

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 3 月 11 日 (11.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/020393 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07C 229/46, C07D 213/74, 231/38, 239/42, 249/14, 257/06, 261/14, 263/48, 271/06, 271/10, 275/02, 277/42, 285/12, A61K 31/41, 31/415, 31/4196, 31/42, 31/421, 31/4245, 31/425, 31/426, 31/433, 31/4402, 31/4406, 31/505, A61P 3/04, 3/06, 9/10, 43/00, A61K 31/196, C07C 255/58

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/011041

(22) 国際出願日: 2003 年 8 月 29 日 (29.08.2003)

(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2002-255604 2002 年 8 月 30 日 (30.08.2002) JP
特願2003-107161 2003 年 4 月 10 日 (10.04.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8422 東京都港区虎ノ門二丁目2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): 前田 公也 (MAEDA, Kimiya) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 長森 弘将 (NAGAMORI, Hiironobu) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 中村 洋 (NAKAMURA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒

569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 新海 久 (SHINKAI, Hisashi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 鈴木 靖規 (SUZUKI, Yasunori) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 高橋 大祐 (TAKAHASHI, Daisuke) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 谷口 寿生 (TANIGUCHI, Toshio) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒541-0044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目2番14号 藤村大和生命ビル Osaka (JP).

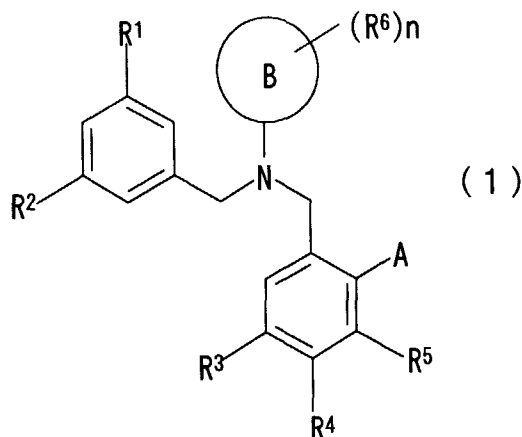
(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),

[続葉有]

(54) Title: DIBENZYLAMINE COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: ジベンジルアミン化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: A dibenzylamine compound represented by the general formula (1): (1) (wherein R¹ and R² each is optionally halogenated C₁₋₆ alkyl, etc.; R³, R⁴, and R⁵ each is hydrogen, halogeno, etc., provided that R³ and R⁴ may form an optionally substituted homocycle or heterocycle in cooperation with the carbon atoms bonded thereto; A is -N(R⁷)(R⁸), etc.; ring B is aryl or a heterocyclic residue; R⁶ is hydrogen, halogeno, nitro, C₁₋₆ alkyl, etc.; and n is an integer of 1 to 3); a prodrug of the compound; or a pharmaceutically acceptable salt of either. They have selective and potent CETP inhibitory activity and are hence usable as, e.g., a therapeutic or preventive drug for hyperlipemia, arteriosclerosis, etc.

[続葉有]

WO 2004/020393 A1



OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

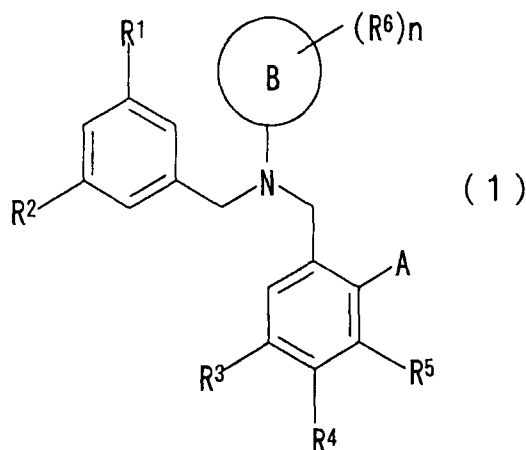
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

一般式 (1)



〔式中、 R^1 及び R^2 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基等であり； R^3 、 R^4 及び R^5 は、水素原子、ハロゲン原子等、あるいは R^3 と R^4 が結合する炭素原子と一緒にあって、置換基を有してもよい同素環又は複素環を形成してもよい；Aは、 $-N(R^7)(R^8)$ 等であり；環Bは、アリール基又はヘテロ環残基であり； R^6 は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基等あり；nは1乃至3の整数である〕で表されるジベンジルアミン化合物もしくはそのプロドラッグ又はそれらの医薬上許容される塩は、選択的かつ強力なCETP阻害活性を示すことから、高脂血症または動脈硬化等の治療又は予防薬等として提供することができる。