

【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 2002-534505 (P2002-534505A)

【公表日】平成 14 年 10 月 15 日 (2002.10.15)

【出願番号】特願 2000-593585 (P2000-593585)

【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 11/04 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 221/12

A 6 1 K 31/473

A 6 1 P 11/04

C 0 7 M 7:00

C 0 7 M 9:00

【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

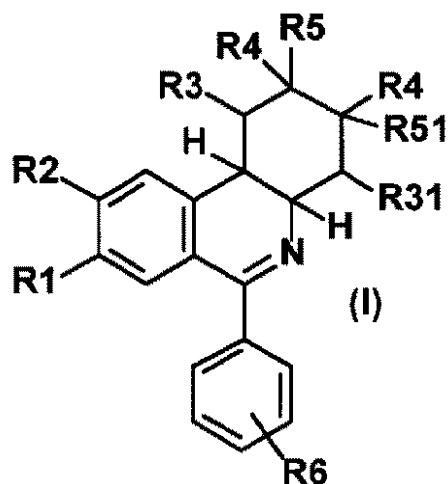
【補正方法】変更

【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であるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 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 - シクロアルコキシメトキシであるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 1 - 4 C - アルコキシであるか、あるいは、

R 1 および R 2 は一緒になって 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 は一緒になって 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 は一緒になって付加的な結合を示し、  
R 6 は  $\text{SO}_2$  - N ( R 7 ) R 8 または  $\text{CO}$  - N ( R 9 ) R 10 であり、その際、R 7 は水素、1 - 7 C - アルキル、3 - 7 C - シクロアルキル、3 - 7 C - シクロアルキルメチル、または、非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 - 置換されたフェニル基であり、  
R 8 は 1 - 7 C - アルキル、3 - 7 C - シクロアルキル、3 - 7 C - シクロ - アルキルメチル、または、非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 - 置換されたフェニル基であるか、または、  
R 7 および R 8 が一緒になって、かつ双方が結合される窒素原子を含んで、1 - ピロリジン、1 - ピペリジル、1 - ヘキサヒドロアゼピニルまたは 4 - モルフォリニル基を示し、  
R 9 は水素または 1 - 4 C アルキルであり、  
R 10 は非置換であるかまたは R 11 - 置換されたピリジル基、または、非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 - 置換されたフェニル基であり、その際、R 11 はハロゲン、ニトロ、カルボキシル、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、トリフルオロメチルであるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 1 - 4 C - アルコキシであり、  
R 12 はヒドロキシル、ハロゲン、1 - 4 C - アルキルまたは 1 - 4 C - アルコキシであり、  
R 13 はヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、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、アミノ、モノ - またはジ - 1 - 4 C - アルキルアミノ、アミノカルボニル、モノ - またはジ - 1 - 4 C - アルキルアミノカルボニルであるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 1 - 4 C - アルコキシである ] の化合物の N - オキシドまたはこの 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であるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 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であるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 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 が一緒になって付加的な結合を示し、  
R 6 が  $\text{SO}_2$  - N ( R 7 ) R 8 または  $\text{CO}$  - N ( R 9 ) R 10 であり、その際、R 7 が水素、1 - 4 C - アルキル、3 - 7 C - シクロアルキル、3 - 7 C - シクロアルキルメチルであるか、あるいは非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 置換されたフェニル基であり、  
R 8 が 1 - 4 C - アルキル、3 - 7 C - シクロアルキル、3 - 7 C - シクロアルキルメチルであるか、あるいは非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 置換されたフェニル基であるか、または、  
R 7 および R 8 が一緒になって、かつ双方が結合される窒素原子を含んで、1 - ピペリジ

ルまたは 4 - モルフォリニル基を示し、

R 9 が水素であり、

R 10 が非置換であるかまたは R 11 - 置換されたピリジル基であるか、あるいは非置換であるかまたは R 12 - および / または R 13 - 置換されたフェニル基であり、

その際、R 11 はハロゲン、1 - 4 C - アルコキシ、1 - 4 C - アルキル、トリフルオロメチルであるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 1 - 4 C - アルコキシであり、

R 12 はヒドロキシル、ハロゲン、1 - 4 C - アルキルまたは 1 - 4 C - アルコキシであり、

R 13 はヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシル、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であるか、あるいは完全にかまたは大部分がフッ素置換された 1 - 4 C - アルコキシである、請求項 1 に記載の式 I の化合物の N - オキシドまたはこの N - オキシドの塩。

【請求項 3】 R 1 が 1 - 2 C - アルコキシ、

R 2 が 1 - 2 C - アルコキシ、

R 3、R 31、R 4、R 5 および R 51 が水素であり、

R 6 が  $\text{SO}_2 - \text{N}(\text{R}7)\text{R}8$  または  $\text{CO} - \text{N}(\text{R}9)\text{R}10$  であり、

その際、R 7 が水素、1 - 4 C - アルキルであるか、あるいは非置換であるかまたは R 13 - 置換されたフェニル基であり、

R 8 が 1 - 4 C - アルキルまたは非置換されたかまたは R 13 - 置換されたフェニル基であり、

R 9 が水素であり、

R 10 が非置換のピリジル基であるか、あるいは非置換であるかまたは R 13 - 置換されたフェニル基であり、かつ、

R 13 はハロゲン、シアノ、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 の化合物の N - オキシドおよびこの 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、R 31、R 4、R 5 および R 51 が水素であり、

R 6 が  $\text{CO} - \text{N}(\text{R}9)\text{R}10$  であり、

その際、R 9 が水素であり、かつ

R 10 が 4 - メトキシフェニルである、請求項 1 に記載の式 I の化合物の N - オキシドまたはこの N - オキシドの塩。

【請求項 5】 出発物質として使用することができる、旋光度

【数 1】

$$[\alpha]_{\text{D}}^{20} = -58.5^\circ (c = 1, \text{エタノール})$$

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 4 a 位および 10 b 位で同じ絶対立体配置を有する、請求項 1 から 4 までのいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の N - オキシド。

【請求項 6】 請求項 1 から 5 までのいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の少なくとも一つの N - オキシドならびに医薬品添加剤および / または賦形剤を含有する 気道疾患を治療するための医薬品。