

【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2月10日(2005.2.10)

【公表番号】特表2000-511920(P2000-511920A)

【公表日】平成12年9月12日(2000.9.12)

【出願番号】特願平10-501287

【国際特許分類第7版】

C 0 7 H 17/075

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 31/7048

【F I】

C 0 7 H 17/075

A 6 1 K 31/00 6 3 1 C

A 6 1 K 31/70 6 1 3

【手続補正書】

【提出日】平成16年6月10日(2004.6.10)

【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16年6月10日

特許庁長官 今井 康夫 殿

1. 事件の表示 平成10年特許願第501287号

2. 補正をする者

名 称 アベンティス ファルマ ソシエテ アノニム

3. 代 理 人

〒103-0027

住 所 東京都中央区日本橋3丁目13番11号

油脂工業会館3階(電話 3273-6436番)

氏 名 (6781) 弁理士 倉 内 基 弘

同

住 所 同 上

氏 名 (8577) 弁理士 風 間 弘 志

4. 補正対象書類名 明細書、請求の範囲

5. 補正対象項目名 明細書、請求の範囲

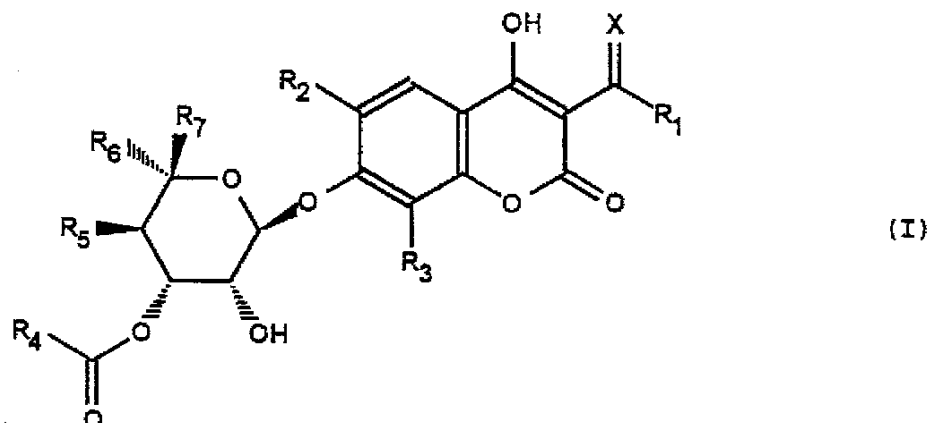
6. 補正の内容 別紙の通り



1. 請求の範囲を別紙の通りに補正する。
2. 明細書第1頁下から10行目の「 $C=N$ 」を「 $C\equiv N$ 」に訂正する。
3. 明細書第2頁第4行の「最大12炭素原子を含み、」を「最大12炭素原子を含み、適宜、酸素、硫黄又は窒素原子が割り込み、」に訂正する。

請求の範囲

1. 下記式(I)の化合物並びにそれらの塩：



{式中、 R_1 は、水素原子、水酸基、適宜、酸素、硫黄若しくは窒素原子が割り込んだ最大12炭素原子を含む直鎖、分枝鎖若しくは環状のアルキル、アルケニル若しくはアルキニル基を表し、これらは、適宜、1つ以上のハロゲン原子、1つ以上のOH、 $C \equiv N$ 、 NO_2 、 $NR_a - R_b$ 基で置換され(ここに、 R_a 及び R_b は、同一であるか又は異なって、水素原子、最大8炭素原子を含むアルキル基を表し、又は R_a 及び R_b は、それらが結合する窒素原子と共にヘテロ環を形成し、それは、適宜、窒素、硫黄若しくは酸素から選択する他のヘテロ原子を含む)、又は R_1 は、最大8炭素原子を含み、適宜、1つ以上の上記の置換基により置換されたアルコキシ基を表し、

又は、 R_1 は、 $NR_c R_d$ 基を表し(ここに、 R_c 及び R_d は、同一であるか又は異なって、水素原子又は最大12炭素原子を含み、適宜、酸素、硫黄若しくは窒素原子が割り込んだアルキル基を表し、これらは、適宜、1つ以上の上記の置換基で置換されており、又は R_c 及び R_d は、それらが結合する窒素原子と共にヘテロ環を形成し、それは、適宜、窒素、硫黄若しくは酸素から選択する他のヘテロ原子を含む)、

