

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004年2月19日 (19.02.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/014932 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07H 17/02, A61K 31/7056, A61P 3/04, 3/06, 3/10, 9/04, 9/10, 9/12, 19/06, 43/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/010048
- (22) 国際出願日: 2003年8月7日 (07.08.2003)
- (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2002-232074 2002年8月8日 (08.08.2002) JP
特願2002-321729 2002年11月5日 (05.11.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野 1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 寺西 弘孝 (TERANISHI, Hirotaka) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県

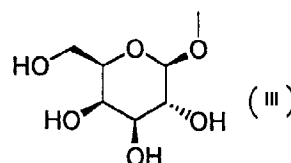
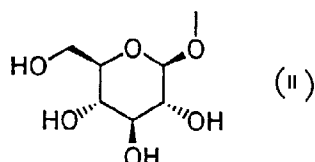
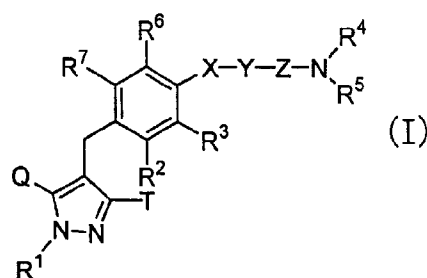
南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伏見 信彦 (FUSHIMI, Nobuhiko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 米窪 滋 (YONEKUBO, Shigeru) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 清水 和夫 (SHIMIZU, Kazuo) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 柴崎 利英 (SHIBAZAKI, Toshihide) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治 正幸 (ISAJI, Masayuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町大字柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,

[続葉有]

(54) Title: PYRAZOLE DERIVATIVE, MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME, MEDICINAL USE THEREOF, AND INTERMEDIATE FOR PRODUCTION THEREOF

(54) 発明の名称: ピラゾール誘導体、それを含有する医薬組成物、その医薬用途及びその製造中間体



(57) Abstract: A pyrazole derivative represented by the general formula (I) (wherein R¹ is H, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; either of Q and T is the group of the formula (II) or the formula (III) and the other is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; R² is H, halogeno, OH, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; X is a single bond, O, or S; Y is a single bond, C₁₋₆ alkylene, etc.; Z is CO or SO₂; R⁴ and R⁵ each is H, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; and R³, R⁶, and R⁷ each is H, halogeno, etc.), a pharmacologically acceptable salt of the derivative, or a prodrug of either. They have excellent human SGLT1 inhibitory activity and are useful as a preventive or therapeutic agent for diseases attributable to hyperglycemia such as diabetes, complications of diabetes, and obesity.

[続葉有]

WO 2004/014932 A1



DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, 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.

GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (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

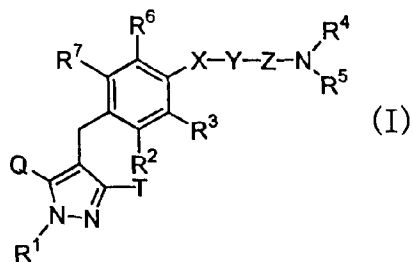
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,

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。

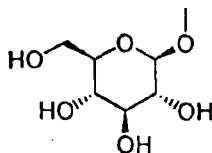
(57) 要約:

本発明は、優れたヒト SGLT1 活性阻害作用を発現し、糖尿病、糖尿病性合併症、肥満症等の高血糖症に起因する疾患の予防又は治療薬として有用な、

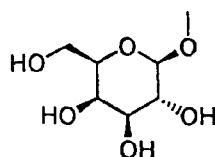
一般式



(式中のR¹はH、置換可C₁₋₆アルキル基等であり；Q及びTは一方が式



または式



であり、他方が置換可C₁₋₆アルキル基等であり；R²はH、ハロゲン原子、OH、置換可C₁₋₆アルキル基等であり；Xは単結合、O又はSであり；Yは単結合、C₁₋₆アルキレン基等であり；ZはCO又はSO₂であり；R⁴及びR⁵はH、置換可C₁₋₆アルキル基等であり；R³、R⁶及びR⁷はH、ハロゲン原子等である）で表されるピラゾール誘導体またはその薬理学的に許容される塩、或いはそれらのプロドラッグ、それを含有する医薬組成物及びその医薬用途、並びにその製造中間体を提供するものである。