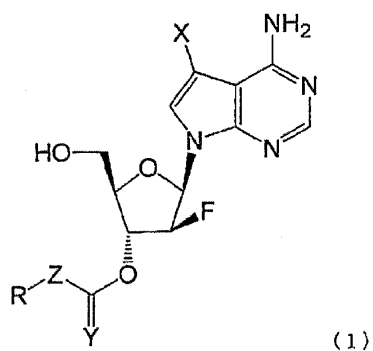


請求の範囲

[請求項1] 下記一般式（１）

[化1]



[式中、

Xは、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を示し、

Yは、酸素原子、又は硫黄原子を示し、

Zは、酸素原子、又は硫黄原子を示し、

Rは、置換基を有しても良い直鎖状のC 1－C 6アルキル基、置換基を有しても良いC 2－C 6アルケニル基、置換基を有しても良いC 2－C 6アルキニル基、置換基を有しても良いC 3－C 10シクロアルキル基、置換基を有しても良いC 4－C 10シクロアルケニル基、置換基を有しても良いC 6－C 10の芳香族炭化水素基、置換基を有しても良い4～10員の飽和複素環基、又は置換基を有しても良い5～10員の不飽和複素環基、を示す。］で表される化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項2]

Rは、置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 6アルケニル基、C 1－C 6アルキニル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルキル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、又は芳香族炭化水素基をそれぞれ1から3個有しても良い、直鎖状のC 1－C 6アルキ

ル基；

置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 6アルケニル基、C 1－C 6アルキニル基、C 1－C 4アルコキシ基、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、又は芳香族炭化水素基をそれぞれ1から3個有しても良い、C 3－C 10シクロアルキル基；

置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 6アルケニル基、C 1－C 6アルキニル基、C 1－C 4アルコキシ基、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、又は芳香族炭化水素基をそれぞれ1から3個有しても良い、C 4－C 10シクロアルケニル基；あるいは

置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 6アルケニル基、C 1－C 6アルキニル基、C 1－C 4アルコキシ基、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、又は芳香族炭化水素基をそれぞれ1から3個有しても良い）4～10員の飽和複素環基；

を示す、請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項3]

Rは、置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、C 1－C 4ハロアルキル基、ハロゲン原子、又はフェニル基をそれぞれ1から3個有しても良い、直鎖状のC 1－C 6アルキル基；置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、ハロゲン原子、又はフェニル基をそれぞれ1から3個有しても良い、C 3－C 10シクロアルキル基；

置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、ハロゲン原子、又はフェニル基をそれぞれ1から3個有しても良い、C 4－C 10シクロアルケニル基；又は

置換基としてC 1－C 6アルキル基、C 1－C 4アルコキシ基、ハロゲン原子、又はフェニル基をそれぞれ1から3個有しても良い、4～10員の飽和複素環基；

を示す、請求項2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項4]

Xは臭素原子又はヨウ素原子を示す、請求項3に記載の化合物又は

その薬学的に許容可能な塩。

[請求項5] Xはヨウ素原子を示す、請求項4に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項6] Yは酸素原子を示す、請求項5に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項7] Rは、置換基としてC1-C2アルキル基、C1-C2アルコキシ基、C1-C2ハロアルキル基、フッ素原子又は塩素原子をそれぞれ1から3個有しても良い、直鎖状のC1-C3アルキル基；

置換基としてC1-C2アルキル基、又はC1-C2アルコキシ基、フッ素原子又は塩素原子をそれぞれ1から2個有しても良い、C3-C7シクロアルキル基；

置換基としてC1-C2アルキル基、又はC1-C2アルコキシ基、フッ素原子又は塩素原子をそれぞれ1から2個有しても良い、C4-C6シクロアルケニル基；又は

置換基としてC1-C2アルキル基、C1-C2アルコキシ基、フッ素原子又は塩素原子をそれぞれ1から3個有しても良い、4～6員の飽和複素環基；

を示す、請求項6に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

[請求項8] 化合物が以下の化合物群から選択されるものである、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩：

O-((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル)S-シクロペンチル カーボノチオエート；

O-((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル)S-イソプロピル カーボノチオエート；

O-((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル)S-エチル カーボノチオエート;

((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル ペンタン-3-イル カーボネート;

((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル シクロペンチル カーボネート;

((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル イソプロピル カーボネート;

((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル シクロペント-3-エン-1-イル カーボネート;

((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-2-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロフラン-3-イル (ビスクロ[2. 2. 1]ヘプタン-2-イル) カーボネート。

[請求項9]

化合物が以下の化合物群から選択されるものである、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩:

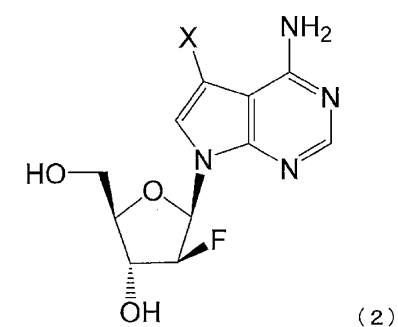
((2R, 3R, 4S, 5R)-5-(4-アミノ-5-ヨード-7H-ピロロ[2, 3-d]ピリミジン-7-イル)-4-フルオロ-

