

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2008年11月13日 (13.11.2008)

PCT

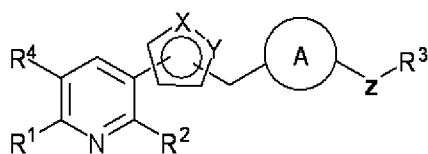
(10) 国際公開番号
WO 2008/136324 A1

- (51) 国際特許分類:
C07F 9/6558 (2006.01) A61P 31/10 (2006.01)
A61K 31/664 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2008/057851
- (22) 国際出願日: 2008年4月23日 (23.04.2008)
- (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2007-118356 2007年4月27日 (27.04.2007) JP
60/914,615 2007年4月27日 (27.04.2007) US
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株式会社 (Eisai R & D Management Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目6番10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): 田中 圭梧 (TANAKA, Keigo) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台5丁目1番地3 エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 山本 栄一 (YAMAMOTO, Eiichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台5丁目1番地3 エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 渡邊 直彰 (WATANABE, Naoaki) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台5丁目1番地3 エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP).
- (74) 代理人: 稲葉 良幸, 外 (INABA, Yoshiyuki et al.); 〒1066123 東京都港区六本木6-10-1 六本木ヒルズ森タワー23階 TMI 総合法律事務所 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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE,

[続葉有]

(54) Title: PYRIDINE DERIVATIVE SUBSTITUTED WITH HETEROCYCLE AND PHOSPHONOAMINO AND ANTIFUNGAL AGENT CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: ヘテロ環およびホスホノアミノ基が置換したピリジン誘導体ならびにそれらを含有する抗真菌剤



(I)

(57) Abstract: An antifungal agent that has an excellent antifungal activity and excels in not only properties, especially solubility in water but also safety. There are disclosed compounds of the formula (I) and salts thereof. [in the formula, R¹ is a hydrogen atom, halogen atom, amino, R¹¹-NH- (R¹¹ is a C₁-C₆ alkyl, hydroxylated C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ alkoxyalkyl or C₁-C₆ alkoxyalkylated C₁-C₆ alkyl), R¹²-(CO)-NH- (R¹² is a C₁-C₆ alkyl or C₁-C₆ alkoxyalkylated C₁-C₆ alkyl), C₁-C₆ alkyl, hydroxylated

C₁-C₆ alkyl, cyano C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ alkoxyalkylated C₁-C₆ alkyl or phosphonoamino; R² is a hydrogen atom, C₁-C₆ alkyl, amino, di-(C₁-C₆ alkylamino) or phosphonoamino; either X or Y is a nitrogen atom while the other is a nitrogen atom or oxygen atom; the ring A is a 5- or 6-membered heteroaryl ring or benzene ring optionally having one or two C₁-C₆ alkyls or halogen atoms; Z is a single bond, methylene, ethylene, oxygen atom, sulfur atom, -CH₂O-, -OCH₂-, -NH-, -CH₂NH-, -NHCH₂-, -CH₂S- or -SCH₂-; R³ is a hydrogen atom, halogen atom, or optionally monosubstituted or disubstituted C₁-C₆ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₆-C₁₀ aryl, 5- or 6-membered heteroaryl or 5- or 6-membered nonaromatic heterocycle; and R⁴ is a hydrogen atom or halogen atom, provided that either R¹ or R² is phosphonoamino].

(57) 要約: 本発明は、優れた抗真菌作用を有し、物性、特に、水への溶解性、および安全性の面でも優れた抗真菌剤を提供する。本発明によれば、下式 (I) で表される化合物またはその塩; [式中、R¹が、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、R¹¹-NH- (R¹¹が、C₁-C₆アルキル基、ヒドロキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、またはC₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル基を意味する。)、R¹²-(CO)-NH- (R¹²が、C₁-C₆アルキル基またはC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基)、C₁-C₆アルキル基、ヒドロキシC₁-C₆アルキル基、シアノC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、またはC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、またはホスホノアミノ基を意味し; R²が、水素原子、C₁-C₆アルキル基、アミノ基、ジC₁-C₆アルキルアミノ基、またはホスホノアミノ基を意味し; XおよびYの一方が、窒素原子を、他方が、窒素原子または酸素原子を意味し; 環Aが、ハロゲン原子もしくはC₁-C₆アルキル基を1個もしくは2個有していてもよい、5もしくは6員のヘテロアリアル環またはベンゼン環を意味し; Zが、単結合、メチレン基、エチレン基、酸素原子、硫黄原子、-CH₂O-、-OCH₂-, -NH-, -CH₂NH-, -NHCH₂-, -CH₂S-, または-SCH₂-を意味し; R³が、水素原子、ハロゲン原子、または、置換基を1個もしくは2個有していてもよい、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₆-C₁₀アリール基、5もしくは6員ヘテロアリアル基、または5もしくは6員の非芳香族系ヘテロ環式基を意味し; R⁴が、水素原子またはハロゲン原子を意味する。ただし、R¹およびR²のいずれか一方はホスホノアミノ基を意味する。]を開示する。