

【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17年6月30日(2005.6.30)

【公表番号】特表2004-522794(P2004-522794A)

【公表日】平成16年7月29日(2004.7.29)

【年通号数】公開・登録公報2004-029

【出願番号】特願2002-569851(P2002-569851)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 H 19/167

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 35/00

【F I】

C 0 7 H 19/167

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成15年11月5日(2003.11.5)

【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】

以下の化合物：

2-フルオロ-5'-メチルチオアデノシン；

2-クロロ-5'-デオキシ-5'-メチルチオアデノシン；

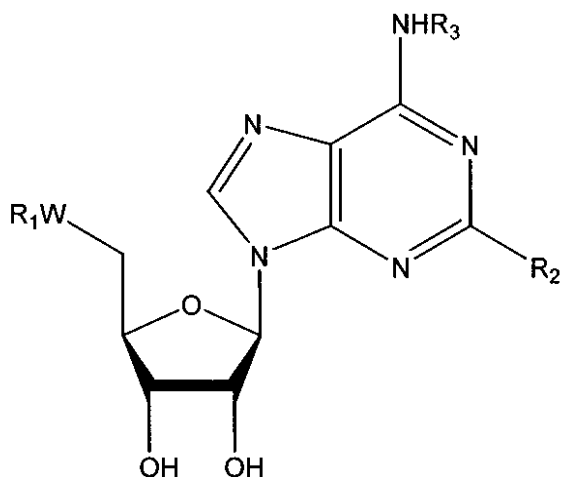
2-フルオロ-5'-エチルチオアデノシン；

2-クロロ-5'-デオキシ-5'-エチルチオアデノシン；および

5'-デオキシ-5'-ブチルチオ-2-クロロアデノシンを除く、

一般式(1)の化合物または前記化合物の塩：

## 【化 1】



式中

Wは、酸素または硫黄原子を表し；

R<sub>1</sub>は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表し；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、低級アルケニル、低級アルキニル、または低級アルキリデンヒドラジノを表し；

R<sub>3</sub>は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、（アラルキル）アルキル、アリール、またはアニリドを表し；前記シクロアルキルアリール、および（アラルキル）アルキルは、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルから選択される1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい。

## 【請求項 2】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がハロゲンを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項1の化合物。

## 【請求項 3】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択されるアルキルを表し、R<sub>2</sub>がヨウ素を表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項2に記載の化合物。

## 【請求項 4】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がアルキニル基を表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 5】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択される低級アルキルを表し、R<sub>2</sub>が1-ヘキシルを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項4に記載の化合物。

## 【請求項 6】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がアルキリデンヒドラジノ基を表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 7】

Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択される低級アルキルを表し、R<sub>2</sub>がN'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す、請求項6に記載の化合物。

## 【請求項 8】

Wが酸素原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がハロゲン原子を表し、およびR<sub>3</sub>が水素、シクロアルキル、置換されたまたは置換されていない（アラルキル）もしくはアルキルからなる群より選択される置換基を表す、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 9】

Wが酸素原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、またはシクロプロピル基を表し、R<sub>2</sub>が塩素を表し、およびR<sub>3</sub>が水素、シクロペンチル、またはハロベンジルを表す、請求項1に記載化合物。

【請求項10】

前記ハロベンジルが3-ヨードベンジルである、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物：

5'-デオキシ-2-ヨード-5'-メチルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-ヨード-5'-エチルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-ヨード-5'-プロピルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-ヨード-5'-イソプロピルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-メチルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-エチルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-プロピルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-イソプロピルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(N'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-メチルチオアデノシン；  
 5'-デオキシ-5'-エチルチオ-2-(N'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)アデノシン；  
 5'-デオキシ-2-(N'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-プロピルチオアデノシン；  
 および  
 5'-デオキシ-2-(N'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-イソプロピルチオアデノシン。

【請求項12】

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物：

N<sup>6</sup>-シクロペンチル-5'-0-メチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-5'-0-メチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-シクロペンチル-5'-0-エチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-5'-0-エチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-シクロペンチル-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-5'-0-シクロプロピルアデノシン。

【請求項13】

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物：

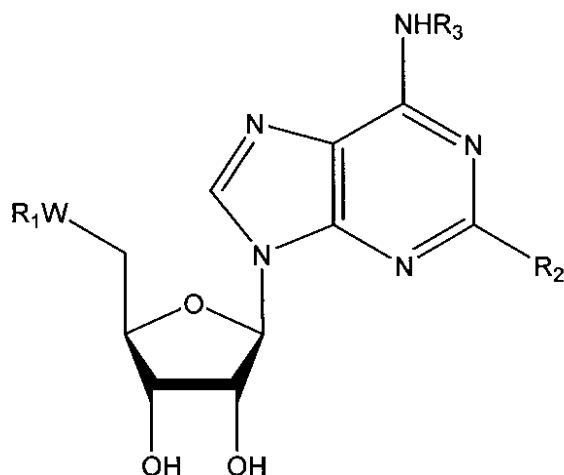
2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；  
 2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；  
 2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン；  
 N<sup>6</sup>-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、  
 N<sup>6</sup>-(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン。

