

【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18年1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2005-507944(P2005-507944A)

【公表日】平成17年3月24日(2005.3.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-012

【出願番号】特願2003-541742(P2003-541742)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

C 0 7 H 19/067 (2006.01)

C 0 7 H 19/167 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7068

A 0 1 N 43/90 1 0 4

A 0 1 N 43/90 1 0 5

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 31/14

C 0 7 H 19/067

C 0 7 H 19/167

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月4日(2005.11.4)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

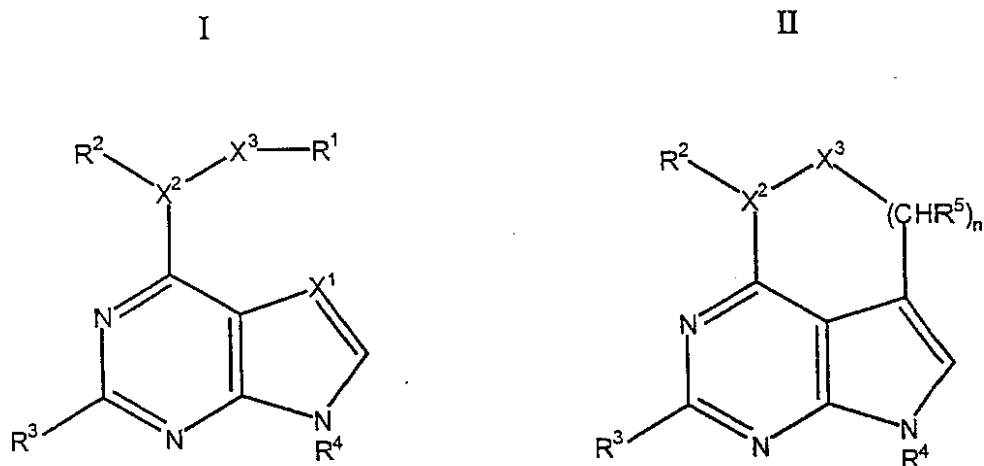
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

医薬組成物であって、生理的に許容可能な賦形剤、希釈剤または担体との混合剤中に、一般式IまたはIIに従うリボヌクレオシド類似体を含み、

【化1】



ここで

$n = 1 - 4$ 、好ましくは $2 - 4$ 、

$X^1 = N$ または CH または CR^5

$X^2 = N$ または S または CR^5

$X^2 = N$ のとき $X^3 = NR^6$ または O または S または R^6 、 $X^2 = S$ のとき $X^3 = NR^6$ または R^6 、 $X^2 = CR^5$ のとき X^3 はなし

$R^1 = H$ または アルキル または アリール または アルカリール または アシル

$R^2 = H$ または アルキル または アリール または アルカリール または アシル、 $X^2 = S$ のとき R^2 はなし

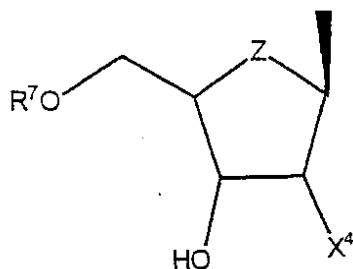
$R^3 = H$ または NR^5R^6 または $NR^5NR^5R^6$ または NR^5OR^5

$R^5 = H$ または アルキル または アルケニル または アルキニル または アリール または アルカリール または アシル

$R^6 = H$ または アルキル または アルケニル または アルキニル または アリール または アルカリール または アシル

$R^4 = H$ または

【化 2】



ここで

$Z = O$ または S または CH_2 または CHF または CF_2 または NR^5

$X^4 = OH$ または F

$R^7 = H$ または PO_3^{2-} または $P_2O_6^{3-}$ または $P_3O_9^{4-}$ または マスクされたリン酸誘導体である、医薬組成物。

【請求項 2】

リボヌクレオシド類似体は塩基類似体またはリボヌクレオチド類似体として与えられる、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