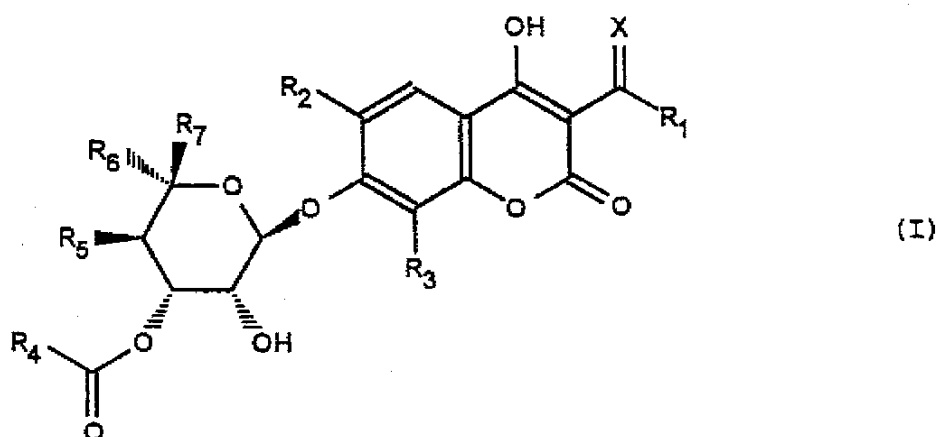
X は、酸素原子又は $N - Na1k_1$ 若しくは $NOa1k_2$ 基を表し(ここに、 $a1k_1$ 及び $a1k_2$ は、最大12炭素原子を含み、適宜、1つ以上のハロゲン原子により、1つ以上の $NR_e - R_f$ 基により置換されたアルキル基(適宜、酸素、硫黄又は窒素原子が割り込む)を表す(ここに、 R_e 及び R_f は、同じであるか又は互いに異なって、水素原子、最大8炭素原子を含み適宜置換されたアルキル基を表し、又は R_e 及び R_f は、それらが結合する窒素原子と共にヘテロ環を形成し得、それは更に、酸素、硫黄原子及び他の窒素原子を含むことができる))、

R_2 は、水素原子又はハロゲン原子を表し、

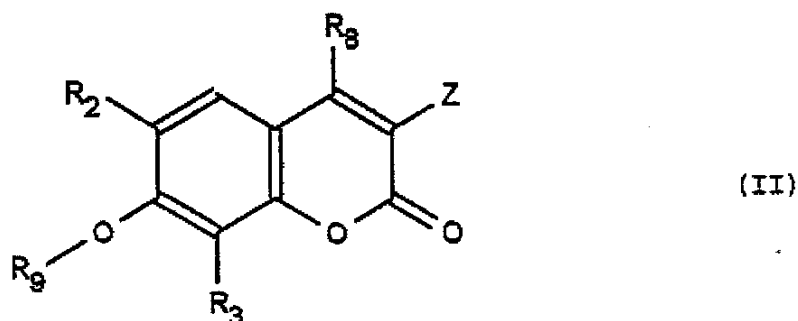
R_3 は、水素原子、最大8炭素原子を含むアルキル基又はハロゲン原子を表し、

R_4 は、 NR_g-R_h 基(ここに、 R_g 及び R_h は、互いに同じであるか又は異なって、水素原子、最大8炭素原子を含み、適宜、アリール若しくはヘテロアリール基で置換された直鎖、分枝鎖、環状アルキル基を表し、又は R_g 及び R_h は、それらが結合する窒素原子と共にヘテロ環を形成し、それは更に、酸素原子、硫黄原子及び他の窒素原子を含むことができる)を表し、又は R_4 は、適宜、1つ以上のハロゲン原子、1つ以上の水酸基、1つ以上のアルキル若しくはアルコキシ基(最大8炭素原子を含む)により置換されたアリール若しくはヘテロアリール基を表し、
 R_5 は、水素原子、最大4炭素原子を含むO-アルキル基を表し、
 R_6 は、アルキル若しくは CH_2-O -アルキル基(ここに、アルキルは、最大8炭素原子を含むアルキル基を表す)を表し、
 R_7 は、水素原子又は最大8炭素原子を含むアルキル基を表す}。

