

【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 07 D 221/12 (2006.01)

A 61 K 31/473 (2006.01)

A 61 P 11/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 221/12

A 61 K 31/473

A 61 P 11/04

C 07 M 7:00

C 07 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

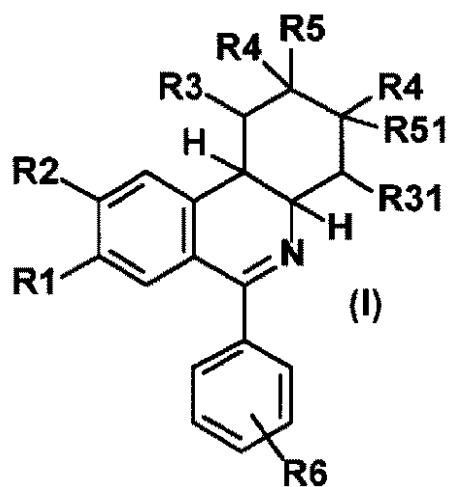
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】式I

【化1】



[式中、R1はヒドロキシル、1-4C-アルコキシ、3-7C-シクロアルコキシ、3-7C-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1-4C-アルコキシであり、

R2はヒドロキシル、1-4C-アルコキシ、3-7C-シクロアルコキシ、3-7C-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1-4C-アルコキシであるか、あるいは、

R1およびR2は一緒になって1-2Cアルキレンジオキシ基であり、

R3は水素または1-4C-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 SO₂ - N (R 7) R 8 または CO - N (R 9) R 1 0 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 1 2 - および / または R 1 3 - 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 1 2 - および / または R 1 3 - 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 - ピロリジニル、1 - ピペリジル、1 - ヘキサヒドロアゼビニルまたは 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 1 0 は非置換であるかまたは R 1 1 - 置換されたピリジル基、または、非置換であるかまたは R 1 2 - および / または R 1 3 - 置換されたフェニル基であり、その際、R 1 1 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 1 2 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 1 3 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 SO₂ - N (R 7) R 8 または CO - N (R 9) R 1 0 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 1 2 - および / または R 1 3 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 1 2 - および / または R 1 3 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、1-4C-アルコキシ、1-4C-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1-4C-アルコキシであり、

R 12はヒドロキシル、ハロゲン、1-4C-アルキルまたは1-4C-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、1-4C-アルキル、トリフルオロメチル、1-4C-アルコキシ、1-4C-アルコキシ-カルボニル、1-4C-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1-4C-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1-2C-アルコキシ、

R 2が1-2C-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SO₂-N(R 7)R 8またはCO-N(R 9)R 10であり、

その際、R 7が水素、1-4C-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1-4C-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、1-4C-アルキルまたは1-4C-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1-2C-アルコキシであり、

R 2が1-2C-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CO-N(R 9)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】

[a]_D²⁰ = -58.5° (c = 1, 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4a位および10b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。