(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
2015 年 4 月 23 日(23.04.2015)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2015/056771 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 495/04 (2006.01) *A61P 25/00* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01) *A61P 25/18* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) *A61P 25/22* (2006.01)
A61K 31/541 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61K 31/554 (2006.01) *C07D 519/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/077653

(22) 国際出願日: 2014 年 10 月 17 日(17.10.2014)

(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 2013-216332 2013 年 10 月 17 日(17.10.2013) JP

(71) 出願人: アステラス製薬株式会社(ASTELLAS PHARMA INC.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 白石 宜之(SHIRAISHI, Nobuyuki); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 星井博昭(HOSHII, Hiroaki); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). ▲浜▼口 渉(HAMAGUCHI, Wataru); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 本庄 絵理子(HONJO, Eriko); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 宅和 知文(TAKUWA, Tomofumi); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 近藤 雄二(KONDO, Yuji); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 後藤貴行(GOTO, Takayuki); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP).

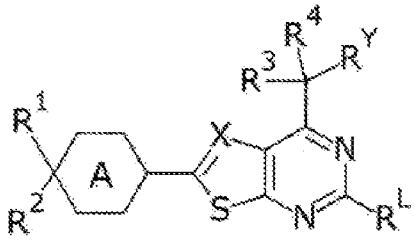
(74) 代理人: 森田 拓, 外(MORITA, Hiroshi et al.); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社 知的財産部内 Tokyo (JP).

(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, BN, 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,

[続葉有]

(54) **Title**: SULFUR-CONTAINING BICYCLIC COMPOUND

(54) 発明の名称 : 含硫黄二環式化合物



(III)

(57) **Abstract**: [Problem] To provide a compound useful as a pharmaceutical composition for prevention and/or treatment of diseases such as schizophrenia. [Solution] The inventors developed the present invention upon investigating a pharmaceutical composition having effects as a GABAB positive allosteric modulator (effects as a PAM), for preventing/treating diseases such as schizophrenia, and confirming that a sulfur-containing bicyclic compound has effects as a GABAB PAM. This sulfur-containing bicyclic compound has effects as a GABAB PAM and can be used as a preventive and/or therapeutic agent for diseases such as schizophrenia. (In the formula, X represents CH, R^1 represents a lower alkyl, R^2 represents a lower alkyl , R^3 represents –H, R^4 represents –H, ring A is a cyclohexane ring, R^Y represents a group represented by formula (III), Y represents NH, etc., and R^L represents a lower alkyl.)

(57) 要約: 【課題】統合失調症等の予防及び/又は治療用医薬組成物として有用な化合物を提供する。 【解決手段】本発明者らは、GABAB のポジティブアロステリックモジュレート作用(PAM 作用)を有し、統合失調症等の予防及び/又は治療用医薬組成物について検討し、含硫黄二環式化合物が GABAB 受容体の PAM であることを確認し、本発明を完成した。本発明の含硫黄二環式化合物は GABAB の PAM 作用を有し、統合失調症等の予防及び／又は治療剤として使用し得る。 （式中、Ｘは、ＣＨ、R^1は、低級アルキル、R^2は、低級アルキル、R^3は、－Ｈ、R^4は、－Ｈ、Ａ環は、シクロヘキサン環、R^Yは、式（ＩＩＩ）で表される基 Ｙは、ＮＨ等、R^Lは、低級アルキルである。）

WO 2015/056771 A1

IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）