(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9 月10 日 (10.09.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/076420 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 213/75, 213/80, 231/40, 239/42, 241/20, 237/20, 277/46, 285/12, 285/08, 417/12, 401/12, 261/14, 271/07, 249/04, 513/04, A61K 31/415, 31/42, 31/426, 31/427, 31/433, 31/437, 31/44, 31/4402, 31/4439, 31/444, 31/454, 31/4965, 31/505, 31/415, 31/4245, 31/4192, 31/429, 31/455, 31/433, 31/4245, 31/495, A61P 3/04, 3/10, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/002284

(22) 国際出願日: 2004 年2 月26 日 (26.02.2004)

(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2003-049466 2003 年2 月26 日 (26.02.2003) JP
特願 2003-400882
2003 年11 月28 日 (28.11.2003) JP
特願2004-031298 2004 年2 月6 日 (06.02.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町２－２－３ Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 飯野 智晴 (IINO, Tomoharu) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP). 橋本 憲明 (HASHIMOTO, Noriaki) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP). 中嶋 弘 (NAKASHIMA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP). 高橋 啓治 (TAKAHASHI, Keiji) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP). 西村 輝之 (NISHIMURA, Teruyuki) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP). 永木 淳一 (EIKI, Jun-ichi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保３番地萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP).

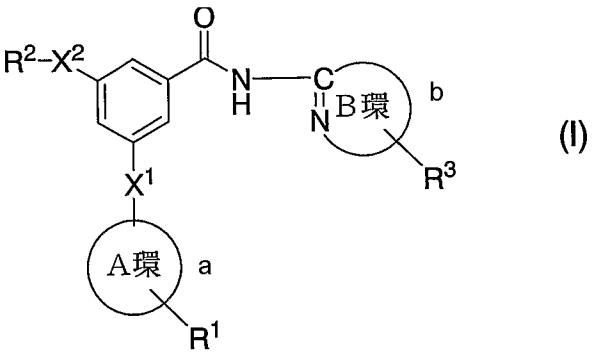
(74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.); 〒1038416 東京都中央区日本橋本町２－２－３ Tokyo (JP).

(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, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,

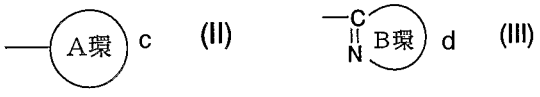
[続葉有]

(54) Title: HETEROARYLCARBAMOYLBENZENE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ヘテロアリールカルバモイルベンゼン誘導体



(I)



a...RING A c...RING A
b...RING B d...RING B

(57) Abstract: A compound represented by the following formula (I): (I) [wherein X^1 represents oxygen, etc.; X^2 represents oxygen, etc.; R^1 represents an alkylsulfonyl or another group on the ring A; R^2 represents, e.g., C_{3-7} cyclic alkyl optionally substituted by halogeno, etc.; R^3 represents a substituent on the ring B, e.g., lower alkyl; the formula (II) [Chemical formula 1] (II) represents 6- to 10-membered aryl, etc.; and the formula (III) [Chemical formula 1] (III) represents a mono- or bicyclic heteroaryl which optionally has a substituent represented by the R^3 in the ring B and in which the carbon atom bonded to the nitrogen atom of the amide group in the formula (I) forms C=N in cooperation with the nitrogen atom of the ring] or a pharmaceutically acceptable salt of the compound. The compound and salt function to activate glucokinase and are useful as a therapeutic agent for diabetes.

[続葉有]

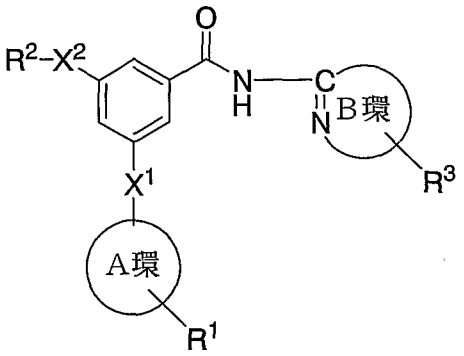
WO 2004/076420 A1

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.

[続葉有]

(57) 要約:

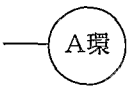
本発明は、グルコキナーゼ活性化作用を有し、糖尿病の治療剤として有用な下記式（Ｉ）



(I)

（式中、式中、Ｘ[1]は酸素原子等を示し、Ｘ[2]は酸素原子等を示し、Ｒ[1]は、アルキルスルホニル基等のＡ環上の基を示し、Ｒ[2]はハロゲン原子等で置換されていてもよい、炭素数３乃至７の環状のアルキル基等を示し、Ｒ[3]は低級アルキル基等のＢ環上の置換基を示し、式（ＩＩ）

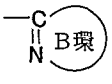
【化１】



(II)

は、６乃至１０員のアリール基等を示し、式（ＩＩＩ）

【化１】



(III)

は、前記Ｒ[3]で示される置換基をＢ環内に有していてもよい、式（Ｉ）のアミド基の窒素原子と結合した該Ｂ環中の炭素原子が、該環中の窒素原子と共にＣ＝Ｎを形成する、単環の又は双環のヘテロアリール基］で表される化合で表される化合物又はその薬学的に許容される塩に関する。

(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, 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。