【請求項14】

以下の化合物：

2-フルオロ-5'-メチルチオアデノシン；  
 2-クロロ-5'-デオキシ-5'-メチルチオアデノシン；  
 2-フルオロ-5'-デオキシ-5'-エチルチオアデノシン；  
 2-クロロ-5'-デオキシ-5'-エチルチオアデノシン；および  
 5'-デオキシ-5'-ブチルチオ-2-クロロアデノシンを除く、  
 活性成分としての一般式(1)の化合物と、薬学的に許容される添加物とを含む薬学的組成物：

## 【化 2】



式中

Wは、酸素または硫黄原子を表し；

R<sub>1</sub>は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表し；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、アルケニル、アルキニル、またはアルキリデンヒドラジノを表し；

R<sub>3</sub>は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、（アラルキル）アルキル、またはアニリドを表し、前記シクロアルキル、アリール、および（アラルキル）アルキルは、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルから選択される1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい。

## 【請求項 15】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がハロゲンを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 16】

請求項15に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択される低級アルキルを表し、R<sub>2</sub>がヨウ素原子を表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 17】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、R<sub>2</sub>がアルキニル基を表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 18】

請求項17に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択される低級アルキルを表し、R<sub>2</sub>が1-ヘキシルを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 19】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がアルキル基を表し、およびR<sub>3</sub>がアルキリデンヒドラジノ基を表し、R<sub>2</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 20】

請求項19に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R<sub>1</sub>がメチル、エチル、n-またはi-プロピルからなる群より選択される低級アルキルを表し、R<sub>2</sub>がN'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノを表し、およびR<sub>3</sub>が水素を表す組成物。

## 【請求項 21】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、Wが

酸素原子を表し、 $R_1$ がアルキル基を表し、 $R_2$ がハロゲン原子を表し、および $R_3$ が水素、シクロアルキル、置換されたまたは置換されていない（アラルキル）アルキルからなる群より選択される置換基を表す組成物。

【請求項 2 2】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分が式(1)の化合物であり、式中、 $W$ が酸素原子を表し、 $R_1$ がメチル、エチル、またはシクロプロピル基を表し、 $R_2$ が塩素原子を表し、および $R_3$ が水素、シクロペンチル、またはハロベンジルを表す組成物。

【請求項 2 3】

前記ハロベンジルが3-ヨードベンジルである、請求項22に記載の組成物。

【請求項 2 4】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分は、以下の化合物から選択される組成物：

5'-デオキシ-2-ヨード-5'-メチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-ヨード-5'-エチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-ヨード-5'-プロピルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-ヨード-5'-イソプロピルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-メチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-エチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-プロピルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-(1-ヘキシル)-5'-イソプロピルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-( $N'$ -3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-メチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-( $N'$ -3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-エチルチオアデノシン；

5'-デオキシ-2-( $N'$ -3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-プロピルチオアデノシン

；および

5'-デオキシ-2-( $N'$ -3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノ)-5'-イソプロピルチオアデノシン。

【請求項 2 5】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分は、以下の化合物から選択される組成物：

$N^6$ -シクロペンチル-5'-0-メチルアデノシン；

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-5'-0-メチルアデノシン；

$N^6$ -シクロペンチル-5'-0-エチルアデノシン；

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-5'-0-エチルアデノシン；

$N^6$ -シクロペンチル-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-5'-0-シクロプロピルアデノシン。

【請求項 2 6】

請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分は、以下の化合物から選択される組成物：

2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；

$N^6$ -シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；

2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；

$N^6$ -シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；

2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン；

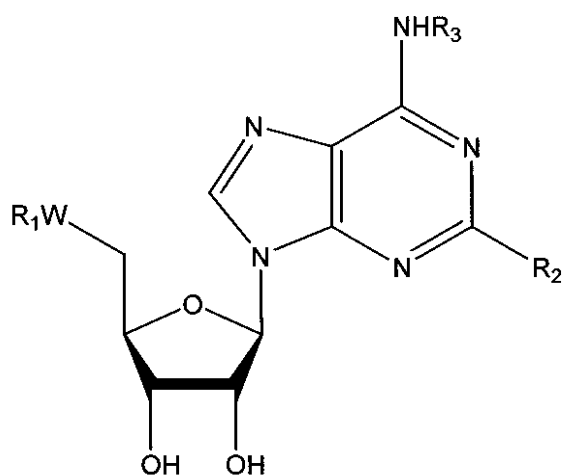
$N^6$ -シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、

$N^6$ -(3-ヨードベンジル)-2-クロロ-5'-0-シクロプロピルアデノシン。

【請求項 2 7】

薬学的組成物の調製における、以下の一般式(1)の化合物または前記化合物の塩の使用：

## 【化 3】



式中

Wは、酸素または硫黄原子を表し；

R<sub>1</sub>は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表し；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、低級アルケニル、低級アルキニル、または低級アルキリデンヒドラジノを表し；

R<sub>3</sub>は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、（アラルキル）アルキル、アリール、またはアニリドを表し；前記シクロアルキル、アリール、および（アラルキル）アルキルは、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルから選択される1つまたは複数の置換基で置換されていてもよい。