

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2006年9月8日 (08.09.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/092902 A1(51) 国際特許分類:
C07C 233/25 (2006.01) C07B 59/00 (2006.01)
A61K 51/00 (2006.01)[CN/JP]; 〒2638555 千葉県千葉市稲毛区穴川四丁目
9番1号 独立行政法人 放射線医学総合研究所内
Chiba (JP). 中里 篤郎 (NAKAZATO, Atsuro) [JP/JP];
〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正
製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/024075

(22) 国際出願日: 2005年12月28日 (28.12.2005)

(74) 代理人: 浅村 皓, 外(ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒
1000004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大
手町ビル331 Tokyo (JP).

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

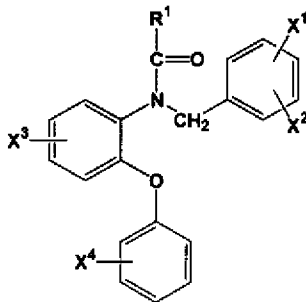
(30) 優先権データ:
特願2005-052527 2005年2月28日 (28.02.2005) JP(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR,
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬
株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.)
[JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番
1号 Tokyo (JP). 独立行政法人 放射線医学総合研
究所 (NATIONAL INSTITUTE OF RADIOLOGICAL
SCIENCES) [JP/JP]; 〒2638555 千葉県千葉市稲毛区
穴川四丁目9番1号 Chiba (JP).(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).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 鈴木 和年
(SUZUKI, Kazutoshi) [JP/JP]; 〒2638555 千葉県千葉
市稲毛区穴川四丁目9番1号 独立行政法人 放射線
医学総合研究所内 Chiba (JP). 須原 哲也 (SUHARA,
Tetsuya) [JP/JP]; 〒2638555 千葉県千葉市稲毛区穴川
四丁目9番1号 独立行政法人 放射線医学総合研
究所内 Chiba (JP). クリスター ハルディン (CHRISTAR,
Halldin) [SE/JP]; 〒2638555 千葉県千葉市稲毛区穴
川四丁目9番1号 独立行政法人 放射線医学総合
研究所内 Chiba (JP). 張 明榮 (ZHANG, Ming-Rong)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: RADIOACTIVE HALOGEN-LABELED PHENYLOXYANILINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 放射性ハロゲン標識フェニルオキシアニリン誘導体

(57) Abstract: A radioactive halogen-labeled phenyloxyaniline derivative rep-
resented by the following formula: wherein R¹ represents a group such as an
alkyl group; X¹, X², X³ and X⁴ represent each a hydrogen atom, an alkyl group,
an alkoxy group, an alkoxy group carrying ¹¹C introduced thereinto or a ra-
dioactive halogen atom, provided that at least one of X¹, X², X³ and X⁴ repre-
sents an alkoxy group carrying ¹¹C introduced thereinto or a radioactive halo-
gen atom; which is a compound useful as a PBR ligand having a high affinity
and a high selectivity. In *in vitro* measurement of PBR, a PBR ligand having a
high affinity and a high selectivity is labeled with a radioactive halogen nuclear
species so as to enable the measurement of PBR *in vivo* with the use of means
including not only PET but also SPECT. Thus, a compound which is useful in
early diagnosing, preventing and treating diseases such as Alzheimer type de-
mentia can be obtained.

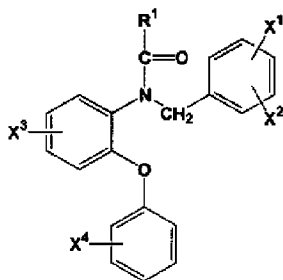
/ 続葉有 /

WO 2006/092902 A1



(57) 要約:

式



(式中、 R^1 はアルキル基等で表される基を示し、 X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 は、水素原子、アルキル基、アルコキシ基、 ^{11}C を導入したアルコキシ基又は放射性ハロゲン原子を示す。ただし、 X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の少なくとも1つは、 ^{11}C を導入したアルコキシ基又は放射性ハロゲン原子等を示す。)で表される放射性ハロゲン標識フェニルオキシアニリン誘導体は、強い親和性と高い選択性を有するPBRのリガンドとしての有用な化合物であり、PBRの体外計測において強い親和性と高い選択性を有するPBRのリガンドを放射性ハロゲン核種で標識し、PETのみならず、SPECTも含めた手段を用い生体でのPBRの測定を可能とする。これによって、アルツハイマー型痴呆などの疾患の早期診断、予防及び治療薬としても有用な化合物が得られる。