

(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
2014年9月18日(18.09.2014)



(10) 国際公開番号

WO 2014/142219 A1

- (51) 国際特許分類:
C07C 279/18 (2006.01) C07D 217/26 (2006.01)
A61K 31/24 (2006.01) C07D 307/80 (2006.01)
A61K 31/343 (2006.01) C07D 333/40 (2006.01)
A61K 31/381 (2006.01) C07D 333/68 (2006.01)
A61K 31/472 (2006.01) C07D 333/70 (2006.01)
A61P 13/12 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/056601
- (22) 国際出願日: 2014年3月13日(13.03.2014)
- (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 2013-050011 2013年3月13日(13.03.2013) JP
- (71) 出願人: アステラス製薬株式会社(ASTELLAS PHARMA INC.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 Tokyo (JP).

- (72) 発明者: 藤安 次郎(FUJIYASU, Jiro); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 浅野 亨(ASANO, Toru); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 山木 晋(YAMAKI, Susumu); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 金子 統(KANEKO, Osamu); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 小池 由佳(KOIKE, Yuka); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 今泉 智禎(IMAIZUMI, Tomoyoshi); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 浦野 泰治(URANO, Yasuharu); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 佐藤 知興(SATOU, Tomohiki); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 笹村 智司(SASAMURA, Satoshi); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 森田 拓, 外(MORITA, Hiroshi et al.); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社 知的財産部内 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, LT, 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, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシ

[続葉有]

(54) Title: GUANIDINOBENZOIC ACID ESTER COMPOUND

(54) 発明の名称: グアニジノ安息香酸エステル化合物

(57) Abstract: [Problem] To provide a compound useful as a drug for preventing and/or treating kidney disease. [Solution] The inventors studied compounds having trypsin-inhibiting activity, confirmed that guanidinobenzoic acid ester compounds have trypsin-inhibiting activity, and completed the invention. These guanidinobenzoic acid ester compounds can be used as drugs for the prevention and/or treatment of kidney disease (for example, chronic kidney disease, acute glomerulonephritis, acute renal failure, and the like) as alternative drugs to a low-protein diet, and/or as drugs for the prevention and/or treatment of diseases in which trypsin participates (for example, chronic pancreatitis, reflux esophagitis, hepatic encephalopathy, influenza, and the like).

(57) 要約: 【課題】 腎臓病の予防及び／又は治療剤として有用な化合物を提供する。【解決手段】 本発明者らは、トリプシン阻害活性を有する化合物について検討し、グアニジノ安息香酸エステル化合物がトリプシン阻害活性を有することを確認し、本発明を完成した。本発明のグアニジノ安息香酸エステル化合物は、低蛋白食療法の代替薬剤としての腎臓病（例えば、慢性腎臓病、急性糸球体腎炎、急性腎障害等）の予防及び／又は治療剤として、及び／又は、トリプシンが関与する疾患（例えば、慢性膵炎、逆流性食道炎、肝性脳症、インフルエンザ等）の予防及び／又は治療剤として使用しうる。



WO 2014/142219 A1



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).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))