

【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4月19日(2007.4.19)

【公表番号】特表2002-539204(P2002-539204A)

【公表日】平成14年11月19日(2002.11.19)

【出願番号】特願2000-605578(P2000-605578)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 31/7012 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 309/28 (2006.01)

C 0 7 K 5/033 (2006.01)

C 0 7 K 7/02 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

C 1 2 Q 1/70 (2006.01)

G 0 1 N 33/569 (2006.01)

G 0 1 N 33/573 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/08

A 6 1 K 31/13

A 6 1 K 31/7012

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 309/28

C 0 7 K 5/033

C 0 7 K 7/02

C 1 2 N 9/99

C 1 2 Q 1/70

G 0 1 N 33/569 G

G 0 1 N 33/573 Z

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月27日(2007.2.27)

【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

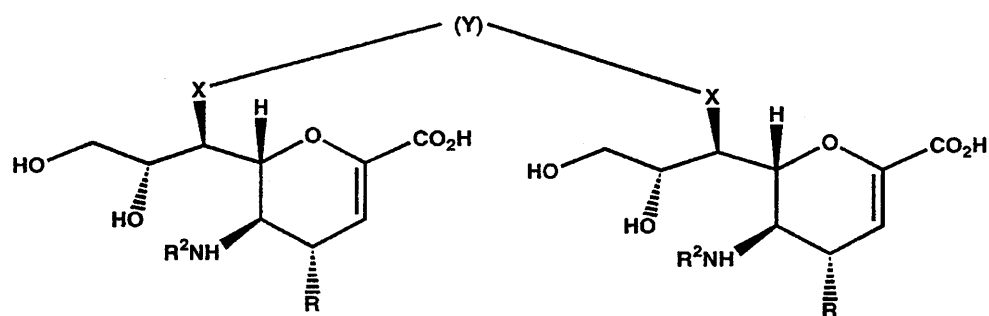
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式Ⅰの化合物、またはその医薬上許容される塩：

【化1】



(I)

{ 式中、

R は、アジド基；水酸基；グアニジノ基；アミノ基、アルキル、ヒドロキシアリル、アリル、ニトリル、アルコキシカルボニルもしくはアシルにより置換されたグアニジノ基；またはアルキル、ヒドロキシアリル、アリル、ニトリル、アルコキシカルボニルもしくはアシルにより置換されたアミノ基を表し、

R² は、COCH₃、COCF₃、SO₂CH₃ または SO₂CF₃ を表し、

X は、O、O(C=O)、NH、NHCO、O(C=O)NH、O(C=S)NH、NH(C=O)NH、または NH(C=S)NH を表し、かつ、

Y は、骨格原子が炭素、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択され、100 までの原子長の直鎖、分枝状、環状の鎖、またはそれらの組合せである}。

【請求項 2】

Y が 8 ~ 100 個の原子長である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Y が 10 ~ 50 個の原子長である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

Y が 12 ~ 30 個の原子長である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R が、アミノ基；グアニジノ基；アルキル、ヒドロキシアリル、アリル、ニトリル、アルコキシカルボニルもしくはアシルにより置換されたグアニジノ基；または、アルキル、ヒドロキシアリル、アリル、ニトリル、アルコキシカルボニルもしくはアシルにより置換されたアミノ基であり、

