

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 7 月 24 日 (24.07.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/059880 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 207/335, 307/52, 333/20, A61K 31/341, 31/40, 31/381, A61P 1/04, 1/16, 3/10, 7/00, 7/06, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 17/00, 17/06, 19/02, 21/00, 25/00, 25/14, 25/16, 25/18, 25/28, 29/00, 31/04, 31/12, 35/02, 37/00, 37/06, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/00136

(22) 国際出願日: 2003 年 1 月 9 日 (09.01.2003)

(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2002-004456 2002 年 1 月 11 日 (11.01.2002) JP
特願2002-004484 2002 年 1 月 11 日 (11.01.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 西 剛秀 (NISHI, Takahide) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP). 下里 隆一 (SHIMOZATO, Takaichi) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP). 奈良 太 (NARA, Futoshi) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番

58号三共株式会社内 Tokyo (JP). 宮崎 正二郎 (MIYAZAKI, Shojiro) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 大野 彰夫, 外(OHNO, Akio et al.); 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, 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, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

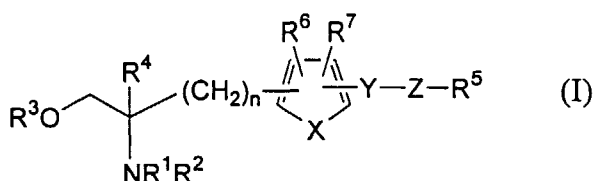
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

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。

(54) Title: AMINO ALCOHOL DERIVATIVE OR PHOSPHONIC ACID DERIVATIVE AND MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THESE

(54) 発明の名称: アミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体及びそれらを含有する医薬組成物



(57) Abstract: An amino alcohol derivative or phosphonic acid derivative each having excellent immunosuppressive activity; a pharmacologically acceptable salt thereof or pharmacologically acceptable ester thereof; and a medicinal composition containing any of these. (I) (In the formula, R¹ and R² each represents hydrogen or an amino-protecting group; R³ represents hydrogen or a hydroxy-protecting group; R⁴ represents lower alkyl; n is an integer of 1 to 6; X represents

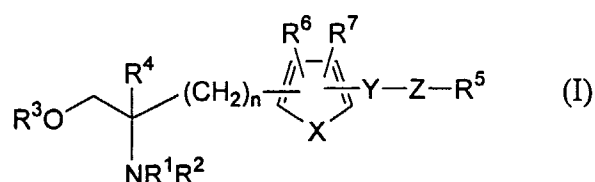
oxygen or nitrogen optionally substituted by lower alkyl, etc.; Y represents ethylene; Z represents C₁₋₁₀ alkylene; R⁵ represents aryl or substituted aryl; and R⁶ and R⁷ each represents hydrogen; provided that when R⁵ is hydrogen, then Z is neither a single bond nor linear C₁₋₁₀ alkylene.)

[続葉有]

WO 03/059880 A1

(57) 要約:

本発明は、優れた免疫抑制作用を有するアミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル並びにそれらを含む医薬組成物に関する；



[式中、 R^1 及び R^2 は、水素原子、アミノ基の保護基； R^3 は、水素原子、ヒドロキシ基の保護基； R^4 は、低級アルキル基； n は1乃至6の整数； X は、酸素原子又は無置換若しくは低級アルキル基等により置換された窒素原子； Y は、エチレン基； Z は、 C_1-C_{10} アルキレン基； R^5 は、アリール基、置換されたアリール基； R^6 及び R^7 は、水素原子；但し、 R^5 が水素原子であるとき、 Z は単結合及び直鎖の C_1-C_{10} アルキレン基以外の基を示す。]