(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
2007 年7 月5 日 (05.07.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/074916 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 413/04 (2006.01) *A61P 17/04* (2006.01)
A61K 31/538 (2006.01) *A61P 19/02* (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01) *A61P 25/00* (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01) *A61P 25/04* (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01) *A61P 25/06* (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01) *A61P 27/16* (2006.01)
A61P 13/02 (2006.01) *A61P 29/00* (2006.01)
A61P 13/10 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01) *A61P 37/08* (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01) *C07D 413/14* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/326314

(22) 国際出願日: 2006 年12 月22 日 (22.12.2006)

(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 2005-377754 2005 年12 月28 日 (28.12.2005) JP
60/756,296 2006 年1 月5 日 (05.01.2006) 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

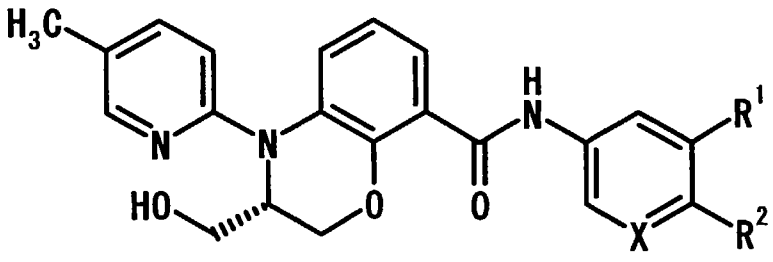
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 古賀 義久 **(KOGA, Yoshihisa)** [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 矢田 伸二 **(YATA, Shinji)** [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 山崎 貴之 **(YAMASAKI, Takayuki)** [JP/JP]; 〒5691125 大阪府高槻市紫町１番１号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 松本 龍弥 **(MATSUMOTO, Tatsuya)** [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). 阪田 昌弘 **(SAKATA, Masahiro)** [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). 近藤 渉 **(KONDO, Wataru)** [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). 堀 義和 **(HORI, Yoshikazu)** [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: 大東 輝雄 **(DAITO, Teruo)**; 〒1080074 東京都港区高輪二丁目２１番４０号 京和工業ビル２階 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: 3,4-DIHYDROBENZOXAZINE COMPOUND AND INHIBITOR OF VANILLOID RECEPTOR TYPE 1 (VR1) ACTIVITY

(54) 発明の名称: ３，４－ジヒドロベンゾオキサジン化合物及びバニロイド受容体１型（ＶＲ１）活性阻害剤



[1]

(57) Abstract: Disclosed is a 3,4-dihydrobenzoxazine compound represented by the formula [1] below, which is useful for the treatment of a disease associated with the activity of a vanilloid receptor type 1 (VR1) such as pain, wherein X represents a nitrogen atom or CR^3; R^1 represents a hydrogen or halogen atom; R^2 represents a C_{1-6} alkoxy group which may be substituted by 1 to 5 substituents independently selected from a halogen atom and a hydroxyl group; and R^3 represents a halogen atom, provided that R^1 is a halogen atom when X is CR^3.

(57) 要約: 本発明の3,4-ジヒドロベンゾオキサジン化合物は、下記式[1](式中、Xは窒素原子又はCR^3、R^1は水素原子又はハロゲン原子、R^2はハロゲン原子及び水酸基から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよいC1-6アルコキシ基、R^3は、ハロゲン原子である。但し、XがCR^3の場合、R^1は、ハロゲン原子である。)で表される。これら化合物は、疼痛などバニロイド受容体1型(VR1)活性が関与する疾患の治療に有効である。

WO 2007/074916 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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, 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, LV, LY, MA, MD, 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, 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, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, 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

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。