

【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17年7月14日(2005.7.14)

【公表番号】特表2001-504479(P2001-504479A)

【公表日】平成13年4月3日(2001.4.3)

【出願番号】特願平10-523345

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/498

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/14

【F I】

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/498

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成16年11月15日(2004.11.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成16年11月15日

特許庁長官殿

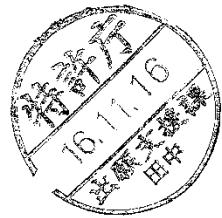
1. 事件の表示

平成10年特許願第523345号



2. 補正をする者

氏名（名称） ダーウィン・ディスカバリー・リミテッド



3. 代理人

住所

〒540-0001
大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル
青山特許事務所
電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名

弁理士 (6214) 青山 葵



4. 補正対象書類名 請求の範囲

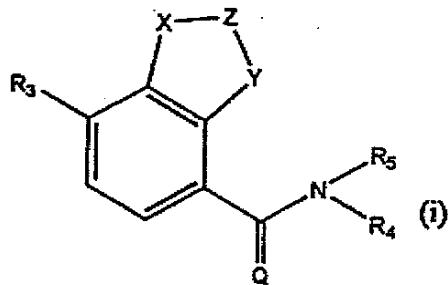
5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容
別紙のとおり。

(別紙)

請求の範囲

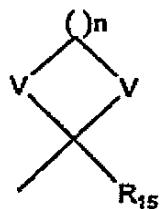
1. 一般構造式(i)



[式中、(1) XはNであり、および(a) Zは=CR₁-CR₂=であり、YはNである、(b) Zは=CR₁-であり、YはO、S、またはNR₄である、または、(c) Zは=CR₁-N=であり、YはCR²である、もしくは(2) XはNR₄であり、Zは-CR₁=であり、およびYはNである、

QはOあるいはSである、

R₁とR₂は同一または異なっていても良く、それぞれCOR₆、C(=NOR₆)R₁₃、アルキルC(=NOR₆)R₁₃、NR₈R₉、CON(R₆)₂、ハロゲン、CF₃、CN、CO₂H、CO₂R₁₀、R₆、CO-hetであり、ここでhetは環中のN原子経由で結合している複素環式の環(モルフォリンやピペリジンのごとき)であって、1もしくは複数のR₁₄あるいは環基



で任意に置換されるものである、

R₃はOH、チオアルキル、またはそれぞれ任意に1もしくは複数のハロゲン

と置換されていても良い C_{1-6} アルコキシもしくはシクロアルコキシである、

R_4 はHまたはアルキルである、

R_5 はアリールまたはヘテロアリールであり、どちらもハロゲン、任意にハロゲン置換されたアルキル、ヒドロキシ、任意にハロゲン置換されたアルコキシ、 CO_2H 、 CO_2R_{10} 、 $CONR_{11}R_{12}$ 、 COR_{10} 、 SO_2R_{10} 、 $SO_2NR_{11}R_{12}$ 、 NR_8R_9 およびCNから選択される1または複数の置換基で任意に置換されてもよい、

各 R_6 は独立してH、またはアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキルおよびヘテロシクロアルキルより選択される基である、これらの基のいずれも、いずれかの位置が R_7 で任意に置換される、

R_7 は、アルキル、ヒドロキシ、 OR_{10} 、 NR_8R_9 、CN、 CO_2H 、 CO_2R_{10} 、 $CONR_{11}R_{12}$ または COR_{10} である、

R_8 はH、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、ヘテロシクロカルボニル、アルキルスルフォニル、アリールスルフォニル、ヘテロアリールスルフォニルまたはヘテロシクロスルフォニルである； R_9 はH、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アラルキル、ヘテロアリールアルキルまたはヘテロシクロアルキルである；あるいは NR_8R_9 は任意に R_{14} で置換される複素環式環(モルフォリン、あるいはピペリジンのごとき)である、

R_{10} はアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキルまたはヘテロシクロアルキルである、

R_{11} および R_{12} は、同一または異なっていても良く、それぞれはHあるいは R_{10} である、

R_{13} は1もしくは複数の R_7 で任意に置換される R_{10} である、

R_{14} はアルキル、アリールアルキルあるいはヘテロアリールアルキルであり、

および

- R_{15} はアルキル、VはOまたはSであり、およびnは2-4である]で表される化合物、またはその製薬学的に許容される化合物の塩。
2. R_3 がメトキシである、請求項1記載の化合物。
 3. R_4 がHである、請求項1または請求項2記載の化合物。
 4. R_5 が任意に置換された4-ピリジルまたは任意に置換された4-ピリジル-N-オキシドである、前記請求項いずれかに記載の化合物。
 5. XがNである、前記請求項いずれかに記載の化合物。
 6. R_1 と R_2 が独立してCOR₆、C(=NOR₆)R₁₃、CF₃、CN、R₆あるいは前述の環基である、前記請求項いずれかに記載の化合物。
 7. R_1 と R_2 が同一あるいは異なっていても良く、それぞれがCOR₆、C(=NOR₆)R₁₃、アルキルC(=NOR₆)R₁₃、NR₈R₉、CON(R₁₃)₂、ハロゲン、CF₃、CN、CO₂H、CO₂R₁₀またはR₆であり、およびR₃がOH、チオアルキルまたは任意に置換されたアルコキシであり、R₅がどちらもハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、CO₂H、CO₂R₁₀、CONR₁₁R₁₂、COR₁₀、SO₂R₁₀、SO₂NR₁₁R₁₂、NR₈R₉およびCNより選出された1または複数の置換基で任意に置換されていてよいアリールまたはヘテロアリールであり、
 8. R₇はアルキルではなく、およびR₈とR₉が独立している、前記請求項いずれかに記載の化合物。
 8. QがOであり、
R₁とR₂が同一あるいは異なっていても良く、それぞれがCOR₁₃、C(=NOR₁₀)R₁₃、CN、CO₂H、CO₂R₁₀、CONR₁₁R₁₂、またはR₆であり、
R₃が、1または複数のハロゲンで任意に置換されたC₁₋₆アルコキシであり、R₆がH、またはアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキルおよびヘテロシクロアルキルから選ばれた基であり、これらの基のいずれも、いずれかの位置が任意にR₇で置換されおり、

