

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2002 年 9 月 26 日 (26.09.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/074770 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 471/10, A61K 31/503, 31/5377,
A61P 43/00, 29/00, 37/08, 11/06, 17/00, 17/04, 13/12,
1/16, 19/02, 17/06, 3/10, 27/14, 37/00, 37/06, 35/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/02554

(22) 国際出願日: 2002 年 3 月 18 日 (18.03.2002)

(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2001-79610 2001 年 3 月 19 日 (19.03.2001) JP
特願2001-160251 2001 年 5 月 29 日 (29.05.2001) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野
薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修
町 2 丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).

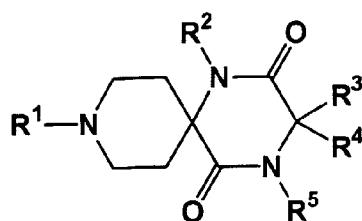
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 巾下 広
(HABASHITA, Hiromu) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株
式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 浜野 進一
(HAMANO, Shin-ichi) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三
島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株
式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 柴山 史朗
(SHIBAYAMA, Shiro) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三
島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株
式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 高岡 義和
(TAKAOKA, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三
島郡 島本町桜井 3 丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式
会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP).(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京
都 中央区 日本橋人形町 2 丁目 2 番 6 号 堀口第 2 ビ
ル 7 階 大家特許事務所 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, 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, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

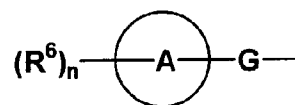
[続葉有]

(54) Title: TRIAZASPIRO[5.5]UNDECANE DERIVATIVES AND DRUGS CONTAINING THE SAME AS THE ACTIVE IN-
GREDIENT

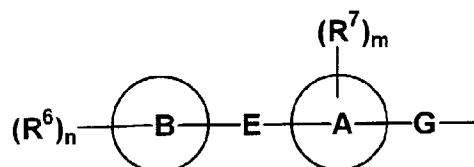
(54) 発明の名称: トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤



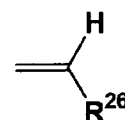
(I)



(II)



(III)



(IV)

(57) Abstract: Triazaspiro[5.5]undecane derivatives represented by the general formula (I), quaternary ammonium salts thereof, N-oxides thereof, nontoxic salts thereof, and drugs containing the same as the active ingredient (wherein R¹ represents a group of the formula (II) or (III); R² represents alkyl, alkynyl, etc.; R³ and R⁴ represent each H, optionally substituted alkyl, etc., or R³ and R⁴ may form together a group of the formula (IV); and R⁵ represents H or alkyl. Because of inhibiting the effects of chemokine/chemokine receptor, the compounds represented by the general formula (I) are useful in preventing and/or treating various inflammatory diseases, asthma, atopic dermatitis, urticaria, allergic diseases, nephritis, nephropathy, hepatitis, arthritis, rheumatoid arthritis, etc.

[続葉有]



WO 02/074770 A1



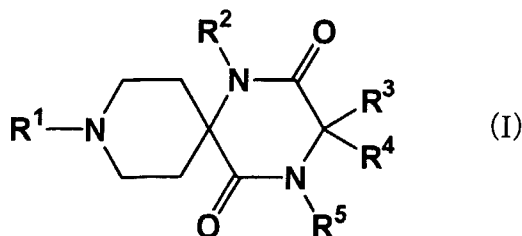
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

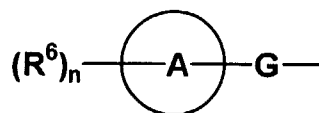
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

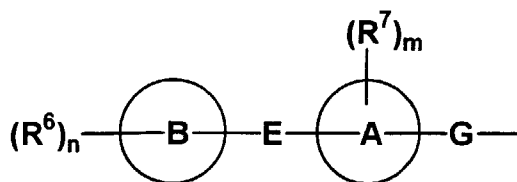
一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシド、それらの非毒性塩、およびそれを有効成分として含有する薬剤 (式中、 R^1 は式 (II), 式 (III); R^2 は、アルキル, アルキニル等; R^3, R^4 は、H, (置換) アルキル等、または R^3 と R^4 とで式 (IV); R^5 は、H, アルキルを表わす。)。



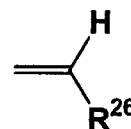
(I)



(II)



(III)



(IV)

一般式 (I) で示される化合物は、ケモカイン/ケモカイン受容体の作用を制御するので、各種炎症性疾患、喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ等の予防および/または治療に有用である。