

【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23年1月13日(2011.1.13)

【公表番号】特表2009-536188(P2009-536188A)

【公表日】平成21年10月8日(2009.10.8)

【年通号数】公開・登録公報2009-040

【出願番号】特願2009-508479(P2009-508479)

【国際特許分類】

C 07 H 19/24 (2006.01)

A 61 K 31/7068 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/24 C S P

A 61 K 31/7068

A 61 P 31/12

【手続補正書】

【提出日】平成22年11月15日(2010.11.15)

【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

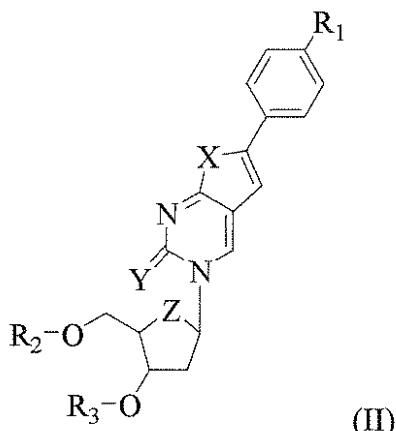
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I) :

【化1】



[式中、

Xは、O、S、NH、またはCH₂であり；

Yは、O、S、またはNHであり；

Zは、O、S、またはCH₂であり；

R₁は、C₁~₆アルキルであり、n-ペンチルまたはn-ヘキシルを含むn-アルキルが好ましく；

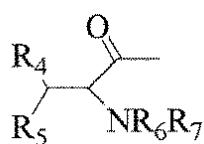
R₂およびR₃の1つはHであり、そしてR₃およびR₂の他方は中性で非極性のアミノ酸分子である]

で示される化合物、またはその医薬的に許容し得る塩もしくは水和物。

【請求項2】

中性で非極性のアミノ酸分子である R₂ または R₃ が、式：

【化 2】



【式中、

R₄、R₅、R₆ および R₇ が各々独立して H または C₁ ~ ₂ アルキルである] である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R₆ および R₇ が共に H である、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R₂ および R₃ の 1 つがバリン、ロイシン、イソロイシン、またはアラニンである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

R₂ または R₃ がバリンである、請求項 1 または請求項 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

