

(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  
2023年5月4日(04.05.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/074847 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 205/12 (2006.01) A61P 25/04 (2006.01)  
A61K 31/397 (2006.01) A61P 25/16 (2006.01)  
A61K 31/4025 (2006.01) A61P 25/20 (2006.01)  
A61K 31/4035 (2006.01) A61P 25/24 (2006.01)  
A61K 31/416 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)  
A61K 31/4178 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)  
A61K 31/4184 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01)  
A61K 31/429 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)  
A61K 31/437 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)  
A61K 31/4375 (2006.01) C07D 403/04 (2006.01)  
A61K 31/4427 (2006.01) C07D 403/12 (2006.01)  
A61K 31/4436 (2006.01) C07D 403/14 (2006.01)  
A61K 31/4725 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)  
A61K 31/4985 (2006.01) C07D 409/14 (2006.01)  
A61K 31/502 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)  
A61K 31/506 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)  
A61K 31/5355 (2006.01) C07D 417/04 (2006.01)  
A61K 31/5377 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)  
A61K 31/541 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)  
A61K 31/55 (2006.01) C07D 498/04 (2006.01)  
A61K 31/551 (2006.01) C07D 513/04 (2006.01)  
A61K 31/553 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)  
A61K 31/554 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/040370

(22) 国際出願日: 2022年10月28日(28.10.2022)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

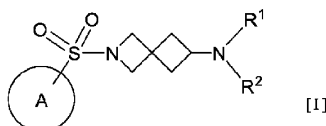
(30) 優先権データ:  
特願 2021-177933 2021年10月29日(29.10.2021) JP

(71) 出願人: 田辺三菱製薬株式会社(MITSUBISHI  
TANABE PHARMA CORPORATION) [JP/JP];  
〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三  
丁目2番10号 Osaka (JP).

(72) 発明者: 林 則 充 (HAYASHI Norimitsu);  
〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目  
2番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka  
(JP). 井久保 仁也(IKUBO Masaya); 〒5418505  
大阪府大阪市中央区道修町三丁目2番10号  
田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP). 中尾 朗  
(NAKAO Akira); 〒5418505 大阪府大阪市中央  
区道修町三丁目2番10号 田辺三菱製薬株式  
会社内 Osaka (JP). 緒方 伸伍(OGATA Shingo);  
〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目2  
番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP).

(54) Title: NOVEL SPIRO COMPOUND

(54) 発明の名称: 新規スピロ化合物



(57) **Abstract:** The present invention provides: a novel spiro compound having a TRH-DE inhibition activity and useful for the prevention/treatment of various diseases associated with TRH and/or symptoms associated with the diseases, or a pharmacologically acceptable salt thereof; a method for producing the compound or a pharmacologically acceptable salt thereof; a use of the compound or a pharmacologically acceptable salt thereof; a pharmaceutical composition which contains the compound or a pharmacologically acceptable salt thereof as an active ingredient; and others. The present invention is a compound represented by general formula [I]: [wherein the ring A represents an optionally substituted aryl group, an optionally substituted heteroaryl group or an optionally substituted aliphatic heterocyclic ring group; and R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> independently represent an optionally substituted alkyl group, an optionally substituted cycloalkyl group, an optionally substituted alkenyl group, an optionally substituted cycloalkenyl group, an optionally substituted alkynyl group, an optionally substituted aryl group, an optionally substituted heteroaryl group, an optionally substituted aliphatic heterocyclic ring group which may contain a double bond in a portion of the ring, an optionally substituted amino group, an optionally substituted alkoxy group, or an optionally substituted alkylthio group, or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together form a ring] or a pharmacologically acceptable salt thereof.

[続葉有]

WO 2023/074847 A1

長岡 南実(NAGAOKA Minami); 〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目2番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP). 福永 謙二(FUKUNAGA Kenji); 〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目2番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP). 菅野 康太郎(KANNO Rentarou); 〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目2番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP). 山田 孝博(YAMADA Takahiro); 〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町三丁目2番10号 田辺三菱製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 弁理士法人 津国, 外 (TSUKUNI & ASSOCIATES et al.); 〒1020083 東京都千代田区麹町5-3-1 麹町ビジネスセンター 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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(57) 要約: 本発明は、T R H-D Eの阻害活性を有し、T R Hが関与する各種疾患及び／又はそれに伴う症状の予防・治療に有用である、新規スピロ化合物又はその薬理的に許容し得る塩、その製造方法、その使用、並びに前記化合物又はその薬理的に許容し得る塩を有効成分としてなる医薬組成物等を提供するものである。本発明は、一般式 [I]: [式中、環Aは、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基又は置換されていてもよい脂肪族複素環基を表し、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、それぞれ置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよく、環の一部に二重結合を含んでいてもよい脂肪族複素環基、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいアルコキシ基、又は置換されていてもよいアルキルチオ基を表すか、あるいはR<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>は一体となって環を形成する基を表す] で示される化合物又はその薬理的に許容し得る塩である。