

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2006年8月3日 (03.08.2006)

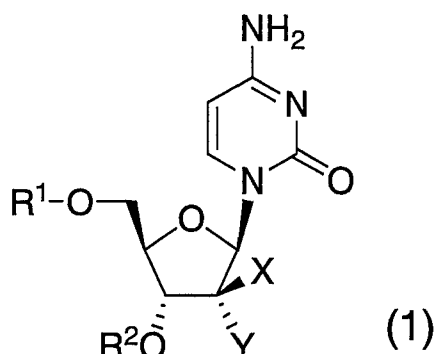
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/080509 A1

- (51) 国際特許分類:
C07H 19/06 (2006.01) C07F 7/10 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2006/301483
- (22) 国際出願日: 2006年1月30日 (30.01.2006)
- (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2005-023278 2005年1月31日 (31.01.2005) 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101番地1-2-404 Aichi (JP). 松田 彰 (MATSUDA, Akira) [JP/JP]; 〒0010024 北海道札幌市北区北24条西十二丁目1番7-501号 Hokkaido (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 野村 誠 (NO-MURA, Makoto) [JP/JP]; 〒3578527 埼玉県飯能市美杉台1-2-7 大鵬薬品工業株式会社内 Saitama (JP). 小野 弥生 (ONO, Yayoi) [JP/JP]; 〒3578527 埼玉県飯能市美杉台1-2-7 大鵬薬品工業株式会社内 Saitama (JP).
- (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).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (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, 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).
- 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: NOVEL PYRIMIDINE NUCLEOSIDE COMPOUND OR ITS SALT

(54) 発明の名称: 新規ピリミジンヌクレオシド化合物又はその塩



(57) Abstract: A novel pyrimidine nucleoside compound, or its salt, of the general formula: (1) wherein one of X and Y is a cyano while the other is a hydrogen atom; and one of R¹ and R² is a hydrogen atom, a carbonyl having an alkyl monosubstituted with amino, or a group of the formula (R³)(R⁴)(R⁵)Si- while the other is a silyl of the formula (R⁶)(R⁷)(R⁸)Si-, or alternatively R¹ and R² together represent a group of the formula -Si(R⁹)(R¹⁰)- and may form a six-membered cyclic group, provided that each of R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ and R⁸ is an alkyl, a cycloalkyl, an aryl or an alkyl substituted with one or two aryls, and that R⁹ and R¹⁰ are alkyls. The provided novel pyrimidine nucleoside compounds exhibit antitumor efficacy higher than those of conventional pyrimidine nucleoside compounds.

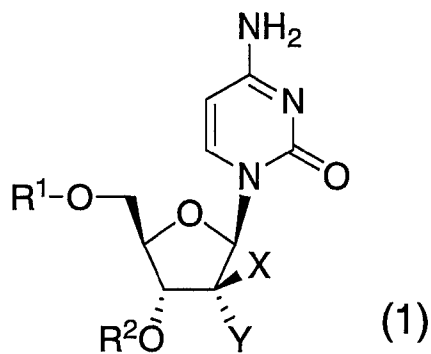
[続葉有]

WO 2006/080509 A1



(57) 要約:

一般式(1)



[式中、X及びYは一方がシアノ基、他方が水素原子であることを示し、 R^1 及び R^2 は、一方が水素原子、アミノ基でモノ置換されたアルキル基を有するカルボニル基、又は $(R^3)(R^4)(R^5)Si-$ で表される基、他方が $(R^6)(R^7)(R^8)Si-$ で表されるシリル基であることを示すか、又は一緒になって式 $-Si(R^9)(R^{10})-$ 基を示し6員の環状基を形成してもよく、 R^3, R^4, R^5, R^6, R^7 又は R^8 はアルキル基、環状アルキル基、アリール基、又はアリール基が1又は2個置換したアルキル基を示し、 R^9 及び R^{10} はアルキル基を示す。]

で表される新規ピリミジンヌクレオシド化合物又はその塩。

既存のピリミジンヌクレオシド化合物より優れた抗腫瘍効果を示す、新規なピリミジンヌクレオシド化合物を提供する。