

【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12月8日(2005.12.8)

【公表番号】特表2001-526687(P2001-526687A)

【公表日】平成13年12月18日(2001.12.18)

【出願番号】特願平10-550617

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 207/34

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/433

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/14

A 6 1 P 9/02

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 33/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 37/06

C 0 7 D 307/68

C 0 7 D 333/38

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 409/12

C 0 7 D 417/12

【F I】

C 0 7 D 207/34

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/40	
A 6 1 K	31/4025	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/433	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/14	
A 6 1 P	9/02	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	33/06	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	37/06	
C 0 7 D	307/68	
C 0 7 D	333/38	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	409/12	
C 0 7 D	417/12	

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月16日(2005.5.16)

【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17年5月16日

特許庁長官 殿



1. 事件の表示

平成10年特許願第550617号

2. 補正をする者

住 所 アメリカ合衆国06516-4175、コネチカット
、ウエストヘブン、モルガンレーン400

名 称 バイエル、コーポレーション

3. 代理人

住 所 大阪府中央区淡路町2丁目1番13号 弘栄ビル

電話 (06) 6222-0547

氏 名 (6036) 弁理士 赤 岡 迪 夫



4. 補正対象書類名

明細書

5. 補正対象項目名

特許請求の範囲

6. 補正の内容

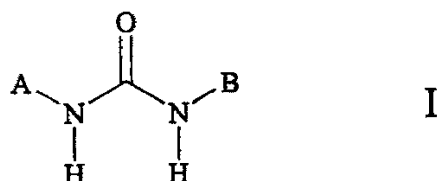
別紙のとおり



補 正 の 内 容

1. 特許請求の範囲を以下のように補正する。

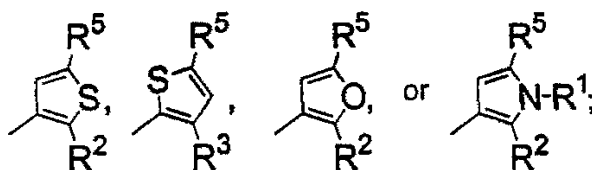
「1. 下記の式 I の化合物：



上式において、

Aは、場合により置換されたC₆₋₁₂アリールまたはC₅₋₁₂ヘテロアリールであり；

Bは、



であり；

R¹は、HまたはC₁₋₄アルキルであり；

R²およびR³は、それぞれ独立して、ハロゲン、-COOR¹、-CN、-CON

R⁷R⁸または-CH₂NHR⁹であり；

R⁵は、C₃₋₅アルキルであり；

R⁶はC₁₋₆アルキルであり；

R⁷は、水素であり；

R⁸は、メチルであり；

R⁹は、水素、メチル、または-CO-R¹⁰であり；そして

R¹⁰は、水素、あるいは場合により、NR⁶₂またはCOOR⁶によって置換されたメチルである。

2. 活性成分として請求項1の化合物を含んでいる炎症性疾患または免疫調節疾患を処置するための医薬。

3. 前記疾患はp38によって調節されるサイトカインまたはプロテアーゼによって仲介される請求項2の医薬。

4. Aは、場合により C_{1-4} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR^1$ または $-NR^1_2$ によって置換された C_{6-12} アリールまたは C_{5-12} ヘテロアリールである請求項2の医薬。

5. R^5 はイソプロピルまたは t -ブチルである請求項2の医薬。

6. Aは、各自 C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR^1$ または $-NR^1_2$ によって置換されたフェニル、1, 3, 4-チアジアゾル-2-イルまたは1, 3, 4-チアジアゾル-5-イル、7-インドリル、あるいは8-キノリニルである請求項2の医薬。

