

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 8 月 19 日 (19.08.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/069243 A1

- (51) 国際特許分類⁷: A61K 31/277, 31/7034, A61P 35/00, 43/00, C07C 255/37 // C07H 15/203
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/001067
- (22) 国際出願日: 2004 年 2 月 3 日 (03.02.2004)
- (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 2003-026856 2003 年 2 月 4 日 (04.02.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社ヤクルト本社 (KABUSHIKI KAISHA YAKULT HONSHA) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号 Tokyo (JP).

Oh) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 長岡 正人 (NAGAOKA, Masato) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 相山 律男 (AIYAMA, Ritsuo) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 橋本 秀介 (HASHIMOTO, Shusuke) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 杉本 芳一 (SUGIMOTO, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒2770061 千葉県柏市東中新宿 1 丁目 1 4 番 2 号 Chiba (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).

- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山崎 竜太 (YAMAZAKI, Ryuta) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 西山 由紀子 (NISHIYAMA, Yukiko) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 古田 富雄 (FURUTA, Tomio) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 松崎 健 (MATSUZAKI, Takeshi) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 旗野 博 (HATANO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋 1 丁目 1 番 1 9 号株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 吉田 央 (YOSHIDA,

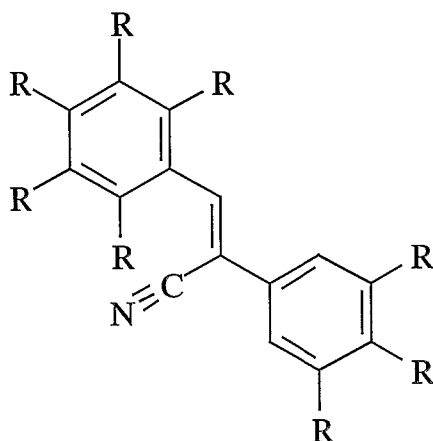
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, 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, 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,

[続葉有]

(54) Title: BREAST CANCER RESISTANCE PROTEIN (BCRP) INHIBITOR

(54) 発明の名称: 乳癌耐性蛋白 (BCRP) 阻害剤



(1)

(57) Abstract: A drug which inhibits BCRPs. It is a breast cancer resistance protein inhibitor which contains as an active ingredient either a diphenylacrylonitrile derivative represented by the following formula (1): (1) {wherein the eight R's are the same or different and each independently represents hydrogen, hydroxy, nitro, amino, acetylamino (-NHCOCH₃), cyano (-CN), formyl (-CHO), -COOR₁ (R₁ is hydrogen or C₁₋₄ alkyl), -O(CH₂)_nCOOR₂ (n is 1 to 7 and R₂ is hydrogen or C₁₋₄ alkyl), -OOCH₂CH₂COOR₃ (R₃ is hydrogen, C₁₋₄ alkyl, (Z)-2-(3,4-dimethoxyphenyl)-3-(4-hydroxyphenyl)acrylonitrile, or glycopyranosyl), C₁₋₈ alkoxy, C₁₋₄ alkyl, halogeno, ((C₁₋₄ alkoxy)C₁₋₄ alkoxy)C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₈ acyloxy, C₂₋₈ halogenoacyloxy, methylenedioxy, trifluoromethyl, phosphate group (-OP(O)(OH)₂) or salt thereof, sulfate group (-OSO₃H) or salt thereof, glycopyranosyl or salt thereof, a glycopyranosyl phosphate or salt thereof, glycopyranosyl sulfate or salt thereof, or piperidinopiperidinocarbonyloxy} or an ester or salt of the derivative.

[続葉有]

WO 2004/069243 A1



CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU,
MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

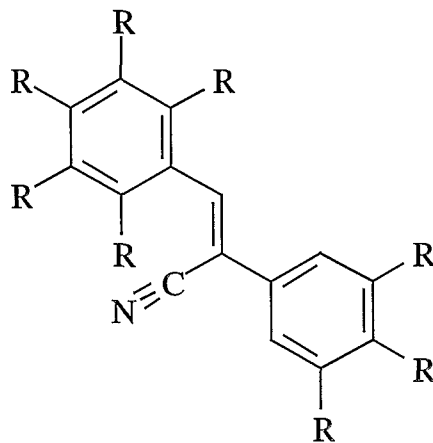
添付公開書類:
— 国際調査報告書

[続葉有]

(57) 要約:

BCRPを阻害する薬剤を提供する。

下記式 (1) :



(1)

〔式中、8個のRは同一又は異なり、それぞれ独立して水素原子、水酸基、ニトロ基、アミノ基、アセチルアミノ基(-NHCOCH₃基)、シアノ基(-CN基)、ホルミル基(-CHO基)、-COOR₁基(R₁=水素原子、C1~C4アルキル基)、-O(CH₂)_nCOOR₂基(n=1~7: R₂=水素原子、C1~C4アルキル基)、-OCH₂CH₂COOR₃基(R₃=水素原子、C1~C4アルキル基、(Z)-2-(3,4-ジメトキシフェニル)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-アクリロニトリル、グリコピラノシル基)、C1~C8アルコキシ基、C1~C4アルキル基、ハロゲン原子、C1~C4アルコキシC1~C4アルコキシC1~C4アルコキシ基、C2~C8アシルオキシ基、C2~C8ハロゲノアシルオキシ基、メチレンジオキシ基、トリフルオロメチル基、リン酸基(-OP(O)(OH)₂)およびその塩、硫酸基(-OSO₃H)およびその塩、グリコピラノシル基およびその塩、グリコピラノシル基のリン酸エステルおよびその塩、グリコピラノシル基の硫酸エステルおよびその塩又はピペリジノピペリジノカルボニルオキシ基を示す。〕で表されるジフェニルアクリロニトリル誘導体、そのエステル又はその塩を有効成分とする乳癌耐性蛋白阻害剤。



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。