(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
2003 年4 月3 日 (03.04.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/027077 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 237/14, A61K 31/50, 31/501, A61P 37/02, 29/00, 9/00, 19/10, 31/04, 29/00, 19/02, 1/04, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/09863

(22) 国際出願日: 2002 年9 月25 日 (25.09.2002)

(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:
60/324,569 2001 年9 月26 日 (26.09.2001) US

(71) 出願人: 興和株式会社 (KOWA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒460-8625 愛知県 名古屋市中区錦 三丁目６番２９号 Aichi (JP).

(72) 発明者: 京谷 善徳 (KYOTANI,Yoshinori); 〒207-0021 東京都 東大和市立野 3丁目1293-10-2-112 Tokyo (JP). 古志 朋之 (KOSHI,Tomoyuki); 〒353-0006 埼玉県 志木市館 2丁目4-4-206 Saitama (JP). 執行 洋陸 (SHIGYO,Hiromichi); 〒183-0035 東京都 府中市四谷 6丁目18-18 Tokyo (JP). 吉崎 栄男 (YOSHIZAKI,Hideo); 〒350-1315 埼玉県 狭山市北入曽 459-16 Saitama (JP). 北村 崇博 (KITAMURA,Takahiro); 〒189-0001 東京都 東村山市秋津町 1丁目25-7 Tokyo (JP). 竹村 俊司 (TAKEMURA,Shunji); 〒192-0045 東京都 八王子市大和田町 5丁目31-18 Tokyo (JP). 安岡 京子 (YASUOKA,Kyoko); 〒207-0012 東京都 東大和市新堀 3丁目19-3-305 Tokyo (JP). 戸塚 順子 (TOTSUKA,Junko); 〒351-0012 埼玉県 朝霞市栄町 459-16 Saitama (JP). 佐藤 精一 (SATO,Seiichi); 〒167-0043 東京都 杉並区上荻 4丁目4-1-202 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒103-0013 東京都 中央区日本橋人形町 1丁目3番6号共同ビル Tokyo (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, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

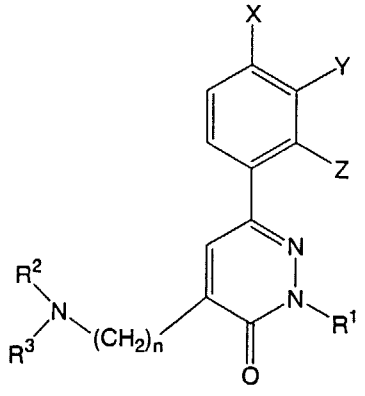
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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。

(54) **Title:** WATER-SOLUBLE PHENYLPYRIDAZINE DERIVATIVES AND DRUGS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 水溶性フェニルピリダジン誘導体及びこれを含有する医薬



(1)

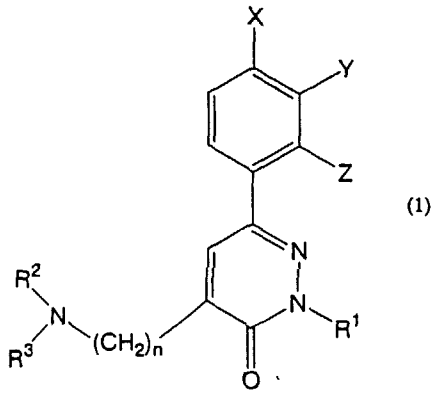
(57) **Abstract:** Compounds represented by the following general formula (1), which have an effect of inhibiting IL-β production, are highly soluble in water and have a favorable oral absorbability, and medicinal compositions containing the same: (1) wherein R^1 represents alkyl, alkenyl, etc.; R^2 and R^3 represent each hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl, dihydroxyalkyl or alkynyl, or R^2 and R^3 may form together with the adjacent nitrogen atom an optionally substituted nitrogen-containing saturated heterocyclic group; X, Y and Z represent each hydrogen, alkyl, halogeno, etc.; and n is from 1 to 5.

[続葉有]

WO 03/027077 A1

(57) 要約:

本発明は一般式（１）



(1)

（式中、Ｒ[1]は、アルキル、アルケニル基等を示し；

Ｒ[2]及びＲ[3]は、それぞれ水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ジヒドロキシアルキル基又はアルキニル基を示すが、Ｒ[2]とＲ[3]が隣接する窒素原子と一緒になって、置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環式基を形成してもよく；

Ｘ、Ｙ及びＺは水素、アルキル、ハロゲン等を示し；ｎは１～５の数を示す）

で表される化合物及びこれを含む医薬組成物に関する。IL-1β産生抑制作用を有し、水溶性が高く、かつ経口吸収性が良好である。