

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2006年2月2日 (02.02.2006)

PCT

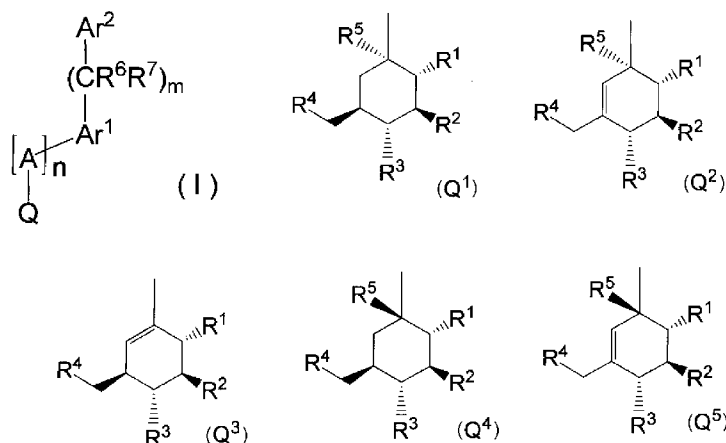
(10) 国際公開番号
WO 2006/011469 A1

- (51) 国際特許分類:
C07C 43/23 (2006.01) *C07D 317/54* (2006.01)
C07C 43/253 (2006.01) *C07D 213/65* (2006.01)
C07C 65/26 (2006.01) *C07D 231/12* (2006.01)
C07C 69/94 (2006.01) *C07D 333/56* (2006.01)
C07C 217/56 (2006.01) *A61K 31/085* (2006.01)
C07C 235/42 (2006.01) *A61K 31/343* (2006.01)
C07C 255/54 (2006.01) *A61K 31/4409* (2006.01)
C07C 317/22 (2006.01) *A61K 31/415* (2006.01)
C07C 323/20 (2006.01) *A61K 31/381* (2006.01)
C07D 209/12 (2006.01) *A61P 3/04* (2006.01)
C07D 307/80 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/013634
- (22) 国際出願日: 2005年7月26日 (26.07.2005)
- (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2004-217065 2004年7月26日 (26.07.2004) JP
 特願2004-340104 2004年11月25日 (25.11.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 中外製薬株式会社 (CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1158543 東京都北区浮間5丁目5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): 松岡 宏治 (MATSUOKA, Hiroharu) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門1丁目135番地 中外製薬株式会

[続葉有]

(54) Title: NOVEL CYCLOHEXANE DERIVATIVE, PRODRUG THEREOF AND SALT THEREOF, AND THERAPEUTIC AGENT CONTAINING THE SAME FOR DIABETES

(54) 発明の名称: 新規なシクロヘキサン誘導体、そのプロドラッグおよびその塩、ならびにそれらを含む糖尿病治療薬



(57) Abstract: A cyclohexane derivative having the function of reducing a blood sugar level and having preferable properties required of medicines, such as long-lasting drug activity, metabolic stability, and safety; and a medicinal composition for use in the prevention or treatment of diseases attributable to hyperglycemia, such as diabetes, e.g., insulin dependent diabetes mellitus (type 1 diabetes) or noninsulin-dependent diabetes mellitus (type 2 diabetes), complications of diabetes, and obesity. The derivative is a compound represented by the formula (I): (wherein A is -O-, -CH₂-, or -NH-; n is an integer selected between 0 and 1; R and R⁷ each independently is hydrogen or C₁₋₆ alkyl; m is an integer selected among 1-3; Q is selected among the following formulae Q¹ to Q⁵; Ar¹ is optionally substituted arylene or optionally substituted heteroarylene, provided that the heteroarylene may be bonded to an aromatic carbocycle or aromatic heterocycle to form a fused ring; and Ar² is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl), a prodrug of the compound, or a pharmaceutically acceptable salt of either. Also provided are a medicine, a medicinal composition, or the like each containing the compound.

(57) 要約: 本発明の目的は、血糖降下作用を有し、さらに薬効持続性、代謝安定性または安全性などの医薬品として好ましい特性を有するシクロヘキサン誘導体を提供すること、およびインスリン依存性糖尿病 (1型糖尿病)、インスリン非依存性糖尿病 (

[続葉有]

WO 2006/011469 A1



社内 Shizuoka (JP). 佐藤 勉 (SATO, Tsutomu) [JP/JP];
〒4128513 静岡県御殿場市駒門 1 丁目 1 3 5 番
地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 西本 昌弘
(NISHIMOTO, Masahiro) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県
御殿場市駒門 1 丁目 1 3 5 番地 中外製薬株式会
社内 Shizuoka (JP). 新聞 信夫 (SHIMMA, Nobuo) [JP/JP];
〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原 2 0 0 中外製薬株式
会社内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 社本 一夫, 外 (SHAMOTO, Ichio et al.); 〒
1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 新大
手町ビル 2 0 6 区 ユアサハラ法律特許事務所 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, 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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,

MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU,
SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, 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, NA, 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,
IS, IT, LT, LU, LV, 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

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。

2 型糖尿病) などの糖尿病、糖尿病性合併症、肥満症などの高血糖症に起因する疾患の予防または治療のために
用いられる医薬組成物を提供することである。本発明により、式 (I) [式中、A は $-O-$ 、 $-CH_2-$ 、または
 $-NH-$ であり、n は 0 および 1 から選択される整数であり、 R^6 および R^7 は、それぞれ独立に、水素原子ま
たは C_1-C_6 アルキル基であり、m は 1 ~ 3 から選択される整数であり、Q は、下式で表される $Q^1 \sim Q^5$ から選択
され、 $A r^1$ は、置換されていてもよいアリーレン基、または置換されていてもよいヘテロアリーレン基であり、
当該ヘテロアリーレン基は芳香族炭素環または芳香族ヘテロ環と縮合環を形成していてもよく、 $A r^2$ は、置換さ
れていてもよいアリール基、または置換されていてもよいヘテロアリール基である] の化合物またはそのプロド
ラッグ、もしくはそれらの製薬上許容されうる塩、ならびに当該化合物を含む医薬、医薬組成物などが提供され
る。