(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
2011 年 9 月 1 日(01.09.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/105590 A1

(51) 国際特許分類:
*C07D 471/04* (2006.01) *A61P 31/18* (2006.01)
*A61K 31/4985* (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
*A61K 31/5377* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/054404

(22) 国際出願日: 2011 年 2 月 25 日(25.02.2011)

(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 2010-043567 2010 年 2 月 26 日(26.02.2010) JP
61/339,729 2010 年 3 月 9 日(09.03.2010) US

(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]; 〒1058422 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): 宮崎 将(MIYAZAKI, Susumu) [JP/JP]; 〒5691125 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). 別所 祐紀(BESSHO, Yuki) [JP/JP]; 〒5691125 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). 足達 馨(ADACHI, Kaoru) [JP/JP]; 〒5691125 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). 川下 誠司(KAWASHITA, Seiji) [JP/JP]; 〒5691125 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). 磯島 裕隆(ISOSHIMA, Hirotaka) [JP/JP]; 〒5691125 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). 大下 賢吾(OSHITA, Kengo) [JP/JP]; 〒5691125 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). 福田 俊一(FUKUDA, Shunichi) [JP/JP]; 〒5691125 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); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目１番１号 明治安田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).

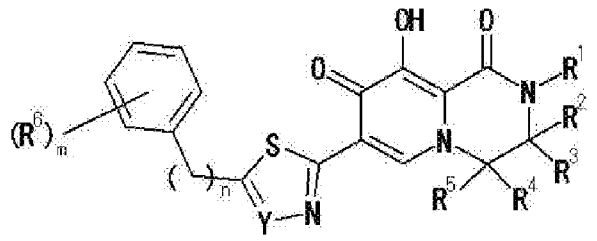
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, 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, 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 (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

[続葉有]

(54) **Title**: 1,3,4,8-TETRAHYDRO-2H-PYRIDO[1,2-A]PYRAZINE DERIVATIVE AND USE OF SAME AS HIV INTEGRASE INHIBITOR

(54) 発明の名称 : １，３，４，８－テトラヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン誘導体及びそのＨＩＶインテグラーゼ阻害剤としての利用



[I]

(57) **Abstract**: Disclosed is a novel 1,3,4,8-tetrahydro-2H-pyrido[1,2-a]pyrazine derivative, a pharmaceutically acceptable salt thereof or a solvate thereof, which is useful as an anti-HIV agent. Specifically disclosed is a compound represented by general formula (I), a pharmaceutically acceptable salt thereof or a solvate thereof. (In the formula, the symbols are as defined in the description.)

(57) 要約: 抗ＨＩＶ剤として有用な、新規１，３，４，８－テトラヒドロ－２Ｈ－ピリド［１，２－ａ］ピラジン誘導体又はその医薬上許容される塩、或いはその溶媒和物を提供する。 下記一般式［Ｉ］で表される化合物又はその医薬上許容される塩、或いはその溶媒和物に関する［式中、各記号は明細書中と同義である］。

WO 2011/105590 A1