

【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6月1日(2006.6.1)

【公表番号】特表2005-530736(P2005-530736A)

【公表日】平成17年10月13日(2005.10.13)

【年通号数】公開・登録公報2005-040

【出願番号】特願2003-585730(P2003-585730)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/7076	(2006.01)
A 6 1 K	31/138	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/216	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 H	19/167	(2006.01)
C 0 7 H	19/16	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/7076	
A 6 1 K	31/138	
A 6 1 K	31/165	
A 6 1 K	31/18	
A 6 1 K	31/216	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 H	19/167	
C 0 7 H	19/16	

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月4日(2006.4.4)

【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】

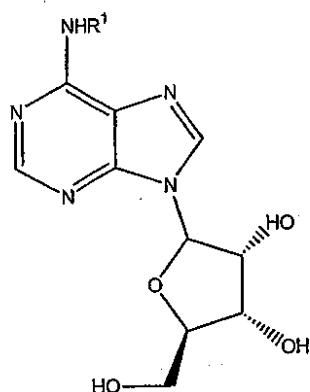
【請求項1】

哺乳動物における不整脈の治療に用いる医薬組成物であつて、治療上効果のある最小用量のA<sub>1</sub>アデノシン受容体アゴニストおよび少なくとも一つの医薬的に受容し得る賦形剤を含み、該医薬組成物は治療上効果のある最小用量のベーターブロッカー、カルシウムチャネルブロッカーまたは心臓グリコシドと共に投与される医薬組成物。

【請求項2】

A<sub>1</sub>アデノシン受容体が、R<sup>1</sup>が場合により置換された複素環式の基とする化学式I:

## 【化1】



式I

の化合物である請求項1の組成物。

## 【請求項3】

化学式Iの化合物が治療上効果的な最少用量のベーターブロッカーと共に投与される請求項2の組成物。

## 【請求項4】

化学式I中のR<sup>1</sup>が3-テトラピトロフラニル、3-テトラヒドロチオフラニル、4-ピラニルまたは4-チオピラニルである請求項3の組成物。

## 【請求項5】

ベーターブロッカーがアテノロール、エスマロール、ソタロールまたはプロプラノロールである請求項4の組成物。

## 【請求項6】

化学式Iの化合物が6-(3-(R)-N-アミノテトラヒドロフラニル)プリンリボシド、即ちCVT-510である請求項5の組成物。

## 【請求項7】

CVT-510が約0.0001から0.05mg/kgの量である請求項6の組成物。

## 【請求項8】

ベーターブロッカーが0.01から200mg/kgの量である請求項6の組成物。

## 【請求項9】

ベーターブロッckerがエスマロールである請求項8の組成物。

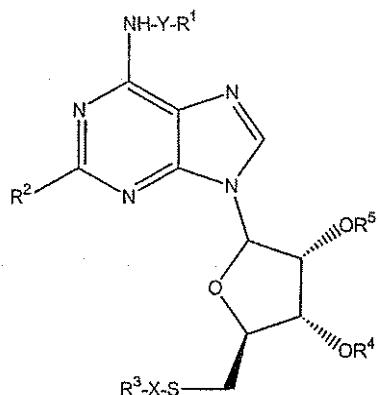
## 【請求項10】

CVT-510が約0.0005から0.020mg/kgの量であり、およびエスマロールが約0.1から10mg/kgの量である請求項9の組成物。

## 【請求項11】

A1アデノシン受容体アゴニストが、化学式II:

## 【化2】



式 I

(式中:

R<sup>1</sup> が場合により置換されたアルキル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>2</sup> が水素、ハロ、トリフルオロメチル、場合により置換されたアシルまたはシアノであり；

R<sup>3</sup> が場合により置換されたアルキル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたアリール；場合により置換されたヘテロアリールまたは場合により置換された複素環であり；

R<sup>4</sup> およびR<sup>5</sup> が独立に水素または場合により置換されたアシルであり；並びにX およびY が独立に共有結合または場合により置換されたアルキレンである)の化合物である請求項1の医薬組成物。

## 【請求項12】

化学式I I の化合物が治療上有効な最少用量のベーターブロッカーと共に投与される請求項11の医薬組成物。

## 【請求項13】

ベーターブロッカーがアテノロール、エスマロール、ソタロールまたはプロプラノロールである請求項12の医薬組成物。

## 【請求項14】

R<sup>1</sup> が(R)-2-ヒドロキシペンチルであり、X およびY が共有結合であり、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> およびR<sup>4</sup> が水素であり、並びにR<sup>5</sup> が2-フルオロフェニルである、即ち2-[((1R,2R)-2-ヒドロキシシクロペンチル)アミノ]プリン-9-イル} (4S,5S,3R)-5-[ (2-フルオロフェニルチオ)メチル]オキソラン-3,4-ジオール(CVT-3619)である請求項13の医薬組成物。

