

(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 4 月 5 日(05.04.2012)



(10) 国際公開番号
WO 2012/043791 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 249/12 (2006.01)	A61P 25/16 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)	A61P 25/18 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)	A61P 25/22 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)	A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/46 (2006.01)	A61P 25/36 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)	A61P 29/00 (2006.01)
A61K 31/5386 (2006.01)	A61P 37/00 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)	C07D 401/04 (2006.01)
A61P 7/10 (2006.01)	C07D 401/10 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)	C07D 403/10 (2006.01)
A61P 9/12 (2006.01)	C07D 405/12 (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01)	C07D 413/10 (2006.01)
A61P 17/14 (2006.01)	C07D 451/06 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)	C07D 491/107 (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01)	C07D 498/08 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)	

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/072556

(22) 国際出願日: 2011 年 9 月 30 日(30.09.2011)

(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 2010-224233 2010 年 10 月 1 日(01.10.2010) JP
特願 2011-054500 2011 年 3 月 11 日(11.03.2011) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL

CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

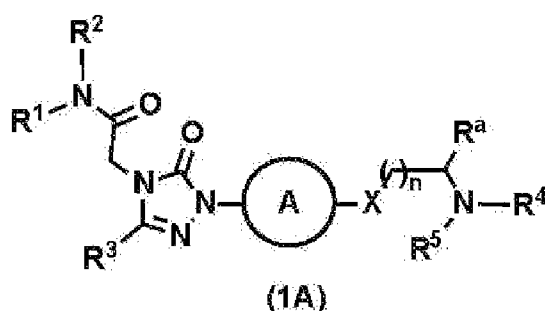
(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): ▲くわ▼田剛志(KUWADA, Takeshi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 吉永 光周(YOSHINAGA, Mitsukane) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 石坂 知子 (ISHIZAKA, Tomoko) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 若杉 大介(WAKASUGI, Daisuke) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 城川 伸一(SHIROKAWA, Shin-ichi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 服部 信隆(HATTORI, Nobutaka) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 島崎 洋一(SHIMAZAKI, Youichi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 宮腰 直樹(MIYAKOSHI, Naoki) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 小野 新次郎, 外(ONO, Shinjiro et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1

[続葉有]

(54) Title: 1,2,4-TRIAZOLONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 1, 2, 4-トリアゾロン誘導体



(57) Abstract: The present invention provides a 1,2,4-triazolone derivative represented by general formula (1A), which acts as an arginine vasopressin 1b receptor antagonist; a pharmacologically acceptable salt thereof; and a drug containing the same as an active ingredient, particularly a therapeutic or prophylactic agent exhibiting favorable in-vivo disposition in the case of mood disorders, anxiety disorders, schizophrenia, Alzheimer's disease, Parkinson's disease, Huntington's disease, eating disorders, hypertension, gastrointestinal disorders, drug dependency, epilepsy, cerebral infarction, cerebral ischemia, cerebral edema, head trauma, inflammation, immunological disorders, hair loss, and other diseases.

(57) 要約: 本発明は、アルギニン-バソプレッシン 1b 受容体拮抗作用を有する、下記一般式 (1A) で表される 1, 2, 4-トリアゾロン誘導体、又はその医薬上許容される塩、及び それらを有効成分として含有する医薬、特に、気分障害、不安障害、統合失調症、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン舞踏病、摂食障害、高血圧、消化器疾患、薬物依存症、てんかん、脳梗塞、脳虚血、脳浮腫、頭部外傷、炎症、免疫関連疾患、脱毛症等の疾患において良好な体内動態を示す治療又は予防剤を提供する。



号 新大手町ビル 206 区 ユアサハラ法律
特許事務所 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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, 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 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, 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 (条約第 21 条(3))