

(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
2011 年 9 月 22 日(22.09.2011)

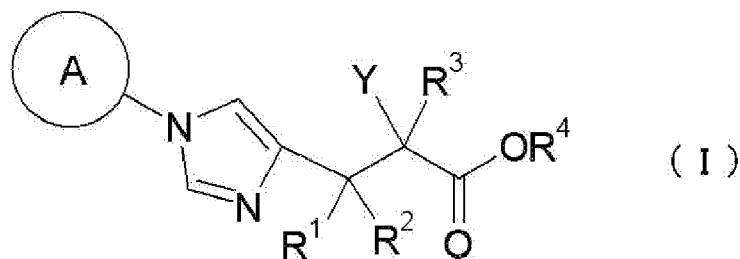


(10) 国際公開番号
WO 2011/115064 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 233/64 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01) A61P 11/00 (2006.01)
A61K 31/4178 (2006.01) A61P 31/00 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01) C07D 403/06 (2006.01)
A61P 9/02 (2006.01) C07D 413/06 (2006.01)
A61P 9/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/055953
- (22) 国際出願日: 2011 年 3 月 14 日(14.03.2011)
- (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 2010-062155 2010 年 3 月 18 日(18.03.2010) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一三共株式会社 (DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目 5 番 1 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): 永田 勉 (NAGATA, Tsutomu). 井上 雅大 (INOUE, Masahiro). 芦田 由香 (ASHIDA, Yuka). 野口 研吾 (NOGUCHI, Kengo). 小野 誠 (ONO, Makoto).
- (74) 代理人: 石橋 公樹, 外 (ISHIBASHI Koki et al.); 〒1340081 東京都江戸川区北葛西一丁目 1 6 番 1 3 号 第一三共株式会社内 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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, 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, LR, 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 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, 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 (条約第 21 条(3))

(54) Title: CYCLOALKYL-SUBSTITUTED IMIDAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: シクロアルキル基で置換されたイミダゾール誘導体



(57) Abstract: Compounds represented by general formula (I) (wherein A represents a C₃₋₁₂ cycloalkyl group optionally substituted by 1-3 substituents selected from among fluoro groups, hydroxide groups and/or a C₁₋₆ alkyl groups; R¹, R² and R³ each individually represents a hydrogen atom, a fluoro group or a C₁₋₆ alkyl group; R⁴ represents a hydrogen atom or a prodrug group; and Y represents -CH₂-CHR⁵-CH₂-NHR⁶, in which R⁵ represents a hydrogen atom, a C₁₋₆ alkyl group or a C₁₋₆ alkoxy group and R⁶ represents a hydrogen atom or a prodrug group) and pharmacologically-acceptable salts thereof exhibit a TAFIa-inhibiting activity, and thus are useful as therapeutic drugs for myocardial infarction, angina, acute coronary syndrome, cerebral infarction, deep vein thrombosis, pulmonary embolism, etc.

(57) 要約: 下記的一般式 (I) [式中、Aはフルオロ基、水酸基、C1～C6アルキル基等から選ばれる1～3個で置換されていてもよいC3～C12シクロアルキル基を示し、R¹、R²及びR³は各々独立して水素原子、フルオロ基又はC1～C6アルキル基を示し、R⁴は水素原子又はプロドラッグ基を示し、Yは-CH₂-CHR⁵-CH₂-NHR⁶ (ここで、R⁵は水素原子、C1～C6アルキル基又はC1～C6アルコキシ基を示し、R⁶は水素原子又はプロドラッグ基を示す。)等を示す。]で表される化合物、またはその薬理上許容される塩は、TAFIa酵素阻害活性を有し、心筋梗塞、狭心症、急性冠不全症候群、脳梗塞、深部静脈血栓症、肺塞栓症などの治療薬として有用である。



WO 2011/115064 A1