(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
2002 年2 月7 日 (07.02.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/10167 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 473/00, A61K 31/522, A61P 25/28

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/06363

(22) 国際出願日: 2001 年7 月24 日 (24.07.2001)

(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2000-230209 2000 年7 月31 日 (31.07.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大日本製薬株式会社 (DAINIPPON PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8524 大阪府大阪市中央区道修町2丁目6番8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): 古川 清 (FURUKAWA, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒520-0531 滋賀県滋賀郡志賀町小野水明2丁目12番地4 Shiga (JP). 久留宮聰 (KURUMIYA, Satoshi) [JP/JP]; 〒662-0864 兵庫県西宮市越水町9番4号 Hyogo (JP). 橋本孝志 (HASHIMOTO, Takashi) [JP/JP]; 〒663-8167 兵庫県西宮市甲子園浜田町15番30-201号 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 青山 葆, 外(AOYAMA, Tamotsu et al.); 〒540-0001 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka (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, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

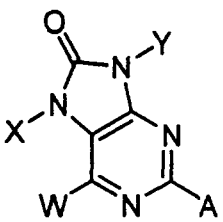
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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。

(54) **Title:** DEMENTIA REMEDIES CONTAINING 2-ARYL-8-OXODIHYDROPURINE DERIVATIVES AS THE ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: 2－アリール－8－オキソジヒドロプリン誘導体を有効成分とする痴呆症治療剤



(I)

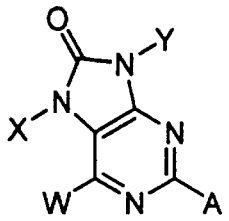
(57) Abstract: Medicines for treatment or prevention of dementia containing as the active ingredient 2-aryl-8-oxodihydropurine derivatives of the general formula (I) or pharmaceutically acceptable acid addition salts thereof: (I) [wherein W is H, C_{1-6} alkyl, halogeno, C_{1-6} alkoxy, or the like; X is H, C_{1-6} alkyl, a group of the general formula (Q): -CH(R^3)CON(R^1)(R^2) (wherein R^1 is C_{1-6} alkyl or the like; R^2 is phenyl-substituted C_{1-4} alkyl or the like; and R^3 is H or the like), or the like; Y is H, C_{1-6} alkyl, a group of the above general formula (Q), or the like; and A is substituted phenyl or the like, with the proviso that one of X and Y is a group of the general formula (Q) and the other is a group selected from among those described above for X or Y except those of the general formula (Q).] The above compounds exhibit an extremely potent ameliorative effect on learning disorder and/or memory disorder and thus are useful in the treatment or prevention of Alzheimer-type dementia, cerebrovascular dementia, senile dementia, and so on.

[続葉有]

WO 02/10167 A1

(57) 要約:

下記式(Ｉ)



(Ｉ)

[式中、WはH、C_{1-6}アルキル、ハロゲン、C_{1-6}アルコキシ等；XはH、C_{1-6}アルキル、式[Q]：－CH(R^3)CON(R^1)(R^2)で表される基等(R^1はC_{1-6}アルキル等；R^2はフェニルで置換されているC_{1-4}アルキル等；R^3はH等)；YはH、C_{1-6}アルキル、上記式[Q]で表される基等；Aは置換フェニル等を意味する。但し、上記式(Ｉ)においてX及びYのいずれか一方は上記式[Q]で表される基であり、他方はそれぞれ式[Q]以外の前掲X及びYと同じ基である]で表される２－アリール－８－オキソジヒドロプリン誘導体又はその製薬学的に許容される酸付加塩を有効成分とする痴呆症の治療剤または予防剤。該化合物は、学習障害および／または記憶障害に対して極めて強い改善作用を示すので、アルツハイマー型痴呆症、脳血管性痴呆症や老人性痴呆症等の痴呆症の治療または予防に使用することができる。