

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 1 月 6 日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/000798 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07C 317/14, C07D 239/26, 211/20, 211/76, 213/87, 213/83, 213/48, 213/79, 213/81, 213/75, 213/73, 213/76, 213/77, 213/57, 213/36, 213/80, 213/89, 213/61, 213/74, 213/42, 213/40, 213/56, 213/53, 213/82, 213/32, 213/65, 213/70, 213/71, 213/55, 213/50, 213/38, 233/60, 235/06, 311/18, 277/26, 309/04, 405/06, 401/06, 405/04, 401/12, 405/12, 409/12, 401/04, 413/04, 417/12, 413/12, A61K 31/10, 31/505, 31/4409, 31/541, 31/496, 31/5377, 31/455, 31/4402, 31/44, 31/4406, 31/444, 31/4545, 31/4164, 31/352, 31/426, 31/351, 31/4433, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/506, 31/366, 31/37, 31/382, A61P 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/009132

(22) 国際出願日: 2004 年 6 月 29 日 (29.06.2004)

(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2003-187796 2003 年 6 月 30 日 (30.06.2003) JP
特願2004-099151 2004 年 3 月 30 日 (30.03.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038234 東京都中央区日本橋 3 丁目 1 4 番 1 0 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): 窪田 秀樹 (KUBOTA, Hideki) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 安河内 孝則 (YASUKOUCHI, Takanori) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川

区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 宮内 智 (MIYAUCHI, Satoru) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 本木 佳代子 (MOTOKI, Kayoko) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 齋藤 正規 (SAITO, Masanori) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP). 飯森 均 (IIMORI, Hitoshi) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西 1 丁目 1 6-1 3 第一製薬株式会社東京研究開発センター内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町 1 丁目 3 番 6 号共同ビル Tokyo (JP).

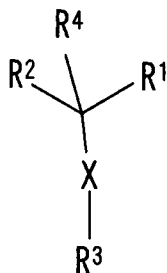
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, 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, IT, LU, 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).

[続葉有]

(54) Title: HETEROCYCLIC METHYL SULFONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 複素環メチルスルホン誘導体



(1)

(57) Abstract: A compound which inhibits the secretion and production of β -amyloid protein. It is a compound represented by the general formula (1): (wherein R^1 represents an optionally substituted heterocyclic group; R^2 represents an optionally substituted cyclic hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group; R^3 represents an optionally substituted cyclic hydrocarbon group or optionally substituted heterocyclic group; R^4 represents hydrogen or C_{1-6} alkyl; and X represents -S-, -SO-, or -SO₂-, an N-oxide thereof, an S-oxide thereof, a salt thereof, or a solvate of any of these. Also provided is a medicine containing any of these.

[続葉有]



添付公開書類：
— 国際調査報告書

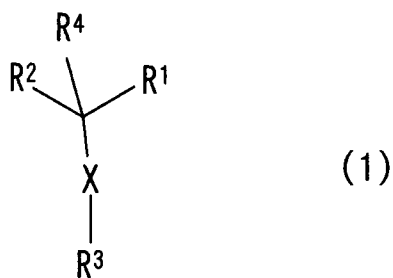
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

β アミロイド蛋白の産生分泌を阻害する化合物の提供。

一般式(1)

【化1】



(式中、 R^1 は置換基を有していてもよい複素環式基を示し、 R^2 は置換基を有していてもよい環状炭化水素基または置換基を有していてもよい複素環式基を示し、 R^3 は置換基を有していてもよい環状炭化水素基または置換基を有していてもよい複素環式基を示し、 R^4 は水素原子または C_{1-6} アルキル基を示し、Xは-S-、-SO-または-SO₂-を示す。)

で表される化合物、そのN-オキシド、そのS-オキシド、その塩またはそれらの溶媒和物、およびこれを含有する医薬。