

(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
2012年5月3日(03.05.2012)



(10) 国際公開番号
WO 2012/057068 A1

- (51) 国際特許分類:
C07C 401/00 (2006.01) A61P 19/10 (2006.01)
A61K 31/593 (2006.01) C07F 7/18 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/074414
- (22) 国際出願日: 2011年10月24日(24.10.2011)
- (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 2010-238524 2010年10月25日(25.10.2010) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 帝人ファーマ株式会社(TELJIN PHARMA LIMITED) [JP/JP]; 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目2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): 齋藤 博 (SAITO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 小宮山 真人 (KOMIYAMA, Masato) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).

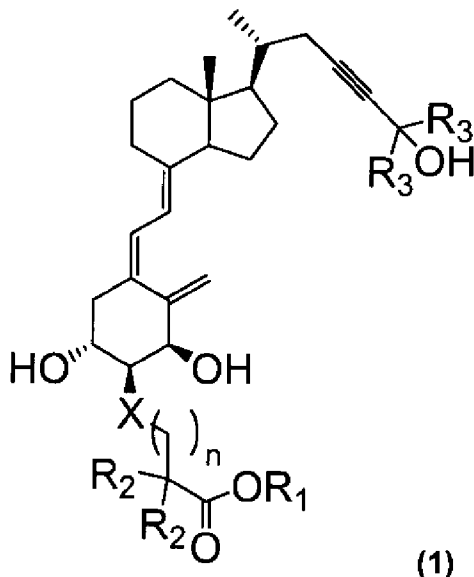
マ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 落合 鋭士(OCHIAI, Eiji) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 高木 健一郎(TAKAGI, Kenichiro) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 千田 貴之(CHIDA, Takayuki) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 藤田 真理子(FUJITA, Mariko) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 今泉 啓一郎(IMAIZUMI, Keiichiro) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP). 金子 俊幸(KANEKO, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒1910065 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).

- (74) 代理人: 青木 篤, 外(AOKI, Atsushi et al.); 〒1058423 東京都港区虎ノ門三丁目5番1号 虎ノ門3 7森ビル青和特許法律事務所 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: 23-YNE-VITAMIN D₃ DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 23-イーン-ビタミンD₃誘導体



(1)

(57) Abstract: Provided is a novel vitamin D₃ derivative which is useful as a therapeutic agent for osteoporosis. Specifically provided is a vitamin D₃ derivative represented by formula (1) or a pharmaceutically acceptable solvate thereof. In the formula, R₁ represents a hydrogen atom, an alkyl group having 1-6 carbon atoms, an alkyl-carbonyloxyalkyl group (wherein each alkyl has 1-6 carbon atoms) or an arylcarbonyloxyalkyl group (wherein the aryl has 6-10 carbon atoms and the alkyl has 1-6 carbon atoms); R₂ represents a hydrogen atom or an alkyl group having 1-6 carbon atoms, or alternatively R₂ may form, together with the other R₂ and carbon atoms bonded to the R₂ moieties, a cyclic alkyl group having 3-6 carbon atoms; R₃ represents an alkyl group having 1-6 carbon atoms, or alternatively R₃ may form, together with the other R₃ and carbon atoms bonded to the R₃ moieties, a cyclic alkyl group having 3-6 carbon atoms; X represents an oxygen atom or a methylene group; and n represents an integer of 1 or 2.

(57) 要約: 骨粗鬆症治療剤として有用な新規ビタミンD₃誘導体を提供する。下記式(1)で表されるビタミンD₃誘導体またはその医薬上許容される溶媒和物。ここで、R₁は水素原子、炭素数1~6のアルキル基、アルキルカルボニルオキシアルキル基(それぞれのアルキルの炭素数は1~6である)、ま

たはアリールカルボニルオキシアルキル基(アリールの炭素数は6~10であり、アルキルの炭素数は1~6である)を表す。R₂は水素原子もしくは炭素数1~6のアルキル基を表すか、または他方のR₂およびそれらが結合する炭素原子とともに炭素数3~6の環状アルキル基を形成してもよい。R₃は、炭素数1~6のアルキル基を表すか、または他方のR₃およびそれらが結合する炭素原子とともに炭素数3~6の環状アルキル基を形成してもよい。Xは酸素原子またはメチレン基を表し、nは1または2の整数を表す。



WO 2012/057068 A1