

(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  
2011 年 1 月 13 日(13.01.2011)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2011/004604 A1

(51) 国際特許分類:

C07F 9/09 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)  
A61K 31/662 (2006.01) C07F 9/38 (2006.01)  
A61P 31/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/004453

(22) 国際出願日: 2010 年 7 月 8 日(08.07.2010)

(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 2009-162289 2009 年 7 月 9 日(09.07.2009) JP  
特願 2010-112138 2010 年 5 月 14 日(14.05.2010) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 杏林製薬株式会社 (KYORIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018311 東京都千代田区神田駿河台 2 丁目 5 番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 河野靖志 (KOHNO, Yasushi) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 2 3 9 9-1 杏林製薬株式会社 創薬研究所内 Tochigi (JP). 藤井清 (FUJII, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 2 3 9 9-1 杏林製薬株式会社 創薬研究所内 Tochigi (JP). 多留桃子 (TARU, Momoko) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 2 3 9 9-1 杏林製薬株式会社 創薬研究所内 Tochigi (JP). 三好啓太 (MIYOSHI, Keita) [JP/JP]; 〒3290114 栃木県下都賀郡野木町野木 2 3 9 9

— 1 杏林製薬株式会社 創薬研究所内 Tochigi (JP).

(74) 代理人: 水野勝文, 外 (MIZUNO, Katsufumi et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内 2 丁目 2 番 3 号 丸の内仲通りビル 7 2 1 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, 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, IS, JP, KE, KG, KM, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, 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.

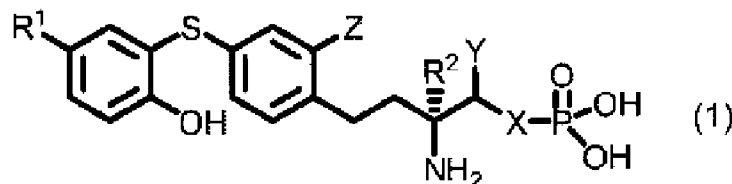
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (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 (条約第 21 条(3))

(54) Title: DIPHENYL SULFIDE DERIVATIVES AND MEDICINES CONTAINING SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: ジフェニルスルフィド誘導体及びそれらを有効成分とする医薬



(57) Abstract: Provided are diphenyl sulfide derivatives which have excellent S1P3 antagonistic activity and are useful as drugs. Intensive studies have been made for the purpose of creating a compound having S1P3 antagonistic activity. As a result of the intensive studies, it has been found that diphenyl sulfide derivatives represented by general formula (1) have excellent S1P3 antagonistic activity. In general formula (1), R<sup>1</sup> is a hydrogen atom or the like; R<sup>2</sup> is an optionally substituted alkyl group having 1 to 6 carbon atoms, or the like; X is a methylene group which may be substituted with one or two fluorine atoms, or the like; Y is a hydrogen atom or the like; and Z is a halogen atom.

(57) 要約: 【課題】 優れた S1P3 アンタゴニスト活性を有する医薬として有用なジフェニルスルフィド誘導体を提供する。【解決手段】 S1P3 アンタゴニスト活性を有する化合物を創製すべく鋭意研究を重ねた結果、一般式 (1) [式 (1) 中、R<sup>1</sup> は水素原子などを、R<sup>2</sup> は置換基を有していてもよい炭素数 1 ~ 6 のアルキル基などを、X は 1 又は 2 のフッ素原子で置換されていてもよいメチレン基などを、Y は水素原子などを、及び Z はハロゲン原子を示す] で表されるジフェニルスルフィド誘導体が優れた S1P3 アンタゴニスト活性を有することを見出した。



WO 2011/004604 A1