

【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16年12月2日(2004.12.2)

【公表番号】特表2001-509782(P2001-509782A)

【公表日】平成13年7月24日(2001.7.24)

【出願番号】特願平9-538862

【国際特許分類第7版】

C 0 7 F 7/08

A 6 1 K 31/695

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 F 7/10

C 0 7 F 7/12

【F I】

C 0 7 F 7/08 F

A 6 1 K 31/695

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 F 7/08 G

C 0 7 F 7/08 J

C 0 7 F 7/10 F

C 0 7 F 7/12 D

【手続補正書】

【提出日】平成16年3月2日(2004.3.2)

【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】

## 手 続 補 正 書

平成16年 3 月 2 日

特許庁長官 今 井 康 夫 殿

## 1. 事件の表示

平成9年特許願第538862号 ✓



## 2. 補正をする者

住 所 アメリカ合衆国ニュージャージー州 08807-0800. ✓ブリッジ /  
ウオーター. ✓サマセット / ✓コーボレイト / プールヴァード  
300 ✓

名 称 アベンティス・ファーマスーティカルズ / インコーポレイ  
テッド ✓

## 3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区麹町一丁目10番地(麹町広洋ビル)

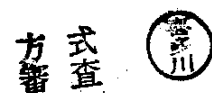
電 話 (3261)2022

氏 名 (9173) 高 木 千 嘉 (外主名) ✓  

## 4. 補正命令の日付 (自発)

## 5. 補正対象書類名

請 求 の 範 囲



## 6. 補正対象項目名

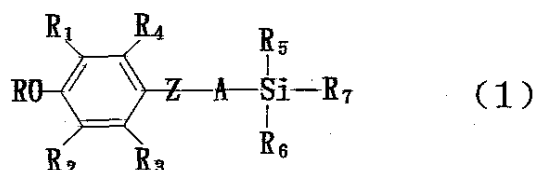
請 求 の 範 囲

## 7. 補正の内容

請求の範囲を別紙のとおり補正します。

## 請求の範囲

## 1. 式



の化合物またはその医薬的に許容し得る塩。

上記式において、

$\text{R}_1$ および $\text{R}_6$ は、それぞれ独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

$\text{R}_2$ 、 $\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、それぞれ独立して、水素または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

$\text{R}$ は、水素または $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_m-\text{Q}$ （式中、 $\text{Q}$ は水素または $-\text{COOH}$ でありそして $m$ は、整数1、2、3または4である）であり；

$\text{Z}$ は、チオ、オキシまたはメチレン基であり；

$\text{A}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキレン基であり；

$\text{R}_5$ および $\text{R}_7$ は、それぞれ独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルまたは $-(\text{CH}_2)_n-(\text{Ar})$ 〔式中、 $n$ は整数0、1、2または3でありそして $\text{Ar}$ は、置換されていないかまたはヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルまたは $-\text{NR}_8\text{R}_9$ （式中、 $\text{R}_8$ および $\text{R}_9$ はそれぞれ独立して水素または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである）からなる群から選択された1～3個の置換分によって置換されているフェニルまたはナフチルである〕である。但し、 $\text{R}_2$ および、 $\text{R}_5$ もしくは $\text{R}_7$ の少なくとも1個が $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルでありそして $\text{Ar}$ がトリフルオロメチルまたは $-\text{NR}_8\text{R}_9$ により置換されていない場合は、 $\text{R}$ は $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_m-\text{Q}$ であるということを条件とする。

2.  $R_1$ がメチルまたは第3ブチルであり； $R_2$ および $R_3$ がそれぞれ独立して水素、メチルまたは第3ブチルであり； $R_4$ が水素またはメチルであり； $R_5$ がメチルであり； $R_6$ がメチルまたはフェニルでありそしてRが水素、アセチルまたはサクシニルである請求項1記載の化合物。
3.  $R_7$ が $-(CH_2)_n-(Ar)$ （式中、 $n$ は整数0、1、2または3でありそしてArは1～3個の $-NR_8R_9$ 置換分により置換されたフェニルである）である請求項1記載の化合物。
4. Rが水素、アセチルまたはサクシニルであり； $R_1$ がメチルまたは第3ブチルであり； $R_2$ および $R_3$ がそれぞれ独立して、水素、メチルまたは第3ブチルであり； $R_4$ が水素またはメチルであり； $R_5$ および $R_6$ がそれぞれメチルである請求項3記載の化合物。
5.  $R_8$ および $R_9$ がそれぞれメチルでありそしてRが水素である請求項4記載の化合物。
6. Rが $-C(O)-(CH_2)_m-Q$ （式中、Qは水素または $-COOH$ でありそしてmは整数1、2、3または4である）である請求項1記載の化合物。
7.  $R_1$ がメチルまたは第3ブチルであり； $R_2$ および $R_3$ がそれぞれ独立して水素、メチルまたは第3ブチルであり； $R_4$ が水素またはメチルであり； $R_5$ がメチルであり； $R_6$ がメチルまたはフェニルであり；そして $R_8$ および $R_9$ がそれぞれメチルである請求項6記載の化合物。
8. Zがチオである請求項2記載の化合物。
9. Zがオキシである請求項2記載の化合物。
10. 化合物が、
  - 2,6-ジ-*t*-ブチル-4-[(ジフェニルメチルシリル)メチルオキシ]フェノール、
  - 2,6-ジ-*t*-ブチル-4-[(4-N,N-ジメチルアミノフェニルジ

メチルシリル) -メチルオキシ] フェノール、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチル-4-トリフルオロメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチル-3-トリフルオロメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール、

2-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノールコハク酸エステル、

2-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノールコハク酸エステル、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルチオ] フェノールコハク酸エステル、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(トリメチルシリル) メチルチオ] フェノールコハク酸エステル、

2-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール酢酸エステル、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール酢酸エステル、

2,3,6-トリメチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール酢酸エステル、

2,5-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール、

2,5-ジ-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル) メチルオキシ] フェノール酢酸エステル、

2-tert-ブチル-4-[(ジメチルフェニルシリル)メチルチオ]フェノール、

2,3,6-トリメチル-4-[(ジメチルフェニルシリル)メチルオキシ]フェノール、

2,3,5-トリメチル-4-[(ジメチルフェニルシリル)メチルオキシ]フェノール、

2-tert-ブチル-4-[(ジメチル-p-メトキシフェニルシリル)メチルオキシ]フェノール、

2,5-ジ-tert-ブチル-4-[(ジフェニルメチルシリル)メチルオキシ]フェノール、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(ジフェニルメチルシリル)メチルオキシ]フェノール、

2,6-ジ-tert-ブチル-4-[(メチル-ジ-p-メトキシフェニルシリル)メチルオキシ]フェノール、または

2-tert-ブチル-4-[(ジメチルベンジルシリル)メチルオキシ]フェノール

である請求項1記載の化合物。

11. 請求項1記載の化合物を医薬的に許容し得る担体または賦形剤とともに含有する医薬組成物。
12. アテローム性動脈硬化症の進行を阻害する医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。
13. アテローム性動脈硬化症を治療する医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。
14. LDLコレステロールの過酸化を阻害する医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。

15. 血漿コレステロールレベルを低下させる医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。
16. 血管細胞接着分子—1および(または)細胞間接着分子—1のサイトカイン—誘発発現を阻害する医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。
17. 喘息、慢性炎症、リウマチ様関節炎、自己免疫糖尿病、移植組織拒絶または腫瘍脈管形成から選ばれる慢性炎症性疾患の治療用医薬組成物を製造するための請求項1記載の化合物の使用。