

【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6月26日(2008.6.26)

【公表番号】特表2007-537187(P2007-537187A)

【公表日】平成19年12月20日(2007.12.20)

【年通号数】公開・登録公報2007-049

【出願番号】特願2007-512067(P2007-512067)

【国際特許分類】

C 07 D 215/22	(2006.01)
A 61 K 31/4704	(2006.01)
C 07 D 263/58	(2006.01)
A 61 K 31/423	(2006.01)
C 07 D 265/36	(2006.01)
A 61 K 31/538	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 11/08	(2006.01)
A 61 P 19/04	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)

【F I】

C 07 D 215/22	C S P
A 61 K 31/4704	
C 07 D 263/58	
A 61 K 31/423	
C 07 D 265/36	
A 61 K 31/538	
A 61 P 11/00	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 11/08	
A 61 P 19/04	
A 61 P 11/06	
A 61 P 35/00	
A 61 P 35/02	
A 61 P 37/08	

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月8日(2008.5.8)

【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】

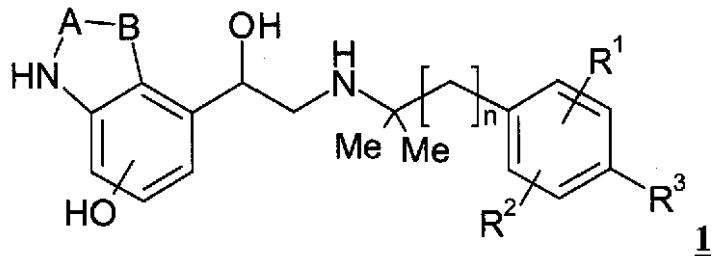
【特許請求の範囲】

【請求項1】

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあっても

よく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び／又は水和物の形態にあってもよい一般式1の化合物：

【化1】



(式中、nは、1又は2を示し；

Aは、- (C=O) -、- S (= O) -、- S (= O)₂ - 及び - C (R⁴ R⁵) - より選ばれる二重結合基を示し；

Bは、- O -、- N R⁶ -、- C H₂ -、- S - C R⁷ R⁸ -、- N R⁶ - C R⁷ R⁸ -、- C H₂ - C R⁷ R⁸ -、- O - C R⁹ R¹⁰ - 及び - C H = C H - より選ばれる二重結合基を示し；

R¹及びR²は、同一であっても異なっていてもよく、水素、C₁₋₄アルキル、ハロゲン、O H又は- O - C₁₋₄アルキルを示し；

R³は、水素、C₁₋₄アルキル、O H、ハロゲン、- O - C₁₋₄アルキル、- C O O H、- C O O - C₁₋₄アルキル、- O - C₁₋₄アルキレン - C O O H又は- O - C₁₋₄アルキレン - C O - O - C₁₋₄アルキルを示し；

R⁴及びR⁵は、同一であっても異なっていてもよく、水素、C₁₋₄アルキル、O H、ハロゲン、- O - C₁₋₄アルキル、- C O O H又は- C O O - C₁₋₄アルキルを示し；

R⁶は、水素又はC₁₋₄アルキルを示し；

R⁷及びR⁸は、同一であっても異なっていてもよく、水素又はC₁₋₄アルキルを示し；

R⁹及びR¹⁰は、同一であっても異なっていてもよく、C₁₋₄アルキルを示す)。

【請求項2】

nが、1又は2を示し；

Aが、- (C=O) -、- S (= O)₂ - 及び - C (R⁴ R⁵) - より選ばれる二重結合基を示し；

Bが、- O -、- N R⁶ -、- C H₂ -、- S - C R⁷ R⁸ -、- N R⁶ - C R⁷ R⁸ -、- C H₂ - C R⁷ R⁸ -、- O - C R⁹ R¹⁰ - 及び - C H = C H - より選ばれる二重結合基を示し；

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、プロピル、フッ素、塩素、臭素、O H、メトキシ又はエトキシを示し；

R³が、水素、メチル、エチル、プロピル、フッ素、塩素、臭素、O H、メトキシ、エトキシ、- C O O H、- C O Oメチル、- C O Oエチル、- O - C H₂ - C O O H、- O - C H₂ - C O O - メチル、- O - C H₂ - C O O - エチル、- O - C H₂ - C H₂ - C O O H、- O - C H₂ - C H₂ - C O O - メチル、- O - C H₂ - C H₂ - C O O - エチル、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C O O H、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C O O - メチル又は- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C O O - エチルを示し；

R⁴及びR⁵が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、O H、フッ素、塩素、- C O O H、- C O Oメチル又は- C O Oエチルを示し；

R⁶が、水素、メチル、エチル又はプロピル、好ましくは水素を示し；

R⁷及びR⁸が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル又はプロピルを示し；

R⁹及びR¹⁰が、同一であっても異なっていてもよく、メチル、エチル又はプロピルを示す。

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の

形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び／又は水和物の形態にあってもよい、請求項1に記載の式1の化合物。

【請求項3】

nが、1又は2を示し；

Aが、- (C=O) - 、 - S (= O)₂ - 及び - C (R⁴R⁵) - より選ばれる二重結合基を示し；

Bが、- O - 、 - NR⁶ - 、 - CH₂ - 、 - S - CR⁷R⁸ - 、 - NR⁶ - CR⁷R⁸ - 、 - CH₂ - CR⁷R⁸ - 、 - O - CR⁹R¹⁰ - 及び - CH = CH - より選ばれる二重結合基を示し；

