(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
2012 年 9 月 20 日(20.09.2012)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/124696 A1

(51) 国際特許分類:
*C07D 205/04* (2006.01)
*A61K 31/426* (2006.01)
*A61K 31/4402* (2006.01)
*A61K 31/4545* (2006.01)
*A61K 31/495* (2006.01)
*A61K 31/496* (2006.01)
*A61K 31/505* (2006.01)
*A61K 31/506* (2006.01)
*A61K 31/5377* (2006.01)
*A61K 31/551* (2006.01)
*A61P 1/02* (2006.01)
*A61P 1/04* (2006.01)
*A61P 1/16* (2006.01)
*A61P 3/04* (2006.01)
*A61P 3/10* (2006.01)
*A61P 9/00* (2006.01)
*A61P 9/10* (2006.01)
*A61P 9/12* (2006.01)
*A61P 11/00* (2006.01)
*A61P 11/06* (2006.01)
*A61P 13/12* (2006.01)
*A61P 17/00* (2006.01)
*A61P 17/04* (2006.01)
*A61P 17/06* (2006.01)
*A61P 19/02* (2006.01)
*A61P 19/06* (2006.01)
*A61P 21/00* (2006.01)
*A61P 25/00* (2006.01)
*A61P 25/04* (2006.01)
*A61P 25/28* (2006.01)
*A61P 27/02* (2006.01)
*A61P 29/00* (2006.01)
*A61P 37/00* (2006.01)
*A61P 37/02* (2006.01)
*A61P 37/06* (2006.01)
*A61P 43/00* (2006.01)
*C07D 211/26* (2006.01)
*C07D 211/46* (2006.01)
*C07D 211/56* (2006.01)
*C07D 211/58* (2006.01)
*C07D 211/62* (2006.01)
*C07D 217/22* (2006.01)
*C07D 237/20* (2006.01)
*C07D 239/34* (2006.01)
*C07D 239/42* (2006.01)
*C07D 239/48* (2006.01)
*C07D 241/04* (2006.01)
*C07D 241/20* (2006.01)
*C07D 243/08* (2006.01)
*C07D 277/20* (2006.01)
*C07D 277/42* (2006.01)
*C07D 277/44* (2006.01)
*C07D 277/46* (2006.01)
*C07D 277/56* (2006.01)
*C07D 277/62* (2006.01)
*C07D 295/08* (2006.01)
*C07D 295/18* (2006.01)
*C07D 295/20* (2006.01)
*C07D 295/22* (2006.01)
*C07D 307/24* (2006.01)
*C07D 309/04* (2006.01)
*C07D 309/06* (2006.01)
*C07D 309/08* (2006.01)
*C07D 309/14* (2006.01)
*C07D 401/04* (2006.01)
*C07D 401/06* (2006.01)
*C07D 401/12* (2006.01)
*C07D 401/14* (2006.01)
*C07D 403/04* (2006.01)
*C07D 403/12* (2006.01)
*C07D 403/14* (2006.01)
*C07D 405/04* (2006.01)
*C07D 405/06* (2006.01)
*C07D 405/12* (2006.01)
*C07D 405/14* (2006.01)
*C07D 409/12* (2006.01)
*C07D 413/04* (2006.01)
*C07D 413/12* (2006.01)
*C07D 413/14* (2006.01)
*C07D 417/12* (2006.01)
*C07D 471/04* (2006.01)
*C07D 471/10* (2006.01)
*C07D 213/38* (2006.01)
*C07D 213/74* (2006.01)
*C07D 213/79* (2006.01)
*C07D 213/80* (2006.01)
*C07D 213/81* (2006.01)
*C07D 217/06* (2006.01)
*C07D 487/04* (2006.01)
*C07D 487/08* (2006.01)
*C07D 487/10* (2006.01)
*C07D 495/04* (2006.01)
*C07D 513/04* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2012/056429

(22) 国際出願日: 2012 年 3 月 13 日(13.03.2012)

(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 2011-056031 2011 年 3 月 15 日(15.03.2011) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 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３番１１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 吉原　耕生 **(YOSHIHARA, Kousei)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１号　アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 鈴木　大輔 **(SUZUKI, Daisuke)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１号　アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 山木　晋 **(YAMAKI, Susumu)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１号　アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 山田　弘美 **(YAMADA, Hiroyoshi)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１号　アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 三原　久史 **(MIHARA, Hisashi)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１号　アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 関　規夫 **(SEKI, Norio)** [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目３番１１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３番１

[続葉有]

(54) **Title**: GUANIDINE COMPOUND

(54) 発明の名称 : グアニジン化合物

(57) **Abstract**: [Problem] To provide a compound which is useful as an active ingredient of a pharmaceutical composition, especially of a pharmaceutical composition for the prophylaxis and/or treatment of VAP-1 associated diseases. [Solution] As a result of intensive studies on a compound having VAP-1 inhibitory activity, the inventors have achieved the present invention by discovering that a compound of the present invention or a salt thereof has excellent VAP-1 inhibitory activity and is thus useful for the prophylaxis and/or treatment of VAP-1 associated diseases, especially for the prophylaxis and/or treatment of diabetic nephropathy or diabetic macular edema. The present invention also relates to a pharmaceutical composition, particularly a pharmaceutical composition for the prophylaxis and/or treatment of VAP-1 associated diseases, said pharmaceutical composition containing a compound of the present invention or a salt thereof and an excipient.

(57) 要約: 【課題】　本発明は、医薬組成物、殊に、VAP-1 関連疾患の予防及び／又は治療用医薬組成物の有効成分として有用な化合物を提供する。 【解決手段】　本発明者らは、VAP-1 阻害活性を有する化合物について鋭意検討した結果、本発明化合物又はその塩が、優れた VAP-1 阻害活性を示し、VAP-1 関連疾患、特に糖尿病性腎症若しくは糖尿病性黄斑浮腫の予防及び／又は治療に有用であることを見出し、本発明を完成した。また、本発明は、本発明化合物又はその塩、及び賦形剤を含有する医薬組成物、殊に、VAP-1 関連疾患の予防及び／又は治療用医薬組成物に関する。

WO 2012/124696 A1

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, 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, IS, JP, KE, KG, KM, 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, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, 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), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）