

【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19年3月22日(2007.3.22)

【公表番号】特表2006-516641(P2006-516641A)

【公表日】平成18年7月6日(2006.7.6)

【年通号数】公開・登録公報2006-026

【出願番号】特願2006-503239(P2006-503239)

【国際特許分類】

**C 0 7 H 19/16 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/7076 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/06 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 H 19/16 C S P

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 3/06

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月30日(2007.1.30)

【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

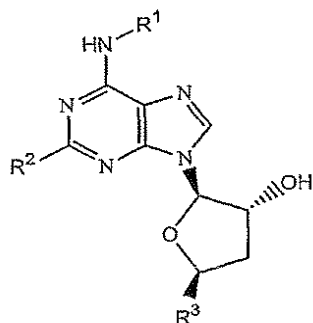
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式 I

## 【化 1】



〔式中、 $R^1$  は任意で置換されたアルキル、任意で置換されたシクロアルキル、任意で置換されたヘテロシクリル、任意で置換されたアリール、または任意で置換されたヘテロアリール；

$R^2$  は水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、任意で置換されたアシル、またはシアノ；

$R^3$  はヒドロキシメチルまたは  $R^4 R^5 N(O)C-$  であって、ここで  $R^4$  および  $R^5$  は独立して水素または任意で置換されたアルキルである。〕

の化合物。

## 【請求項 2】

$R^3$  がヒドロキシメチルである、請求項 1 の化合物。

## 【請求項 3】

$R^1$  が任意で置換されたヘテロシクロルまたは任意で置換されたシクロアルキルである、請求項 2 の化合物。

## 【請求項 4】

$R^2$  が水素またはハロゲンである、請求項 3 の化合物。

## 【請求項 5】

$R^1$  が任意で置換されたシクロアルキルである、請求項 4 の化合物。

## 【請求項 6】

2-6-[[ (1R)-2-ヒドロキシシクロヘキシル)アミノ]プリン-9-イル}(5S,2R,3R)-5-(ヒドロキシメチル)オキソラン-3-オール；

2-6-[[ (1R)-2-ヒドロキシシクロヘキシル)アミノ]プリン-9-イル}(5S,2R,3R)-5-(ヒドロキシメチル)オキソラン-3-オール；

(5S,2R,3R)-2-{6-[[ (1S,2S)-2-ヒドロキシシクロペンチル)アミノ]プリン-9-イル}-5-(ヒドロキシメチル)オキソラン-3-オール；および

(2-{6-[[ (1R)-2-ヒドロキシシクロペンチル)アミノ]-2-クロロプリン-9-イル}(5S,2R,3R)-5-(ヒドロキシメチル)オキソラン-3-オール

よりなる群から選択される、請求項 5 の化合物。

## 【請求項 7】

$R^1$  が任意で置換されたヘテロシクリル基である、請求項 4 の化合物。

## 【請求項 8】

$R^1$  が、少なくとも一つの窒素若しくは酸素のヘテロ原子を含む、任意で置換された 5 員環である、請求項 7 の化合物。

## 【請求項 9】

$R^1$  が任意で置換されたピロリジニル基である、請求項 8 の化合物。

## 【請求項 10】

$R^1$  が  $R-X-$  の構造を有する置換基で置換され、 $R$  が任意で置換されたアリールまたは任意で置換されたアルキルであり、 $X$  がカルボニルまたはスルホニルである、請求項 9 の化合物。

## 【請求項 11】

$R$  が任意で置換されたフェニルである、請求項 10 の化合物。

## 【請求項 12】

(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル フェニル ケトン;  
 (3R)-3-[(9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 4-フルオロフェニルケトン;  
 4-[(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル]カルボニル}ベンゼンカルボニトリル;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 4-メトキシフェニルケトン;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 4-(トリフルオロメチル)フェニル ケトン;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 4-エチルフェニルケトン;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 3-フルオロフェニルケトン;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル]オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)-1-(フェニルスルホニル)ピロリジン;および  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 2-フルオロフェニルケトンよりなる群から選択される、化合物。

【請求項 13】

R が任意で置換されたナフタレンである、請求項 10 の化合物。

【請求項 14】

(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル 2-ナフチルケトン、および(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル ナフチルケトンよりなる群から選択される請求項 13 の化合物。

【請求項 15】

R が C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> アルキルである、請求項 10 の化合物。

【請求項 16】

(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)-1-アセチルピロリジン;  
 1-[(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル]-2-メチルプロパン-1-オン;  
 1-[(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]プリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル]ヘプタン-1-オン;  
 (3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]-2-クロロプリン-6-イル}アミノ)-1-アセチルピロリジン;および  
 1-[(3R)-3-({9-[(5S,2R,3R)-3-ヒドロキシ-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-2-イル]-2-クロロプリン-6-イル}アミノ)ピロリジニル]ヘプタン-1-オンよりなる群から選択される、請求項 5 の化合物。

【請求項 17】

R<sup>1</sup> が任意で置換されたオキシラン基である、請求項 8 の化合物。

【請求項 18】

2-{6-[(3R)オキシラン-3-イル]アミノ}プリン-9-イル}(5S,2R,3R)-5-(ヒドロキシメチル)オキシラン-3-オールである、請求項 17 の化合物。

【請求項 19】

少なくとも一つの薬学的に許容される賦形剤および請求項 1 の化合物の治療上の有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 20】

アデノシン A<sub>1</sub> 受容体の部分アゴニストまたは完全アゴニストによる治療で軽減され得る

哺乳類の症状を治療するための、請求項 1 の化合物を有効成分とする薬学的組成物。

【請求項 2 1】

該症状が心房細動、上室性頻脈、心粗動、うっ血性心不全、てんかん、脳梗塞、糖尿病、肥満、虚血、安定性狭心症、不安定性狭心症、心臓移植、および心筋梗塞から選択される、請求項 2 0 の組成物。

【請求項 2 2】

該症状が高脂血症である、請求項 2 0 の組成物。