

(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
2014 年 11 月 13 日(13.11.2014)



(10) 国際公開番号
WO 2014/181788 A1

(51) 国際特許分類:

C07C 237/22 (2006.01) A61P 25/24 (2006.01)
A61K 31/166 (2006.01) C07C 237/36 (2006.01)
A61K 31/343 (2006.01) C07D 213/56 (2006.01)
A61K 31/36 (2006.01) C07D 213/81 (2006.01)
A61K 31/381 (2006.01) C07D 213/82 (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01) C07D 213/84 (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01) C07D 215/54 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01) C07D 217/26 (2006.01)
A61K 31/421 (2006.01) C07D 221/04 (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01) C07D 231/14 (2006.01)
A61K 31/425 (2006.01) C07D 233/90 (2006.01)
A61K 31/426 (2006.01) C07D 237/08 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01) C07D 237/24 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) C07D 239/26 (2006.01)
A61K 31/4402 (2006.01) C07D 239/28 (2006.01)
A61K 31/4406 (2006.01) C07D 241/12 (2006.01)
A61K 31/4409 (2006.01) C07D 241/24 (2006.01)
A61K 31/443 (2006.01) C07D 261/18 (2006.01)
A61K 31/4436 (2006.01) C07D 263/34 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) C07D 271/08 (2006.01)
A61K 31/455 (2006.01) C07D 275/02 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01) C07D 277/20 (2006.01)
A61K 31/472 (2006.01) C07D 277/30 (2006.01)
A61K 31/4965 (2006.01) C07D 277/56 (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01) C07D 307/78 (2006.01)

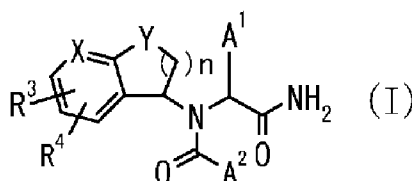
A61K 31/50 (2006.01) C07D 307/82 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01) C07D 317/62 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) C07D 333/38 (2006.01)
A61P 13/02 (2006.01) C07D 333/70 (2006.01)
A61P 13/08 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
A61P 13/10 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)

- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/062218
(22) 国際出願日: 2014 年 5 月 7 日(07.05.2014)
(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 2013-098835 2013 年 5 月 8 日(08.05.2013) JP
(71) 出願人: キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI
PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒3998710
長野県松本市芳野 1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).
(72) 発明者: 平澤 秀明 (HIRASAWA, Hideaki); 〒
3998304 長野県安曇野市穂高柏原 4 3 6 5 - 1
キッセイ薬品工業株式会社中央研究所内 Nagano

[続葉有]

(54) Title: A-SUBSTITUTED GLYCINEAMIDE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: α -置換グリシンアミド誘導体



(57) Abstract: The present invention provides: a novel α -substituted glycineamide derivative or a pharmacologically acceptable salt thereof; a pharmaceutical composition containing the α -substituted glycineamide derivative or a pharmacologically acceptable salt thereof; and a use of the α -substituted glycineamide derivative or a pharmacologically acceptable salt thereof for medical purposes. The present invention provides a compound which has an inhibitory activity on TRPM8 and is represented by general formula (I) [wherein A¹ represents a C₆₋₁₀ aryl group or the like; A² represents a C₆₋₁₀ aryl group or the like; X represents CH or the like; Y represents -CR¹R²- or the like; R¹ and R² independently represent a hydrogen atom or the like; R³ and R⁴ independently represent a halogen atom or the like; and n represents 1 or 2] or a pharmacologically acceptable salt thereof. The compound (I) according to the present invention can be used as a therapeutic or prophylactic agent for diseases or conditions associated with afferent nerve hyper-excitability or injury.

(57) 要約: 本発明は、新規な α -置換グリシンアミド誘導体、またはその薬理学的に許容される塩、それを含む医薬組成物およびその医薬用途を提供することである。本発明は、TRPM8 阻害作用を有する一般式 (I) [式中、A¹はC₆₋₁₀アリール等であり、A²はC₆₋₁₀アリール等であり、Xは、CH等であり、Yは、-CR¹R²-等であり、R¹およびR²は、独立して、水素原子等であり、R³およびR⁴は、独立して、ハロゲン原子等であり、nは、1または2である]で表される化合物、またはその薬理学的に許容される塩を提供するものである。さらに、本発明の化合物 (I) は、求心性神経の過剰興奮または障害に起因する疾患または症状の治療または予防薬として利用できる。



(JP). 川村 直裕 (KAWAMURA, Naohiro); 〒
9420145 新潟県上越市頸城区上吉 1 9 7 - 5
キッセイ薬品工業株式会社上越化学研究所内
Niigata (JP). 小林 淳一 (KOBAYASHI, Junichi); 〒
3998304 長野県安曇野市穂高柏原 4 3 6 5 - 1
キッセイ薬品工業株式会社中央研究所内
Nagano (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, IR, 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, SA, 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, 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))