

(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
2015 年 11 月 26 日(26.11.2015)



(10) 国際公開番号
WO 2015/178404 A1

(51) 国際特許分類:

<i>C07C 403/24</i> (2006.01)	<i>A61P 25/18</i> (2006.01)
<i>A61K 31/22</i> (2006.01)	<i>A61P 25/24</i> (2006.01)
<i>A61K 31/27</i> (2006.01)	<i>A61P 25/28</i> (2006.01)
<i>A61K 31/4178</i> (2006.01)	<i>A61P 27/00</i> (2006.01)
<i>A61P 3/04</i> (2006.01)	<i>A61P 27/02</i> (2006.01)
<i>A61P 3/06</i> (2006.01)	<i>A61P 27/06</i> (2006.01)
<i>A61P 9/04</i> (2006.01)	<i>A61P 29/00</i> (2006.01)
<i>A61P 9/12</i> (2006.01)	<i>A61P 35/00</i> (2006.01)
<i>A61P 21/00</i> (2006.01)	<i>C07D 233/61</i> (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2015/064408

(22) 国際出願日: 2015 年 5 月 20 日(20.05.2015)

(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 2014-104480	2014 年 5 月 20 日(20.05.2014)	JP
特願 2014-247549	2014 年 12 月 8 日(08.12.2014)	JP

(71) 出願人: 富士化学工業株式会社(FUJI CHEMICAL INDUSTRIES CO., LTD.) [JP/JP]; 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 Toyama (JP).

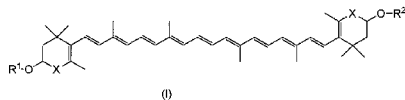
(72) 発明者: 藤田 岳(FUJITA, Takashi); 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 富士化学工業株式会社内 Toyama (JP). 小林 学史(KOBAYASHI, Satoshi); 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 富士化学工業株式会社内 Toyama (JP). 篠原 龍馬(SHINOHARA, Ryoma); 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 富士化学工業株式会社内 Toyama (JP). 西田 康弘(NISHIDA, Yasuhiro); 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 富士化学工業株式会社内 Toyama (JP). 高橋 二郎(TAKAHASHI, Jiro); 〒9300397 富山県中新川郡上市町横法音寺 5 5 番地 富士化学工業株式会社内 Toyama (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 8 号 沢の鶴人形町ビル Tokyo (JP).

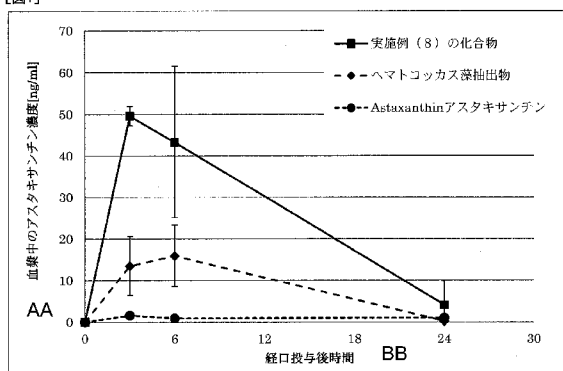
[続葉有]

(54) Title: CAROTENOID DERIVATIVE, PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT THEREOF, AND PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE ESTER OR AMIDE THEREOF

(54) 発明の名称: カロテノイド誘導体、その薬学上許容される塩又はその薬学上許容されるエステル類若しくはアミド類



[図1]



AA Astaxanthin concentration in plasma [ng/ml]
BB Time since oral administration
—■— Example (8) compound
--◆-- Haematococcus pluvialis extract
...●... Astaxanthin

(57) Abstract: The present invention addresses the problem of discovering a carotenoid compound exhibiting excellent water solubility. Provided is a carotenoid derivative represented by general formula (I) [in general formula (I): X represents a carbonyl group or a methylene group; R¹ and R² represent (a), namely -CO-A-B-D (in (a), A represents an alkylene group, an alkenylene group, or the like, B represents the formula -S(O)_n-, or the formula -NR⁴CONR⁵-, and D represents hydrogen, a carboxyl group, or the like), or (b), namely -CO-E-F (in (b), E represents an alkylene group, or the formula -NR³- {wherein R³ represents (a1) hydrogen, (b1) an alkyl group, or the like}, and F represents a sulfo group); and the remainder comprises hydrogen, (a), (b), or (c), namely -CO-G (in (c), G represents hydrogen, an alkyl group, or the like)]. Also provided are: a pharmaceutically acceptable salt of the carotenoid derivative; and a pharmaceutically acceptable ester or amide of the carotenoid derivative.

(57) 要約:

[続葉有]



(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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, LR, LS, MW,

MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

本発明は、水溶性に優れたカロテノイド化合物を見出すことを課題とする。一般式 (I) [式中、X はカルボニル基あるいはメチレン基を示し、 R^1 及び R^2 は (a) 又は (b) であり、残余は (a)、(b)、(c) 又は水素原子であり、(a) : $-\text{CO}-\text{A}-\text{B}-\text{D}$ {式中、A はアルキレン基、アルケニレン基等であり、B は式 $-\text{S}(\text{O})_n-$ 、式 $-\text{NR}^4\text{CONR}^5-$ であり、D は水素原子、カルボキシ基等を示す。}、(b) : $-\text{CO}-\text{E}-\text{F}$ {式中、E はアルキレン基、式 $-\text{NR}^3-$ (式中、 R^3 は (a 1) 水素原子、(b 1) アルキル基等を示す。)、F はスルホ基を示す。}、(c) : $-\text{CO}-\text{G}$ {式中、G は水素原子、アルキル基等、を示す。} である。] を有するカロテノイド誘導体、その薬学上許容される塩又はその薬学上許容されるエステル類若しくはアミド類である。