

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2008 年 11 月 27 日 (27.11.2008)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2008/142986 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 231/14 (2006.01) A61P 3/10 (2006.01)
 A61K 31/415 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
 A61K 31/4155 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
 A61K 31/5377 (2006.01) C07D 231/16 (2006.01)
 A61P 3/00 (2006.01) C07D 231/20 (2006.01)
 A61P 3/04 (2006.01) C07D 231/38 (2006.01)
 A61P 3/06 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2008/058461

(22) 国際出願日: 2008 年 5 月 7 日 (07.05.2008)

(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 2007-132259 2007 年 5 月 18 日 (18.05.2007) JP

特願 2007-327114 2007 年 12 月 19 日 (19.12.2007) JP

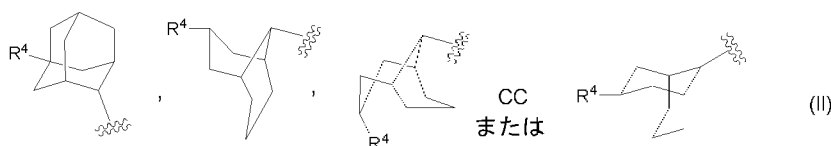
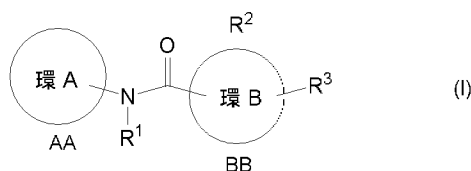
(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (Shionogi & Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 増田 功嗣 (MASUDA, Koji) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 小川 知行 (OGAWA, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 中谷 卓二 (NAKATANI, Takuji) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高山 裕貢, 外 (TAKAYAMA, Hirotugu et al.); 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

[続葉有]

(54) Title: NITROGEN-CONTAINING HETEROCYCLIC DERIVATIVE HAVING 11 β -HYDROXYSTEROID DEHYDROGENASE TYPE I INHIBITORY ACTIVITY(54) 発明の名称: I 型 11 β ヒドロキシステロイド脱水素酵素阻害活性を有する含窒素複素環誘導体

AA... RING A
 BB... RING B
 CC... OR

(57) Abstract: Disclosed is a compound which is useful as an 11 β -hydroxysteroid dehydrogenase type I inhibitor. Specifically disclosed is a compound represented by the following formula (I): (wherein ring A represents (II); ring B represents an optionally substituted heteroaryl (excluding an optionally substituted isoxazole) or an optionally substituted heterocycle; R¹ represents a hydrogen or an optionally substituted alkyl; R² represents -OR⁵, -SR⁵, a halogen, a halogenated alkyl or the like; R³ represents an optionally substituted alkyl or the like; R⁴ represents an optionally substituted alkyl or the like; R⁵ represents an optionally substituted alkyl or the like; R⁶ represents a hydrogen or the like; R⁷ and R⁸ independently represent a hydrogen or the like; R¹⁰ and R¹¹ independently represent a hydrogen or the like; R¹² represents an optionally substituted alkyl or the like; and m and p independently represent an integer of 1-3), a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate of any of them.

(57) 要約: I 型 11 β ヒドロキシステロイド脱水素酵素阻害剤として有用な化合物を提供する。式 (I): (式中、環 A は、(II) であり、環 B は、置換されていてもよいヘテロアリ

[続葉有]



WO 2008/142986 A1



(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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, 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

ール (ただし、置換されていてもよいイソキサゾールは除く。) または置換されていてもよいヘテロサイクルであり、 R^1 は水素または置換されていてもよいアルキルであり、 R^2 は $-OR^5$ 、 $-SR^5$ 、ハロゲンまたはハロゲン化アルキル等であり、 R^3 は置換されていてもよいアルキル等であり、 R^4 は置換されていてもよいアルキル等であり、 R^5 は置換されていてもよいアルキル等であり、 R^6 は水素等であり、 R^7 および R^8 は各々独立して水素等であり、 R^{10} および R^{11} は各々独立して水素等であり、 R^{12} は置換されていてもよいアルキル等であり、 m および p は各々独立して 1 ~ 3 の整数である。) で示される化合物、その製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。