

【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 0 7 D 215/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/4704 (2006.01)

C 0 7 D 263/58 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

C 0 7 D 265/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (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 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/22 C S P

A 6 1 K 31/4704

C 0 7 D 263/58

A 6 1 K 31/423

C 0 7 D 265/36

A 6 1 K 31/538

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 19/04

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 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】

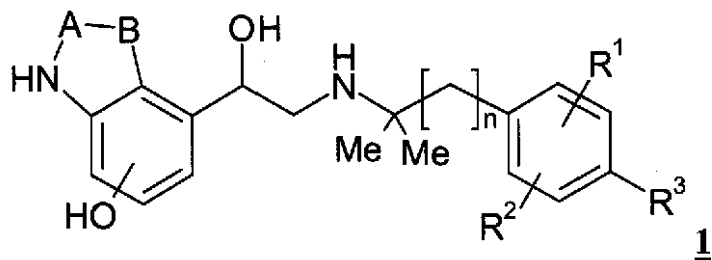
【特許請求の範囲】

【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 $-C(R^4R^5)-$ より選ばれる二重結合基を示し；

B は、 $-O-$ 、 $-NR^6-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-CR^7R^8-$ 、 $-NR^6-CR^7R^8-$ 、 $-CH_2-CR^7R^8-$ 、 $-O-CR^9R^{10}-$ 及び $-CH=CH-$ より選ばれる二重結合基を示し；

R^1 及び R^2 は、同一であっても異なってもよく、水素、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン、 OH 又は $-O-C_{1-4}$ アルキルを示し；

R^3 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 OH 、ハロゲン、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-COOH$ 、 $-COO-C_{1-4}$ アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキレン- $COOH$ 又は $-O-C_{1-4}$ アルキレン- $CO-O-C_{1-4}$ アルキルを示し；

R^4 及び R^5 は、同一であっても異なってもよく、水素、 C_{1-4} アルキル、 OH 、ハロゲン、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-COOH$ 又は $-COO-C_{1-4}$ アルキルを示し；

R^6 は、水素又は C_{1-4} アルキルを示し；

R^7 及び R^8 は、同一であっても異なってもよく、水素又は C_{1-4} アルキルを示し；

R^9 及び R^{10} は、同一であっても異なってもよく、 C_{1-4} 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 $-C(R^4R^5)-$ より選ばれる二重結合基を示し；

B が、 $-O-$ 、 $-NR^6-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-CR^7R^8-$ 、 $-NR^6-CR^7R^8-$ 、 $-CH_2-CR^7R^8-$ 、 $-O-CR^9R^{10}-$ 及び $-CH=CH-$ より選ばれる二重結合基を示し；

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、エチル、プロピル、フッ素、塩素、臭素、 OH 、メトキシ又はエトキシを示し；

R^3 が、水素、メチル、エチル、プロピル、フッ素、塩素、臭素、 OH 、メトキシ、エトキシ、 $-COOH$ 、 $-COO$ メチル、 $-COO$ エチル、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-COO$ メチル、 $-O-CH_2-COO$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-CH_2-COO$ メチル、 $-O-CH_2-CH_2-COO$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-COO$ メチル又は $-O-CH_2-CH_2-CH_2-COO$ エチルを示し；

R^4 及び R^5 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、エチル、 OH 、フッ素、塩素、 $-COOH$ 、 $-COO$ メチル又は $-COO$ エチルを示し；

R^6 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；

R^7 及び R^8 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、エチル又はプロピルを示し；

R^9 及び R^{10} が、同一であっても異なってもよく、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 $-C(R^4R^5)-$ より選ばれる二重結合基を示し；

B が、 $-O-$ 、 $-NR^6-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-CR^7R^8-$ 、 $-NR^6-CR^7R^8-$ 、 $-CH_2-CR^7R^8-$ 、 $-O-CR^9R^{10}-$ 及び $-CH=CH-$ より選ばれる二重結合基を示し；

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、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；

R^3 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、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-COO-$ メチル、 $-O-CH_2-COO-$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-CH_2-COO-$ メチル又は $-O-CH_2-CH_2-COO-$ エチルを示し；

R^4 及び R^5 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、エチル、 $-COOH$ 、 $-COO$ メチル又は $-COO$ エチルを示し；

R^6 が、水素、メチル又はエチルを示し；

R^7 及び R^8 が、同一であっても異なってもよく、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；

R^9 及び R^{10} が、同一であっても異なってもよく、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 $-C(R^4R^5)-$ より選ばれる二重結合基を示し；

B が、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-C$
 H_2- 、 $-O-CR^9R^{10}-$ 及び $-CH=CH-$ より選ばれる二重結合基を示し；

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、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；

R^3 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、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-COO-$ メチル、 $-O-CH_2-COO-$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-CH_2-COO-$ メチル又は $-O-CH_2-CH_2-COO-$ エチルを示し；

R^4 及び R^5 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、エチル、 $-COOH$ 、 $-COO$ メチル又は $-COO$ エチルを示し；

R^9 及び R^{10} が、同一であっても異なってもよく、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、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-C$
 H_2- 、 $-O-CR^9R^{10}-$ 及び $-CH=CH-$ より選ばれる二重結合基を示し；

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、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；

R^3 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、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-COO-$
 メチル、 $-O-CH_2-COO-$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-$
 CH_2-COO- メチル又は $-O-CH_2-CH_2-COO-$ エチルを示し；

R^9 及び R^{10} が、同一であっても異なってもよく、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】

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、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；

R^3 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】

R^1 及び R^2 が、同一であっても異なってもよく、水素、メチル、フッ素、塩素又は
 メトキシを示し；

R^3 が、同一であっても異なってもよく、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】

R^3 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、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-COO-$ メチル
 $-O-CH_2-COO-$ エチル、 $-O-CH_2-CH_2-COOH$ 、 $-O-CH_2-CH_2-$
 $-COO-$ メチル又は $-O-CH_2-CH_2-COO-$ 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】

R^3 が、メチル、エチル、OH、メトキシ、エトキシ、 $-O-CH_2-COOH$ 、 $-O-$
 CH_2-COO- メチル又は $-O-CH_2-COO-$ 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】

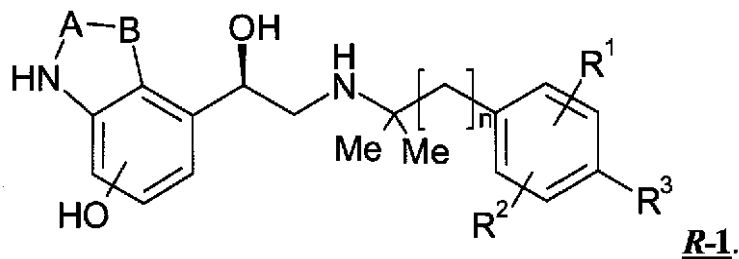
塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ヒドロスルフェート、ヒドロホスフェート、

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 1 1】

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 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の式 1 の化合物。

【請求項 1 2】

医薬組成物としての請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の一般式 1 の化合物。

【請求項 1 3】

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 ~ 1 2 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 1 4】

請求項 1 ~ 1 2 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。