

(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 12 月 10 日(10.12.2015)



(10) 国際公開番号

WO 2015/186821 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 417/14 (2006.01) A61P 13/10 (2006.01)
A61K 31/497 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 13/02 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2015/066321

(22) 国際出願日: 2015 年 6 月 5 日(05.06.2015)

(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 2014-118046 2014 年 6 月 6 日(06.06.2014) 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: 高橋 泰輔(TAKAHASHI, Taisuke); 〒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). 小池 貴徳(KOIKE, Takanori); 〒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). 根来 賢二(NEGORO, Kenji); 〒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). 田中 宏明(TANAKA, 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). 前田 純(MAEDA, Jun); 〒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). 横山 和宏(YOKOYAMA, Kazuhiro); 〒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). 高松 肇

(TAKAMATSU, Hajime); 〒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, 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), ユーロパ (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ユーロッパ (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))

(54) Title: 2-ACYLAMINOTHIAZOLE DERIVATIVE OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: 2-アシルアミノチアゾール誘導体またはその塩

(57) Abstract: [Problem] To provide a compound useful as an active ingredient of a pharmacological composition for the treatment of urinary storage symptoms, dysuria, lower urinary tract diseases, and the like. [Solution] The inventors perfected the present invention after discovering that thiazole derivatives substituted at position 2 by pyrazinylcarbonylamino are exceptional muscarinic M₃ receptor positive allosteric modulators and can be expected to serve as agents for the prevention or treatment of urinary bladder and urinary tract diseases involving bladder contraction mediated by muscarinic M₃ receptors. The 2-acylaminothiazole derivatives or salts thereof of the present invention can be expected to serve as agents for the prevention or treatment of urinary bladder and urinary tract diseases involving bladder contraction mediated by muscarinic M₃ receptors, e.g., underactive bladder and the like.

(57) 要約: 【課題】蓄尿障害、排尿障害及び下部尿路系疾患等の治療用医薬組成物の有効成分として有用な化合物を提供する。【解決手段】本発明者らは、ピラジニルカルボニルアミノが 2 位に置換したチアゾール誘導体が優れたムスカリン M₃ 受容体ポジティブアロステリックモジュレーターであり、ムスカリン M₃ 受容体を介した膀胱収縮が関与する膀胱・尿路系疾患の予防又は治療剤として期待されることを知見して本発明を完成した。本発明の 2-アシルアミノチアゾール誘導体またはその塩は、ムスカリン M₃ 受容体を介した膀胱収縮が関与する膀胱・尿路系疾患、例えば低活動膀胱等の排尿障害の予防又は治療剤として期待される。

WO 2015/186821 A1