

(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
2013 年 2 月 7 日(07.02.2013)



(10) 国際公開番号
WO 2013/018837 A1

(51) 国際特許分類:

A61K 31/4015 (2006.01) A61P 9/04 (2006.01)
A61K 38/22 (2006.01) A61P 11/00 (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01) A61P 13/00 (2006.01)
A61K 47/40 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01) C07D 207/26 (2006.01)
A61P 7/10 (2006.01) C08B 37/16 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2012/069609

(22) 国際出願日: 2012 年 8 月 1 日(01.08.2012)

(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 2011-169389 2011 年 8 月 2 日(02.08.2011) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 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; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 金治 敏也 (KANAJI, Toshiya) [JP/JP]; 〒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). 洲邊 和寛 (FUCHIBE, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒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). ▲高▼橋 正弥(TAKAHASHI, Masaya) [JP/JP]; 〒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 3 7 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, 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), ユーロパ (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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

(54) Title: LEFT VENTRICULAR DIASTOLIC FUNCTION IMPROVING AGENT

(54) 発明の名称: 左室拡張機能改善剤

(57) Abstract: Provided is a therapeutic agent for heart failure, which can improve the diastolic function of the left ventricle without relying on the diuretic activity or the vasodilatory activity thereof and therefore can control the condition of impaired vasodilatation so as to prevent the recurrence of impaired vasodilatation, and can also improve breathing difficulty or death associated with the condition of impaired vasodilatation. 4-[(2-{(2R)-2-[(1E,3S)-4-(4-Fluorophenyl)-3-hydroxy-1-butene-1-yl]-5-oxo-1-pyrrolidiny]ethyl}thio]butanoic acid can act on the heart directly to improve the diastolic function of the left ventricle, and therefore can treat heart failure, particularly impaired vasodilatation, effectively. Thus, the present invention can provide a novel therapeutic agent for heart failure, which can improve impaired vasodilatation for which any effective treatment method is not established yet.

(57) 要約: 利尿作用や血管拡張作用に依らず左心室の拡張機能そのものを改善して、拡張機能不全の病態をコントロールして再発を防ぎ、同病態による呼吸困難や致死を改善し得る心不全の治療剤を提供する。4-[(2-{(2R)-2-[(1E, 3S)-4-(4-フルオロフェニル)-3-ヒドロキシ-1-ブテン-1-イル]-5-オキソ-1-ピロリジニル}エチル)チオ]ブタン酸は、心臓に直接作用することで、左心室の拡張機能を改善し、心不全の中でも、とりわけ、拡張機能不全を効果的に治療し得る。したがって、本発明により、有効な治療方法が確立していない拡張機能不全を改善しうる、新たな心不全治療剤を提供することができる。

WO 2013/018837 A1