

【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5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-527502(P2005-527502A)

【公表日】平成17年9月15日(2005.9.15)

【年通号数】公開・登録公報2005-036

【出願番号】特願2003-569646(P2003-569646)

【国際特許分類】

**C 0 7 H 19/16 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/7076 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/06 (2006.01)**

**C 0 7 H 19/167 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 H 19/16 C S P

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 37/06

C 0 7 H 19/167

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月14日(2005.10.14)

【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

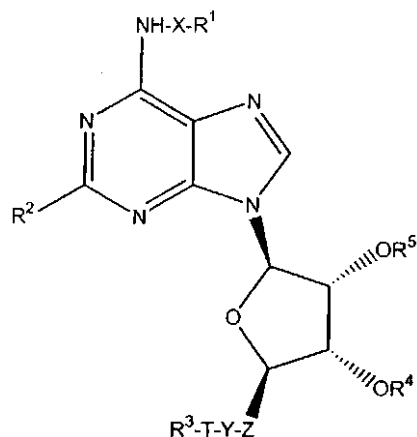
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

## 【化 1】



式 1

[ 式中、

R<sup>1</sup> は、適宜置換されたシクロアルキル、適宜置換されたヘテロサイクリル、適宜置換されたアリール、または適宜置換されたヘテロアリールであり；

R<sup>2</sup> は、水素、ハロ、トリフルオロメチル、またはシアノであり；

R<sup>3</sup> は、適宜置換されたシクロアルキル、適宜置換されたアリール、適宜置換されたヘテロアリール、または適宜置換されたヘテロサイクリルであり；

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は独立して、水素または適宜置換されたアシルであり；

T および X は独立して、共有結合またはアルキルもしくはシクロアルキルで適宜置換された 1 ~ 3 個の炭素原子のアルキレンであり；

Y は、- O -、- NH -、または共有結合であり；および

Z は、アルキルもしくはシクロアルキルで適宜置換された 1 ~ 3 個の炭素原子のアルキレンである ]

の化合物、またはその立体異性体、医薬的に許容される塩若しくはプロドラッグ。

## 【請求項 2】

R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、および R<sup>5</sup> が水素であり、Y が - O - である、請求項 1 の化合物。

## 【請求項 3】

R<sup>1</sup> が適宜置換されたヘテロサイクリルまたは適宜置換されたシクロアルキルであり、X が共有結合である、請求項 2 の化合物。

## 【請求項 4】

R<sup>3</sup> が適宜置換されたアリールまたは適宜置換されたヘテロアリールである、請求項 3 の化合物。

## 【請求項 5】

R<sup>1</sup> が 3 - テトラヒドロフランニルであり、Z がメチレンである、請求項 4 の化合物。

## 【請求項 6】

R<sup>3</sup> が 5 - メチルイソキサゾール - 3 - イルであり、T がメチレンである、すなわち (4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - [ (5 - メチルイソキサゾール - 3 - イルオキシ) メチル ] - 5 - [ 6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) プリン - 9 - イル ] テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである請求項 5 の化合物。

## 【請求項 7】

R<sup>3</sup> が適宜置換されたフェニルであり、T が共有結合である、請求項 5 の化合物。

## 【請求項 8】

R<sup>3</sup> が 2 - フルオロフェニルである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (2 - フルオロフェノキシメチル) - 5 - [ 6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) - プリン - 9 - イル ] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 7 の化合物。

物。

【請求項 9】

$R^3$  が 2 - クロロフェニルである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (2 - クロロフェノキシメチル) - 5 - [6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) - プリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 7 の化合物。

【請求項 10】

$R^3$  が 4 - フルオロフェニルである、すなわち(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (4 - フルオロフェノキシメチル) - 5 - [6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) - プリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 7 の化合物。

【請求項 11】

$R^3$  が 3 - フルオロフェニルである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (3 - フルオロフェノキシメチル) - 5 - [6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) - プリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 7 の化合物。

【請求項 12】

$R^3$  が 2 - メチルフェニルである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (2 - メチルフェノキシメチル) - 5 - [6 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルアミノ) - プリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 7 の化合物。

【請求項 13】

$R^1$  がシクロペンチルである、請求項 4 の化合物。

【請求項 14】

$R^3$  が 2 - フルオロフェニルであり、T が共有結合であり、Z がメチレンである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - (2 - フルオロフェノキシメチル) - 5 - [6 - シクロペンチルアミノプリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 13 の化合物。

【請求項 15】

$R^3$  がフェニルであり、T がメチレンであり、Z がエチレンである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - [6 - (シクロペンチルアミノ)プリン - 9 - イル] - 5 - [2 - (フェニルメトキシ) - エチル]テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 13 の化合物。

【請求項 16】

$R^1$  が(3 - クロロ - 2 - チエニル) - 2 - ブチルであり、 $R^2$  が 2 - フルオロフェニルであり、T が共有結合であり、Z がメチレンである、すなわち、(4S, 2R, 3R, 5R) - 2 - [(5 - (2 - フルオロフェニルオキシ)メチル) - 2 - [6 - [(3 - クロロ - 2 - チエニル)メチル]プロピル}アミノ)プリン - 9 - イル]テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 4 の化合物。

【請求項 17】

$R^2$ 、 $R^4$ 、および  $R^5$  が水素であり、Y が - NH - である、請求項 1 の化合物。

【請求項 18】

$R^1$  が適宜置換されたヘテロサイクリルであり、X が共有結合であり、Z がメチレンである、請求項 17 の化合物。

【請求項 19】

$R^3$  が適宜置換されたヘテロアリールである、請求項 18 の化合物。

【請求項 20】

$R^1$  が 3 - テトラヒドロフラニルであり、 $R^3$  が 3 - メチルイソキサゾリン - 5 - イルであり、T が共有結合である、すなわち、2 - (3 - メチルイソキサゾール - 5 - イルアミノメチル) - 5 - [6 - シクロペンチルアミノプリン - 9 - イル] - テトラヒドロフラン - 3, 4 - ジオールである、請求項 19 の化合物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれかの化合物からなる、部分的または全 A<sub>1</sub> アデノシン受容体アゴニストを用いた処置で軽減される病状の治療剤。

【請求項 2 2】

該病状が、心房細動、上室頻脈および心房粗動、うっ血性心不全、てんかん、脳卒中、糖尿病、肥満症、虚血、安定狭心症、不安定狭心症、心臓移植、並びに心筋梗塞から選択される、請求項 2 1 の治療剤。

【請求項 2 3】

該病状が高脂血症である、請求項 2 1 の治療剤。

【請求項 2 4】

少なくとも 1 つの医薬的に許容される賦形剤および請求項 1 ~ 2 0 のいずれかの化合物を含む医薬組成物。