

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2008 年 1 月 31 日 (31.01.2008)

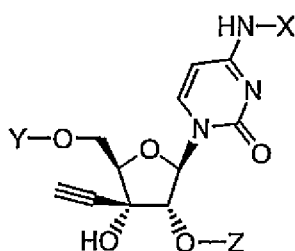
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2008/012945 A1

- (51) 国際特許分類:
C07H 23/00 (2006.01) A61P 35/02 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01) C07H 19/06 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
- (74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町 1 丁目 3 番 6 号共同ビル Tokyo (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2007/000787
- (22) 国際出願日: 2007 年 7 月 23 日 (23.07.2007)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2006-200587 2006 年 7 月 24 日 (24.07.2006) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大鵬薬品工業株式会社 (TAIHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018444 東京都千代田区神田錦町 1-2-7 Tokyo (JP). 佐々木 琢磨 (SASAKI, Takuma) [JP/JP]; 〒4660812 愛知県名古屋市中区昭和区八事富士見 1-0-1 番地 1-2-404 Aichi (JP). 松田 彰 (MAT-SUDA, Akira) [JP/JP]; 〒0010024 北海道札幌市北区北 2 4 条西十二丁目 1 番 7-501 号 Hokkaido (JP).
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 田中 基明 (TANAKA, Motoaki) [JP/JP]; 〒1018444 東京都千代田区神田錦町 1-2-7 大鵬薬品工業株式会社内 Tokyo (JP). 福島 正和 (FUKUSHIMA, Masakazu) [JP/JP]; 〒7710132 徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4-2 大鵬薬品工業株式会社内 Tokushima (JP).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 3'-ETHYNYLCYTIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 3'-エチニルシチジン誘導体



(1)

(57) Abstract: Disclosed is a compound which has excellent anti-tumor activity and excellent oral absorbability and is useful as an anti-tumor agent. Specifically disclosed is a 3'-ethynylcytidine derivative represented by the general formula (1) [wherein X represents a (substituted) alkylcarbonyl group, a (substituted) alkoxy carbonyl group or a hydrogen atom; one of Y and Z represents a hydrogen atom or a group represented by the formula: (R¹)(R²)(R³)Si- and the other represents a group represented by the formula: (R⁴)(R⁵)(R⁶)Si-; and R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ independently represent a (substituted) alkyl group, a (substituted) cyclic alkyl group or a (substituted) aryl group] or a salt thereof.

/ 続葉有 /



(57) 要約:

優れた抗腫瘍活性を示すとともに、優れた経口吸収性を有し、抗腫瘍剤として有用な化合物の提供。

下記一般式（１）

〔式中、Xは（置換）アルキルカルボニル基、（置換）アルコシカルボニル基又は水素原子を示し、Y及びZは一方が水素原子又は（R¹）（R²）（R³）S iーで表される基、他方が（R⁴）（R⁵）（R⁶）S iーで表される基を示し、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は（置換）アルキル基、（置換）環状アルキル基、又は（置換）アリール基を示す。〕で表される3'-エチニルシチジン誘導体又はその塩。

