

【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2004-529125(P2004-529125A)

【公表日】平成16年9月24日(2004.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2004-037

【出願番号】特願2002-574920(P2002-574920)

【国際特許分類】

C 0 7 D	207/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/265	(2006.01)
A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/365	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/453	(2006.01)
A 6 1 K	31/4741	(2006.01)
A 6 1 K	31/513	(2006.01)
A 6 1 K	31/522	(2006.01)
A 6 1 K	31/5513	(2006.01)
A 6 1 K	31/661	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/18	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/16	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	243/12	(2006.01)
C 0 7 D	249/18	(2006.01)
C 0 7 D	305/14	(2006.01)
C 0 7 D	405/04	(2006.01)
C 0 7 D	473/16	(2006.01)

**C 0 7 D 487/04 (2006.01)**

**C 0 7 D 491/22 (2006.01)**

**C 0 7 D 519/00 (2006.01)**

**【 F I 】**

C 0 7 D 207/404

A 6 1 K 31/265

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/365

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/453

A 6 1 K 31/4741

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/522

A 6 1 K 31/5513

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/16

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 0 5

C 0 7 D 243/12

C 0 7 D 249/18 5 0 5

C 0 7 D 305/14

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 473/16

C 0 7 D 487/04 1 3 2

C 0 7 D 491/22

C 0 7 D 519/00

C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月9日(2005.6.9)

【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】

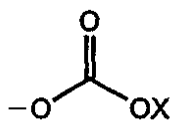
式、

R - Q

式中、Rは脂肪アルコールROHのC<sub>8</sub>～C<sub>26</sub>の脂肪基であり、Qは、

1.)

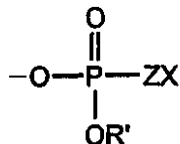
【化1】



式中、Xは薬剤XOHの薬剤部分である、

2.)

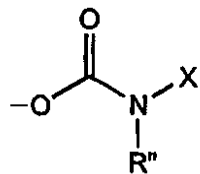
【化2】



式中、Xは薬剤XZHの薬剤部分であり、ZはO、第一級アミノ基、または第二級アミノ基であり、R'はH、イオンまたは保護基である、

3.)

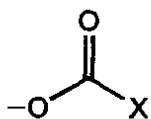
【化3】



式中、Xは薬剤HNRR''Xの薬剤部分であり、R''はH、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基またはアリール基である、

4.)

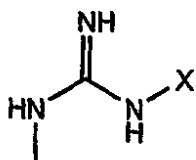
【化4】



式中、Xは薬剤XC(O)OHの薬剤部分である、および

5.)

## 【化 5】



式中、X は薬剤  $\text{XNH}_2$  の薬剤部分である、  
 かなる群から選択される、  
 で表される化合物。

## 【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容し得る担体を含む、医薬製剤。

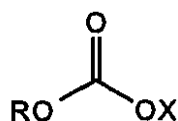
## 【請求項 3】

医薬の製造のための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 4】

式

## 【化 6】

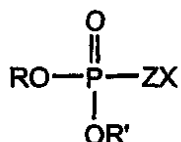


で表される化合物を製造する方法であって、  
 式  $\text{ROC}(\text{O})\text{T}$  で表される中間体を、前記化合物を形成するのに十分な時間、式  $\text{XOH}$  で表される薬剤と反応させることを含み、式中、R は脂肪アルコール  $\text{ROH}$  の  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、X は式  $\text{XOH}$  で表される薬剤の薬剤部分であり、そして T は離脱基である、前記方法。

## 【請求項 5】

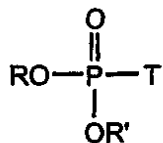
式

## 【化 7】



で表される化合物を製造する方法であって、  
 式

## 【化 8】

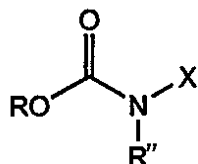


で表される中間体を、前記化合物を形成するのに十分な時間、薬剤  $\text{XZH}$  と反応させることを含み、式中、R は脂肪アルコール  $\text{ROH}$  の  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、X は薬剤  $\text{XZH}$  の薬剤部分であり、Z は O、第一級アミノ基、または第二級アミノ基であり、R' は H、イオン、保護基または第二の薬剤であり、そして T は離脱基である、前記方法。

## 【請求項 6】

式

【化 9】

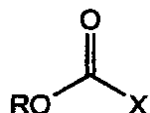


で表される化合物を製造する方法であって、式  $\text{ROC}(\text{O})\text{T}$  で表される中間体を、前記化合物を形成するのに十分な時間、式  $\text{HNRR}''\text{X}$  で表される薬剤と反応させることを含み、式中、R は脂肪アルコール  $\text{ROH}$  の  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、X は式  $\text{HNRR}''\text{X}$  で表される薬剤の薬剤部分であり、 $\text{R}''$  は H、アルキル基またはアリール基であり、そして T は離脱基である、前記方法。

【請求項 7】

式

【化 10】

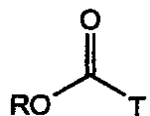


で表される化合物を製造する方法であって、  
式  $\text{XC}(\text{O})\text{OH}$  で表される薬剤を離脱基により誘導体化して中間体を形成すること、および  
該中間体を前記化合物を形成するのに十分な時間、式  $\text{ROH}$  で表される脂肪アルコールと反応させることを含み、  
ここで、R は前記脂肪アルコールの  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、X は式  $\text{XC}(\text{O})\text{OH}$  で表される薬剤の薬剤部分である、前記方法。

【請求項 8】

式

【化 11】

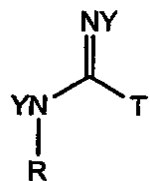


式中、R は脂肪アルコール  $\text{ROH}$  の  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、T は離脱基である、  
で表される化合物。

【請求項 9】

式

【化 12】



式中、R は脂肪アルコール  $\text{ROH}$  の  $\text{C}_8 \sim \text{C}_{26}$  の脂肪基であり、Y は保護基であり、そして T は離脱基である、  
で表される化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 4 8

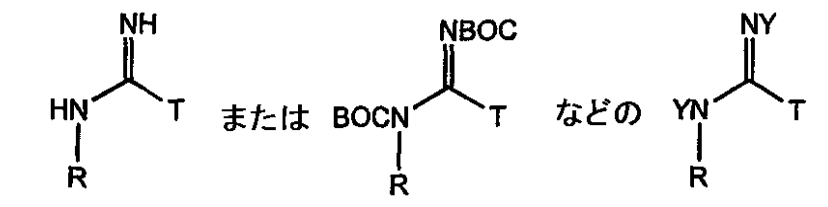
【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 4 8 】

本発明のさらに他の観点によって、薬剤脂肪アルコール複合体の合成における中間体として有用な化合物を提供する。これらの化合物は、式

【化 1 4 】



で表され、式中、Rは脂肪アルコールROHのC<sub>8</sub>～C<sub>26</sub>の基であり、Yは保護基であり、Tは離脱基であり、BOCはtert-ブトキシ基である。