

(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
2013 年 4 月 11 日(11.04.2013)



(10) 国際公開番号

WO 2013/051639 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 471/04 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2012/075748
- (22) 国際出願日: 2012 年 10 月 4 日(04.10.2012)
- (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:
61/544860 2011 年 10 月 7 日(07.10.2011) US
61/550623 2011 年 10 月 24 日(24.10.2011) US
61/558110 2011 年 11 月 10 日(10.11.2011) US
61/580903 2011 年 12 月 28 日(28.12.2011) US
- (71) 出願人: エーザイ・アール・アンド・ディー・
マネジメント株式会社(EISAI R&D MANAGE-
MENT CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区
小石川四丁目 6 番 1 0 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 乗嶺 吉彦(NORIMINE Yoshihiko); 〒
3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3
エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 武田
邦稔(TAKEDA Kunitoshi); 〒3002635 茨城県つくば
市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑
波研究所内 Ibaraki (JP). 萩原 幸司(HAGIWARA

Koji); 〒3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1
番地 3 エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki
(JP). 鈴木 裕一(SUZUKI Yuichi); 〒3002635 茨城
県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株
式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 石原 祐樹
(ISHIHARA Yuki); 〒3002635 茨城県つくば市東光
台 5 丁目 1 番地 3 エーザイ株式会社筑波研究
所内 Ibaraki (JP). 佐藤 信明(SATO Nobuaki); 〒
3002635 茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3
エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP).

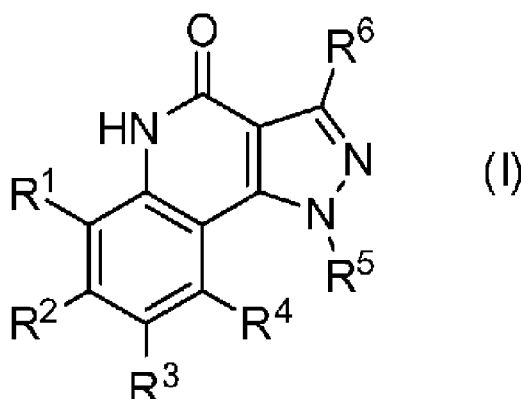
(74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外(HASEGAWA Yoshiki et
al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二丁目 1 番
1 号丸の内 M Y P L A Z A (明治安田生命
ビル) 9 階 創英国際特許法律事務所 Tokyo
(JP).

(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,
IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR,
LS, LT, 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, 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.

[続葉有]

(54) Title: PYRAZOLOQUINOLINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ピラゾロキノリン誘導体



(57) Abstract: A compound represented by formula (I) or a pharmacologically acceptable salt thereof which has an inhibitory effect on PDE9 and, therefore, is expected as being capable of increasing the cGMP level in the brain. Since the inhibitory effect on PDE9 and an increase in the cGMP level contribute to improvement in learning and memory behavior, the aforesaid compound or a pharmacologically acceptable salt thereof would be available as a remedy for cognitive dysfunction in Alzheimer's disease. In formula (I): R¹ represents a hydrogen atom; R² represents an aromatic ring group, etc.; R³ represents a hydrogen atom, etc.; R⁴ represents a hydrogen atom; R⁵ represents an oxepanyl group, etc.; and R⁶ represents a hydrogen atom.

(57) 要約: 式 (I) で表される化合物またはその薬理学的に許容される塩は、PDE9 阻害作用を有することにより、脳内における cGMP 濃度を上昇させることが期待できる。PDE9 阻害作用や cGMP の上昇は、学習記憶行動の改善につながり、アルツハイマー病における認知機能障害の治療剤としての利用可能性を有している。[式中、R¹ は水素原子であり、R² は芳香環基等であり、R³ は水素原子等であり、R⁴ は水素原子であり、R⁵ はオキセパニル基等であり、R⁶ は水素原子である。]



(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, 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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第 21 条(3))
- 明細書の別個の部分として表した配列リスト (規則 5.2(a))