

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002 年 1 月 24 日 (24.01.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/06268 A1

(51) 国際特許分類: C07D 333/20, 333/22, 333/32, C07C 271/16, A61K 31/381, A61P 37/06, C12P 13/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/05988

(22) 国際出願日: 2001 年 7 月 10 日 (10.07.2001)

(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2000-212246 2000 年 7 月 13 日 (13.07.2000) JP
特願2000-241744 2000 年 8 月 9 日 (09.08.2000) JP
特願2000-283218 2000 年 9 月 19 日 (19.09.2000) 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]; 〒103-8426 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): 西 剛秀 (NISHI,

Takahide) [JP/JP]. 竹元利泰 (TAKEMOTO, Toshiyasu) [JP/JP]. 下里隆一 (SHIMOZATO, Takaichi) [JP/JP]. 奈良太 (NARA, Futoshi) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 大野彰夫, 外(OHNO, Akio et al.); 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AU, BR, CA, CN, CO, CZ, HU, ID, IL, IN, KR, MX, NO, NZ, PL, RU, SG, SK, US, ZA.

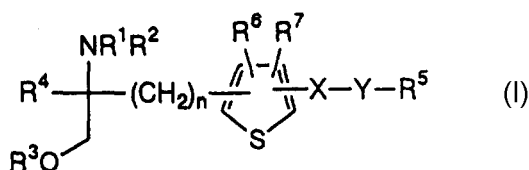
(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).

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: AMINO ALCOHOL DERIVATIVES

(54) 発明の名称: アミノアルコール誘導体



(57) Abstract: Compounds of the general formula (I), or pharmaceutically acceptable salts, esters, or other derivatives thereof, exhibiting excellent immunosuppressive activities wherein R¹ and R² are each hydrogen or an amino-protecting group; R³ is hydrogen or a hydroxyl-protecting group; R⁴ is lower alkyl; n is an integer of 1 to 6; X is ethylene; Y is C₁₋₁₀ alkylene which may be mono- to tri-substituted with one to more members selected from groups a and b of substituents; R⁵ is aryl; and R⁶ and R⁷ are each hydrogen or a member selected from group a of substituents, with the proviso that when R⁵ is hydrogen, Y is a group exclusive of single bond and linear C₁₋₁₀ alkylene.

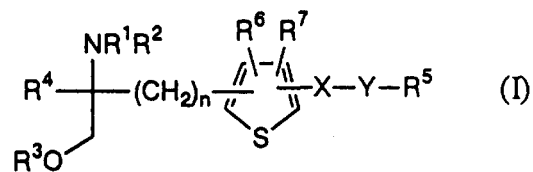
[続葉有]

WO 02/06268 A1



(57) 要約:

本発明は、優れた免疫抑制作用を有する、下記一般式（I）を有する化合物、その薬理上許容される塩、そのエステル又はその他の誘導体に関する。



[式中、 R^1 及び R^2 は、水素原子、アミノ基の保護基； R^3 は、水素原子、ヒドロキシ基の保護基； R^4 は、低級アルキル基； n は、1乃至6の整数； X は、エチレン基； Y は、 C_1 － C_{10} アルキレン基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された C_1 － C_{10} アルキレン基； R^5 は、アリール基； R^6 及び R^7 は、水素原子、置換基群aから選択される基；但し、 R^5 が水素原子であるとき、 Y は単結合及び直鎖の C_1 － C_{10} アルキレン基以外の基を示す。]