

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2007 年 1 月 25 日 (25.01.2007)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2007/010383 A1

## (51) 国際特許分類:

*C07D 215/38* (2006.01)    *A61K 31/498* (2006.01)  
*A61K 31/4155* (2006.01)    *A61K 31/5377* (2006.01)  
*A61K 31/416* (2006.01)    *A61K 31/538* (2006.01)  
*A61K 31/427* (2006.01)    *A61P 1/04* (2006.01)  
*A61K 31/428* (2006.01)    *A61P 3/04* (2006.01)  
*A61K 31/433* (2006.01)    *A61P 9/00* (2006.01)  
*A61K 31/435* (2006.01)    *A61P 9/10* (2006.01)  
*A61K 31/437* (2006.01)    *A61P 11/00* (2006.01)  
*A61K 31/4709* (2006.01)    *A61P 11/06* (2006.01)  
*A61K 31/4725* (2006.01)    *A61P 13/12* (2006.01)

[続葉有]

(21) 国際出願番号: PCT/IB2006/002016

(22) 国際出願日: 2006 年 7 月 24 日 (24.07.2006)

(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2005-213534    2005 年 7 月 22 日 (22.07.2005)    JP

特願 2005-330890

2005 年 11 月 15 日 (15.11.2005)    JP

特願2006-045985    2006 年 2 月 22 日 (22.02.2006)    JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 持田製薬株式会社 (MOCHIDA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目 7 番地 Tokyo (JP).

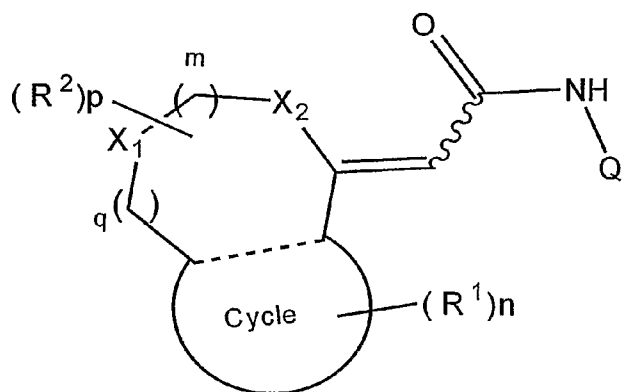
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 内田 秀春 (UCHIDA, Hideharu) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 小菅 直人 (KOSUGA, Naoto) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 佐藤 勉 (SATO, Tsutomu) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 堀田 大道 (HOTTA, Daido) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 神野 智之 (KAMINO, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒1608515 東京都新宿区四谷一丁目

[続葉有]

(54) Title: NOVEL HETEROCYCLIDENE ACETAMIDE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規なヘテロシクリデンアセトアミド誘導体



(I')

(57) Abstract: Disclosed are a compound represented by the formula (I') below, a salt thereof, and a solvate of any of them. Also disclosed are a pharmaceutical composition containing such a compound as an active ingredient, and a TRPV 1 (Transient Receptor Potential Type 1) receptor antagonist. [Chemical formula 1] (I') (In the formula, m, n and p respectively represent 0-2; q represents 0-1; R<sup>1</sup> represents a halogen, a hydrocarbon group, a heterocyclic group, an alkoxy group, an alkoxycarbonyl group, a sulfamoyl group, a CN group, an NO<sub>2</sub> group or the like; R<sup>2</sup> represents a halogen, an amino, a hydrocarbon group, an aromatic heterocyclic group or an oxo group; X<sub>1</sub> represents O, -NR<sup>3</sup>- or -S(O)r-; X<sub>2</sub> represents a methylene group, O, -NR<sup>3</sup>- or -S(O)r-; Q' represents a heteroaryl group, a heteroarylalkyl group, a substituted aryl group or aralkyl group; the cycle moiety represents an aryl ring or a heteroaryl ring; and the wavy line represents an E-form or a Z-form.)

[続葉有]

WO 2007/010383 A1



目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 前田 能崇 (MAEDA, Yoshitaka) [JP/JP]; 〒1608515 東京都 新宿区 四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 天野 賢一 (AMANO, Ken-ichi) [JP/JP]; 〒1608515 東京都 新宿区 四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP). 赤田 安繁 (AKADA, Yasushige) [JP/JP]; 〒1608515 東京都 新宿区 四谷一丁目 7 番地 持田製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 萼 経夫, 外 (HANABUSA, Tsuneo et al.); 〒1010062 東京都 千代田区 神田駿河台 3 丁目 2 番地 新御茶ノ水アーバントリニティ 萼特許事務所内 Tokyo (JP).

[ 続葉有 ]

(57) 要約: 下記式 (I') (式中、m、n、p は 0 ~ 2、q は 0 ~ 1、R<sup>1</sup> はハロゲン、炭化水素基、複素環基、アルコキシ基、アルコキシカルボニル基、スルファモイル基、CN 基、NO<sub>2</sub> 基等、R<sup>2</sup> は、ハロゲン、アミノ、炭化水素基、芳香族複素環基、オキソ基、X<sub>1</sub> は、O、-NR<sup>3</sup>-、-S(O)<sub>r</sub>-、X<sub>2</sub> は、メチレン基、O、-NR<sup>3</sup>-、-S(O)<sub>r</sub>-、Q' はヘテロアリール基、ヘテロアリールアルキル基、置換アリール基、アラルキル基、c y c l e 部は、アリール環、ヘテロアリール環、波線は E 体、Z 体を表す。) で表される化合物、その塩、それらの溶媒和物。及びこれらの化合物を有効成分とする医薬組成物、並びに TRPV 1 (Transient Receptor Potential Type 1) 受容体拮抗剤。



(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, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, 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, 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, LV, 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).

(51) 国際特許分類 [統葉有]:

A61P 17/02 (2006.01)

A61P 17/06 (2006.01)

A61P 19/02 (2006.01)

A61P 21/00 (2006.01)

A61P 25/04 (2006.01)

A61P 25/06 (2006.01)

A61P 25/28 (2006.01)

A61P 27/16 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 31/04 (2006.01)

A61P 37/08 (2006.01)

C07D 215/14 (2006.01)

C07D 313/08 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 407/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 491/044 (2006.01)

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。