

(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
2013 年 3 月 21 日(21.03.2013)



(10) 国際公開番号
WO 2013/039057 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 401/12 (2006.01) *A61P 1/04* (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2012/073171
- (22) 国際出願日: 2012 年 9 月 11 日(11.09.2012)
- (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 2011-199482 2011 年 9 月 13 日(13.09.2011) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): エーザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株式会社(Eisai R&D Management Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目 6 番 10 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): 吉田 一郎(YOSHIDA Ichiro) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 岡部 忠志(OKABE Tada-shi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内

Ibaraki (JP). 松本 泰信(MATSUMOTO Yasunobu) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 渡辺 信久(WATANABE Nobuhisa) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 大橋 芳章(OHASHI Yoshiaki) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 鬼澤 裕二(ONIZAWA Yuji) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 原田 均(HARADA Hitoshi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP).

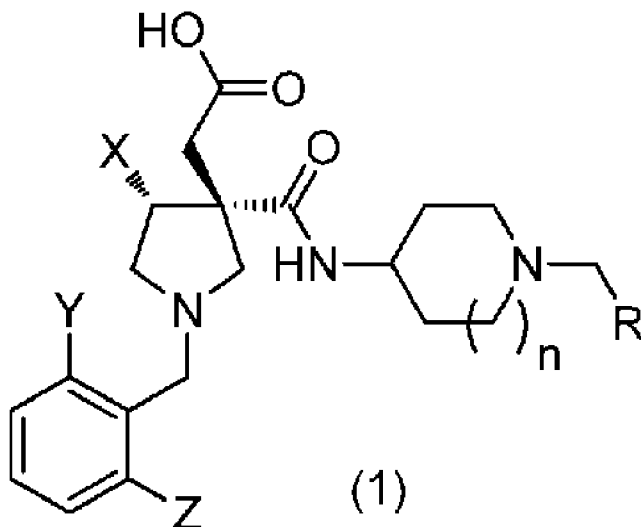
(74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外(HASEGAWA Yoshiki et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二丁目 1 番 1 号丸の内 MY PLAZA (明治安田生命ビル) 9 階 創英国際特許法律事務所 Tokyo (JP).

(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, 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,

[続葉有]

(54) Title: PYRROLIDINE-3-YLACETIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ピロリジン-3-イル酢酸誘導体



(57) Abstract: A compound indicated by formula (1) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, having an inhibitory activity in a fractalkine-CX3CR1 pathway. [R indicates a C₁₋₆ alkyl group having 1-3 unsubstituted groups or 1-3 substituted groups selected from a group (A) of substituted groups, a C₃₋₈ cycloalkyl group having 1-3 unsubstituted groups or 1-3 substituted groups selected from the group (A) of substituted groups, or a C₃₋₈ cycloalkenyl group having 1-3 unsubstituted groups or 1-3 substituted groups selected from the group (A) of substituted groups; X indicates a C₁₋₆ alkyl group; Y and Z are the same or different and indicate a halogen atom or a C₁₋₆ alkyl group having 1-3 unsubstituted groups or 1-3 substituted groups selected from a group (B) of substituted groups; n indicates 0 or 1, the group (A) of substituted groups comprises halogen atoms; and the group (B) of substituted groups comprises halogen atoms.]

(57) 要約: 式(1)で表される化合物またはその薬理学的に許容される塩は、フラクタルカイン-CX3CR1経路における阻害作用を有する。

[Rは、無置換のもしくは置換基群Aから選択される置換基を1~3個有するC₁₋₆アルキル基、無置換のもしくは置換基群Aから選択される置換基を1~3個有するC₃₋₈シクロアルキル基、または無置換のもしくは置換基群Aから選択される置換基を1~3個有するC₃₋₈シクロアルケニル基を意味し、XはC₁₋₆アルキル基を意味し、YおよびZは、同一または相異なって、ハロゲン原子または無置換のもしくは置換基群Bから選択される置換基を1~3個有するC₁₋₆アルキル基を意味し、nは0または1を意味し、置換基群Aはハロゲン原子からなり、置換基群Bはハロゲン原子からなる。]

WO 2013/039057 A1



FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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, 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, 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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第 21 条(3))