## 【請求項15】

CVT-3619が約0.1から200mg/kgの量である請求項14の医薬組成物。

## 【請求項16】

ベーターブロッカーが約0.01から100mg/kgの量である請求項14の医薬組成物。

## 【請求項17】

ベーターブロッカーがエスマロールである請求項16の医薬組成物。

## 【請求項18】

CVT-3619が約0.5から50mg/kgの量であり、およびエスマロールが約0.1から10mg/kgの量である請求項17の医薬組成物。

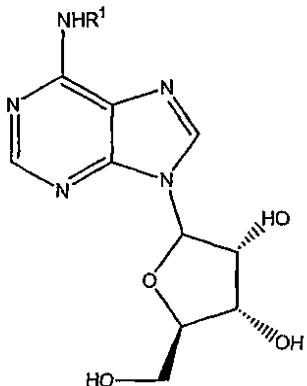
## 【請求項19】

治療上効果のある最少用量のA<sub>1</sub>アデノシン受容体アゴニストおよび治療上効果のある最少用量のベーターブロッカーが並びに少なくとも一つの医薬的に受容し得る賦形剤を含む医薬的な組成物。

**【請求項 20】**

A<sub>1</sub>アデノシン受容体アゴニストが、R<sup>1</sup>が場合により置換された複素環式の基である化学式I：

**【化3】**



式I

の化合物の化合物である請求項19の医薬的な組成物。

**【請求項 21】**

化学式Iの化合物が治療上効果のある最少用量のベーターブロッカーと共に投与される請求項20の医薬的な組成物。

**【請求項 22】**

化学式IにおいてR<sup>1</sup>が3-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、4-ピラニルまたは4-チオピラニルである請求項21の医薬的な組成物。

**【請求項 23】**

ベーターブロッカーがアニロール、エスマロール、スタロールまたはプロプラノロールである請求項22の医薬的な組成物。

**【請求項 24】**

化学式Iの化合物においてR<sup>1</sup>が6-(3-(R)-N-アミノテトラヒドロフラニル)プリンリボシド、即ちCVT-510である請求項23の医薬的な組成物。

**【請求項 25】**

CVT-510が約0.0001から0.05mg/kgの量である請求項24の医薬的な組成物。

**【請求項 26】**

ベーターブロッカーが約0.01から100mg/kgの量である請求項24の医薬的な組成物。

**【請求項 27】**

ベーターブロッカーがエスマロールである請求項26の医薬的な組成物。

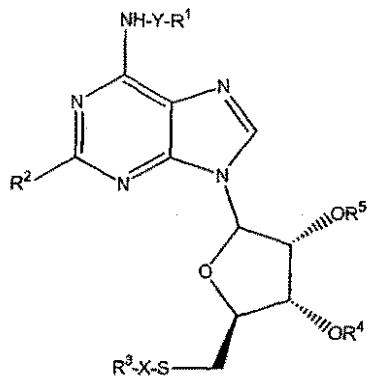
**【請求項 28】**

CVT-510が約0.0005から0.02mg/kgの量であり、およびエスマロールが約0.1から10mg/kgの量である請求項27の医薬的な組成物。

**【請求項 29】**

A<sub>1</sub>アデノシン受容体アゴニストが、化学式II：

## 【化4】



式 II

(式中:

R<sup>1</sup> が場合によりアルキル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたアリールまたは場合により置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>2</sup> が水素、ハロ、トリフルオロメチル、場合により置換されたアシルまたはシアノであり；

R<sup>3</sup> が場合により置換されたアルキル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたアリール；場合により置換されたヘテロアリールまたは場合により置換された複素環式であり、

R<sup>4</sup> およびR<sup>5</sup> が独立に水素または場合により置換されたアシルであり；並びにX およびY が独立に共有結合でありまたは場合により置換されたアルキレンである)の化合物である請求項19の医薬的な組成物。

## 【請求項30】

化学式IIの化合物が治療上効果のある最少用量のベーターブロッカーと共に投与される請求項29の医薬的な組成物。

## 【請求項31】

ベーターブロッカーがアテノロール、エスマロール、ソタロールまたはプロプラノロールである請求項30の医薬的な組成物。

## 【請求項32】

R<sup>1</sup> が(R)-2-ヒドロキシシクロペンチルであり、X およびY が共有結合であり、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> およびR<sup>4</sup> が水素であり並びにR<sup>5</sup> がフルオロフェニルである、即ち2-[((1R,2R)-2-ヒドロキシシクロペンチル)アミノ]プリン-9-イル}-(4S,5S,3R)-5-[((2-フルオロフェニルチオ)メチル]オキソラン-3,4-ジオール(CV T-3619)である請求項31の医薬的な組成物。

## 【請求項33】

CVT-3619が約0.1から200mg/kgの量である請求項32の医薬的な組成物。

## 【請求項34】

ベーターブロッカーが約0.01から100mg/kg量である請求項32の医薬的な組成物。

## 【請求項35】

ベーカーブロッカーがエスマロールである請求項34の医薬的な組成物。

## 【請求項36】

CVT-3619が約0.5から25mg/kgの量であり、およびエスマロールが約0.1から10mg/kg量である請求項35の医薬的な組成物。