7. Aは、4-メチルフェニル、4-フルオロフェニル、5-メチル-2-チエニル、4-メチル-2-チエニル、または5-シクロプロピル-1, 3, 4-チアジアゾル-2-イルである請求項2の医薬。

8. R^2 または R^3 は、 $-COOR^1$ または CH_2NHR^9 であり、かつ R^1 は C_{1-4} アルキルであり、 R^7 はHであり、 R^8 は C_{1-10} アルキルである請求項2の医薬。

9. 式Iの化合物がp38を阻害するのに有効な量で存在する請求項2の医薬。

10. 前記疾患は、 $TNF\alpha$ 、MMP-1、MMP-3、IL-1、IL-6またはIL-8によって仲介される請求項3の医薬。

11. 前記疾患は、慢性関節リウマチ、骨粗鬆症、喘息、敗血症性ショック、炎症性腸疾患、または宿主対移植片拒絶の結果である、請求項2の医薬。

12. 前記化合物は下記の化合物である、請求項2の医薬：

N-(2-カルボメトキシ-5-イソプロピル-3-チエニル)-N'-(フェニル)尿素；N-(2-カルボメトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素；N-(2-カルボメトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(4-フルオロフェニル)尿素；N-(2-カルボメトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(3-メチルフェニル)尿素；N-(2-カルボメトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(5-シクロプロピル-2-チアジアゾリル)尿素；N-(2-カルボメトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(2-アミノフェニル)尿素；N-(2-カルボエトキシ-5-*tert*-ブチル-3-チエニル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素；N-(2-(カルボ-1-プロ

プー2-エニルオキシ) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-(カルボ-2-プロピルオキシ) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-(カルボ-1-プロピルオキシ) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-フルオロフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-エチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-イソプロピルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (2, 4-ジメチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (3-クロロ-4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (3-フルオロ-4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-メチルカルバモイル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (3-クロロ-4-フルオロフェニル) 尿素; N - (2-カルボキシ-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-(N-グリシルアミノメチル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-(N-(N-カルボ-tert-ブトキシグリシル) アミノメチル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-(N-アセチルアミノメチル) - 5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (4-メチル-2-チエニル) 尿素; または N - (2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-チエニル) - N' - (5-メチル-2-チエニル) 尿素。

13. 前記化合物は下記の化合物である、請求項2の医薬:

N - (2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-フリル) - N' - (4-メチルフェニル) 尿素; N - (2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-

3-フリル)-N'-(4-フルオロフェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-フリル)-N'-(2,3-ジクロロフェニル)尿素;N-(2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-フリル)-N'-(4-フルオロフェニル)尿素;またはN-(2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチルフリル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素。

14. 前記化合物は下記の化合物である、請求項2の医薬:

N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(フェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(2,3-ジクロロフェニル)尿素;またはN-(N-メチル-2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(5-メチル-2-チエニル)尿素。

15. 前記化合物は下記の化合物である、請求項2の医薬:

N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素;N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(フェニル)尿素;N-(3-カルボメトキシ-5-イソプロピル-2-チエニル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素;またはN-(3-カルボメトキシ-5-イソプロピル-2-チエニル)-N'-(フェニル)尿素。

16. 前記化合物は下記の化合物である、請求項2の医薬:

N-(2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-フリル)-N'-(3,4-ジクロロフェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(2,3-ジクロロフェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(3,4-ジクロロフェニル)尿素;N-(2-カルボメチル-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(1-ナフチル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(2-ナフチル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)尿素;N-(2-カルボメトキシ-5-tert-ブ

チル-3-ピロリル)-N'-(3-クロロ-4-メチルフェニル)尿素; N-(2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(2, 3-ジクロロフェニル)尿素; N-(2-メチルカルバモイル-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(1-ナフチル)尿素; N-(N-メチル-2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(1-ナフチル)尿素; N-(N-メチル-2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(2, 3-ジクロロフェニル)尿素; N-(N-メチル-2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素; N-(N-メチル-2-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-3-ピロリル)-N'-(フェニル)尿素; N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(3-メチルフェニル)尿素; N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(2, 3-ジクロロフェニル)尿素; N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(2, 3-ジクロロ-4-ヒドロキシフェニル)尿素; N-(3-カルボメトキシ-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(3-メトキシフェニル)尿素; またはN-(3-カルバモイル-5-tert-ブチル-2-チエニル)-N'-(4-メチルフェニル)尿素。」