R_{10} がアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、またはヘテロシクロアルキルであり、および、

R_{11} および R_{12} が同一または異なっていても良く、それぞれはHまたは R_1 である、請求項7記載の化合物。

9. 8-メトキシキノキサリン-5-[N-(2,6-ジクロロピリド-4-イル)]カルボキシアミドである、請求項1記載の化合物。

10. 2-トリフルオロメチル-3-メチル-7-メトキシベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリド-4-イル)]カルボキシアミド、

2-エチル-4-メトキシベンゾオキサゾール-7-[N-(4-ピリジル)]カルボキシアミド、および

2-エチル-7-メトキシベンゾオキサゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリド-4-イル)]カルボキシアミドより選択される、請求項1記載の化合物。

11. 2-アセチル-7-メトキシ-3-メチルエンジイミダゾール-4-[N-(ピリジン-4-イル)]カルボキシアミド、

7-メトキシ-3-プロピル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イル)]カルボキシアミド、

2-アセチル-7-メトキシ-3-メチルベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリド-4-イル)]カルボキシアミド、

2-エチル-4-メトキシベンゾオキサゾール-7-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イル)]カルボキシアミド、

2-エチル-7-メトキシベンゾオキサゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イルN-オキシド)]カルボキシアミド、

4-メトキシベンゾオキサゾール-7-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イル)]カルボキシアミド、

7-メトキシ-3-(4-メトキシベンジル)-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イル)]カルボキシアミド、

2-(2-メチル-[1,3]ジオキソラン-2-イル)-4-メトキシベン

ゾオキサゾール-7-[N-(3,5-ジクロロピリジン-4-イル)]カルボン酸、
N-(3,5-ジクロロピリド-4-イル)-7-メトキシ-2-トリフル
オロメチルベンゾイミダゾール-4-カルボキシアミド、
2-(1-ヒドロキシイミノ)エチル-7-メトキシ-3-メチルベンゾ
イミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリジル)]カルボキシアミド、
3-メチル-2-1-(2-メチルチアゾール-4-イルメトキシ)イミノ
エチル)-7-メトキシベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリド
-4-イル)]カルボキシアミド、および
3-メチル-2-[1-(3-ジメチルアミノプロピロキシ)イミノエチル]
-7-メトキシベンゾイミダゾール-4-[N-(3,5-ジクロロピリド-4-
イル)]カルボキシアミドより選択される、請求項1記載の化合物。

12. エナンチオマーの形態である、前記請求項いずれかに記載の化合物。

13. 前記請求項の化合物および製薬学的に許容される担体あるいは賦形剤を
含む、治療上の使用のための医薬組成物。

14. ホスホジエステラーゼIVあるいは腫瘍壞死因子の阻害により調節が可能
な疾患の治療、あるいは、ホスホジエステラーゼIVの機能、好酸球の集積あるいは
好酸球の機能と関わりのある病理学的症状の疾患の治療に用いられる薬剤の製
造に関する、請求項13記載の医薬組成物。

15. 疾患が炎症性疾患または自己免疫性疾患である、請求項14記載の医薬
組成物。

16. 疾患が、喘息、慢性気管支炎、慢性肺炎、慢性閉鎖性気管支炎、アトピー
性皮膚炎、アレルギー性鼻炎、乾癬、関節炎、リューマチ関節炎、関節炎、潰
瘍性大腸炎、クローン病、アトピー性湿疹、卒中、骨粗鬆症、多発性硬化症およ
び、炎症性腸炎から選択される、請求項14記載の医薬組成物。

17. 疾患が、蕁麻疹、アレルギー性結膜炎、春の結膜炎、目の炎症、目のア
レルギー反応、好酸性肉芽腫、痛風性関節炎およびその他の関節炎症状、成人呼
吸障害症候群、尿崩症、ケラトーシス、大脳老衰、多梗塞痴呆、老衰痴呆、パー
キンソン病に関わる記憶障害、鬱病、心停止、間欠脈跛行、リューマチ性脊椎炎、
骨関節症、敗血症、敗血ショック、エンドトキシンショック、グラム陰性敗血症、

毒ショック症候群、大脳マラリア、珪肺症、肺サルコイドーシス、再灌流障害、移植片対ホスト反応、同種移植片拒絶反応、感染熱、あるいは筋肉痛、マラリア、H I V、A I D S、A R C、カヘキシー、ケロイド生成、瘢痕組織生成、パイレス(pyresis)、全身性エリテマドーデス、1型糖尿病、ベーチェット病、アナフィラキシー様の紫斑腎炎、慢性糸球体腎炎、白血病、遅発性ジスキネジア、イーストまたは真菌感染、胃保護を要する症状、および炎症と痛みを伴う神経性炎症病から選択される、請求項14記載の医薬組成物。

18. 疾患が喘息である請求項14記載の医薬組成物。

19. 疾患が、慢性閉塞性気管障害、慢性気管支炎、または慢性肺炎症性疾患である、請求項14記載の医薬組成物。