

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
8. Juni 2006 (08.06.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/058868 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 475/08 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)

(74) Gemeinsamer Vertreter: BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH; Binger Str. 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/056245

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum:
25. November 2005 (25.11.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 057 594.0
29. November 2004 (29.11.2004) DE

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von DE, US): BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH [DE/DE]; Binger Str. 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).

(71) Anmelder (nur für DE): BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG [DE/DE]; Binger Str. 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DOLLINGER, Horst [DE/DE]; Schemmerberger Steige 1, 88433 Schemmerhofen (DE). MARTYRES, Domnic [GB/DE]; Amriswilstr. 53, 88400 Biberach (DE). MACK, Juergen [DE/DE]; Maria-menz-weg 12, 88400 Biberach (DE). NICKOLAUS, Peter [DE/DE]; Sattlergasse 3, 88447 Warthausen (DE). JUNG, Birgit [DE/DE]; Schlossäcker 9, 88471 Laupheim (DE).

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 3. August 2006

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED PTERIDINES FOR TREATING INFLAMMATORY DISEASES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PTERIDINE ZUR BEHANDLUNG VON ENTZÜNDLICHEN ERKRANKUNGEN

(57) Abstract: The invention relates to novel pteridines which can be used in the treatment of respiratory or gastrointestinal complaints or diseases, joint, skin or eye inflammatory diseases, diseases of the periphery or central nervous system or cancer. The invention also relates to pharmaceutical compositions which contain said compounds.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue Pteridine, die geeignet sind zur Behandlung von: Atemwegs- oder gastrointestinalen Beschwerden oder Erkrankungen, entzündlichen Erkrankungen der Gelenke, der Haut oder der Augen, Erkrankungen des peripheren oder zentralen Nervensystems oder Krebserkrankungen, sowie pharmazeutische Zusammensetzungen die diese Verbindungen beinhalten.

WO 2006/058868 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2005/056245

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D475/08 A61K31/519 A61P35/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	DE 35 40 952 A1 (DR.KARL THOMAE GMBH; DR. KARL THOMAE GMBH, 88400 BIBERACH, DE) 21 May 1987 (1987-05-21) cited in the application claim 1 page 3, line 43	1-17
Y	EP 0 185 259 A (DR. KARL THOMAE GMBH) 25 June 1986 (1986-06-25) page 2, line 8 - line 15	1-17
Y	WO 03/062240 A (FAUSTUS FORSCHUNGS CIE. TRANSLATIONAL CANCER RESEARCH GMBH; EISENBRAND) 31 July 2003 (2003-07-31) claim 1	1-17
	----- -/--	
<input checked="" type="checkbox"/>	Further documents are listed in the continuation of Box C.	<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents :		
<p>*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>*E* earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>*L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>*P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p>		<p>*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>*X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>*Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>*Z* document member of the same patent family</p>
Date of the actual completion of the international search 22 May 2006		Date of mailing of the international search report 07/06/2006
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Steendijk, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2005/056245

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	<p>MERZ K-H ET AL: "Synthesis of 7-Benzylamino-6-chloro-2-piperazino-4-pyrr olidinopterid ine and Novel Derivatives Free of Positional Isomers. Potent Inhibitors of cAMP-Specific Phosphodiesterase and of Malignant Tumor Cell Growth" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON, US, vol. 41, no. 24, 1998, pages 4733-4743, XP002239611 ISSN: 0022-2623 cited in the application table 2</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-17

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No PCT/EP2005/056245

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 3540952	A1	21-05-1987 CA 1337813 C	26-12-1995
EP 0185259	A	25-06-1986 AU 576924 B2	08-09-1988
		AU 5123285 A	19-06-1986
		CA 1252783 A1	18-04-1989
		DE 3445298 A1	12-06-1986
		DK 572685 A	13-06-1986
		ES 8707238 A1	01-10-1987
		FI 854862 A	13-06-1986
		GR 852996 A1	16-04-1986
		IL 77294 A	28-02-1989
		JP 61140585 A	27-06-1986
		NO 854965 A	13-06-1986
		NZ 214522 A	28-07-1988
		PH 24451 A	25-06-1990
		PT 81650 A	01-01-1986
		ZA 8509462 A	29-07-1987
WO 03062240	A	31-07-2003 CA 2511238 A1	31-07-2003
		DE 10202468 A1	30-09-2004
		EP 1467994 A1	20-10-2004
		JP 2005519912 T	07-07-2005
		US 2005054653 A1	10-03-2005

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/056245

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D475/08 A61K31/519 A61P35/00				
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC				
B. RECHERCHIERTE GEBIETE				
Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D				
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen				
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data				
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN				
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.		
Y	DE 35 40 952 A1 (DR.KARL THOMAE GMBH; DR. KARL THOMAE GMBH, 88400 BIBERACH, DE) 21. Mai 1987 (1987-05-21) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 Seite 3, Zeile 43	1-17		
Y	EP 0 185 259 A (DR. KARL THOMAE GMBH) 25. Juni 1986 (1986-06-25) Seite 2, Zeile 8 - Zeile 15	1-17		
Y	WO 03/062240 A (FAUSTUS FORSCHUNGS CIE. TRANSLATIONAL CANCER RESEARCH GMBH; EISENBRAND). 31. Juli 2003 (2003-07-31) Anspruch 1	1-17		
----- -/--				
<table style="width: 100%; border: none;"> <tr> <td style="width: 50%; border: none;"><input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen</td> <td style="width: 50%; border: none;"><input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie</td> </tr> </table>			<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie			
<table style="width: 100%; border: none;"> <tr> <td style="width: 50%; border: none;"> * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist </td> <td style="width: 50%; border: none;"> *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist </td> </tr> </table>			* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist			
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts		
22. Mai 2006		07/06/2006		
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Steendijk, M		

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	<p>MERZ K-H ET AL: "Synthesis of 7-Benzylamino-6-chloro-2-piperazino-4-pyrro- lidinopterin and Novel Derivatives Free of Positional Isomers. Potent Inhibitors of cAMP-Specific Phosphodiesterase and of Malignant Tumor Cell Growth" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON, US, Bd. 41, Nr. 24, 1998, Seiten 4733-4743, XP002239611 ISSN: 0022-2623 in der Anmeldung erwähnt Tabelle 2</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-17

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/056245

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
DE 3540952	A1	21-05-1987	CA 1337813 C	26-12-1995
EP 0185259	A	25-06-1986	AU 576924 B2	08-09-1988
			AU 5123285 A	19-06-1986
			CA 1252783 A1	18-04-1989
			DE 3445298 A1	12-06-1986
			DK 572685 A	13-06-1986
			ES 8707238 A1	01-10-1987
			FI 854862 A	13-06-1986
			GR 852996 A1	16-04-1986
			IL 77294 A	28-02-1989
			JP 61140585 A	27-06-1986
			NO 854965 A	13-06-1986
			NZ 214522 A	28-07-1988
			PH 24451 A	25-06-1990
			PT 81650 A	01-01-1986
			ZA 8509462 A	29-07-1987
WO 03062240	A	31-07-2003	CA 2511238 A1	31-07-2003
			DE 10202468 A1	30-09-2004
			EP 1467994 A1	20-10-2004
			JP 2005519912 T	07-07-2005
			US 2005054653 A1	10-03-2005