(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
2004 年10 月21 日 (21.10.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/089918 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 263/32, 417/14, 333/20, 413/12, 417/06, 409/12, 333/38, 333/16, 333/18, 277/22, 277/28, 417/12, A61K 31/421, 31/4439, 31/4725, 31/538, 31/497, 31/4184, 31/427, 31/428, 31/381, 31/405, 31/4155, 31/423, 45/00, A61P 43/00, 3/10, 3/06, 3/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/005119

(22) 国際出願日: 2004 年4 月9 日 (09.04.2004)

(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2003-105267 2003 年4 月9 日 (09.04.2003) JP
特願2003-157590 2003 年6 月3 日 (03.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 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).

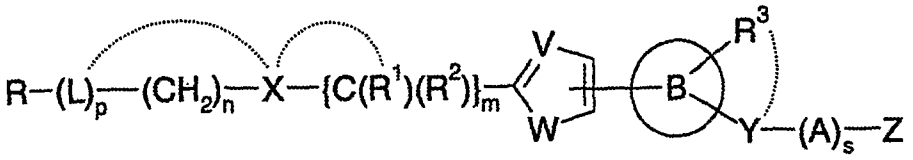
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 池本 知之 (IKEMOTO, Tomoyuki) [JP/JP]; 〒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). 田中 正浩 (TANAKA, Masahiro) [JP/JP]; 〒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). 油納 健夫 (YUNO, Takeo) [JP/JP]; 〒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). 坂本 丞平 (SAKAMOTO, Johei) [JP/JP]; 〒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). 中西 博行 (NAKANISHI, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒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). 中川 祐一 (NAKAGAWA, Yuichi) [JP/JP]; 〒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). 太田 毅 (OHTA, Takeshi) [JP/JP]; 〒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). 坂田 昌平 (SAKATA, Shohei) [JP/JP]; 〒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). 森長 寿代 (MORINAGA, Hisayo) [JP/JP]; 〒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).

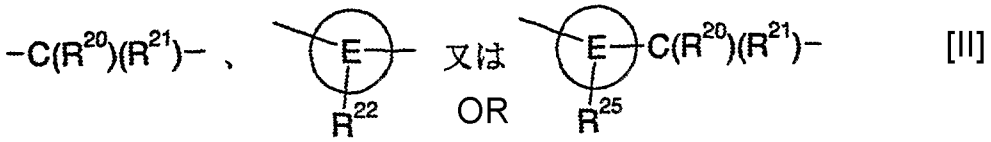
[続葉有]

(54) Title: HETEROAROMATIC PENTACYCLIC COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 複素芳香５員環化合物及びその医薬用途



[I]



[II]

(57) Abstract: A heteroaromatic pentacyclic compound of the general formula: [I] [wherein V is CH or N; W is S or O; each of R^1 and R^2 is H, etc.; X is -N(R^4)-, -O-, -S-, -SO_2-N(R^5)-, -CO-N(R^7)-, etc.; L is formula [II]; (Each of R^{20}, R^{21}, R^{22} and R^{25} is H, etc.; and E is an aryl or an aromatic heterocycle); R is -COOH, etc.; B is an aryl, etc.; R^3 is H, etc.; Y is -C(R^{13})(R^{14})-N(R^{12})-, -C(R^{13})(R^{14})-O-, -N(R^{11})-, -O-, etc.; A is an alkylene; Z is an aryl, etc.; etc.]. This compound or its prodrug or a pharmaceutically acceptable salt thereof has a protein tyrosine phosphatase 1B inhibiting activity and is useful as a curative medicine for diabetes mellitus, diabetes mellitus complications, hyperlipemia or obesity.

[続葉有]

WO 2004/089918 A1

(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２番１４号 藤村大和生命ビル 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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

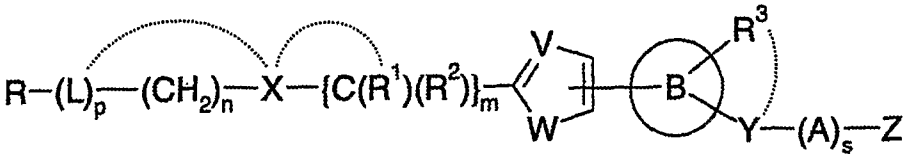
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書
— 補正書・説明書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

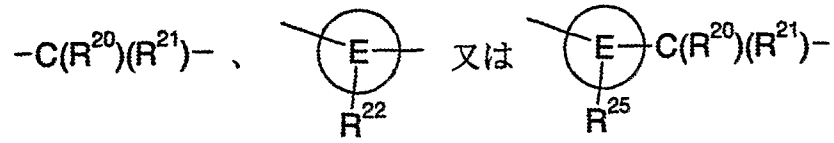
(57) 要約:

一般式［Ｉ］



[I]

〔式中、ＶはＣＨ又はＮ；Ｗは Ｓ又はＯ；R^1及びR^2はＨ等；Ｘは－Ｎ（R^4）－、－Ｏ－、－Ｓ－、－SO_2－Ｎ（R^5）－、－ＣＯ－Ｎ（R^7）－等；Ｌは



（R^{20}、R^{21}、R^{22}及びR^{25}はＨ等；Ｅはアリール又は芳香族ヘテロ環基）；Ｒは－ＣＯＯＨ等；Ｂはアリール等；R^3はＨ等；Ｙは－Ｃ（R^{13}）（R^{14}）－Ｎ（R^{12}）－、－Ｃ（R^{13}）（R^{14}）－Ｏ－、－Ｎ（R^{11}）－、－Ｏ－等；Ａはアルキレン；Ｚはアリール等；等〕で示される複素芳香５員環化合物若しくはそのプロドラッグ、又はそれらの医薬上許容し得る塩は、蛋白質チロシンホスファターゼ１Ｂ阻害活性を有し、糖尿病、糖尿病合併症、高脂血症、肥満症の治療薬として有用である。