(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
2004 年6 月3 日 (03.06.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/046115 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 215/56, 401/06, 409/06, 417/06, 471/04, A61K 31/47, 31/4709, 31/5377, 31/4375, A61P 31/12, 31/18, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/014773

(22) 国際出願日: 2003 年11 月20 日 (20.11.2003)

(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 2002-336843 2002 年11 月20 日 (20.11.2002) JP
特願2003-065807 2003 年3 月11 日 (11.03.2003) JP
特願2003-139616 2003 年5 月16 日 (16.05.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8422 東京都 港区 虎ノ門二丁目２番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 佐藤 元秀 (SATOH,Motohide) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 川上 浩 (KAWAKAMI,Hiroshi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 伊藤 佳治 (ITOH,Yoshiharu) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 新海 久 (SHINKAI,Hisashi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 本村 隆尚 (MOTOMURA,Takahisa) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 荒巻 久晃 (ARAMAKI,Hisateru) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 松崎 裕児 (MATSUZAKI,Yuji) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 渡辺 渡 (WATANABE,Wataru) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 和巻 修一 (WAMAKI,Shuichi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA,Hajime); 〒541-0044 大阪府 大阪市 中央区伏見町四丁目２番１４号 藤村大和生命ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): 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, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, 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.

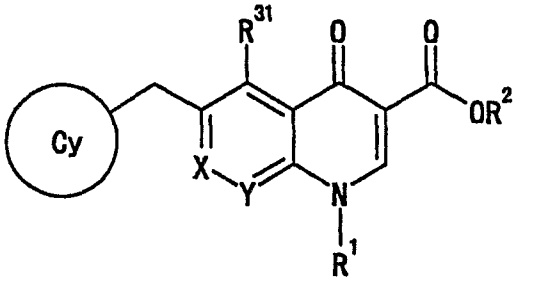
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,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

添付公開書類:
— 国際調査報告書

[続葉有]

(54) Title: 4-OXOQUINOLINE COMPOUNDS AND UTILIZATION THEREOF AS HIV INTEGRASE INHIBITORS

(54) 発明の名称: ４−オキソキノリン化合物及びそのＨＩＶインテグラーゼ阻害剤としての利用



[I]

(57) Abstract: 4-Oxoquinoline compounds represented by the following general formula [I]: [I] wherein each symbol has the meaning as defined in the description; or pharmaceutically acceptable salts thereof and anti-HIV agents containing these compounds. Because of having an activity of inhibiting HIV integrase, the above compounds are useful as anti-HIV agents in remedies or preventives for AIDS. By using together with other anti-HIV agents such as a protease inhibitor and a reverse transcriptase inhibitor, the above compounds can be used as more efficacious anti-HIV agents. Because of having a high inhibitory activity specific to the integrase, furthermore, these compounds are usable as drugs which are safe to the human body with little side effect.

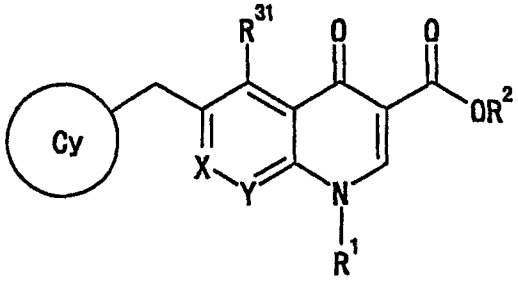
[続葉有]

WO 2004/046115 A1

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:

下記一般式［Ｉ］



[I]

（式中、各記号は明細書に記載の通りである。）で表される４－オキソキノリン化合物又は製薬上許容されるその塩、及びそれら化合物を含有してなる抗ＨＩＶ剤に関する。本発明の化合物は、ＨＩＶインテグラーゼ活性を阻害する作用を有し、抗ＨＩＶ剤としてエイズの治療剤若しくは予防剤として有用である。また、プロテアーゼ阻害剤、逆転写酵素阻害剤等の他の抗ＨＩＶ剤との併用により、更に有効な抗ＨＩＶ剤となり得る。また、インテグラーゼに特異的な高い阻害活性を有することは、人体に対し安全な副作用の少ない薬剤となり得る。