(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
2009 年 10 月 22 日(22.10.2009)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2009/128383 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 513/04 (2006.01) *A61P 25/18* (2006.01)
A61K 31/429 (2006.01) *A61P 25/20* (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01) *A61P 25/22* (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01) *A61P 25/24* (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01) *A61P 25/30* (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2009/057270

(22) 国際出願日: 2009 年 4 月 9 日(09.04.2009)

(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 2008-106080 2008 年 4 月 15 日(15.04.2008) JP
61/045084 2008 年 4 月 15 日(15.04.2008) 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

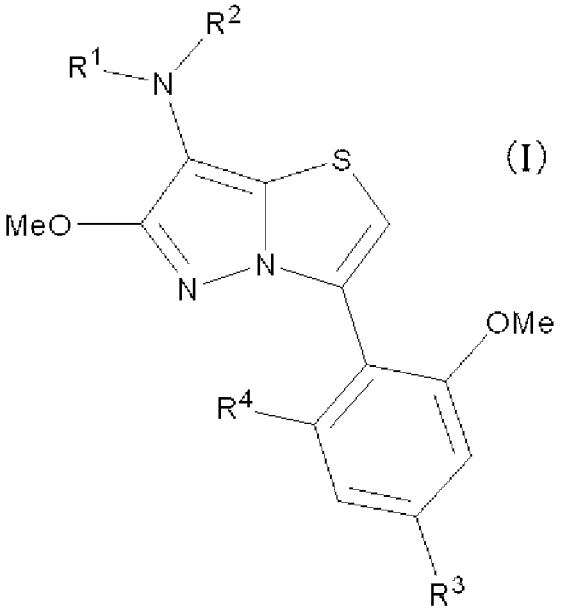
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 柴田 寿 (SHIBATA, Hisashi) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 志方 幸道 (SHIKATA, Kodo) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 猪又 晃 (INOMATA, Akira) [JP/JP]; 〒3002635 茨城県つくば市東光台５丁目１番地３ エーザイ株式会社筑波研究所内 Ibaraki (JP). 愼 光玉 (SHIN, Kogyoku) [KR/JP]; 〒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). 寺内 太朗 (TERAUCHI, Taro) [JP/JP]; 〒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). 高橋 良典 (TAKAHASHI, Yoshinori) [JP/JP]; 〒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). 橋爪 みな子 (HASHIZUME, Minako) [JP/JP]; 〒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) [JP/JP]; 〒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.); 〒1040061 東京都中央区銀座一丁目１０番６号銀座ファーストビル 創英国際特許法律事務所 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) **Title**: 3-PHENYLPYRAZOLO[5,1-b]THIAZOLE COMPOUND

(54) 発明の名称: ３－フェニルピラゾロ［５，１－ｂ］チアゾール化合物



(57) **Abstract**: Disclosed is a compound represented by formula (I) or a salt thereof, which has an excellent antagonistic activity on a CRF receptor and also has sufficient levels of a pharmacological activity, safety and *in vivo* kinetics for use as a medicinal agent. [In the formula, R^1 represents a group represented by formula $-A^{11}-A^{12}$; R^2 represents a tetrahydrofurylmethyl group, a tetrahydropyranylmethyl group or a tetrahydropyranyl group; A^{11} represents a single bond, a methylene group or a 1,2-ethylene group; A^{12} represents a C1-6 alkyl group, a C3-6 cycloalkyl group, or a C3-6 cycloalkyl group having a methyl group; R^3 represents a methoxy group, a cyano group, a cyclobutyloxymethyl group, a methoxymethyl group or an ethoxymethyl group; and R^4 represents a methoxy group or a chlorine atom.]

(57) 要約: 下記式（Ｉ）で表される化合物もしくはその塩は、優れたＣＲＦ受容体拮抗作用を有し、且つ、医薬として、十分な薬理活性、安全性、体内動態を有する。［式中、R^1は式－A^{11}－A^{12}を意味し；R^2はテトラヒドロフリルメチル基、テトラヒドロピラニルメチル基またはテトラヒドロピラニル基を意味し；A^{11}は単結合、メチレン基または１，２－エチレン基を意味し；A^{12}はＣ１－６アルキル基、Ｃ３－６シクロアルキル基またはメチル基を有するＣ３－６シクロアルキル基を意味し；R^3はメトキシ基、シアノ基、シクロブチルオキシメチル基、メトキシメチル基またはエトキシメチル基を意味し；R^4はメトキシ基または塩素原子を意味する。］

WO 2009/128383 A1

(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, 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.

(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（条約第 21 条(3)）