(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
2006 年10 月26 日 (26.10.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/112442 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 405/14 (2006.01) *A61P 19/02* (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) *A61P 27/16* (2006.01)
A61P 1/02 (2006.01) *A61P 31/04* (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01) *C07D 493/10* (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/308069

(22) 国際出願日: 2006 年4 月17 日 (17.04.2006)

(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2005-117643 2005 年4 月15 日 (15.04.2005) JP
60/675848 2005 年4 月29 日 (29.04.2005) US

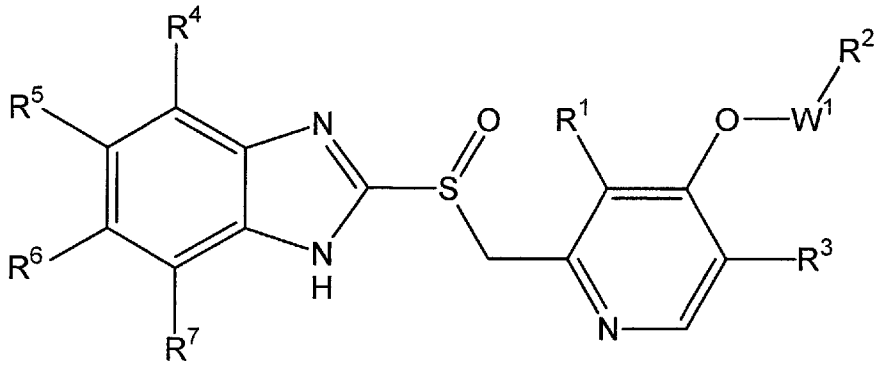
(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株式会社 **(EISAI R&D MANAGEMENT CO., LTD.)** [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川４丁目６番１０号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 宮澤 修平 **(MIYAZAWA, Shuhei)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 篠田 昌信 **(SHINODA, Masanobu)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 川原 哲也 **(KAWAHARA, Tetsuya)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 渡辺 信久 **(WATANABE, Nobuhisa)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 原田 均 **(HARADA, Hitoshi)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 飯田 大介 **(IIDA, Daisuke)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 寺内 広毅 **(TERAUCHI, Hiroki)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 永川 純一 **(NAGAKAWA, Junichi)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 藤崎 秀明 **(FUJISAKI, Hideaki)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 窪田 篤彦 **(KUBOTA, Atsuhiko)** [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 上田 正

[続葉有]

(54) Title: BENZIMIDAZOLE COMPOUND

(54) 発明の名称: ベンズイミダゾール化合物



(1)

(57) Abstract: A novel compound which is useful as a therapeutic or preventive agent for diseases attributable to gastric hydrochloric acid. It has excellent gastric hydrochloric acid secretion inhibitory activity and is richer in the retention of gastric hydrochloric acid secretion inhibitory activity. It can keep the gastric pH high for long. It is safer and has moderate physicochemical stability. It is a compound represented by the general formula (1) (wherein R^1 and R^3 are the same or different and each represents hydrogen or $C_{1\text{-}6}$ alkyl; R^2 represents (5,5-dimethyl-1,3-dioxan-2-yl)methoxy, 5,7-dioxaspiro[2.5]oct-6-ylmethoxy, 1,5,9-trioxaspiro[5.5]undec-3-ylmethoxy, (2,2-dimethyl-1,3-dioxan-5-yl)methoxy, etc.; R^4, R^5, R^6, and R^7 each represents hydrogen, halogeno, $C_{1\text{-}6}$ alkyl, $C_{1\text{-}6}$ haloalkyl, $C_{1\text{-}6}$ alkoxy, $C_{1\text{-}6}$ haloalkoxy, etc.; and W^1 represents a single bond, methylene, or ethylene), a salt thereof, or a solvate of either.

[続葉有]

WO 2006/112442 A1

人 (UEDA, Masato) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP).

(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).

(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.

(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).

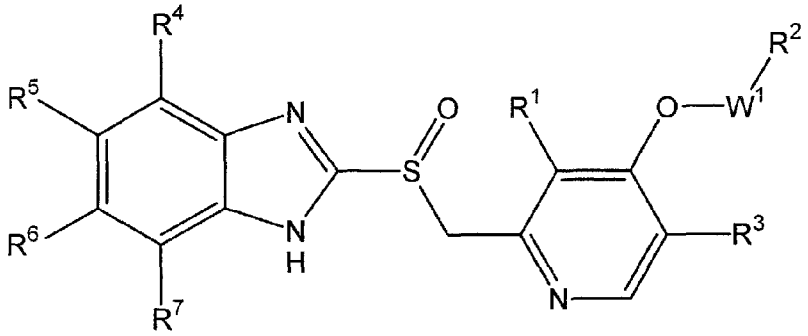
添付公開書類:
— 国際調査報告書

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:

本発明の課題は、胃酸に起因する疾患の治療または予防剤として有用な、優れた胃酸分泌抑制作用を有し、より胃酸分泌抑制作用の持続性に富み、胃内pHを長時間高く持続でき、より安全で、適度な物理化学的安定性を有する新規化合物を提供することにある。

一般式



(1)

(式中、R1およびR3は、同一または異なって、水素原子またはC1－6アルキル基を示し、R2は、(5, 5－ジメチル－1, 3－ジオキサン－2－イル)メトキシ基、5, 7－ジオキサスピロ[2. 5]オクター6－イルメトキシ基、1, 5, 9－トリオキサスピロ[5. 5]ウンデカ－3－イルメトキシ基、(2, 2－ジメチル－1, 3－ジオキサン－5－イル)メトキシ基等を示し、R4、R5、R6およびR7は、水素原子、ハロゲン原子、C1－6アルキル基、C1－6ハロアルキル基、C1－6アルコキシ基またはC1-6ハロアルコキシ基等を示し、W1は、単結合、メチレンまたはエチレン基を示す。)で表される化合物もしくはその塩またはそれらの溶媒和物。