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ又はエトキシを示し；

R³が、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ、エトキシ、- COO H、- COOメチル、- COOエチル、- O - CH₂ - COOH、- O - CH₂ - COO - メチル、- O - CH₂ - COO - エチル、- O - CH₂ - CH₂ - COOH、- O - CH₂ - CH₂ - COO - メチル又は- O - CH₂ - CH₂ - COO - エチルを示し；

R⁴及びR⁵が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、- COO H、- COOメチル又は- COOエチルを示し；

R⁶が、水素、メチル又はエチルを示し；

R⁷及びR⁸が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル又はエチル、好ましくは水素又はメチルを示し；

R⁹及びR¹⁰が、同一であっても異なっていてもよく、メチル又はエチル、好ましくはメチルを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び／又は水和物の形態にあってもよい、請求項1又は2に記載の式1の化合物。

【請求項4】

nが、1又は2を示し；

Aが、- (C=O) - 、 - S (= O)₂ - 及び - C (R⁴R⁵) - より選ばれる二重結合基を示し；

Bが、- O - 、 - NH - 、 - CH₂ - 、 - S - CH₂ - 、 - NH - CH₂ - 、 - CH₂ - CH₂ - 、 - O - CR⁹R¹⁰ - 及び - CH = CH - より選ばれる二重結合基を示し；

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ又はエトキシを示し；

R³が、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ、エトキシ、- COO H、- COOメチル、- COOエチル、- O - CH₂ - COOH、- O - CH₂ - COO - メチル、- O - CH₂ - COO - エチル、- O - CH₂ - CH₂ - COOH、- O - CH₂ - CH₂ - COO - メチル又は- O - CH₂ - CH₂ - COO - エチルを示し；

R⁴及びR⁵が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、- COO H、- COOメチル又は- COOエチルを示し；

R⁹及びR¹⁰が、同一であっても異なっていてもよく、好ましくは同一であり、メチル又はエチル、好ましくはメチルを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び／又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～3のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項5】

nが、1又は2を示し；

Aが、- (C=O) - 及び - S (= O)₂ - より選ばれる二重結合基を示し；

Bが、-O-、-NH-、-CH₂-、-S-CH₂-、-NH-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-O-CR⁹R¹⁰-及び-CH=CH-より選ばれる二重結合基を示し；

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ又はエトキシを示し；

R³が、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ、エトキシ、-COOH、-COOメチル、-COOエチル、-O-CH₂-COOH、-O-CH₂-COO-メチル、-O-CH₂-COO-エチル、-O-CH₂-CH₂-COOH、-O-CH₂-CH₂-COO-メチル又は-O-CH₂-CH₂-COO-エチルを示し；

R⁹及びR¹⁰が、同一であっても異なっていてもよく、好ましくは同一であり、メチル又はエチル、好ましくはメチルを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び/又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～4のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項6】

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ又はエトキシを示し；

R³が、水素を示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び/又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～5のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項7】

R¹及びR²が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、フッ素、塩素又はメトキシを示し；

R³が、同一であっても異なっていてもよく、水素、メチル、フッ素、塩素又はメトキシを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び/又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～5のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項8】

R³が、メチル、エチル、フッ素、塩素、OH、メトキシ、エトキシ、-COOH、-COOメチル、-COOエチル、-O-CH₂-COOH、-O-CH₂-COO-メチル、-O-CH₂-COO-エチル、-O-CH₂-CH₂-COOH、-O-CH₂-CH₂-COO-メチル又は-O-CH₂-CH₂-COO-エチルを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び/又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～5のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項9】

R³が、メチル、エチル、OH、メトキシ、エトキシ、-O-CH₂-COOH、-O-CH₂-COO-メチル又は-O-CH₂-COO-エチル、好ましくは、OH、メトキシ又はエトキシを示す、

場合により個々のエナンチオマー、個々のエナンチオマー又はラセミ化合物の混合物の形態にあってもよく、場合により薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩の形態にあってもよく、又は、場合によりそれらの溶媒和物及び/又は水和物の形態にあってもよい、請求項1～5のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項10】

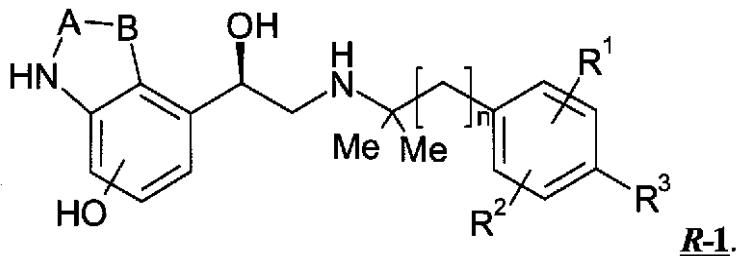
塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ヒドロスルフェート、ヒドロホスフェート、

ヒドロメタンスルホネート、ヒドロニトレート、ヒドロマレエート、ヒドロアセテート、ヒドロベンゾエート、ヒドロシトレート、ヒドロフマレート、ヒドロタートレート、ヒドロオキサレート、ヒドロスクシネート、ヒドロベンゾエート及びヒドロ-*p*-トルエンスルホネートより選ばれる、薬理学的に許容可能な酸との酸付加塩のものの形態にある請求項1～9のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項11】

一般式R-1：

【化2】



のR-エナンチオマーの形態にある請求項1～10のいずれか1項に記載の式1の化合物。

【請求項12】

医薬組成物としての請求項1～11のいずれか1項に記載の一般式1の化合物。

【請求項13】

呼吸器疾患の治療用医薬組成物を製造するための請求項1～12のいずれか1項に記載の一般式1の化合物の使用。

【請求項14】

請求項1～12のいずれか1項に記載の式1の化合物を含む医薬配合物。