(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
2005 年7 月14 日 (14.07.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/063705 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 207/06, 207/12, 207/273, 207/325, 211/14, 211/16, 211/18, 211/38, 211/42, 211/46, 211/56, 211/58, 211/62, 211/70, 211/72, 213/36, 213/64, 213/75, 233/04, 241/18, 257/04, 261/08, 265/30, 265/32, 271/10, 277/28, 295/02, 295/08, 295/12, 295/14, 295/18, 307/52, 309/04, 333/20, 335/02, 405/12, 413/12, 487/08, A61K 31/381, 31/382, 31/40, 31/407, 31/4418, 31/451, 31/4525, 31/495, 31/496, 31/4965, 31/5375, 31/5377, 31/55, A61P 1/00, 1/04, 11/06, 17/00, 17/06, 19/02, 37/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/019795

(22) 国際出願日: 2004 年12 月24 日 (24.12.2004)

(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 2003-434312
2003 年12 月26 日 (26.12.2003) JP
特願 2003-435050
2003 年12 月26 日 (26.12.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川４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): 川原 哲也 (KAWAHARA, Tetsuya) [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). 小竹 真 (KOTAKE, Makoto) [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). 米田 直樹 (YONEDA, Naoki) [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). 廣田 信介 (HIROTA, Shinsuke) [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). 大黒 理勝 (OHKURO, Masayoshi) [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: 長谷川 芳樹, 外 (HASEGAWA, Yoshiki et al.); 〒1040061 東京都中央区銀座一丁目10番6号 銀座ファーストビル 創英国際特許法律事務所 Tokyo (JP).

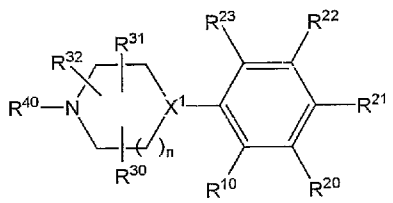
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, 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,

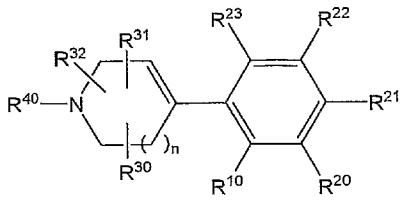
[続葉有]

(54) Title: BENZENE COMPOUNDS DISUBSTITUTED WITH CYCLIC GROUPS AT THE 1- AND 2-POSITIONS

(54) 発明の名称: 1,2-ジ（環式基）置換ベンゼン化合物



(1)



(100)

(57) Abstract: Compounds represented by the general formula (1) or (100) have excellent inhibitory activities against cell adhesion and cell infiltration and are useful as therapeutic or preventive agents for various inflammatory and autoimmune diseases caused by the adhesion and infiltration of white blood cells, for example, inflammatory diseases of intestine (particularly ulcerative colitis or Crohn's disease), irritable bowel syndrome, rheumatic arthritis, psoriasis, multiple sclerosis, asthma, and atopic dermatitis: (1) (100) wherein $R^{10}$ is optionally substituted cycloalkyl or the like; $R^{20}$, $R^{21}$, $R^{22}$ and $R^{23}$ are each hydrogen, alkyl, alkoxy, or the like; $R^{30}$, $R^{31}$ and $R^{32}$ are each hydrogen, alkyl, oxo, or the like; and $R^{40}$ is optionally substituted alkyl or the like.

[続葉有]

WO 2005/063705 A1

IE, IS, IT, LT, LU, 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).

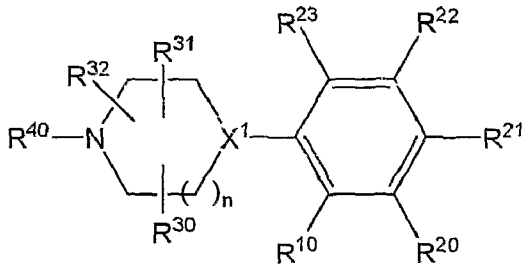
添付公開書類:
— 国際調査報告書

— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

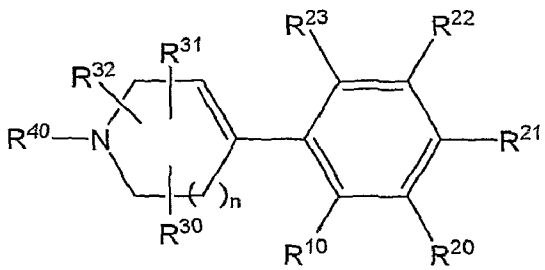
２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

以下の一般式（１）または（１００）で表される化合物は、優れた細胞接着抑制作用および細胞浸潤抑制作用を有し、炎症性腸疾患（特に、潰瘍性大腸炎もしくはクローン病）、過敏性腸症候群、リウマチ関節炎、乾癬、多発性硬化症、喘息、アトピー性皮膚炎などの白血球の接着および浸潤を起因する種々の炎症性疾患および自己免疫疾患の治療または予防剤として有用である。



(1)



(100)

（式中、

Ｒ１０は置換されていてもよいシクロアルキル基等を示し、

Ｒ２０～２３は水素原子、アルキル基、アルコキシ基等を示し、

Ｒ３０～３２は水素原子、アルキル基、オキソ基等を示し、

Ｒ４０は置換されていてもよいアルキル基等を示す。）