

六、申請專利範圍

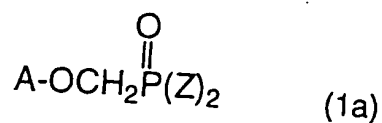
附件 2A :

第 86110757 號專利申請案

中文申請專利範圍更正本

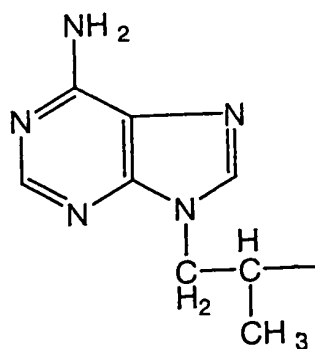
民國 97 年 2 月 26 日更正

1. 一種式 (1a) 化合物



其中 Z 分別是 $-\text{OC}(\text{R}^2)_2\text{OC}(\text{O})\text{OR}'$ 或 $-\text{OC}(\text{R}^2)_2\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}'')_2$

A 是具有式 (1b) 之抗病毒的磷酸基甲氧基核苷酸類似物的殘基：



(1b)

R^2 分別為 $-\text{H}$ 或 C_1-C_6 烷基 (其係未經取代或經一個 $-\text{OR}^3$ 取代, 其中 R^3 是 C_1-C_6 烷基) ;

R' 分別是 C_1-C_6 烷基 ; 以及

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

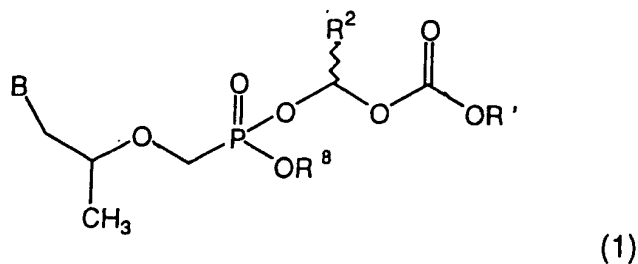
訂

編

六、申請專利範圍

R'' 分別是 H 或 C_1-C_6 烷基,但是一個 R'' 為 C_1-C_6 烷基;
以及其鹽類及互變異構物。

2.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其如式(1)所示:



B 是腺嘌呤-9-基;

R^2 是氫或 C_1-C_6 烷基;

R^8 是 $-CHR^2-O-C(O)-OR'$;

R' 分別是 C_1-C_6 烷基;

以及其鹽類及互變異構物。

3.如申請專利範圍第 2 項之化合物,其中 R^2 是 -H。

4.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中 R^2 是 -H。

5.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中一 R^2 是 $-CH_3$,
及另一 R^2 是 -H。

6.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中 R^3 是 $-CH_3$ 或
 $-C_2H_5$ 。

7.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中 Z 分別為
 $OC(R^2)_2OC(O)OR'$ 。

8.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中 Z 分別為
 $OC(R^2)_2OC(O)N(R'')_2$ 。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

六、申請專利範圍

9.如申請專利範圍第2項之化合物，其中該化合物在連接至結構(1b)之甲基側鏈之碳原子不對稱中心係富含的(enriched)或解析的(resolved)。

10.如申請專利範圍第9項之化合物，其中至少約90%之化合物為(R)構型。

11.如申請專利範圍第2項之化合物，其中R'是乙基。

12.如申請專利範圍第2項之化合物，其中R'是異丙基。

13.如申請專利範圍第2項之化合物，其中R'是3-戊基或新戊基。

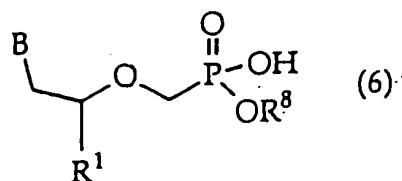
14.如申請專利範圍第2項之化合物，其中R'是第三丁基或異丁基。

15.一種用於治療被病毒感染或有感染病毒危險之病人的藥學組成物，其包含治療有效量之如申請專利範圍第1項之化合物。

16.一種製備式(1a)化合物之方法，該方法包括將磷酸基甲氧基核苷酸類似物之二酸與L-CH(R²)OC(O)OR'反應，其中L是離去基。

17.一種製備式(1)化合物的方法，其中包括將式(6)化合物

六、申請專利範圍



與 $L\text{-CHR}^2\text{-O-C(O)-OR}^1$ 反應後回收式(1)化合物，其中 B 是鳥糞嘌呤-9-基，腺嘌呤-9-基，2,6-二胺基嘌呤-9-基，2-胺基嘌呤-9-基或其 1-去氮，3-去氮，或 8-氮基類似物，或 B 是胞嘧啶-1-基；

R^1 是氫， $-\text{CH}_3$ ， $-\text{CH}_2\text{OH}$ ， $-\text{CH}_2\text{F}$ ， $-\text{CH}=\text{CH}_2$ ， $-\text{CH}_2\text{N}_3$ 或 R^1 與 R^8 連結形成 $-\text{CH}_2-$ ；及

R^8 是氫， $-\text{CHR}^2\text{-O-C(O)-OR}^1$ 或 R^8 與 R^1 連結形成 $-\text{CH}_2-$ ；

R^2 是 H， $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ 烷基，芳基，烯基，炔基，烯芳基，炔芳基，烷芳基，芳炔基，芳烯基或芳烷基，其係未經取代或經鹵基，疊氮基，硝基或 OR^3 (R^3 為 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ 烷基)取代；

R^1 分別是 H， $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ 烷基，芳基，烯基，炔基，烯芳基，炔芳基，烷芳基，芳炔基，芳烯基或芳烷基，其係未經取代或經鹵基，疊氮基，硝基或 OR^3 取代，惟至少一個 R^1 不是 H；及

L 是離去基。

18.如申請專利範圍第 17 項之方法，該方法包括用至少約 1.0 當量之 $L\text{-CHR}^2\text{-O-C(O)-OR}^1$ 進行反應。

19.如申請專利範圍第 17 項之方法，該方法包括在有機鹼存在下，於有機溶劑中及反應溫度約 $4\text{-}100^\circ\text{C}$ 進行反應約 4-72 小時。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

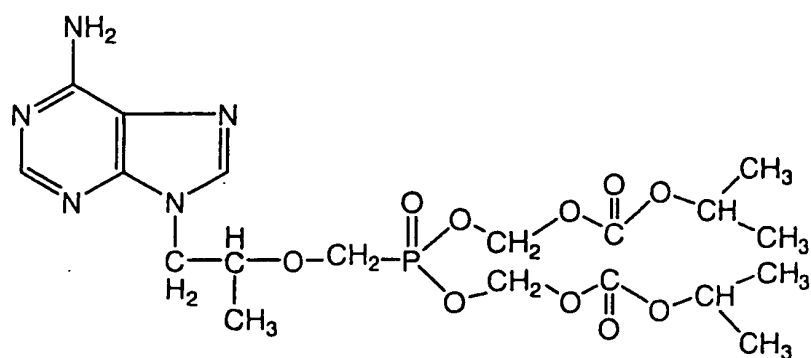
編

六、申請專利範圍

20.如申請專利範圍第 17 項之方法，其中式(1)化合物形成鹽類後沈澱回收。

21.如申請專利範圍第 20 項之方法，其中該鹽類得自硫酸、磷酸、乳酸或檸檬酸。

22.一種具有下式之化合物



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線