(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
2012 年 1 月 12 日(12.01.2012)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/005227 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 471/04 (2006.01)	*A61P 13/08* (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)	*A61P 17/00* (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)	*A61P 19/02* (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)	*A61P 21/00* (2006.01)
A61K 31/497 (2006.01)	*A61P 29/00* (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01)	*A61P 35/00* (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)	*A61P 43/00* (2006.01)
A61P 13/00 (2006.01)	*C07D 471/14* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/065312

(22) 国際出願日: 2011 年 7 月 5 日(05.07.2011)

(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 2010-154280 2010 年 7 月 6 日(06.07.2010) JP
特願 2011-060765 2011 年 3 月 18 日(18.03.2011) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社(ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418526 大阪府大阪市中央区道修町二丁目１番５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): 大畑　正(OHATA, Akira) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目１番１号　小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 中谷　真悟(NAKATANI, Shingo) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目１番１号　小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 杉山　哲也(SUGIYAMA, Tetsuya) [JP/JP]; 〒3004247 茨城県つくば市和台１７番地２　小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 森元崇史(MORIMOTO, Takashi) [JP/JP]; 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目１番１号　小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

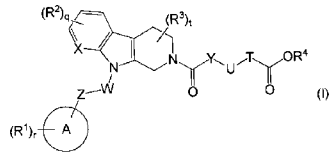
(74) 代理人: 特許業務法人三枝国際特許事務所(Saegusa & Partners); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町１－７－１　北浜ＴＮＫビル Osaka (JP).

(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, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW,

[続葉有]

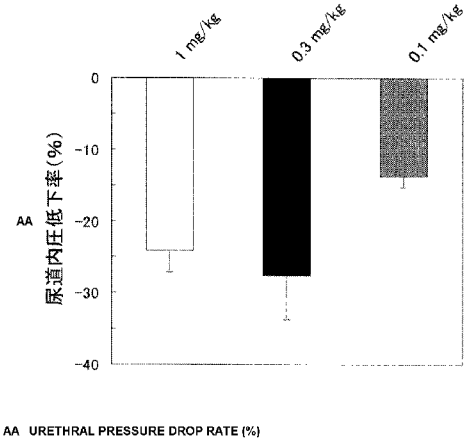
(54) **Title**: TETRAHYDROCARBOLINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 : テトラヒドロカルボリン誘導体



(I)

[図1]



AA URETHRAL PRESSURE DROP RATE (%)

(57) **Abstract**: As a pharmaceutical product useful for patients with urine evacuation disorders for whom conventional drugs are ineffective, a drug is disclosed having inhibitory activity on ENPP2, which is a target different from that of already existing drugs. Disclosed are a compound represented by formula (I) (wherein definitions of the groups are as in the description) having ENPP2 inhibitory activity, a salt or solvate thereof, a prodrug of either of these, or an agent for prevention, treatment and/or symptomatic improvement of urine evacuation disorders containing either of these as an active ingredient.

(57) 要約:　既存薬では効果が不十分な尿排出障害患者に有用な医薬品として、既存薬とは異なる標的であるＥＮＰＰ２に対して阻害活性を有する薬剤を提供すること。　本発明は、ＥＮＰＰ２阻害活性を有する一般式（Ｉ）（式中、各基の定義は明細書中の記載と同じ意味を表わす。）で示される化合物、その塩もしくはその溶媒和物またはそれらのプロドラッグならびにそれらを有効成分として含有する尿排出障害の予防、治療および／または症状改善剤を提供する。

WO 2012/005227 A1

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)）