

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2009年7月23日 (23.07.2009)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2009/091016 A1

## (51) 国際特許分類:

C07D 279/08 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)  
 A61K 31/4439 (2006.01) C07D 417/10 (2006.01)  
 A61K 31/5415 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)  
 A61K 31/542 (2006.01) C07D 513/04 (2006.01)  
 A61P 25/28 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2009/050511

(22) 国際出願日: 2009年1月16日 (16.01.2009)

(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2008-008680 2008年1月18日 (18.01.2008) JP  
 61/021939 2008年1月18日 (18.01.2008) US  
 特願2008-197204 2008年7月31日 (31.07.2008) JP  
 61/085024 2008年7月31日 (31.07.2008) 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四丁目6番10号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

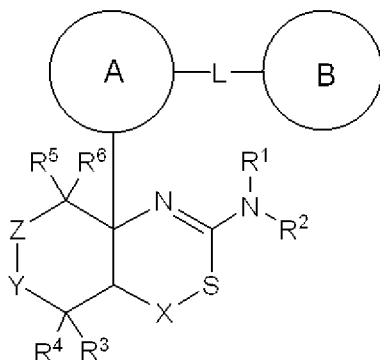
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 鈴木 裕一 (SUZUKI, Yuichi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市

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). 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). 金子 敏彦 (KANEKO, Toshihiko) [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). 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). 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). 山本 昇 (YAMAMOTO, Noboru) [JP/GB]; WC1E6BT ロンドンゴウアーストリートユニバーシティカレッジロンドンバーナードカッツビルディングエーザイロンドンリサーチラボラトリーズリミテッド内 London (GB). カーンアフザル (KHAN, Afzal) [GB/GB]; WC1E6BT ロンドンゴウアーストリートユニバーシティカレッジロンドンバーナードカッツビルディングエーザイロンドンリサーチラボラトリーズリミテッド内 London (GB). ディモポラス パスカリス (DIMOPOULOS, Paschalis) [GR/GB]; WC1E6BT ロンドンゴウアース

[続葉有]

(54) Title: CONDENSED AMINODIHYDROTHIAZINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 縮合アミノジヒドロチアジン誘導体



(I)

(57) Abstract: Disclosed is a compound represented by General formula (I), a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate of the compound or the pharmaceutically acceptable salt, which has an inhibitory activity of the production of A $\beta$  or a BACE1-inhibiting activity, and is therefore useful as a prophylactic or therapeutic agent for A $\beta$ -induced neurodegenerative diseases typified by Alzheimer-type dementia. Wherein the ring A represents a C<sub>6-14</sub> aryl group or the like; L represents -NR<sup>e</sup>CO- [wherein R<sup>e</sup> represents a hydrogen atom or the like] or the like; the ring B represents a C<sub>6-14</sub> aryl group or the like; X represents a C<sub>1-3</sub> alkylene group or the like; Y represents a single bond or the like; Z represents a C<sub>1-3</sub> alkylene group or the like; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> independently represent a hydrogen atom or the like; and R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> independently represent a hydrogen atom, a halogen atom or the like.

(57) 要約: 一般式 [式中、環AはC<sub>6-14</sub>アリール基などであり、Lは-NR<sup>e</sup>CO- (R<sup>e</sup>は水素原子など) などであり、環Bは、C<sub>6-14</sub>アリール基などであり、XはC<sub>1-3</sub>アルキレン基などであり、Yは単結合などであり、ZはC<sub>1-3</sub>アルキレン基などであり、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は各々独立して水素原子などであり、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>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、A $\beta$ 産生抑制作用又はBACE1阻害作用を有し、A $\beta$ 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予防剤または治療剤として有用である。

WO 2009/091016 A1



トリートユニバーシティカレッジ ロンドン パー  
ナード カッツ ビルディング エーザイ ロンドン リ  
サーチ ラボラトリーズ リミテッド内 London (GB).

NO, NZ, OM, PG, PH, 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.

(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 3 3 1 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, 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,

(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, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,  
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書