R² がアセチルまたはトリフルオロアセチルであり、

X が O(C=O)NH であり、かつ

Y が 10 ~ 50 個の原子長である、

請求項 1 に記載の化合物。

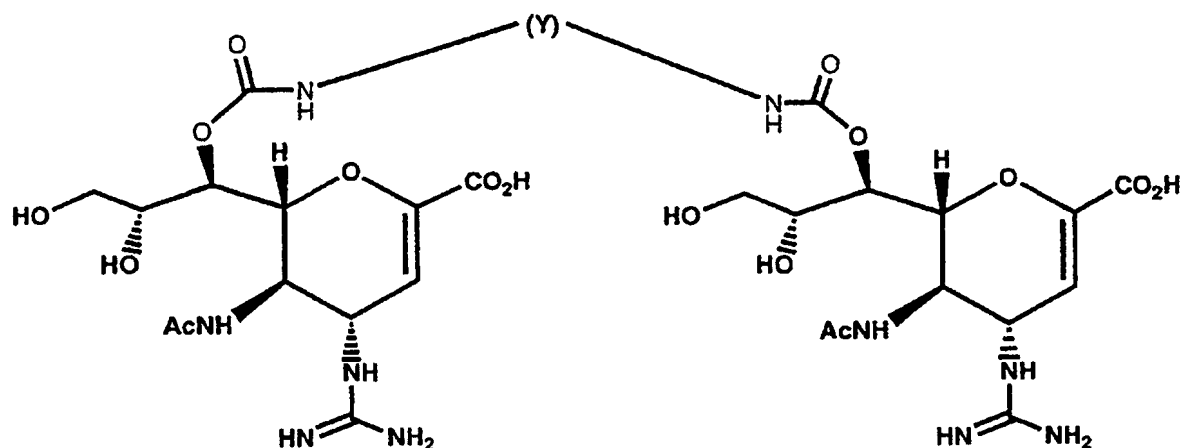
【請求項 6】

Y が、直鎖もしくは分枝状炭化水素鎖；Br、Cl、F、I、CF₃、NH₂、アミノ、アルキルアミノ、NHアシル、アルコキシ、メトキシ、ヒドロキシもしくはカルボキシにより置換された直鎖もしくは分枝状炭化水素鎖；ペプチド；オリゴ糖；ポリアミノ酸；ポリエチレングリコール単位；アルキルアミドアルカン；アルキルウレイドアルカンからなる群から選択され、いずれも単独で、多形でまたは組み合わせて用いてもよい、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

下記式 (1a) である、請求項 1 に記載の化合物。

【化 2】



(Ia)

(ここで、Yは、

$(\text{CH}_2)_6 \text{NHCONH}(\text{CH}_2)_4 \text{NHCONH}(\text{CH}_2)_6$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NHCONH}(\text{CH}_2)_{1-2} \text{NHCONH}(\text{CH}_2)_6$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NH}[\text{COCH}_2 \text{NH}]_3 \text{CONH}(\text{CH}_2)_6 \text{NHCO}[\text{NHCH}_2 \text{CO}]_3 \text{NH}(\text{CH}_2)_6$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NH}[\text{CO}(\text{CH}_2)_5 \text{NH}]_2 \text{CONH}(\text{CH}_2)_{1-2} \text{NHCO}[\text{NH}(\text{CH}_2)_5 \text{CO}]_2 \text{NH}(\text{CH}_2)_6$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NH}[\text{CO}(\text{CH}_2)_5 \text{NH}]_4 \text{CONH}(\text{CH}_2)_6 \text{NHCO}[\text{NH}(\text{CH}_2)_5 \text{CO}]_4 \text{NH}(\text{CH}_2)_5$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NHCOCH}_2 \text{N}[\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{H}]\text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{N}[\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{H}]\text{CH}_2 \text{CONH}(\text{CH}_2)_6$,
 $(\text{CH}_2)_6 \text{NHCO}(\text{CH}_2)_2 \text{CH}[\text{NH}_2, \text{TFA}]\text{CONHCH}_2 \text{CONH}(\text{CH}_2)_6$, または
 $\text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{OCH}_2 \text{CH}_2 \text{OCH}_2 \text{CH}_2$,
 である)。

【請求項 8】

Yが、化合物の薬学上または薬動力学上の特性を改善するために、親油性炭化水素基、ポリエチレングリコール (PEG) 鎖およびペプチドからなる群から選択される付加的な官能基と結合している、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物を、医薬上許容される担体とともに含んでなる、医薬組成物。

【請求項 10】

1 種以上のその他の治療的および / または予防的成分をさらに含んでなる、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

第 2 の抗ウイルス剤をさらに含んでなる、請求項 9 または 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

第 2 の抗ウイルス剤がシアル酸類似体、アマンタジン、リマンタジンおよびリバビリンからなる群から選択される、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

ウイルス感染症を治療および / または予防するための、請求項 9 ~ 12 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 14】

オルソミクスウイルスまたはパラミクスウイルスの感染症の治療または予防用である、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

感染症が A 型または B 型インフルエンザによって引き起こされるものである、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

感染症が哺乳類におけるものである、請求項 13 ~ 15 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 17】

哺乳類がヒトである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

化合物が式 (I) または式 (Ia) のものである、請求項 13 ~ 17 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 19】

用量が一日当たり約 0.01 ~ 100 mg / 体重 kg の範囲である、請求項 13 ~ 18 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 20】

ウイルス感染を治療および / または予防する医薬の製造のための、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物と、ウイルスを含むと思われるサンプルとを接触させる工程を含んでなる、インフルエンザウイルスの検出方法。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、または請求項 9 ~ 19 のいずれか一項に記載の組成物を含んでなる、抗ウイルス剤。