リボヌクレオシド類似体はプリン類似体を含む、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

ヒトまたは動物被験者への投与に続き、被験者の細胞内で、細胞中に存在する細胞またはウイルスの RNA ポリメラーゼによって RNA 分子に取込まれる化学的実体を生じさせる、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 5】

細胞は RNA ウイルスにより感染され、RNA 分子はウイルスゲノム核酸分子の少なくとも一部の RNA コピーである、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

リボヌクレオシド類似体は Z が O である、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 7】

X^2 は N を含む、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8】

X^3 は O であるか、または N を含む、請求項 1 から 7 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 9】

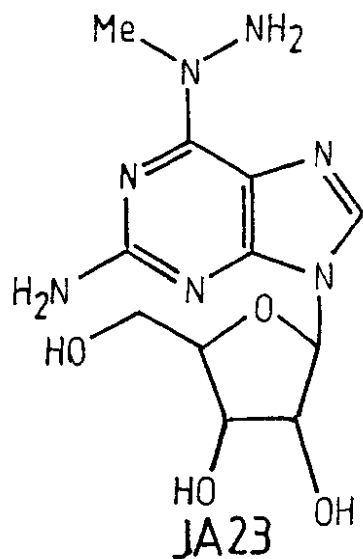
X^4 はOHである、請求項1から8のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項10】

X^2 はNであり、 X^3 は N_2 である、請求項1から9のいずれかに記載の医薬組成物。

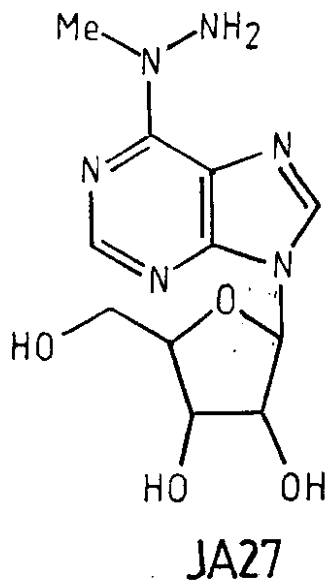
【請求項11】

【化3】



または

【化4】



に示される構造を有するリボヌクレオシド類似体を含む、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

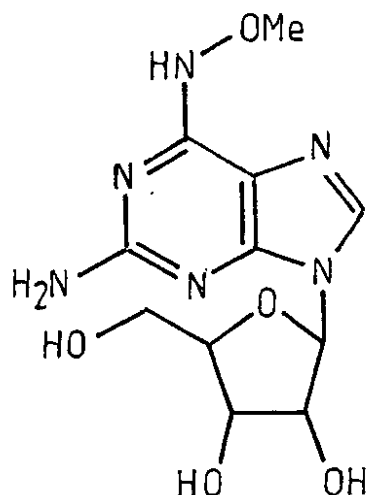
X^2 はNであり、 X^3 はOであり、 R^1 はアルキルである、請求項1から9のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項13】

R^1 はメチルまたは置換されたメチルである、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項14】

【化 5】



JA31 (rK)

に示される構造を有するリボヌクレオシド類似体または対応するリボヌクレオチド類似体を含む、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

ヒトまたは動物被験者における RNA ウイルス感染を防止および/または治療するために好適な医薬組成物を作製する方法であって、前記方法は、一般式 I または II に従うリボヌクレオシド類似体を生理的に許容可能な賦形剤、希釈剤または担体と混合するステップを含む、方法。

【請求項 1 6】

実行の結果、請求項 1 から 1 4 のいずれかに記載の医薬組成物が調製される、請求項 1 5 に記載の方法。

【請求項 1 7】

複数の異なるリボヌクレオシド類似体を組合せるステップを含み、各類似体は一般式 I または II に従う、請求項 1 5 に記載の方法。

【請求項 1 8】

医薬組成物中にさらなる抗ウイルス剤を含めるステップを含む、請求項 1 5 または 1 6 に記載の方法。

【請求項 1 9】

さらなる抗ウイルス剤は逆転写酵素の阻害剤である、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 2 0】

