

(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
2010 年 3 月 18 日(18.03.2010)



(10) 国際公開番号
WO 2010/029986 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 241/44 (2006.01) A61P 27/02 (2006.01)
A61K 31/498 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2009/065888
- (22) 国際出願日: 2009 年 9 月 11 日(11.09.2009)
- (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 2008-234105 2008 年 9 月 12 日(12.09.2008) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 参天製薬株式会社 (SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄 3 丁目 9 番 19 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): 加藤 雅智 (KATO, Masatomo) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 高井 美和 (TAKAI, Miwa) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 松山 高央

(MATSUYAMA, Takahiro) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 黒瀬 達治 (KUROSE, Tatsuji) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 萩原由美 (HAGIWARA, Yumi) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 隠樹 健二 (OKI, Kenji) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 松田学 (MATSUDA, Mamoru) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 森 俊之 (MORI, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP).

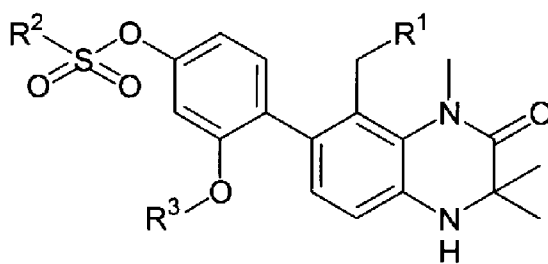
(74) 代理人: 日比 紀彦, 外 (HIBI, Norihiko et al.); 〒5420086 大阪府大阪市中央区西心斎橋 1 丁目 13 番 18 号 イナバビル 3 階 キシモト特許事務所内 Osaka (JP).

(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,

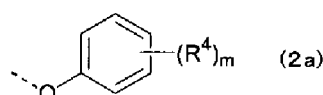
[続葉有]

(54) Title: GLUCOCORTICOID RECEPTOR AGONIST COMPRISING NOVEL 1,2,3,4-TETRAHYDROQUINOXALINE DERIVATIVE CONTAINING PHENYL GROUP HAVING SULFONIC ACID ESTER STRUCTURE INTRODUCED THEREIN AS SUBSTITUENT

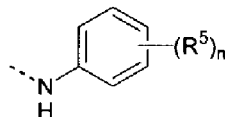
(54) 発明の名称: スルホン酸エステル構造を導入したフェニル基を置換基として有する新規 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリン誘導体からなるグルココルチコイド受容体アゴニスト



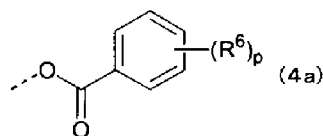
(1)



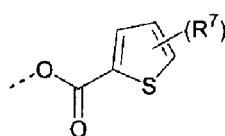
(2a)



(3a)



(4a)



(5a)

(57) Abstract: The object aims to find a novel pharmacological activity of a novel 1,2,3,4-tetrahydroquinoxaline derivative which contains, as a substituent, a phenyl group having a sulfonic acid ester structure introduced therein. A compound represented by general formula (1) or a salt thereof is useful as a glucocorticoid receptor agonist, particularly as a therapeutic agent for diseases against which a glucocorticoid receptor agonist (e.g., a steroid) is believed to be effective, such as inflammatory bone/joint diseases, inflammatory ophthalmic diseases (inflammatory ophthalmic diseases in the anterior or posterior segment of an eye). R¹ represents a group represented by general formula (2a), (3a), (4a) or (5a); R² represents a lower alkyl group which may have a substituent, a lower cycloalkyl group which may have a substituent, or the like; R³ represents a lower alkyl group; R⁴, R⁵, R⁶ or R⁷ represent a halogen atom, a lower alkyl group which may have a substituent, a hydroxy group, a lower alkoxy group which may have a substituent, or the like; and m, n, p or q represents a number of 0, 1 or 2.

(57) 要約:

[続葉有]



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

(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, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(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

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

本発明は、スルホン酸エステル構造を導入したフェニル基を置換基として有する新規 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリン誘導体の新たな薬理作用を見出すことを目的とする。一般式 (1) で表される化合物又はその塩はグルココルチコイド受容体アゴニストとして有用である。特にステロイド類等のグルココルチコイド受容体アゴニストが有効とされる疾患、例えば、炎症性の骨・関節疾患、眼炎症性疾患 (前眼部又は後眼部炎症性疾患) の治療剤として有用である。R¹は下記一般式 (2 a)、(3 a)、(4 a) 又は (5 a) を、R²は置換基を有してもよい低級アルキル基、置換基を有してもよい低級シクロアルキル基等を、R³は低級アルキル基を、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、ハロゲン原子、置換基を有してもよい低級アルキル基、ヒドロキシ基、置換基を有してもよい低級アルコキシ基等を、m、n、p又はqは、0、1又は2を示す。