

(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
2019年10月10日(10.10.2019)



(10) 国際公開番号

WO 2019/194207 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 403/14 (2006.01) A61P 3/10 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2019/014721

(22) 国際出願日: 2019年4月3日(03.04.2019)

(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 2018-072557 2018年4月4日(04.04.2018) JP

(71) 出願人: 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: 三浦 智也(MIURA, Tomoya); 〒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). 平島 新太郎(HIRASHIMA, Shintaro); 〒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).

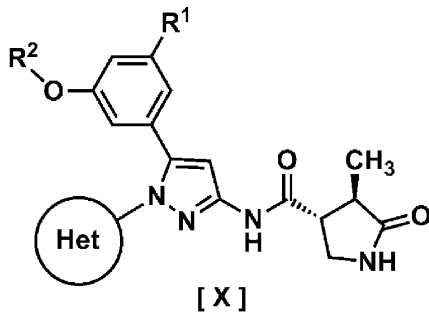
府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社医薬総合研究所内 Osaka (JP). 眞部 知幸(MANABE, Tomoyuki); 〒5691125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社医薬総合研究所内 Osaka (JP). 飯田 哲也(HIDA, Tetsuya); 〒5691125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社医薬総合研究所内 Osaka (JP). 櫻井 健太郎(SAKURAI, Kentaro); 〒5691125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社医薬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 山尾 憲人, 外 (YAMAO, Norihito et al.); 〒5300017 大阪府大阪市北区角田町8番1号 梅田阪急ビルオフィスタワー 青山特許事務所 Osaka (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, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,

(54) Title: HETEROARYL-SUBSTITUTED PYRAZOLE COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: ヘテロアリアルで置換されたピラゾール化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: Disclosed are: a heteroaryl-substituted pyrazole compound or a pharmaceutically acceptable salt thereof having SGLT1 inhibitory activity and medicinal usefulness; a medicinal composition comprising same; and medicinal uses of the compound, salt, and composition. Specifically, a compound represented by formula [X] (in the formula, R¹ is hydrogen or halogen, R² is C₁₋₆ alkyl or halo-C₁₋₆-alkyl, RingHet is a substituted pyridyl or a substitutable pyrazinyl, pyrimidinyl or pyridazinyl) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, a medicinal composition comprising same, and medicinal uses of the compound, salt, and composition are provided.

(57) 要約: SGLT1 阻害活性を有し、医薬として有用な、ヘテロアリアルで置換されたピラゾール化合物又はその製薬上許容される塩及びそれを含有する医薬組成物並びにそれらの医薬用途が開示される。具体的には、式 [X]: [式中、R¹は水素又はハロゲンであり、R²はC₁₋₆アルキル又はハロC₁₋₆アルキルであり、環Hetは置換ピリジル、又は置換されてもよいピラジニル、ピリミジニル若しくはピリダジニルである]の化合物又はその製薬上許容される塩及びそれを含有する医薬組成物並びにそれらの医薬用途が提供される。

[続葉有]

WO 2019/194207 A1

HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, 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).

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第21条(3))