(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
2015 年 6 月 18 日(18.06.2015)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2015/087994 A1

(51) 国際特許分類:
*C07D 471/04* (2006.01) *A61P 3/06* (2006.01)
*A61K 31/4545* (2006.01) *A61P 9/04* (2006.01)
*A61K 31/497* (2006.01) *A61P 9/10* (2006.01)
*A61K 31/501* (2006.01) *A61P 13/12* (2006.01)
*A61K 31/506* (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/082943

(22) 国際出願日: 2014 年 12 月 12 日(12.12.2014)

(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 2013-258008 2013 年 12 月 13 日(13.12.2013) JP

(71) 出願人: 第一三共株式会社 (DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 小林　英樹 (KOBAYASHI, Hideki); 〒1408710 東京都品川区広町１丁目２番５８号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 荒井　雅巳 (ARAI, Masami); 〒1408710 東京都品川区広町１丁目２番５８号　第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 金子　俊雄 (KANEKO, Toshio); 〒1408710 東京都品川区広町１丁目２番５８号　第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 寺坂　直生 (TERASAKA, Naoki); 〒1408710 東京都品川区広町１丁目２番５８号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 石橋　公樹，外 (ISHIBASHI, Koki et al.); 〒1400005 東京都品川区広町一丁目２番５８号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP).

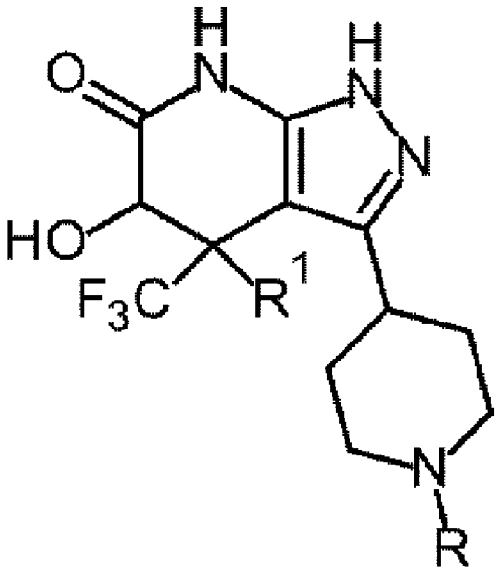
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[続葉有]

(54) **Title**: 5-HYDROXY-4-(TRIFLUOROMETHYL)PYRAZOLOPYRIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 : ５－ヒドロキシ－４－（トリフルオロメチル）ピラゾロピリジン誘導体



(I)

(57) **Abstract**: A compound which has excellent LCAT activation effects, is useful as an active ingredient of a therapeutic or preventive agent for arteriosclerosis, arteriosclerotic cardiovascular disease, coronary heart disease (including heart failure, myocardial infarction, angina, cardiac ischemia, cardiovascular disorder, and angioplastic restenosis), cerebrovascular disease (including cerebral stroke and cerebral infarction), peripheral vascular disease (including diabetic vascular complication), dyslipidemia, low HDL cholesterol, high HDL cholesterol, or kidney disease, in particular, of an anti-arteriosclerosis agent, and is represented by general formula (I) (I) [In the formula, R is an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, and $R^1$ is a hydrogen atom or a hydroxyl group.] or a pharmacologically acceptable salt thereof.

(57) 要約:　優れたＬＣＡＴ活性化作用を有し、動脈硬化症、動脈硬化性心疾患、冠状動脈性心疾患（心不全、心筋梗塞、狭心症、心虚血、心血管障害及び血管形成性再狭窄を含む）、脳血管疾患（脳卒中及び脳梗塞を含む）、末梢血管疾患（糖尿病血管合併症を含む）、脂質異常症、低ＨＤＬコレステロール血症、高ＬＤＬコレステロール血症、又は、腎疾患の治療剤又は予防剤、特に、抗動脈硬化剤の有効成分として有用な一般式（Ｉ）［式中、Ｒは、置換されてよいアリール基又は置換されてよいヘテロアリール基であり、$R^1$は、水素原子又は水酸基である。］で表される化合物、又はその薬理上許容される塩。

WO 2015/087994 A1

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）