

(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 12 月 5 日(05.12.2013)



(10) 国際公開番号

WO 2013/180271 A1

(51) 国際特許分類:

C07C 229/50 (2006.01) A61P 25/24 (2006.01)
A61K 31/265 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/357 (2006.01) A61P 25/30 (2006.01)
A61K 38/00 (2006.01) A61P 31/22 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 21/02 (2006.01) C07C 237/04 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01) C07C 237/20 (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01) C07C 271/24 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01) C07C 321/16 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01) C07D 317/40 (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/065202

(22) 国際出願日: 2013 年 5 月 31 日(31.05.2013)

(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 2012-126162 2012 年 6 月 1 日(01.06.2012) JP
特願 2013-052574 2013 年 3 月 15 日(15.03.2013) JP

(71) 出願人: 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 端早田 隆 (HASHIHAYATA, Takashi); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 大嶽 憲一 (OTAKE, Norikazu); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 宮腰 直樹 (MIYAKOSHI, Naoki); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 坂上 一成 (SAKAGAMI, Kazunari); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

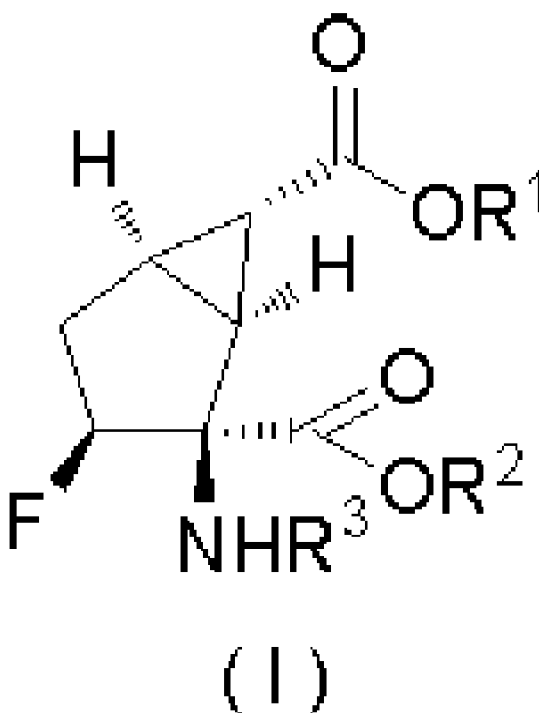
(74) 代理人: 小野 新次郎, 外 (ONO, SHINJIRO et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 新大手町ビル 206 区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).

(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, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, 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.

[続葉有]

(54) Title: PRODRUG OF FLUORINE-CONTAINING AMINO ACID

(54) 発明の名称: 含フッ素アミノ酸のプロドラッグ



(57) Abstract: Provided are a fluorine-containing amino acid prodrug represented by general formula (I) that makes a fluorine-containing amino acid which is a group 2 metabotropic glutamate receptor agonist into a prodrug, or a pharmacologically acceptable salt thereof. More specifically, provided is a prodrug that increases the in vivo exposure and heightens the oral absorbability and other such mucosal absorbability of a novel compound that acts on group 2 metabotropic glutamate receptors as an agent for the treatment or prevention of conditions in which group 2 metabotropic glutamate receptors are said to participate, such as: schizophrenia, anxiety disorder and related conditions, depression, bipolar disorder, epilepsy, developmental disorders, sleep disorders, and other such neuropsychiatric conditions; and drug dependence, cognitive disorders, Alzheimer's disease, Huntington's chorea, Parkinson's disease, movement disorders associated with muscular rigidity, cerebral ischemia, cerebral insufficiency, spinal cord disorders, cephalopathy, and other such neurological conditions.

(57) 要約: グループ2代謝型グルタミン酸受容体作動薬である含フッ素アミノ酸をプロドラッグ化した一般式 (I) で表される含フッ素アミノ酸プロドラッグ、又はその医薬上許容される塩を提供する。より詳細には、統合失調症、不安障害及びその関連疾患、うつ病、双極性障害、てんかん、発達障害、睡眠障害等の精神神経疾患、並びに、薬物依存症、認知障害、アルツハイマー病、ハンチントン舞蹈病、パーキンソン病、筋硬直に伴う運動障害、脳虚血、脳不全、脊髄障害、頭部障害等の神経学的疾患など、グループ2代謝型グルタミン酸受容体が関与しているとされる疾患の治療剤又は予防剤として、グループ2代謝型グルタミン酸受容体に作用する親化合物の経口吸収性等の粘膜吸収性を高め、生体内暴露量を増大させるプロドラッグを提供する。

化合物の経口吸収性等の粘膜吸収性を高め、生体内暴露量を増大させるプロドラッグを提供する。



(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, 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))