

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2007年3月22日 (22.03.2007)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2007/032362 A1

## (51) 国際特許分類:

C07C 311/14 (2006.01) C07D 207/50 (2006.01)  
 A61K 31/215 (2006.01) C07D 303/36 (2006.01)  
 A61K 31/336 (2006.01) C07D 307/94 (2006.01)  
 A61K 31/343 (2006.01) C07D 311/96 (2006.01)  
 A61K 31/357 (2006.01) C07D 317/72 (2006.01)  
 A61K 31/385 (2006.01) C07D 319/08 (2006.01)  
 A61K 31/39 (2006.01) C07D 327/04 (2006.01)  
 A61K 31/40 (2006.01) C07D 339/06 (2006.01)  
 A61K 31/4025 (2006.01) C07D 339/08 (2006.01)  
 A61K 31/443 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)  
 A61K 31/5375 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)  
 A61P 43/00 (2006.01) C07D 493/10 (2006.01)

長崎 孝美 (NAGASAKI, Takayoshi), 杉立 収寛 (SUGIDACHI, Atsuhiko) [JP/JP]; (JP). 安東 治 (ANDO, Osamu) [JP/JP]; (JP).

(74) 代理人: 矢口 敏昭, 外(YAGUCHI, Toshiaki et al.); 〒1408710 東京都品川区広町 1 丁目 2 番 5 8 号 三共株式会社内 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, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/318103

(22) 国際出願日: 2006年9月13日 (13.09.2006)

(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2005-267504 2005年9月14日 (14.09.2005) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町 3 丁目 5 番 1 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): 木村 富美夫 (KIMURA, Tomio), 大川 信幸 (OHKAWA, Nobuyuki).

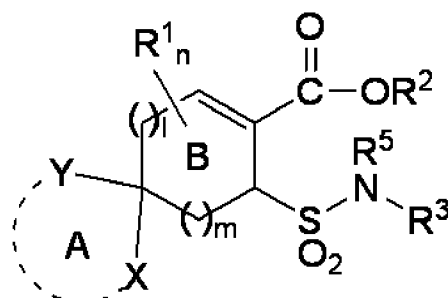
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, 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: SUBSTITUTED CYCLOALKENE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 置換シクロアルケン誘導体



(I)

formula (I): {In the formula, X and Y represent a group which forms the ring A with the carbon atom of the ring B to which X and Y are bound or the like. l and m independently represent an integer of 0 to 3 and l+m is 1 to 3. R<sup>1</sup> represents an aliphatic hydrocarbon group which may be substituted or the like. n represents an integer of 0 to 3. R<sup>2</sup> represents a hydrogen atom, an alkyl group which may be substituted or the like, R<sup>3</sup> represents a phenyl group which may be substituted or the like, and R<sup>5</sup> represents a hydrogen atom, an alkyl group which may be substituted or the like.}

(57) Abstract: It is intended to provide a substituted cycloalkene derivative represented by the general formula (I) which has an action of suppressing intracellular signal transduction or cell activation caused by endotoxin and a cell response such as hyperproduction of an inflammatory mediator caused by them, a pharmacologically acceptable salt thereof, a method for producing the same, and a pharmaceutical containing the cycloalkene derivative as an active ingredient, which is excellent in prevention and/or treatment of a disease such as sepsis (septic shock, disseminated intravascular coagulation, multiple organ failure or the like). General

/ 続葉有 /

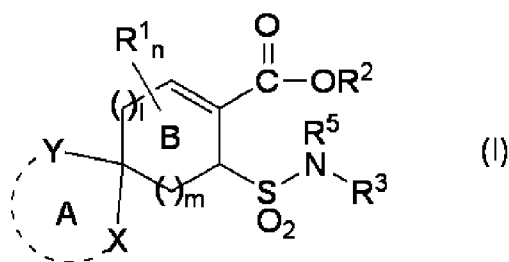
WO 2007/032362 A1



## (57) 要約:

エンドトキシンにより引き起こされる細胞内シグナル伝達あるいは細胞活性化及びそれらに起因する炎症性メディエーターの過剰産生等の細胞応答を抑制する作用を有する、一般式 (I) で表される置換シクロアルケン誘導体、その薬理上許容される塩、それらの製法、及び、敗血症（敗血症性ショック、播種性血管内凝固症候群、多臓器不全など）等の疾患の予防及び／又は治療に優れる、上記置換シクロアルケン誘導体を有効成分として含有する医薬を提供する。

一般式 (I) :



{式中、

X及びYは、それらが結合する環Bの炭素原子と一緒になって環Aを形成する基等を示す。

l及びmは、各々独立に、0乃至3の整数を示し、1+mは1乃至3である。

R<sup>1</sup>は、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基等である。nは、0乃至3の整数を示す。

R<sup>2</sup>は、水素原子、置換されていてもよいアルキル基等、R<sup>3</sup>は、置換されていてもよいフェニル基等、R<sup>5</sup>は、水素原子、置換されていてもよいアルキル基等である。}