

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2006 年 10 月 12 日 (12.10.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/106778 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 207/337 (2006.01) A61K 31/426 (2006.01)
 A61K 31/277 (2006.01) A61K 31/428 (2006.01)
 A61K 31/341 (2006.01) A61K 31/44 (2006.01)
 A61K 31/345 (2006.01) A61K 31/4409 (2006.01)
 A61K 31/381 (2006.01) A61K 31/4525 (2006.01)
 A61K 31/40 (2006.01) A61K 31/4535 (2006.01)
 A61K 31/404 (2006.01) A61K 31/47 (2006.01)
 A61K 31/4164 (2006.01) A61K 31/5377 (2006.01)
 A61K 31/4184 (2006.01) A61K 31/661 (2006.01)
 A61K 31/42 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)

[続葉有]

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/306560

(22) 国際出願日: 2006 年 3 月 29 日 (29.03.2006)

(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2005-097661 2005 年 3 月 30 日 (30.03.2005) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社ヤクルト本社 (KABUSHIKI KAISHA YAKULT HONSHA) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 Tokyo (JP). 西山 由紀子 (NISHIYAMA, YUKIKO) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP).

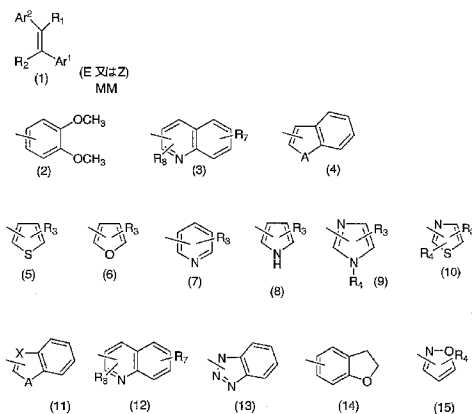
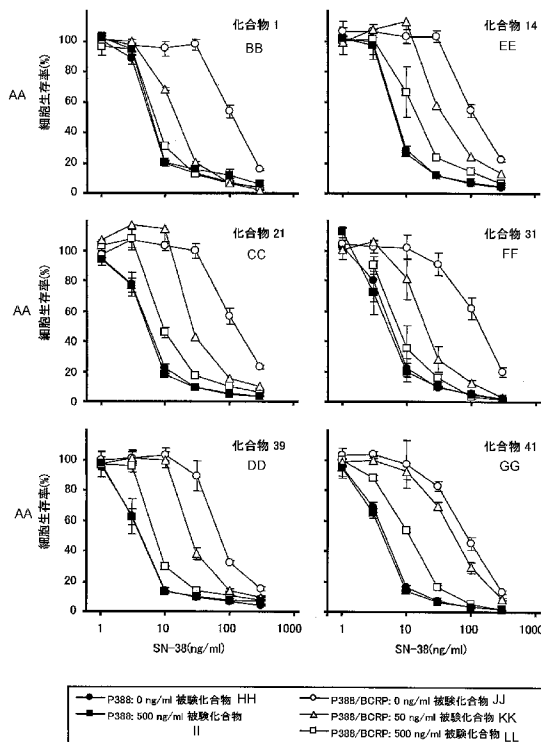
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山崎 竜太 (YAMAZAKI, Ryuta) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 古田 富雄 (FURUTA, Tomio) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 松崎 健 (MATSUZAKI, Takeshi) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 旗野 博 (HATANNO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒1058660 東京都

[続葉有]

(54) Title: BCRP/ABCG2 INHIBITOR

(54) 発明の名称: BCRP / ABCG2 阻害剤



AA... RATE OF SURVIVING CELLS (%)
 BB... COMPOUND 1
 CC... COMPOUND 21
 DD... COMPOUND 39
 EE... COMPOUND 14
 FF... COMPOUND 31
 GG... COMPOUND 41
 HH... TEST COMPOUND 0 ng/ml
 II... TEST COMPOUND 500 ng/ml
 JJ... TEST COMPOUND 0 ng/ml
 KK... TEST COMPOUND 50 ng/ml
 LL... TEST COMPOUND 500 ng/ml
 MM...(E OR Z)

(57) Abstract: Disclosed is a breast cancer resistant protein (BCRP/ABCG2) inhibitor. A BCRP inhibitor comprising an acrylonitrile derivative represented by the general formula (1) or a salt thereof as the active ingredient: (1) (E or Z) wherein one of R₁ and R₂ represents a cyano group and the other represents a hydrogen atom; Ar¹ represents a group selected from the groups represented by the formulae (2) to (4) below; and Ar² represents an aromatic hydrocarbon group which has a fused ring optionally substituted by a halogen atom or a group selected from the groups represented by the formulae (5) to (15) below.

