

【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20年12月18日(2008.12.18)

【公表番号】特表2008-524327(P2008-524327A)

【公表日】平成20年7月10日(2008.7.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-027

【出願番号】特願2007-548240(P2007-548240)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/24 (2006.01)

C 0 7 C 323/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/664 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/24 C S P Z

C 0 7 C 323/41

A 6 1 K 31/664

A 6 1 P 35/00

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月28日(2008.10.28)

【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

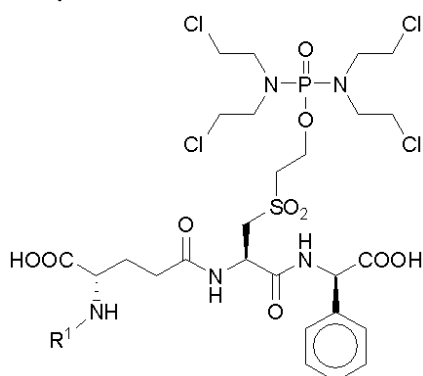
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：



[式中、R¹ は、アミン保護基である]

で示される化合物またはその塩。

【請求項 2】

R¹ が、触媒的に除去しうるアミン保護基である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

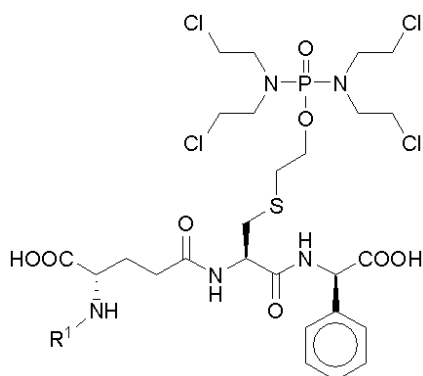
R¹ が、(必要に応じて置換されたベンジル)オキシカルボニルまたは(必要に応じて置換されたアリル)オキシカルボニルである請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ が、ベンジルオキシカルボニルである請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

式：

[式中、 R^1 は、アミン保護基である]

で示される化合物またはその塩。

【請求項 6】

 R^1 が、触媒的に除去しうるアミン保護基である請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

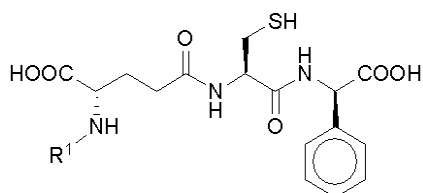
 R^1 が、(必要に応じて置換されたベンジル)オキシカルボニルまたは(必要に応じて置換されたアリル)オキシカルボニルである請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

 R^1 が、ベンジルオキシカルボニルである請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式：

[式中、 R^1 は、アミン保護基である]

で示される化合物またはその塩。

【請求項 10】

 R^1 が、触媒的に除去しうるアミン保護基である請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

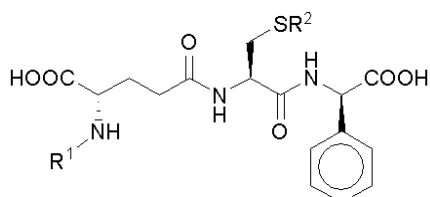
 R^1 が、(必要に応じて置換されたベンジル)オキシカルボニルまたは(必要に応じて置換されたアリル)オキシカルボニルである請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

 R^1 が、ベンジルオキシカルボニルである請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

式：

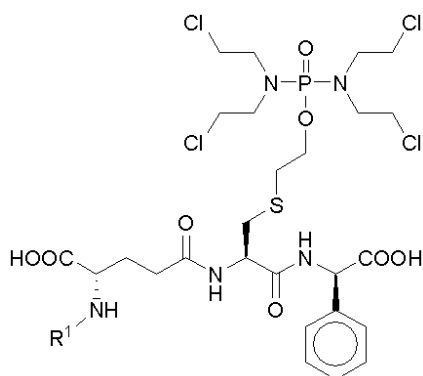
[式中、 R^1 は、アミン保護基であり、 R^2 は、イオウ保護基である]

で示される化合物またはその塩。

【請求項 14】

 R^1 が、触媒的に除去しうるアミン保護基である請求項 13 に記載の化合物。

式：



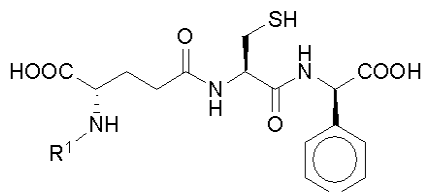
酸化が、過硫酸塩との反応を含む請求項 25 ~ 28 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 30】

過硫酸塩が、 $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$ である請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】

式：



[式中、 R^1 は、アミン保護基である]

で示される化合物を、塩基性条件下で2-(A-スルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートと反応させることを含む請求項 5 に記載の化合物の製造方法。

【請求項 32】

R^1 が、触媒的に除去しうるアミン保護基である請求項 31 に記載の方法。

【請求項 33】

R^1 が、(必要に応じて置換されたベンジル)オキシカルボニルまたは(必要に応じて置換されたアリル)オキシカルボニルである請求項 32 に記載の方法。

【請求項 34】

R^1 が、ベンジルオキシカルボニルである請求項 33 に記載の方法。

【請求項 35】

2-(A-スルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートが、2-((必要に応じて置換された)ベンゼンスルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートである請求項 31 に記載の方法。

【請求項 36】

2-((必要に応じて置換された)ベンゼンスルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートが、2-(4-ブロモベンゼンスルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートである請求項 35 に記載の方法。

【請求項 37】

2-(A-スルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートを過剰で用いる請求項 31 に記載の方法。

【請求項 38】

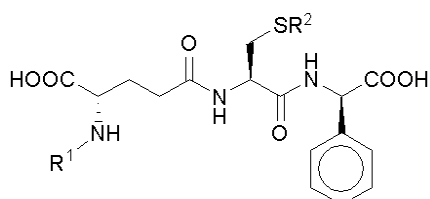
2-(A-スルホニルオキシ)エチル N,N,N',N'-テトラキス(2-クロロエチル)ホスホロジアミデートを少なくとも二倍過剰で用いる請求項 37 に記載の方法。

【請求項 39】

塩基性条件が、 C_{1-6} アルカノール中のアルカリ金属水酸化物を含む請求項 31 ~ 38 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 40】

式：



[式中、 R^1 は、アミン保護基であり、 R^2 は、イオウ保護基である]

で示される化合物のイオウ原子を脱保護することを含む請求項 9 に記載の化合物の製造方

法。

【請求項 4 1】

R^1 が、触媒的に除去しうるアミン保護基であり、 R^2 が、酸分解的に除去しうるイオウ保護基である請求項 4 0 に記載の方法。

【請求項 4 2】

R^1 が、(必要に応じて置換されたベンジル)オキシカルボニルまたは(必要に応じて置換されたアリル)オキシカルボニルである請求項 4 1 に記載の方法。

【請求項 4 3】

R^2 が、(必要に応じて置換されたフェニル)置換メチルである請求項 4 0 に記載の方法。

【請求項 4 4】

R^1 が、ベンジルオキシカルボニルであり、 R^2 が、トリフェニルメチルである請求項 4 0 に記載の方法。

【請求項 4 5】

脱保護が、酸とシランとの反応を含む請求項 4 0 ~ 4 4 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 4 6】

脱保護が、トリフルオロ酢酸とポリ(メチルヒドロシロキサン)との反応を含む請求項 4 5 に記載の方法。

【請求項 4 7】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 4 8】

ガンの治療のための医薬の製造のための請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。