のいずれかに記載の式(1)の化合物または薬剤として許容できるその塩、ならびに1つまたは複数の薬剤として許容できる担体および/または賦形剤を含む薬剤組成物。

【請求項 3 8】

哺乳類において炎症性および/またはアレルギー性疾患の治療および/または予防のための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 3 5 のいずれかに記載の式(1)の化合物または薬剤として許容できるその塩の使用。

【請求項 3 9】

炎症性および/またはアレルギー性疾患が、ヒトにおける慢性閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、リウマチ様関節炎、またはアレルギー性鼻炎である請求項 3 8 に記載の使用。