

(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
2016年6月16日(16.06.2016)



(10) 国際公開番号
WO 2016/093285 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 471/04 (2006.01) A61P 7/02 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2015/084573
- (22) 国際出願日: 2015年12月9日(09.12.2015)
- (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 2014-249822 2014年12月10日(10.12.2014) JP
特願 2014-263251 2014年12月25日(25.12.2014) JP
特願 2015-046150 2015年3月9日(09.03.2015) JP
特願 2015-160632 2015年8月17日(17.08.2015) JP
- (71) 出願人: 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418526 大阪府大阪市中央区道修町二丁目1番5号 Osaka (JP).
- (72) 発明者: 田中 元之 (TANAKA, Motoyuki); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 近藤隆史 (KONDO, Takashi); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 廣岡 康男 (HIROOKA, Yasuo); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号

号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 西山泰平 (NISHIYAMA, Taihei); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 平松 篤 (HIRAMATSU, Atsushi); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 耕田 智之 (KODA, Tomoyuki); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 神山 祥 (KOUYAMA, Sho); 〒6188585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

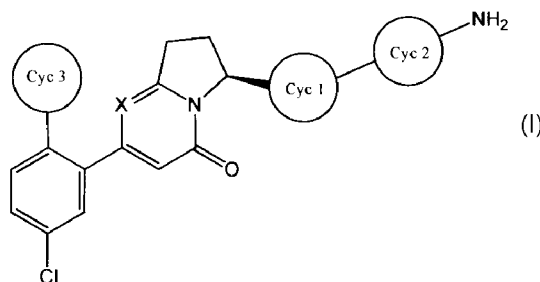
(74) 代理人: 青木 篤, 外 (AOKI, Atsushi et al.); 〒1058423 東京都港区虎ノ門三丁目5番1号 虎ノ門37森ビル 青和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(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,

[続葉有]

(54) Title: DIHYDROINDOLIZINONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ジヒドロインドリジノン誘導体



(57) Abstract: A compound represented by general formula (I) (wherein all symbols are as defined in the description) or a salt, solvate, N-oxide form or prodrug thereof is a potent FXIa inhibitor, has excellent oral absorption properties and kinetics in blood, can exert a potent anti-coagulation activity over a long period of time after being administered orally, and has a discrepancy between the anti-coagulation activity thereof and the CYP-inhibiting activity thereof. Therefore, the compound or the salt, solvate, N-oxide form or prodrug thereof can be used as an efficient prophylactic and/or therapeutic agent for vascular occlusive diseases.

(57) 要約: 一般式 (I) (式中、すべての記号は明細書記載の通り。) で示される化合物、その塩、その溶媒和物、そのN-オキシド体またはそのプロドラッグは、強力なFXIa阻害剤であって、経口吸収性および血中動態に優れ、経口投与後長時間にわたり強力な抗凝固活性を示し、かつ抗凝固活性とCYP阻害活性の間に乖離のある化合物であることから、有用な血栓塞栓性疾患の予防および/または治療剤となり得る。



WO 2016/093285 A1



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).

添付公開書類:
— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))