

(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8月8日(08.08.2019)



(10) 国際公開番号

WO 2019/151274 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 487/04 (2006.01) A61P 9/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) A61P 9/12 (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01) C07D 498/04 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2019/003052

(22) 国際出願日: 2019年1月30日(30.01.2019)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

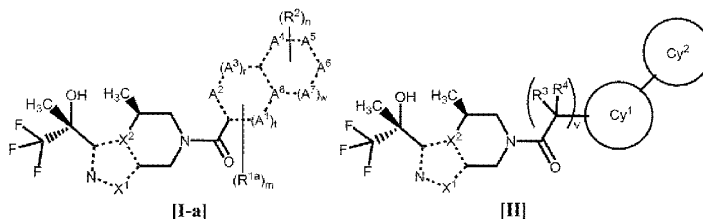
(30) 優先権データ:
特願 2018-016328 2018年2月1日(01.02.2018) JP

(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: 前場 貴樹(MAEBE, Takaki); 〒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). 須澤 孝一(SUZAWA, Koichi); 〒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). 古徳 将之(KOTOKU, Masayuki); 〒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). 増尾 律己(MASUO, Ritsuki); 〒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). 元田 大(MOTODA, Dai); 〒5691125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式

(54) Title: NITROGENATED HETEROCYCLIC AMIDE COMPOUND, AND USE THEREOF FOR MEDICAL PURPOSES

(54) 発明の名称: 含窒素複素環アミド化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: The present invention provides a compound which has a PDHK-inhibiting activity and is useful for the treatment or prevention of diabetes (type 1 diabetes, type 2 diabetes, etc.), insulin resistance syndrome, metabolic syndrome, hyperglycemia, hyperlactatemia, diabetes complications (diabetic neuropathy, diabetic retinopathy, diabetic nephropathy, cataract, etc.), heart failure (acute heart failure, chronic heart failure), cardiomyopathy, myocardial ischemia, myocardial infarction, angina pectoris, dyslipidemia, atherosclerosis, peripheral arterial disease, intermittent claudication, chronic obstructive pulmonary disease, brain ischemia, stroke, mitochondrial disease, mitochondrial encephalomyopathy, cancer, pulmonary hypertension or Alzheimer's disease. The present invention relates to a compound represented by formula [I-a] or [II] or a pharmaceutically acceptable salt thereof. [In the formulae, each symbol is as defined in the description.]

(57) 要約: 本発明は、PDHK阻害活性を有し、糖尿病(1型糖尿病、2型糖尿病等)、インスリン抵抗性症候群、メタボリックシンドローム、高血糖症、高乳酸血症、糖尿病合併症(糖尿病性神経障害、糖尿病性網膜症、糖尿病性腎症、白内障等)、心不全(急性心不全、慢性心不全)、心筋症、心筋虚血症、心筋梗塞、狭心症、脂質異常症、アテローム性硬化症、末梢動脈疾患、間欠性跛行、慢性閉塞性肺疾患、脳虚血症、脳卒中、ミトコンドリア病、ミトコンドリア脳筋症、癌、肺高血圧症、またはアルツハイマー病の治療または予防のために有用な化合物を提供する。本発明は、式[I-a]もしくは式[II]の化合物、またはその製薬上許容される塩に関する。〔式中の各記号は明細書に記載のものと同義である。〕

[続葉有]

WO 2019/151274 A1

会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 山岡 信
貴(YAMAOKA, Nobutaka); 〒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: 高 島 一 (TAKASHIMA, Hajime);
〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町
四丁目 1 番 1 号 明治安田生命大阪
御堂筋ビル 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,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, 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))
- 明細書の別個の部分として表した配列リスト
(規則5.2(a))