

(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
2009 年 10 月 1 日(01.10.2009)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2009/119534 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 217/06 (2006.01) A61P 15/08 (2006.01)
A61K 31/472 (2006.01) A61P 27/12 (2006.01)
A61K 31/4725 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)
A61P 3/06 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2009/055738

(22) 国際出願日: 2009 年 3 月 24 日(24.03.2009)

(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 2008-079901 2008 年 3 月 26 日(26.03.2008) 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 (米国についてののみ): 宇都 芳一 (UTO, Yoshikazu), 唐澤 博史 (KARASAWA, Hiroshi), 高石 巨澄 (TAKAISHI, Kiyosumi).

(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, 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, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

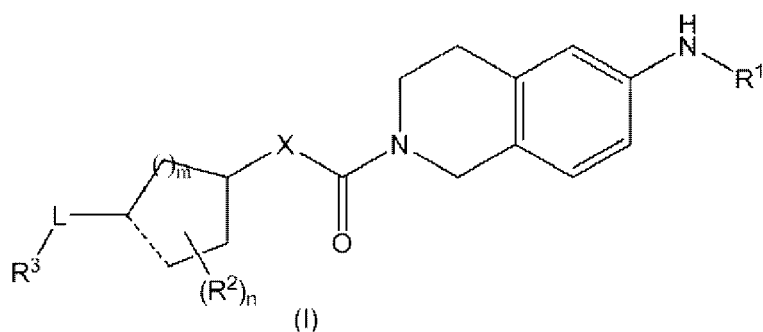
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL,

[続葉有]

(54) Title: NOVEL TETRAHYDROISOQUINOLINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規テトラヒドロイソキノリン誘導体

【化1】



(57) Abstract: Disclosed is a compound having an excellent DGAT inhibiting activity and an excellent anorexigenic activity or a pharmacologically acceptable salt thereof. Specifically disclosed is a compound represented by general formula (I) or a pharmacologically acceptable salt thereof [in the formula, R¹ represents a phenylaminocarbonyl group which may be substituted by 1 to 5 substituents independently selected from the members of the substituent group (A), a benzoxazol-2-yl group which may be substituted by 1 to 3 substituents independently selected from the members of the substituent group (A), or the like; R²'s independently represent a C₁-C₆ alkyl group; R³ represents a group represented by formula -C(=O)-O-R⁴, or the like; R⁴ represents a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl group which may be substituted by 1 to 3 substituents independently selected from the members of the substituent group (B), or the like; X represents an oxygen atom, a methylene group, a group represented by formula -NH-, or the like; L represents a single bond, a methylene group, or the like; a mark ' ' represents a single bond or a double bond; m represents a number of 1 or 2; n represents an integer of 0 to 5; the substituent group (A) includes a halogen atom, a C₁-C₆ alkyl group, a C₁-C₆ halogenated alkyl group, a C₁-C₆ alkoxy group, and others; the substituent group (B) includes a C₃-C₆ cycloalkyl group, a phenyl group, a carboxyl group, and others.] (I)

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2009/119534 A1



NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, 添付公開書類:

CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, — 国際調査報告 (条約第 21 条(3))
TG).

本発明は、優れた D G A T 阻害作用及び摂食抑制作用を有する化合物又はその薬理上許容される塩に関する。一般式 (I) 【化 1】 [式中、 R^1 は、置換基群 A から選択される基で独立に 1 乃至 5 個置換されていてもよいフェニルアミノカルボニル基、置換基群 A から選択される基で独立に 1 乃至 3 個置換されていてもよいベンゾオキサゾール-2-イル基等； R^2 は、独立に C_1-C_6 アルキル基； R^3 は、式 $-C(=O)-O-R^4$ で表わされる基等； R^4 は、水素原子、置換基群 B から選択される基で独立に 1 乃至 3 個置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル基等；X は、酸素原子、メチレン基又は式 $-NH-$ で表わされる基等；L は、単結合、メチレン基等；……は、単結合又は二重結合；m は、1 又は 2；n は、0 乃至 5 の整数；置換基群 A は、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 ハロゲン化アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基等；置換基群 B は、 C_3-C_6 シクロアルキル基、フェニル基、カルボキシ基等] を有する化合物又はその薬理上許容される塩。