

(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
2012 年 3 月 29 日(29.03.2012)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/039371 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 239/34 (2006.01)	A61P 25/24 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)	A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)	A61P 25/34 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01)	A61P 25/36 (2006.01)
A61K 31/538 (2006.01)	C07D 239/47 (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01)	C07D 239/88 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)	C07D 401/12 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)	C07D 401/14 (2006.01)
A61P 13/08 (2006.01)	C07D 403/12 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)	C07D 405/12 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)	C07D 409/14 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)	C07D 413/12 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)	C07D 417/12 (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01)	C07D 471/04 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)	

(30) 優先権データ:

61/385342 2010 年 9 月 22 日(22.09.2010) US
特願 2010-211629 2010 年 9 月 22 日(22.09.2010) JP

(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): 寺内 太朗
(TERAUCHI Taro) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つく
ば市東光台 5 丁目 1 番 3 エーザイ株式会社
筑波研究所内 Ibaraki (JP). 竹村 鮎美(TAKEMU-
RA Ayumi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東
光台 5 丁目 1 番 3 エーザイ株式会社 筑波
研究所内 Ibaraki (JP). 土幸 隆司(DOKO Takashi)
[JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目 6
番 10 号 エーザイ株式会社内 Tokyo (JP). 吉
田 融(YOSHIDA Yu) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つ
くば市東光台 5 丁目 1 番 3 エーザイ株式会
社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 田中 利知
(TANAKA Toshiaki) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つく
ば市東光台 5 丁目 1 番 3 エーザイ株式会

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/071325

(22) 国際出願日: 2011 年 9 月 20 日(20.09.2011)

(25) 国際出願の言語: 日本語

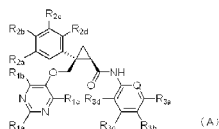
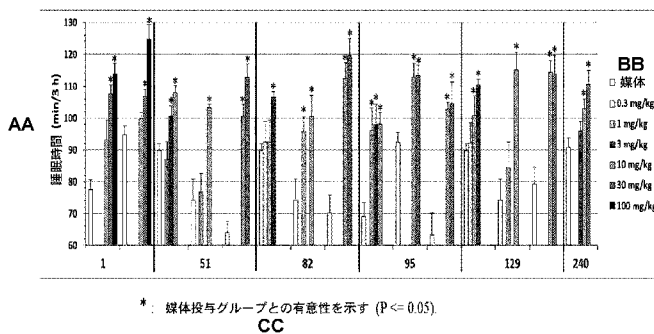
(26) 国際公開の言語: 日本語

[続葉有]

(54) Title: CYCLOPROPANE COMPOUND

(54) 発明の名称: シクロプロパン化合物

[図1]



AA SLEEPING TIME (min/3 h)

BB MEDIUM

CC REPRESENTS SIGNIFICANCE IN COMPARISON TO
MEDIUM-ADMINISTERED GROUP (P <= 0.05)

(57) Abstract: A compound represented by formula (A) [wherein Q represents -CH- or a nitrogen atom; R_{1a} and R_{1b} independently represent a C₁₋₆ alkyl group or the like; R_{1c} represents a hydrogen atom or the like; R_{2a}, R_{2b}, R_{2c} and R_{2d} independently represent a hydrogen atom, a halogen atom or the like; R_{3a}, R_{3b} and R_{3c} independently represent a hydrogen atom, a halogen atom or the like; and R_{3d} represents a hydrogen atom or the like] or a pharmaceutically acceptable salt thereof, which has an antagonistic activity on an orexin receptor, and therefore can be used as a therapeutic agent for sleep disorders, such as insomnia, on which the antagonistic activity on an orexin receptor is effective.

(57) 要約: 式 (A) : [式中、Qは-CH-又は窒素原子であり、R_{1a}及びR_{1b}は、それぞれ独立してC₁₋₆アルキル基などであり、R_{1c}は水素原子などであり、R_{2a}、R_{2b}、R_{2c}及びR_{2d}は、それぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子などであり、R_{3a}、R_{3b}及びR_{3c}は、それぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子などであり、R_{3d}は、水素原子などである。]で示される化合物又はその薬学的に許容される塩は、オレキシン受容体拮抗作用を有し、オレキシン受容体拮抗作用が有効な睡眠障害、例えば不眠症の治療剤として利用可能性を有している。