

【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21年3月19日 (2009.3.19)

【公表番号】特表2008-528556(P2008-528556A)

【公表日】平成20年7月31日 (2008.7.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-030

【出願番号】特願2007-552659(P2007-552659)

【国際特許分類】

C 0 7 D 221/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 221/12 C S P

A 6 1 K 31/473

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 31/18

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月28日(2009.1.28)

【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

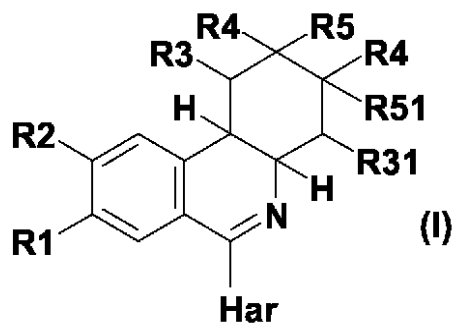
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



〔式中、

R 1 は、ヒドロキシル、C₁～C₄－アルコキシ、C₃～C₇－シクロアルコキシ、C₃～C₇－シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換されたC₁～C₄－アルコキシであり、

R 2 は、ヒドロキシル、C₁～C₄－アルコキシ、C₃～C₇－シクロアルコキシ、C₃～C₇－シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換されたC₁～C₄－アルコキシであるか、又は

R 1 及び R 2 は、一緒になって、C₁～C₂－アルキレンジオキシ基であり、

R 3 は、水素又はC₁～C₄－アルキルであり、

R 3 1 は、水素又はC₁～C₄－アルキルであるか、又は

R 3 及び R 3 1 は、一緒になって、C₁～C₄－アルキレン基であり、

R 4 は、水素又はC₁～C₄－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、又は

R 5 及び R 5 1 は、一緒になって、付加的な結合を表し、

H a r は、R 6 及び／又は R 7 及び／又は R 8 によって置換されたピリジニルであり、その際、

R 6 は、ハロゲン、C₁～C₄－アルキル、C₁～C₄－アルコキシ、C₁～C₄－アルコキシ－C₂～C₄－アルコキシ、C₁～C₄－アルキルチオ、スルファニル、シアノ、C₁～C₄－アルコキシカルボニル、カルボキシル、ヒドロキシル、オキソ、－A－N (R 6 1) R 6

2、ピリジル又は、完全にもしくは部分的にフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、その際、

A は、結合又は $C_1 \sim C_4$ -アルキレンであり、

R 6 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 6 2 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R 6 1 及び R 6 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、R 6 1 1 によって置換されていてよく、かつ R 6 1 及び R 6 2 が結合される窒素原子と、場合により酸素、窒素及び硫黄からなる群から無関係に選択される 1 ～ 3 個の更なるヘテロ原子とを有する、3 員ないし 7 員の飽和もしくは不飽和の単環式の複素環式の環基であり、その際、

R 6 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 7 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、スルファニル、ヒドロキシル、オキソ、アミノ又はモノ-もしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノであり、

R 8 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシである] で示される化合物（但し、式中の H a r が、ヒドロキシル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、カルボキシル、トリフルオロメチル及び $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニルから選択されるいずれか 1 つによって一置換されたピリジルである化合物は除く）及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの塩。

【請求項 2】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであり、

R 3、R 3 1、R 4、R 5 及び R 5 1 は、水素であり、

H a r は、R 6 及び / 又は R 7 及び / 又は R 8 によって置換されたピリジルであり、その際、

R 6 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニル、カルボキシル、オキソ又は -A-N (R 6 1) R 6 2 であり、その際、

A は、結合であり、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであり、

R 6 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであるか、又は

R 6 1 及び R 6 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、一側面では、

H e t 1 は、R 6 1 1 によって環窒素原子上で置換されていてよく、かつ R 6 1 及び R 6 2 が結合される窒素原子と、場合により酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される 1 個の更なるヘテロ原子とを有する、5 員ないし 7 員の飽和の単環式の複素環式の環基であり、その際、

R 6 1 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであるか、又はもう一つの側面では、

H e t 1 は、R 6 1 及び R 6 2 が結合される窒素原子と、場合により 1 ～ 3 個の更なる窒素原子とを有する、5 員の不飽和の単環式のヘテロアリール基であり、

R 7 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 8 は、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシである、請求項 1 記載の化合物（但し、式中の H a r が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、カルボキシル及び $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニルから選択されるいずれか 1 つによって一置換されたピリジルである化合物を除く）及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの

塩。

【請求項 3】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであり、

R 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであり、

R 3、R 3 1、R 4、R 5 及び R 5 1 は、水素であり、

H a r は、R 6 及び R 7 によって置換されており、かつピリジニルであり、その際、

R 6 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ又は A-N (R 6 1) R 6 2 であり、その際、

A は、結合であり、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであり、

R 6 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであり、かつ

R 7 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシであるか、又は

H a r は、R 6 によって置換されており、かつピリジニルであり、その際、

R 6 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ又は -A-N (R 6 1) R 6 2 であり、その際、

A は、結合であり、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであり、

R 6 2 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであるか、又は

H a r は、R 6 及び R 7 によって置換されており、かつピリジニルであり、その際、

R 6 は、オキソであり、かつ

R 7 は、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルであるか、又は

H a r は、R 6 によって置換されており、かつピリジニルであり、その際、

R 6 は、モルホリン-4-イル、ピペリジン-1-イル、ピラゾール-1-イル又はイミダゾール-1-イルである、請求項 1 記載の化合物及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの塩。

【請求項 4】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、メトキシ又はメトキシであり、

R 2 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 3、R 3 1、R 4、R 5 及び R 5 1 は、水素であり、

H a r は、2, 6-ジメトキシピリジン-4-イル、2, 6-ジメトキシピリジン-3-イル、4, 6-ジメトキシ-ピリジン-3-イル、4, 6-ジエトキシ-ピリジン-3-イル、5, 6-ジメトキシ-ピリジン-3-イル、5-エトキシ-6-メトキシ-ピリジン-3-イル及び 1-メチル-1H-ピリジン-2-オン-5-イルである、請求項 1 記載の化合物及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの塩。

【請求項 5】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、メトキシ又はエトキシであり、

R 2 は、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、

R 3、R 3 1、R 4、R 5 及び R 5 1 は、水素であり、

H a r は、R 6 及び R 7 によって置換されており、かつピリジニルであり、その際、

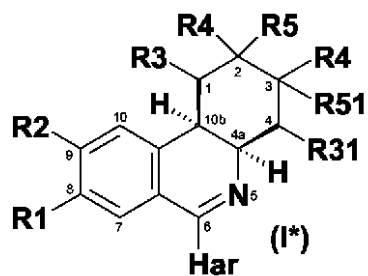
R 6 は、ハロゲン、例えば塩素又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、例えばメトキシであり、

R 7 は、ハロゲン、例えば塩素又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、例えばメトキシである、請求項 1 記載の化合物及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの塩。

【請求項 6】

式 I で示され、4 a 位及び 10 b 位に関して式 I* :

【化 2】



に示される立体配置を有する、請求項 1 から 5 までのいずれか 1 項記載の化合物及び塩、N-オキシド並びにこれらの化合物の N-オキシドの塩。

【請求項 7】

請求項 1 から 6 までのいずれか 1 項記載の 1 種以上の化合物と一緒に医薬品助剤及び／又は賦形剤を含有する呼吸器疾患の治療用の医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 から 6 までのいずれか 1 項記載の化合物を、呼吸器疾患の治療用の医薬組成物を製造するために用いる使用。