(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2005 年8 月25 日 (25.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/077905 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 217/24, A61K 31/4725, 31/519, 31/55, A61P 1/16, 3/04, 3/06, 3/10, 3/12, 5/00, 9/00, 9/04, 9/10, 9/12, 13/12, 19/06, 25/02, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/32, 25/36, 43/00, C07D 239/70, 239/91, 401/04, 401/12, 403/04, 403/12, 471/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002664

(22) 国際出願日: 2005 年2 月14 日 (14.02.2005)

(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2004-037190 2004 年2 月13 日 (13.02.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 長瀬 剛 (NAGASE, Tsuyoshi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 佐藤 長明 (SATO, Nagaaki) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 金谷 章生 (KANATANI, Akio) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 鴇田 滋 (TOKITA, Shigeru) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外 (HASEGAWA, Yoshiki et al.); 〒1040061 東京都中央区銀座一丁目10番6号 銀座ファーストビル 創英国際特許法律事務所 Tokyo (JP).

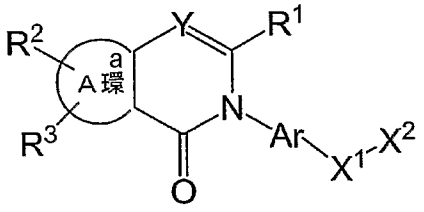
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, 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,

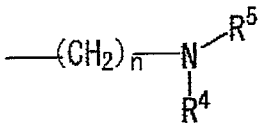
[続葉有]

(54) Title: FUSED-RING 4-OXOPYRIMIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 縮環４－オキソ－ピリミジン誘導体



(I)



(II)

a...RING A

(57) Abstract: A compound represented by the formula (I): (I) [wherein Ar represents a divalent group formed by removing two hydrogen atoms from benzene, etc.; X^1 represents nitrogen, sulfur, or oxygen; R^1 represents 5- or 6-membered heteroaryl, etc.; ring A represents 5- or 6-membered heteroaryl ring, etc.; R^2 and R^3 each represents amino, alkylamino, etc.; and $-X^2$ represents, e.g., a group represented by the formula (II): (II) (wherein R^4 and R^5 each represents lower alkyl, etc.; and n is an integer of 2 to 4)] or a pharmaceutically acceptable salt of the compound. The compound or salt has antagonistic activity against a histamine H3 receptor or inverse agonistic activity against a histamine H3 receptor and is useful in the prevention or treatment of metabolic diseases, circulatory diseases, or neurotic diseases.

[続葉有]

WO 2005/077905 A1

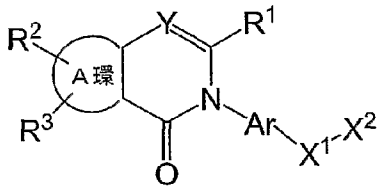
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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。

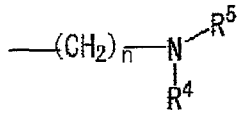
(57) 要約:

本発明は、ヒスタミンＨ３受容体拮抗作用又はヒスタミンＨ３受容体逆作動作用を有し、代謝系疾患、循環器系疾患又は神経系疾患の予防又は治療に有用である、式（Ｉ）：



(I)

［式中、Ａｒはベンゼン等から２個の水素原子を除いてなる２価の基を表し、Ｘ^{1}は窒素原子、硫黄原子又は酸素原子を表し、Ｒ^{1}は５乃至６員のヘテロアリール基等を表し、Ａ環は５乃至６員のヘテロアリール環等を表し、Ｒ^{2}及びＲ^{3}はアミノ基、アルキルアミノ基等を表し、－Ｘ^{2}は、式（ＩＩ）：



(II)

（式中、Ｒ^{4}及びＲ^{5}は低級アルキル基等を表し、ｎは２乃至４の整数を表す）で表される基等を表す］で表される化合物、又はその薬学的に許容される塩を提供する。