

【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4月24日(2008.4.24)

【公表番号】特表2004-506606(P2004-506606A)

【公表日】平成16年3月4日(2004.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2004-009

【出願番号】特願2001-580925(P2001-580925)

【国際特許分類】

C 0 7 H 19/23 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 H 19/23

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 P 31/12

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年3月6日(2008.3.6)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

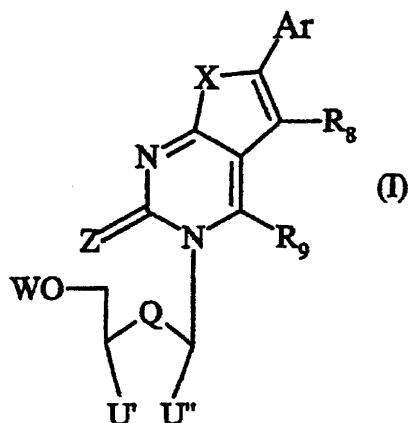
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式：

【化1】



(式中

Arは、任意に置換された芳香環系であって、前記芳香環系は1つの6員芳香環又は2つの縮合した6員芳香環を含み；

R₈及びR₉は、それぞれ独立に、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロゲン、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、アルキオキシ、アリーロキシ、チオール、アルキルチオール、アリールチオール、アリールを含む群から選択され；

QはO、S、及びCY₂を含む群から選択され、ここでYは同一又は異なりH、アルキル、及びハロゲンから選択され；

XはO、NH、S、N-アルキル、 $(CH_2)_m$ (mは1から10)、及び CY_2 を含む群から選択され、ここでYは同一又は異なり水素、アルキル、及びハロゲンから選択され；

ZはO、S、NH、及びN-アルキルを含む群から選択され；

U'はHでありU''はH及び CH_2T から選択されるか、またはU'及びU''が結合しQを含む環部分を形成しここでU'-U''は合わせてそれぞれ-CTH-CT'T''-及び-CT=CT-及び-CT'=CT''-を含む群から選択され、それにより；

【化2】



を含む群から選択される環部分を提供し；

ここで；

TはOH、H、ハロゲン、O-アルキル、O-アシル、O-アリーール、CN、 NH_2 及び N_3 を含む群から選択され；

T'はH及びハロゲンを含む群から選択され、1つより多いT'が存在する場合、それらは同一か又は異なり；

T''はH及びハロゲンを含む群から選択され；

WはH、ホスフェート基、及び薬理的に許容しうるその塩、誘導体又はプロドラッグを含む群から選択され；

但し；

(1)TがOAcでありT'及びT''が存在しHである場合、Arは4-(2-ベンゾキサゾリル)フェニルでなく；且つ

(2)Q、X及びZがそれぞれOであり、 R_8 、 R_9 、T'、T''及びWがそれぞれHでありTがOH又はO-アシルである場合、Arが；

アルキル、アリーール、シクロアルキル、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、アリーールオキシ、アルキルチオ及びアリーールチオを含む群より独立に選択された1つ以上の基により置換された1つの6員炭素環芳香環(アルキル、シクロアルキル又はアリーール基は塩素、臭素、ヨウ素、CN、 CO_2 アルキル($C_1 \sim C_6$)、 $CONH_2$ 、 $CONH$ アルキル($C_1 \sim C_6$)、SH、Sアルキル($C_1 \sim C_6$)及び NO_2 を含む群より選択される1つ以上のものにより置換されていてもよい)；

1つ、2つ、3つ又は4つのヘテロ原子を含み任意に置換されていてもよい1つの6員芳香環系；又は

任意に置換されていてもよい2つの縮合した6員芳香環である。)を有する化合物。

【請求項2】 Ar中の前記芳香環系が、1つ、2つ、3つ又は4つのヘテロ環原子を含む請求項1記載の化合物。

【請求項3】 Ar中の前記芳香環系が、1つの6員炭素環を含む請求項1記載の化合物。

【請求項4】 Arが芳香環系を含み、前記芳香環系は、H、アルキル、アリーール、シクロアルキル、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシ、アリーールオキシ、アルキルチオール及びアリーールチオールを含む群から独立に選択される1つ以上の基により置換され、これらのアルキル、シクロアルキル又はアリーール基は、塩素、臭素、ヨウ素、CN、 CO_2 アルキル($C_1 \sim C_6$)、 $CONH_2$ 、 $CONH$ アルキル($C_1 \sim C_6$)、SH、Sアルキル($C_1 \sim C_6$)および NO_2 を含む群から選択される1つ以上のもので置換されていてもよい、前記請求項のいずれか1項記載の化合物。

