

【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；

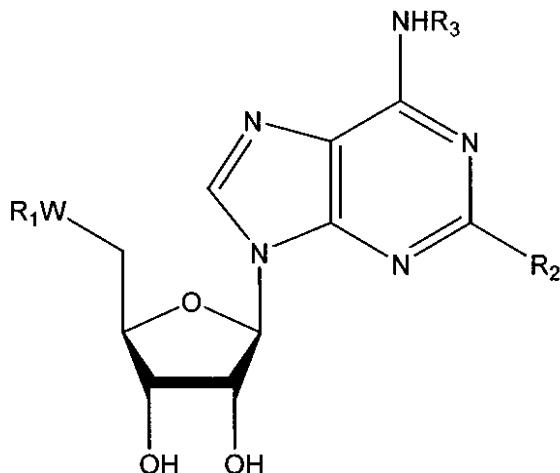
2-フルオロ-5'-エチルチオアデノシン；

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(I)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；

R₁は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表し；R₂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；R₃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、R₁がアルキル基を表し、R₂がハロゲンを表し、およびR₃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、R₁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、R₂がヨウ素を表し、およびR₃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、R₁がアルキル基を表し、R₂がアルキニル基を表し、およびR₃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、R₁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、R₂が1-ヘキシルを表し、およびR₃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、R₁がアルキル基を表し、R₂がアルキリデンヒドラジノ基を表し、およびR₃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、R₁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、R₂がN'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノを表し、およびR₃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、R₁がアルキル基を表し、R₂がハロゲン原子を表し、およびR₃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、R₁がメチル、エチル、またはシクロプロピル基を表し、R₂が塩素を表し、およびR₃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：

N⁶-シクロペンチル-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-(3-ヨードベンジル)-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-シクロペンチル-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-(3-ヨードベンジル)-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-シクロペンチル-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、
 N⁶-(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；
 N⁶-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-(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；
 N⁶-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-(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；
 N⁶-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、
 N⁶-(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。

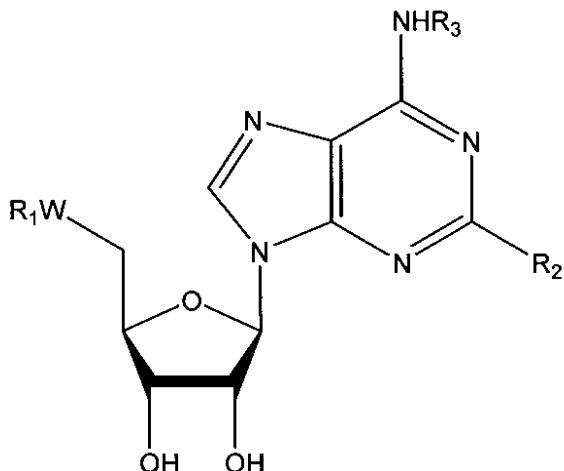
【請求項14】

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(I)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；

R₁は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表し；R₂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；

R₃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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁がアルキル基を表し、R₂がハロゲンを表し、およびR₃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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁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、R₂がヨウ素原子を表し、およびR₃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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁がアルキル基を表し、R₂がアルキニル基を表し、およびR₃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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁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、R₂が1-ヘキシルを表し、およびR₃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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁がアルキル基を表し、およびR₃がアルキリデンヒドラジノ基を表し、R₂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(I)の化合物であり、式中、Wが硫黄原子を表し、R₁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、R₂がN'-3-メチル-1-ブチリデンヒドラジノを表し、およびR₃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(I)の化合物であり、式中、Wが

酸素原子を表し、R₁がアルキル基を表し、R₂がハロゲン原子を表し、およびR₃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（Ⅰ）の化合物であり、式中、Wが酸素原子を表し、R₁がメチル、エチル、またはシクロプロピル基を表し、R₂が塩素原子を表し、およびR₃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：

N⁶-シクロペンチル-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-（3-ヨードベンジル）-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-シクロペンチル-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-（3-ヨードベンジル）-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-シクロペンチル-5'-0-シクロプロピルアデノシン；および、
 N⁶-（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】

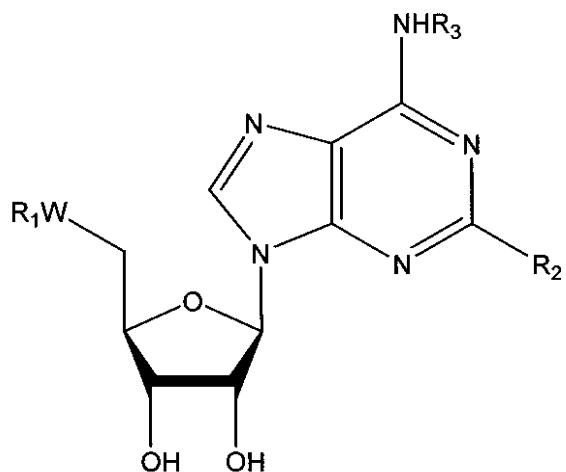
請求項14に記載の組成物であって、前記活性成分は、以下の化合物から選択される組成物：

2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-メチルアデノシン；
 N⁶-（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；
 N⁶-シクロペンチル-2-クロロ-5'-0-エチルアデノシン；
 N⁶-（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；
 N⁶-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、
 N⁶-（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（Ⅰ）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_1 は、低級アルキルまたは低級シクロアルキルを表す；

R_2 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_3 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、ヒドロキシリル、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。