2. 請求項1に規定した式(I)の化合物：

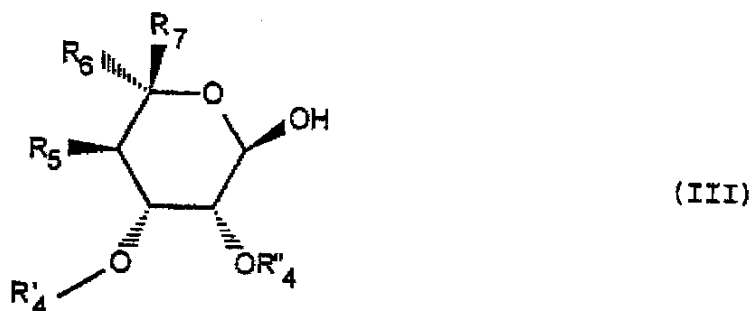


(式中、置換基は、請求項1と同じ意味を保持している)
 の製造方法であって、該方法は、下記により特徴付けられる：
 下記式(II)の化合物：

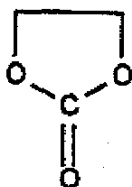


(式中、 R_8 は、遊離の若しくはブロックされた水酸基であり、 Z は、水素

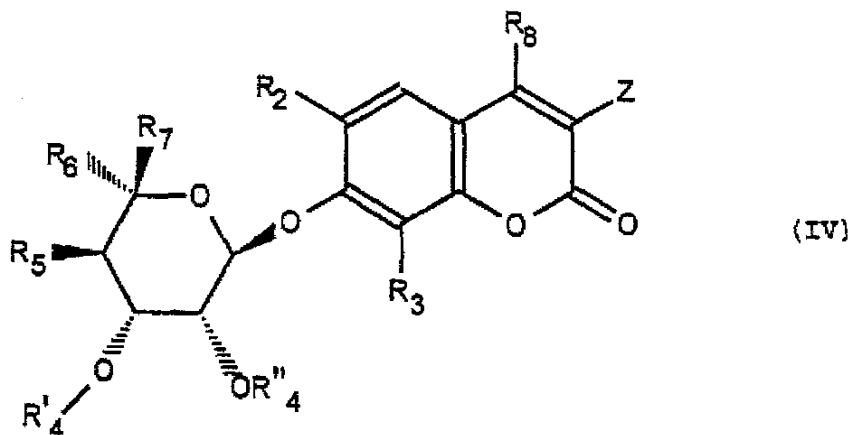
$$\begin{array}{c} \text{X} \\ \parallel \\ \text{C} - \text{R}_1 \end{array}$$
 若しくは $\text{C} - \text{R}_1$ 基を表し、X、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、それらの以前の意味を保持し、 OR_9 は、遊離の若しくはブロックされた水酸基を表す)を、下記式(III)の化合物：



(式中、 R_5 、 R_6 及び R_7 は、それらの以前の意味を保持し、 OR'_4 は、ブロックされた水酸基を表し、 R''_4 は、水素原子を表し又は R'_4 と R''_4 は、それらが結合する炭素原子と共に下記の環



を形成する)
 の作用にかけて、下記式(IV)の化合物：



(式中、置換基は、それらの以前の意味を保持する)
 を得、次いで、こうして得た式(IV)の化合物を、全部又は部分的に、次の

ステップにかける

ー OR'_4 のアルファ位の糖の水酸基の随意のブロッキングの後の 4 位の水酸基の放出、

ー Z が水素原子を表すならば、反応することのできる水酸基の随意のブ

X

||

ロッキングの後の $\text{C}-\text{R}_1$ 基の導入、

ー $\text{C}-\text{R}_4$ 基の、この基の R'_4 基による置換による導入、

||

O

ー X 基の修飾。

3. 新規な化学生成物としての、式(II)、(III)及び(IV)の化合物。

4. 医薬としての、請求項 1 に規定した式(I)の化合物。

5. 請求項 4 に規定した少なくとも 1 種の医薬を活性成分として含む製薬組成物。