

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 11 月 17 日 (17.11.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/108389 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 401/04, A61K 31/454, 31/4725, 31/536, 31/553, A61P 13/02, 13/10, 43/00, C07D 401/14, 405/14, 413/14, 417/14

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/008632

(22) 国際出願日: 2005 年 5 月 11 日 (11.05.2005)

(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2004-142437 2004 年 5 月 12 日 (12.05.2004) 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]; 〒1120002 東京都文京区小石川 4 丁目 6 番 10 号 Tokyo (JP).

(SASAKI, Atsushi) [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). 上野 貢嗣 (UENO, Koshi) [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). 酒井 瑞雪 (SAKAI, Miyuki) [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). 石原 浩樹 (ISHIHARA, Hiroki) [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). 窪田 篤彦 (KUBOTA, Atsuhiko) [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: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号 新大手町ビル 3 3 1 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

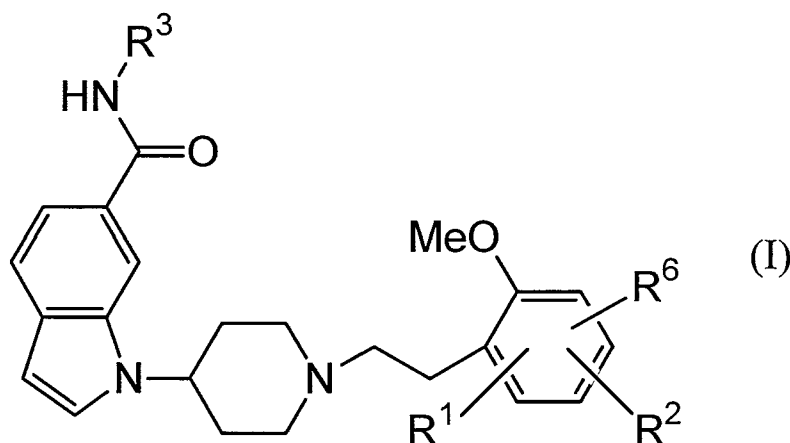
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 鈴木 裕一 (SUZUKI, Yuichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 伊藤 康一 (ITO, Koichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 佐々木 淳

(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, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC,

[続葉有]

(54) Title: INDOLE DERIVATIVES HAVING PIPERIDINE RINGS

(54) 発明の名称: ピペリジン環を有するインドール誘導体



particularly urine accumulation symptom.

(57) Abstract: Compounds represented by the general formula (I) or pharmaceutically acceptable salts thereof; and use of the same as drugs: [wherein R¹ and R² are adjacent substituents and R¹ and R² together with the two carbon atoms to which they are bonded respectively form a 5- to 7-membered nonaromatic hydrocarbon ring which may have one to four substituents selected from among (1) oxo, (2) hydroxyl, and so on; R³ is hydrogen or the like; and R⁶ is hydrogen or the like]. The compounds exhibit the ability to combine with 5-HT_{1A} receptor and 5-HT_{1A} receptor antagonism and are useful as therapeutic or preventive agents for lower urinary tract symptoms,

(57) 要約: 本発明は、式【化1】〔式中、R¹およびR²は、隣接する置換基であって、これら置換基とその各々が結合する2つの炭素原子とが一緒になって、(1)オキソ基または(2)水酸基等から選択される、1ないし4個の置換基で置換されてもよい、5ないし7員環式非芳香族炭化水素環基等を形成し、R³は、水素原子等を示し、R⁶は、水素原子等を示す。〕で表される化合物または薬理的に許容される塩およびその医薬としての用途に関する。該化合物は5-HT_{1A}受容体結合力および受容体拮抗作用を有し、下部尿路症状、特に蓄尿症状の治療剤または予防剤に有用である。

WO 2005/108389 A1



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, 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。