2- (ヒドロキシメチル) テトラヒドロフラン-3-イル シクロペンチル カーボネート ;

(2 R, 3 R, 4 S, 5 R) - 5 - (4-アミノ-5-ヨード-7 H-ピロロ [2, 3-d] ピリミジン-7-イル) - 4-フルオロ-2- (ヒドロキシメチル) テトラヒドロフラン-3-イル イソプロピル カーボネート。

- [請求項10] 請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を有効成分とする抗腫瘍剤。
- [請求項11] 請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩、及び薬学的に許容される担体を含有する医薬組成物。
- [請求項12] 経口剤又は注射剤として製剤化されたものである、請求項10に記載の抗腫瘍剤又は請求項11に記載の医薬組成物。
- [請求項13] 腫瘍の予防及び／又は治療方法であって、それを必要とする対象に、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を投与することを含む、方法。
- [請求項14] 腫瘍の予防及び／又は治療方法であって、それを必要とする対象に、経口剤又は注射剤として製剤化された請求項1～9のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を投与することを含む、方法。
- [請求項15] 医薬組成物として使用するための請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。
- [請求項16] 腫瘍の予防及び／又は治療に使用するための請求項1～9いずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。
- [請求項17] 経口剤又は注射剤として製剤化されたものである腫瘍の予防及び／又は治療に使用するための請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。
- [請求項18] 抗腫瘍剤を製造するための請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

- [請求項19] 医薬組成物を製造するための請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項20] 経口剤又は注射剤として製剤化されたものである抗腫瘍剤を製造するための請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項21] 前記腫瘍が、頭頸部癌（口腔癌、咽頭癌、喉頭癌、鼻腔癌、副鼻腔癌、唾液腺癌、甲状腺癌等）、消化器癌（食道癌、胃癌、十二指腸癌、肝臓癌、胆道癌（胆嚢・胆管癌等）、膵臓癌、大腸癌（結腸癌、直腸癌等）等）、肺癌（非小細胞肺癌、小細胞肺癌、中皮腫等）、乳癌、生殖器癌（卵巣癌、子宮癌（子宮頸癌、子宮体癌等）等）、泌尿器癌（腎癌、膀胱癌、前立腺癌、精巣腫瘍等）、造血器腫瘍（白血病、悪性リンパ腫、多発性骨髄腫等）、骨・軟部腫瘍、皮膚癌、及び脳腫瘍からなる群から選択される、請求項10に記載の抗腫瘍剤、請求項13～14に記載の方法、請求項15～17に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩、又は請求項18～20に記載の使用。
- [請求項22] 前記腫瘍が、脳腫瘍である、請求項21に記載の抗腫瘍剤、方法、使用、化合物又はその薬学的に許容可能な塩。
- [請求項23] 下記一般式（2）



[式中、

Xは、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を示す。]

で表される化合物又はその薬学的に許容な塩。

- [請求項24] 請求項23に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩、及び薬学的に許容可能な担体を有効成分として含む抗腫瘍剤又は医薬組成物。
- [請求項25] 経口剤又は注射剤として製剤化されたものである、請求項24に記載の抗腫瘍剤又は医薬組成物。
- [請求項26] 請求項23に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を投与することを含む、腫瘍の予防及び／又は治療方法。
- [請求項27] 腫瘍を予防及び／又は治療するための、請求項23に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。
- [請求項28] 医薬組成物又は抗腫瘍剤を製造するための請求項23に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項29] 前記腫瘍が、頭頸部癌（口腔癌、咽頭癌、喉頭癌、鼻腔癌、副鼻腔癌、唾液腺癌、甲状腺癌等）、消化器癌（食道癌、胃癌、十二指腸癌、肝臓癌、胆道癌（胆嚢・胆管癌等）、膵臓癌、大腸癌（結腸癌、直腸癌等）等）、肺癌（非小細胞肺癌、小細胞肺癌、中皮腫等）、乳癌、生殖器癌（卵巣癌、子宮癌（子宮頸癌、子宮体癌等）等）、泌尿器癌（腎癌、膀胱癌、前立腺癌、精巣腫瘍等）、造血器腫瘍（白血病、悪性リンパ腫、多発性骨髄腫等）、骨・軟部腫瘍、皮膚癌、及び脳腫瘍からなる群から選択される、請求項24～25に記載の抗腫瘍剤又は医薬組成物、請求項26に記載の腫瘍の予防及び／又は治療方法、請求項27に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩、又は請求項28に記載の使用。
- [請求項30] 前記腫瘍が、脳腫瘍である、請求項29に記載の抗腫瘍剤又は医薬組成物、腫瘍の予防及び／又は治療方法、化合物又はその薬学的に許容可能な塩、又は使用。
- [請求項31] アルキル化剤と併用することを特徴とする、請求項1～9及び23

のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩からなる抗腫瘍剤、又は医薬組成物。

- [請求項32] アルキル化剤の抗腫瘍効果を増強するための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を含む抗腫瘍効果増強剤。
- [請求項33] アルキル化剤の投与を受けた癌患者を治療するための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を含む抗腫瘍剤。
- [請求項34] アルキル化剤と併用することを特徴とする、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を投与することを含む腫瘍の予防及び／又は治療方法。
- [請求項35] 請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を患者に投与することを含む、アルキル化剤の抗腫瘍効果を増強するための方法。
- [請求項36] 請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩からなる抗腫瘍剤、及びアルキル化剤を投与することを含む、腫瘍の予防及び／又は治療方法。
- [請求項37] アルキル化剤を併用投与することを特徴とする、腫瘍の治療のための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項38] アルキル化剤を併用投与することを特徴とする、アルキル化剤の抗腫瘍効果増強のための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項39] アルキル化剤の投与を受けた癌患者を治療することを特徴とする、腫瘍の治療のための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。
- [請求項40] アルキル化剤の投与を受けた癌患者を治療することを特徴とする、アルキル化剤の抗腫瘍効果増強のための、請求項 1 ～ 9 及び 2 3 のい

ずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

- [請求項41] 抗腫瘍剤の製造のための、請求項 1～9 及び 23 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍剤は、アルキル化剤と併用投与することを特徴とする、使用。
- [請求項42] アルキル化剤の抗腫瘍効果増強剤の製造のための、請求項 1～9 及び 23 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍効果増強剤は、アルキル化剤と併用投与することを特徴とする、使用。
- [請求項43] 抗腫瘍剤の製造のための、請求項 1～9 及び 23 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍剤は、アルキル化剤の投与を受けた癌患者に、又はアルキル化剤の投与を受けようとする癌患者に対して投与される、使用。
- [請求項44] アルキル化剤の抗腫瘍効果増強剤の製造のための、請求項 1～9 及び 23 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍効果増強剤は、アルキル化剤の投与を受けた癌患者に、又はアルキル化剤の投与を受けようとする癌患者に対して投与される、使用。
- [請求項45] アルキル化剤がテモゾロミドである、請求項 31 若しくは 33 に記載の抗腫瘍剤、請求項 32 に記載の抗腫瘍効果増強剤、請求項 34～36 に記載の方法、又は請求項 37～44 に記載の使用。
- [請求項46] アルキル化剤に加えて、放射線療法と併用することを特徴とする、請求項 31 若しくは 33 に記載の抗腫瘍剤、請求項 32 に記載の抗腫瘍効果増強剤、請求項 34～36 に記載の方法、又は請求項 37～44 に記載の使用。
- [請求項47] 放射線療法と併用することを特徴とする、請求項 1～9 及び 23 のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩からなる抗腫瘍剤、又は医薬組成物。
- [請求項48] 放射線療法の抗腫瘍効果を増強するための、請求項 1～9 及び 23

のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を含む抗腫瘍効果増強剤。

[請求項49] 放射線療法を受けた癌患者を治療するための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を含む抗腫瘍剤。

[請求項50] 放射線療法と併用することを特徴とする、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩からなる腫瘍の予防及び／又は治療方法。

[請求項51] 請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩を患者に投与することを含む、放射線療法の抗腫瘍効果を増強するための方法。

[請求項52] 放射線療法を受けた癌患者に、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩からなる抗腫瘍剤を投与することを含む、腫瘍の予防及び／又は治療方法。

[請求項53] 放射線療法を併用することを特徴とする、腫瘍の治療のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

[請求項54] 放射線療法を併用することを特徴とする、抗腫瘍効果増強のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

[請求項55] 放射線療法を受けた癌患者を治療することを特徴とする、腫瘍の治療のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

[請求項56] 放射線療法を受けた癌患者を治療することを特徴とする、抗腫瘍効果増強のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用。

[請求項57] 抗腫瘍剤の製造のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍

剤は、放射線療法を併用することを特徴とする、使用。

[請求項58] 抗腫瘍効果増強剤の製造のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍効果増強剤は、放射線療法を併用することを特徴とする、使用。

[請求項59] 抗腫瘍剤の製造のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍剤は、放射線療法を受けた癌患者に対して投与される、使用。

[請求項60] 抗腫瘍効果増強剤の製造のための、請求項1～9及び23のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩の使用であって、前記抗腫瘍効果増強剤は、放射線療法を受けた癌患者に対して投与される、使用。

[請求項61] 放射線療法に加えて、アルキル化剤と併用することを特徴とする、請求項47若しくは49に記載の抗腫瘍剤、請求項48に記載の抗腫瘍効果増強剤、請求項50～52に記載の方法、又は請求項53～60に記載の使用。

[請求項62] アルキル化剤がテモゾロミドである、請求項61に記載の抗腫瘍剤、抗腫瘍効果増強剤、方法、又はその使用。