

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003年6月5日 (05.06.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/045923 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 237/20, 239/48, 239/50, 251/18, 251/52, A61K 31/50, 31/505, 31/53, A61P 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/12265

(22) 国際出願日: 2002年11月25日 (25.11.2002)

(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 2001-361847
2001年11月28日 (28.11.2001) JP
特願 2002-192777 2002年7月2日 (02.07.2002) 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): 目黒 正規 (ME-GURO, Masaki) [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). 尾田 富一郎 (ODA, Tomiichiro) [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). 中神 康裕 (NAKAGAMI, Yasuhiro) [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). 丸本 真志 (MARUMOTO, Shinji) [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). 小山 和

男 (KOYAMA, Kazuo) [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). 金子 勲 (KANEKO, Isao) [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): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

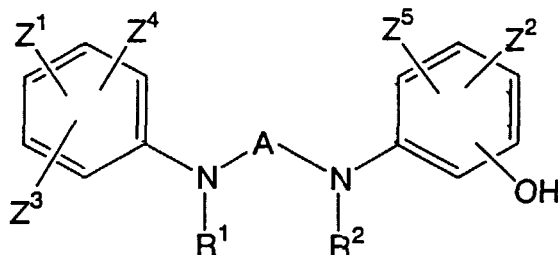
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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: PREVENTIVES OR REMEDIES FOR ALZHEIMER'S DISEASE OR AMYLOID PROTEIN FIBROSIS INHIBITORS CONTAINING NITROGEN-CONTAINING HETEROARYL COMPOUNDS

(54) 発明の名称: 含窒素芳香複素環化合物を含有するアルツハイマー病の予防薬若しくは治療薬又はアミロイド蛋白線維化抑制剤



(I)

and Z² represent each H, alkyl, alkoxy, haloalkyl or halogeno; Z³ represents alkoxy, SH, alkylthio, NH₂, mono- or dialkylamino, OH or halogeno; Z⁴ and Z⁵ represent each H or halogeno; and A represents 4,6-pyrimidine-1,3-diyl, 1,3,5-triazine-2,6-diyl, etc.(57) Abstract: Preventives or remedies for Alzheimer's disease or amyloid protein fibrosis inhibitors containing, as the active ingredient, compounds having the following general formula (I) or pharmacologically acceptable salts thereof; and nitrogen-containing heteroaryl derivatives having specific substituents, which are useful as preventives or remedies for Alzheimer's disease or amyloid protein fibrosis inhibitors, or pharmacologically acceptable salts thereof: (I) wherein R¹ and R² represent each H or alkyl; Z¹

[続葉有]

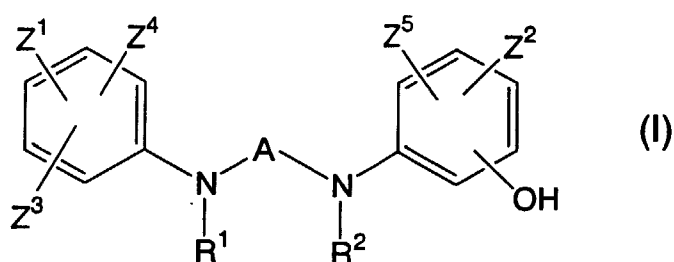


WO 03/045923 A1



(57) 要約:

本発明は、下記一般式（I）を有する化合物又はその薬理学上許容される塩を有効成分として含有する、アルツハイマー病の予防薬若しくは治療薬又はアミロイド蛋白線維化抑制剤ならびにアルツハイマー病の予防薬若しくは治療薬又はアミロイド蛋白線維化抑制剤として有用な特定された置換基を有する含窒素芳香複素環誘導体またはその薬理学上許容される塩に関する：



（式中、 R^1 , R^2 ：H、アルキル； Z^1 , Z^2 ：H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン化アルキル、ハロゲン； Z^3 ：アルコキシ、SH、アルキルチオ、 NH_2 、モノーもしくはジアルキルアミノ、OH、ハロゲン； Z^4 , Z^5 ：H、ハロゲン；A：4, 6-ピリミジン-1, 3-ジイル、1, 3, 5-トリアジン-2, 6-ジイル等）。