

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 3 月 4 日 (04.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/018491 A1(51) 国際特許分類: C07H 17/02, A61K 31/7056,
31/10, 31/205, 31/37, 31/4166, 31/7072, 31/737, 38/00,
38/26, 38/27, 38/28, 45/00, A61P 3/04, 3/06, 3/10, 5/48,
7/10, 9/04, 9/10, 9/12, 19/06, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/010551

(22) 国際出願日: 2003 年 8 月 21 日 (21.08.2003)

(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2002-244381 2002 年 8 月 23 日 (23.08.2002) JP
特願2002-324076 2002 年 11 月 7 日 (07.11.2002) 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).

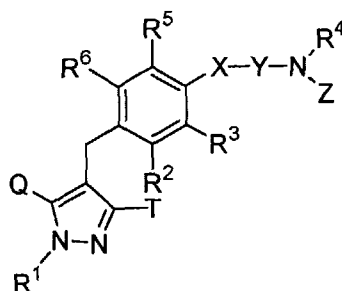
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 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). 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). 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). 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). 戸前 昌
樹 (TOMAE, Masaki) [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

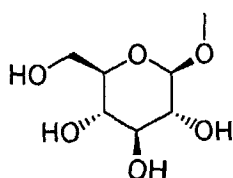
[続葉有]

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

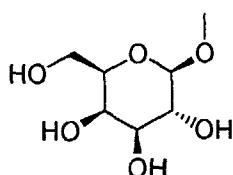
(54) 発明の名称: ピラゾール誘導体、それを含有する医薬組成物、その医薬用途及びその製造中間体



(I)



(II)



(III)

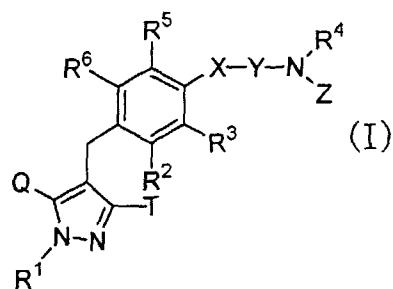
(57) Abstract: A pyrazole derivative represented by the general formula (I) [wherein R¹ is H, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; either of Q and T is the group of the formula (II) or the formula (III) and the other is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; R² is H, halogeno, OH, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; X is a single bond, O, or S; Y is optionally substituted C₁₋₆ alkylene, etc.; Z is -R^B, -COR^C, etc. (R^B is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; and R^C is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.); R⁴ is H, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; and R³, R⁵, and R⁶ 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, impaired glucose tolerance, fasting blood sugar abnormality, complications of diabetes, and obesity and for diseases attributable to an increased blood galactose level such as galactosemia.

[続葉有]

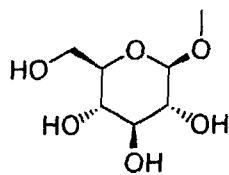
WO 2004/018491 A1

(57) 要約:

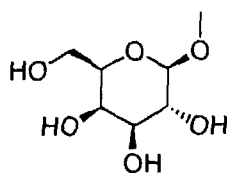
本発明は、優れたヒト SGLT1 活性阻害作用を発現し、糖尿病、耐糖能異常、空腹時血糖異常、糖尿病性合併症、肥満症等の高血糖症に起因する疾患やガラクトース血症等の血中ガラクトース値の上昇に起因する疾患の予防又は治療薬として有用な、一般式



(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 は置換可 C₁₋₆ アルキレン基等であり；Z は -R³、-COR⁶ 等（R³ は置換可 C₁₋₆ アルキル基等であり；R⁶ は置換可 C₁₋₆ アルキル基等である）であり；R⁴ は H、置換可 C₁₋₆ アルキル基等であり；R³、R⁵ 及び R⁶ 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。



業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治 正幸 (ISA,JI,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, 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.

- (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, 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

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。