

(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
2023年3月9日(09.03.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/032987 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 487/04 (2006.01) A61P 9/10 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01) A61P 13/12 (2006.01)
A61K 31/5355 (2006.01) A61P 17/00 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) A61P 19/02 (2006.01)
A61K 31/5386 (2006.01) A61P 19/06 (2006.01)
A61K 31/541 (2006.01) A61P 25/00 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/551 (2006.01) A61P 27/04 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01) A61P 37/02 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01) A61P 37/06 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01) A61P 37/08 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)

(71) 出願人: 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒1056927 東京都港区虎ノ門四丁目1番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 大場 雄介 (OHBA, Yusuke); 〒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). 足達 馨 (ADACHI, Kaoru); 〒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). 西丸 達也 (NISHIMARU, Tatsuya); 〒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). 生越 洋介 (OGOSHI, Yosuke); 〒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). 佐藤 晋平 (SATO, Shimpei); 〒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).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/032606

(22) 国際出願日: 2022年8月30日(30.08.2022)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

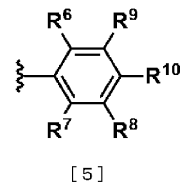
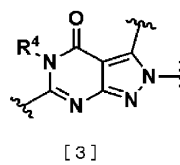
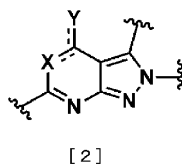
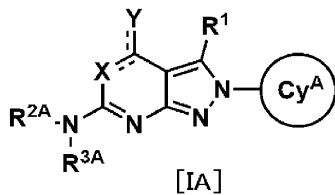
(30) 優先権データ:

特願 2021-141253 2021年8月31日(31.08.2021) JP
特願 2022-068967 2022年4月19日(19.04.2022) 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

(54) Title: 6-AMINOPYRAZOLOPYRIMIDINE COMPOUND AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 6-アミノピラゾロピリミジン化合物及びその医薬用途



(57) Abstract: Provided are: a 6-aminopyrazolopyrimidine compound having an inhibitory activity on NLRP3 inflammasomes or a pharmaceutically acceptable salt thereof; a pharmaceutical composition containing the same; and a pharmaceutical use thereof. A compound represented by formula [IA] or a pharmaceutically acceptable salt thereof. [IA] (In the formula, the partial structure [2] is a structure represented by formula [3] (in the formula, R⁴ is hydrogen or a C₁₋₄ alkyl (where the alkyl may be substituted with hydroxy or cyano)), and a cyclic group Cy^A is a group represented by formula [5] (in the formula, R⁶ and R⁷ are each independently hydrogen, hydroxy, cyano, C₁₋₆ alkyl, or the like, R⁸ and R⁹ are each independently hydrogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl, and R¹⁰ is hydrogen, cyano, C₁₋₆ alkyl, or the like), R¹ is hydrogen or C₁₋₄ alkyl, R^{2A} and R^{3A} are each independently hydrogen, C₁₋₆ alkyl, or the like, or R^{2A} and R^{3A} together with a nitrogen atom to which they are bonded may form a 4-membered to 7-membered heterocycloalkyl, or the like, to which a -NR^{2A}R^{3A} group may be substituted.)

[続葉有]

1 号 大阪梅田ツインタワーズ・ノース
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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, 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:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(57) 要約: NLRP3 インフラマソーム阻害活性を有する 6-アミノピラゾロピリミジン化合物又はその製薬上許容される塩、それを含む医薬組成物、及びその医薬用途等が提供される。式 [1A] の化合物又はその製薬上許容される塩。[1A] {式中、部分構造: [2] は、式: [3] {式中、R⁴は、水素又はC₁₋₄アルキル(ここで、該アルキルは、ヒドロキシ又はシアノで置換されてもよい)である}で示される構造等であり、環基Cy^Aは、式: [5] (式中、R⁶及びR⁷は各々独立して、水素、ヒドロキシ、シアノ、C₁₋₆アルキル等であり、R⁸及びR⁹は各々独立して、水素、C₁₋₄アルキル、又はC₁₋₄ハロアルキルであり、R¹⁰は、水素、シアノ、C₁₋₆アルキル等である)で示される基等であり、R¹は、水素又はC₁₋₄アルキルであり、R^{2A}及びR^{3A}は各々独立して、水素、C₁₋₆アルキル等であるか、あるいは、R^{2A}とR^{3A}が、これらが結合する窒素原子と一緒にあって、-NR^{2A}R^{3A}基が置換されてもよい4から7員のヘテロシクロアルキル等を形成してもよい}