バリンが L - バリン、D - バリン、または D, L - バリンである、請求項 5 記載の化合物。

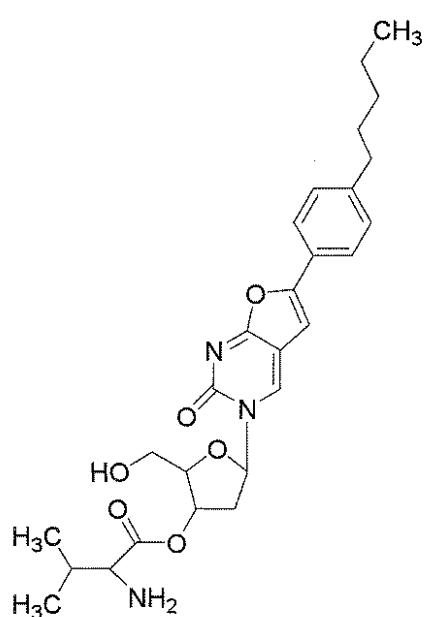
【請求項 7】

X、Y および Z が好ましくは全て O である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 8】

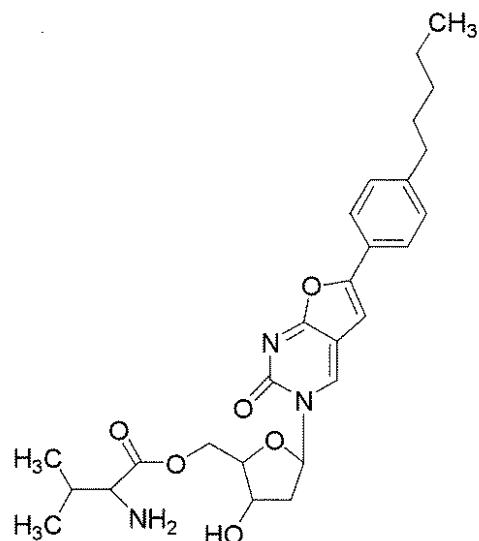
式：

【化 3】



化合物 3

【化4】



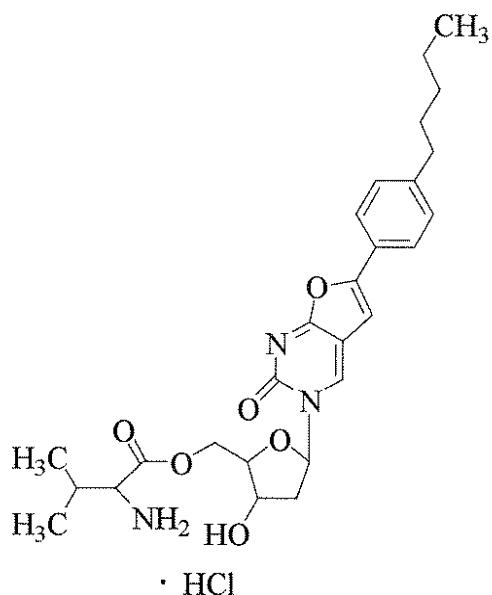
化合物 5

、または化合物3もしくは化合物5の塩酸塩である、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

式：

【化5】



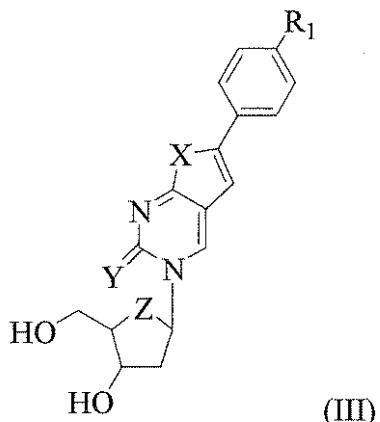
化合物 6

である、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

式(III)：

【化6】

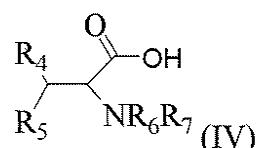


の化合物を、保護された中性で非極性のアミノ酸（ここで、R₁、X、YおよびZは請求項1に定義する通りである）を用いてエステル化し、その後に適宜、得られたエステルを酸と反応させて医薬的に許容し得る塩を得ることを含む、
請求項1～9のいずれか1つに記載の化合物の製造方法。

【請求項11】

アミノ酸が式(IV)：

【化7】



(式中、R₄、R₅、R₆、およびR₇が請求項2に定義する通りである)
を有する、請求項10記載の方法。

【請求項12】

R₆およびR₇が共にHであり、そして該アミノ基が、3,9-フルオレニルメトキシカルボニル(Fmoc)保護基によってエステル化反応の間に保護される、請求項1記載の方法。

【請求項13】

エステル化をミツノブ条件下で行なう、請求項10～12のいずれか1つに記載の方法。

【請求項14】

更に、エステルをHClの溶液を用いて処理して塩酸塩を得ることを含む、請求項10～13のいずれか1つに記載の方法。

【請求項15】

R₁がn-ペンチルまたはn-ヘキシルであり、X、YおよびZが全てOであり、そしてR₄およびR₅が共にメチルである、請求項10～14のいずれか1つに記載の方法。

【請求項16】

ウイルス感染症の予防または治療のための医薬の製造における、請求項1～9のいずれか1つに記載の化合物の使用。

【請求項17】

請求項1～9のいずれか1つに記載の化合物の有効量および医薬的に許容し得る賦形剤を含有する、ウイルス感染症の予防または治療のための医薬組成物。

【請求項18】

請求項1～9のいずれか1つに記載の化合物を医薬的に許容し得る賦形剤と組み合わせて含有する、医薬組成物。