

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 2 月 10 日 (10.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/012272 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 267/14, 417/06, 413/06,
A61K 31/553, 31/427, 31/4245, 45/00, A61P 43/00, 3/06,
3/00, 13/12, 9/10, 9/06, 9/04, 7/00, 9/12, 3/10, 19/10, 1/18,
5/14, 25/28, 19/00, 21/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/011293

(22) 国際出願日: 2004 年 7 月 30 日 (30.07.2004)

(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2003-285341 2003 年 8 月 1 日 (01.08.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 武田薬品
工業株式会社 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES,
LTD.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町
四丁目 1 番 1 号 Osaka (JP).

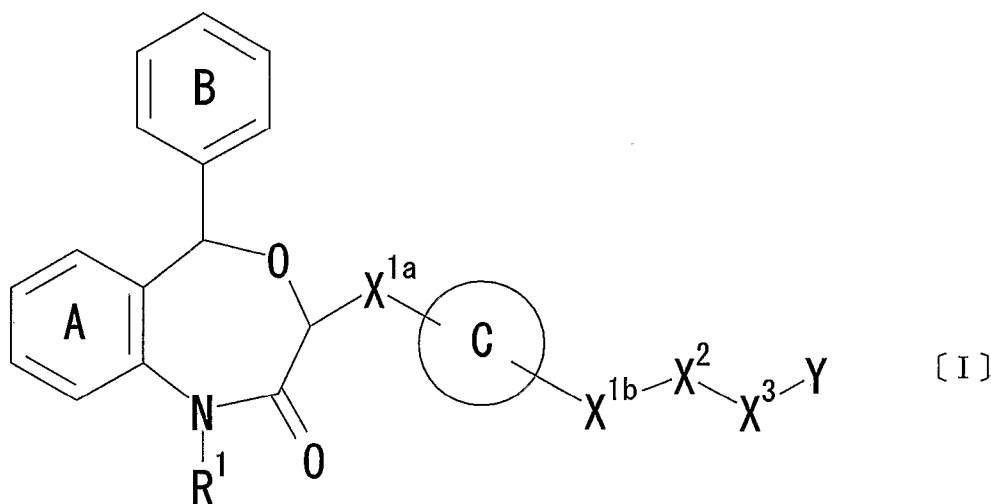
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 圓井 省吾
(MARUI, Shogo) [JP/JP]; 〒6511233 兵庫県神戸市北
区日の峰 1 丁目 10-7 Hyogo (JP). 三木 隆 (MIKI,Takashi) [JP/JP]; 〒5450021 大阪府大阪市阿倍野区
阪南町 2 丁目 23-23-205 Osaka (JP). 三浦
正太郎 (MIURA, Shoutarou) [JP/JP]; 〒5600021 大阪
府豊中市本町 2 丁目 4-7-502 Osaka (JP). 西
本 誠之 (NISHIMOTO, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒5650862
大阪府吹田市津雲台 5 丁目 18-D73-102
Osaka (JP). 中田 善久 (NAKADA, Yoshihisa) [JP/JP]; 〒
5630105 大阪府豊能郡豊能町新光風台 2 丁目 19-
14 Osaka (JP).(74) 代理人: 河宮 治, 外 (KAWAMIYA, Osamu et al.); 〒
5400001 大阪府大阪市中央区城見 1 丁目 3 番 7 号
IMPビル 青山特許事務所 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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

[続葉有]

(54) Title: BENZOXAZEPINE COMPOUND

(54) 発明の名称: ベンゾオキサゼピン系化合物

(57) Abstract: A compound represented by the formula [I]: [I] (wherein ring A and ring B each represents an optionally substituted benzene ring; ring C represents an optionally further substituted aromatic ring; R¹ represents a lower alkyl optionally substituted by optionally substituted hydroxy; X^{1a} represents a bond or optionally substituted lower alkylene; X^{1b} represents a bond or optionally substituted lower alkylene; X² represents a bond, -O-, or -S-; X³ represents a bond or an optionally substituted divalent hydrocarbon group; and Y represents optionally esterified or amidated carboxy) or a salt of the compound. The compound of the formula [I] is safer and has more potent lipid-lowering activity such as squalene synthase inhibitory activity (cholesterol-lowering activity) and triglyceride-lowering activity. The compound is useful as a medicine for, e.g., the prevention of and treatments for hyperlipemia.

[続葉有]

WO 2005/012272 A1



(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, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

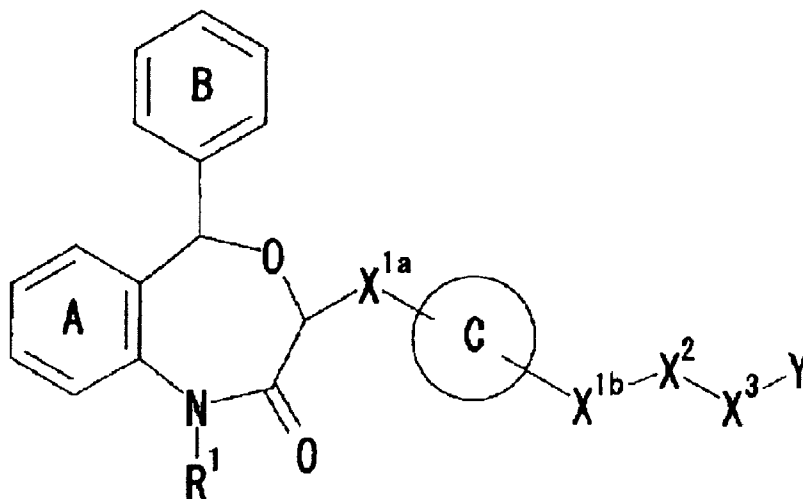
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

式 [I]



〔式中、環Aおよび環Bはそれぞれ置換されていてもよいベンゼン環；環Cはさらに置換されていてもよい芳香環；R¹は置換されていてもよい水酸基で置換されていてもよい低級アルキル基；X^{1a}は結合手または置換されていてもよい低級アルキレン；X^{1b}は結合手または置換されていてもよい低級アルキレン；X²は結合手、—O—または—S—；X³は結合手または置換されていてもよい二価の炭化水素基；Yはエステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示す。〕で表される化合物またはその塩。式[I]の化合物は、より安全で、かつ、より強力なスクアレン合成酵素阻害作用（コレステロール低下作用）、トリグリセライド低下作用等の脂質低下作用を有し、高脂血症の予防治療等の医薬として有用な化合物である。