さらなる抗ウイルス剤は HIV またはその他のレトロウイルスに対して活性である、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 2 1】

組成物を単位投与量の形に包装するステップをさらに含む、請求項 1 5 から 2 0 のいずれかに記載の方法。

【請求項 2 2】

ヒトまたは動物被験者における RNA ウイルス感染を防止および/または治療するための薬の調製における、一般式 I または II に従うリボヌクレオシド類似体の使用。

【請求項 2 3】

ヒトまたは動物被験者における RNA ウイルス感染を防止および/または治療するための、請求項 1 から 1 4 のいずれかに記載の医薬組成物の調製における、一般式 I または II に従うリボヌクレオシド類似体の使用。

【請求項 2 4】

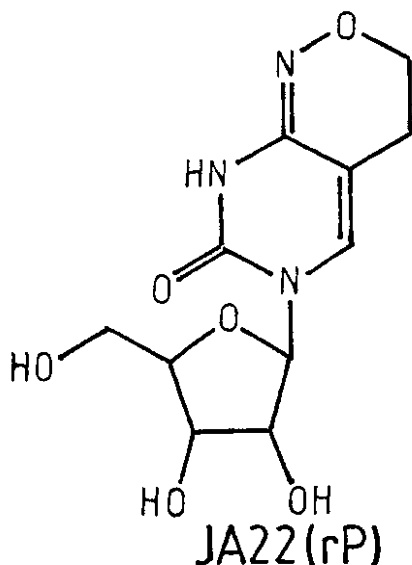
ウイルス核酸の LTR の介在する転写を抑制することによってヒトまたは動物被験者に

におけるRNAウイルス感染を防止および/または治療するための薬の調製における、リボヌクレオシド類似体の使用。

【請求項25】

リボヌクレオシド類似体は

【化6】



に示される構造を有するか、または対応するリボヌクレオチド類似体である、請求項24に記載の使用。

【請求項26】

薬は請求項1から14のいずれかに記載の医薬組成物である、請求項24に記載の使用

。【請求項27】

RNAウイルスに感染したヒトまたは動物被験者に投与されるときに、ウイルスの複製を抑制し、および/またはウイルスの突然変異頻度の増加をもたらす、請求項1から14のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項28】

RNAウイルスに感染したヒトまたは動物被験者に投与されるときに、ウイルス核酸のLTRの介在する転写の抑制をもたらす、請求項1から14のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項29】

RNAウイルスに感染したヒトまたは動物被験者に投与されるときに、ウイルス核酸のLTRの介在する転写の抑制をもたらす、請求項1から14のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項30】

植物のRNAウイルス感染を防止および/または治療する目的のために、植物への適用に好適な組成物であって、前記組成物は一般式IまたはIIに適合するRNAヌクレオシド類似体を含む、組成物。

【請求項31】

界面活性剤および/または植物浸透促進剤をさらに含む、請求項30に記載の組成物。

【請求項32】

抵抗性のない植物におけるRNAウイルス感染を防止および/または治療する方法であって、前記方法は請求項30または31に記載の組成物の有効量を植物に適用するステップを含む、方法。

