(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
2010 年 4 月 8 日(08.04.2010)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2010/038686 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 513/04 (2006.01) *A61P 25/28* (2006.01)
A61K 31/542 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2009/066728

(22) 国際出願日: 2009 年 9 月 28 日(28.09.2009)

(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 2008-252062 2008 年 9 月 30 日(30.09.2008) JP
61/101359 2008 年 9 月 30 日(30.09.2008) US
特願 2009-100457 2009 年 4 月 17 日(17.04.2009) JP
61/170179 2009 年 4 月 17 日(17.04.2009) US
特願 2009-168490 2009 年 7 月 17 日(17.07.2009) JP
61/226365 2009 年 7 月 17 日(17.07.2009) US

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 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 Management Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川４丁目６番１０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): 元木 貴史 (MOTOKI Takafumi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 武田 邦稔 (TAKEDA Kunitoshi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 北 陽一(KITA Yoichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 高石 守(TAKAISHI Mamoru) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 鈴木 裕一(SUZUKI Yuichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 石田 祐(ISHIDA Tasuku) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番３ エーザイ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP).

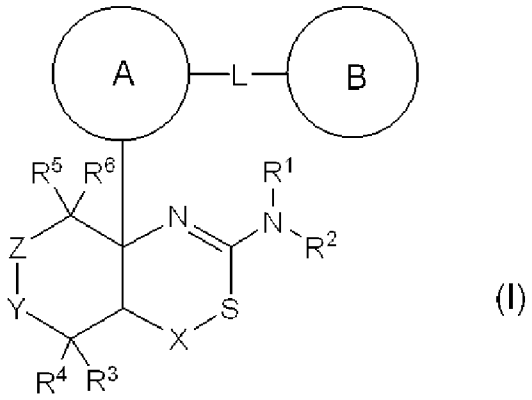
(74) 代理人: 浅村 皓, 外(ASAMURA Kiyoshi et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町２丁目２番１号 新大手町ビル３３１ Tokyo (JP).

(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, 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, PE, PG, PH,

[続葉有]

(54) **Title**: NOVEL FUSED AMINODIHYDROTHIAZINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 : 新規な縮合アミノジヒドロチアジン誘導体



(I)

(57) **Abstract**: A compound represented by general formula (I), a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate of the compound or salt has an Aβ production inhibitory activity or BACE 1 inhibitory activity, and is thus useful as an agent for treating neurodegenerative diseases caused by Aβ as typified by Alzheimer's disease. (In the formula, ring A represents a C_{6-14} aryl group or the like; L represents $-NR^{L}CO-$ (wherein R^{L} represents a hydrogen atom or the like) or the like; ring B represents a C_{6-14} aryl group or the like; X represents a C_{1-3} alkylene group or the like; Y represents a C_{1-3} alkylene group or the like; Z represents an oxygen atom or the like; R^1 and R^2 each independently represents a hydrogen atom or the like; and R^3, R^4, R^5 and R^6 each independently represents a hydrogen atom, a halogen atom or the like.)

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2010/038686 A1

PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, 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, 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 (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, 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)）

一般式 ［式中、環ＡはＣ$_{6-14}$アリール基などであり、Ｌは－ＮＲ^{L}ＣＯ－（Ｒ^{L}は水素原子など）などであり、環Ｂは、Ｃ$_{6-14}$アリール基などであり、ＸはＣ$_{1-3}$アルキレン基などであり、ＹはＣ$_{1-3}$アルキレン基などであり、Ｚは酸素原子などであり、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は各々独立して水素原子などであり、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は独立して水素原子、ハロゲン原子などである］で示される化合物若しくはその医薬上許容される塩又はそれらの溶媒和物は、Ａβ産生抑制作用又はＢＡＣＥ１阻害作用を有し、Ａβに起因する、アルツハイマー型認知症に代表される神経変性疾患の治療剤として有用である。