[続葉有]



港区東新橋1丁目1番19号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 吉田 央 (YOSHIDA, Oh) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋1丁目1番19号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 長岡 正人 (NAGAOKA, Masato) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋1丁目1番19号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 相山 律男 (AIYAMA, Ritsuo) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋1丁目1番19号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 橋本 秀介 (HASHIMOTO, Shusuke) [JP/JP];

〒1058660 東京都港区東新橋1丁目1番19号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 杉本 芳一 (SUGIMOTO, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒2770061 千葉県柏市東新宿1-14-2 Chiba (JP).

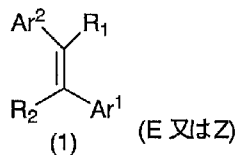
(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).

[続葉有]

(57) 要約:

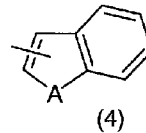
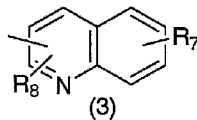
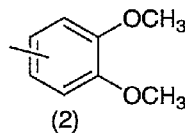
本発明は乳がん耐性蛋白(BCRP/ABCG2)阻害剤に関する。

一般式(1)

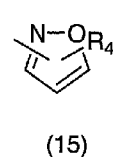
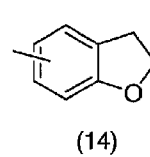
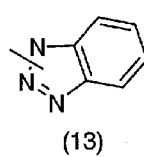
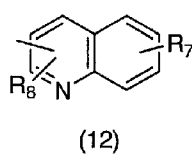
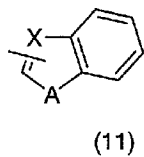
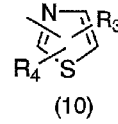
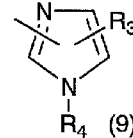
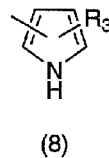
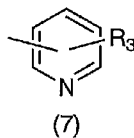
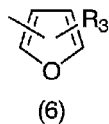
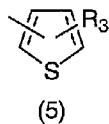


[式中、 R_1 及び R_2 はいずれか一方がシアノ基、他方が水素原子を示し;

Ar^1 は下記式(2)～(4)から選択される基を示し;



Ar^2 はハロゲン原子が置換していてもよい縮合環を有する芳香族炭化水素基又は下記式(5)～(15)から選択される基を示す。]



で表されるアクリロニトリル誘導体又はその塩を有効成分とするBCRP阻害剤。



(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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, 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, 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 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(51) 国際特許分類 [統葉有]:

<i>A61P 43/00</i> (2006.01)	<i>C07D 307/58</i> (2006.01)
<i>C07D 209/24</i> (2006.01)	<i>C07D 307/72</i> (2006.01)
<i>C07D 213/57</i> (2006.01)	<i>C07D 333/28</i> (2006.01)
<i>C07D 213/64</i> (2006.01)	<i>C07D 333/36</i> (2006.01)
<i>C07D 215/12</i> (2006.01)	<i>C07D 333/42</i> (2006.01)
<i>C07D 261/08</i> (2006.01)	<i>C07D 401/04</i> (2006.01)
<i>C07D 233/64</i> (2006.01)	<i>C07D 405/04</i> (2006.01)
<i>C07D 235/16</i> (2006.01)	<i>C07D 409/04</i> (2006.01)
<i>C07D 277/20</i> (2006.01)	<i>C07D 413/04</i> (2006.01)
<i>C07D 277/30</i> (2006.01)	<i>C07D 417/04</i> (2006.01)
<i>C07D 277/64</i> (2006.01)	<i>C07C 255/37</i> (2006.01)
<i>C07D 307/54</i> (2006.01)	<i>C07F 9/09</i> (2006.01)

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。