【請求項5】 前記芳香環系上に置換された前記基が、1つ以上の、任意に置換された、アルキル又はアルコキシ部分を含み、前記アルキル又はアルコキシ部分は、合計で、

前記アルキル又はアルコキシ部分上に存在しうる置換基を除外して計算して3~8の炭素原子を含む、前記請求項のいずれか1項記載の化合物。

【請求項6】 前記アルキル又はアルコキシ部分が、1つ以上の直鎖の飽和アルキル又はアルコキシ部分を含む請求項5記載の化合物。

【請求項7】 前記アルキル又はアルコキシ部分が、合計で、1つ以上の非置換アルキル又はアルコキシ部分を含む請求項5又は請求項6記載の化合物。

【請求項8】 前記アルキル部分が、合計で、前記アルキル部分上に存在しうる置換基を除外して計算して4~7の炭素原子を含む請求項5~7のいずれか1項記載の化合物。

【請求項9】 前記アルキル部分が、合計で、前記アルキル部分上に存在しうる置換基を除外して計算して5~6の炭素原子を含む請求項8記載の化合物。

【請求項10】 前記アルキル部分が、C₁、C₂、C₃、C₄、C₅、C₆、C₇及びC₈アルキル部分並びにこれらの混合物を含む群、好ましくはC₃、C₄、C₅、C₆、C₇及びC₈アルキル部分並びにこれらの混合物を含む群、より好ましくはC₄、C₅、C₆及びC₇アルキル部分並びにこれらの混合物を含む群より選択される請求項5~9のいずれか1項記載の化合物。

【請求項11】 前記アルキル部分がC₅及びC₆アルキル部分並びにこれらの混合物を含む群から選択される請求項10記載の化合物。

【請求項12】 前記アルコキシ部分が、合計で、前記アルコキシ部分上に存在しうる置換基を除外して計算して3~7の炭素原子を含む請求項5~7のいずれか1項記載の化合物。

【請求項13】 前記アルキル又はアルコキシ部分が、1つのアルキル又は1つのアルコキシ部分を含む請求項5~12のいずれか1項記載の化合物。

【請求項14】 前記芳香環系が、1つの6員芳香環、好ましくは炭素環芳香環、及び前記6員芳香環のパラ位に1つの置換基、好ましくは1つのアルキル又は1つのアルコキシ部分を含む前記請求項のいずれか1項記載の化合物。

【請求項15】 3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-メチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-エチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-プロピルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-ブチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-ペンチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-ヘキシルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-ヘプチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-n-オクチルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；及び

これらの混合物を含む群より選択される請求項1記載の化合物。

【請求項16】 3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-クロロフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-ブロモフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-フェニルフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ-β-D-リボフラノシル)-6-(4-メトキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ--D-リボフラノシル)-6-(4-エトキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ--D-リボフラノシル)-6-(4-n-プロポキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ--D-リボフラノシル)-6-(4-n-ペントキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ--D-リボフラノシル)-6-(4-n-ヘキソキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

3-(2'-デオキシ--D-リボフラノシル)-6-(4-n-ヘプトキシフェニル)-2,3-ジヒドロフロ-[2,3-d]ピリミジン-2-オン；

これらの混合物；及び

これらと請求項 15 記載のいずれかの化合物との混合物を含む群より選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 17】 請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の化合物の調製方法であって、5-ハロヌクレオシド類を末端アルキンと触媒の存在下で接触させるか、又は5-アルキルヌクレオシドを触媒の存在下で環化させる方法。

【請求項 18】 治療の方法における使用のための請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の、又は但し書き(2)を除いて請求項 1 に規定される化合物。

【請求項 19】 ウイルス感染の予防又は治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の、又は但し書き(2)を除いて請求項 1 に規定される化合物の使用。

【請求項 20】 ウイルス感染の予防又は治療における使用のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の、又は但し書き(2)を除いて請求項 1 に規定される化合物。

【請求項 21】 請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の、又は但し書き(2)を除いて請求項 1 に規定される化合物を、薬剤学的に許容しうる賦形剤と組み合わせて含む薬剤組成物。

【請求項 22】 請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項記載の、又は但し書き(2)を除いて請求項 1 に規定される化合物を、薬剤学的に許容しうる賦形剤と合わせる工程を含む薬剤組成物の調製方法。