【手続補正2】

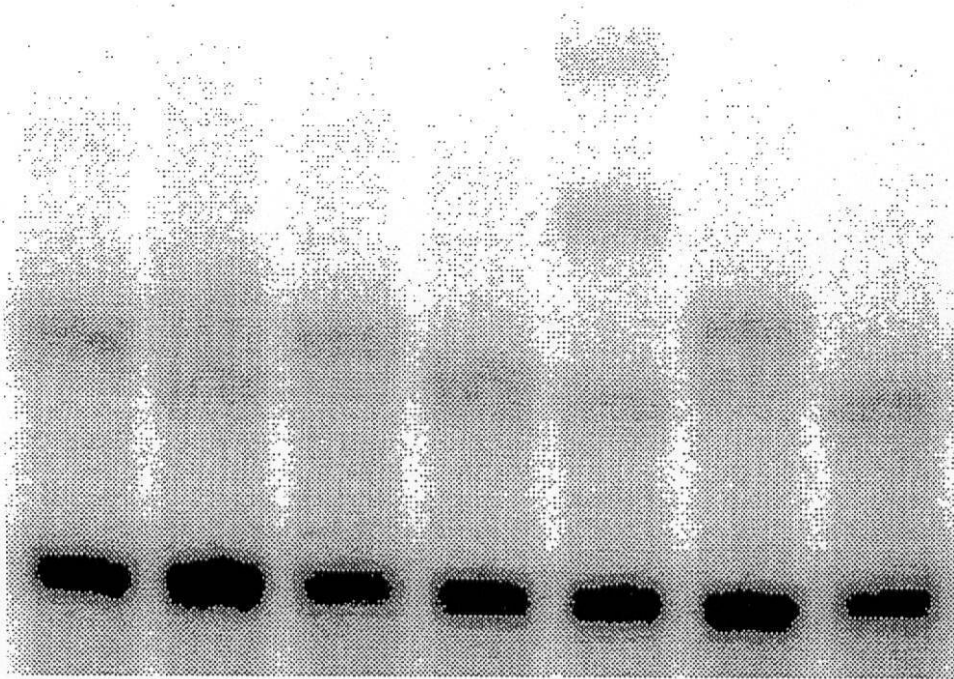
【補正対象書類名】図面

【補正対象項目名】図 2 5 A

【補正方法】変更

【補正の内容】

【図 2 5 A】



JA- JA- JA- JA- JA- JA- ATP
23 24 26 27 28 31

Fig. 25A

【手続補正 3】

【補正対象書類名】図面

【補正対象項目名】図 2 5 B

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 図 2 5 B 】

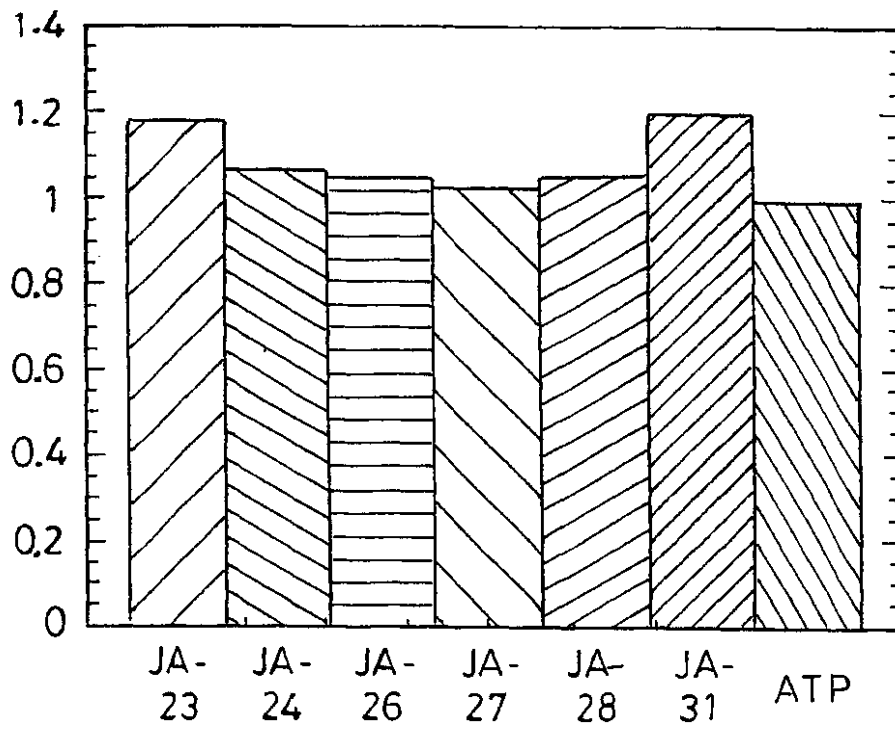


Fig. 25B