

(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
2013 年 9 月 6 日(06.09.2013)



(10) 国際公開番号
WO 2013/129443 A1

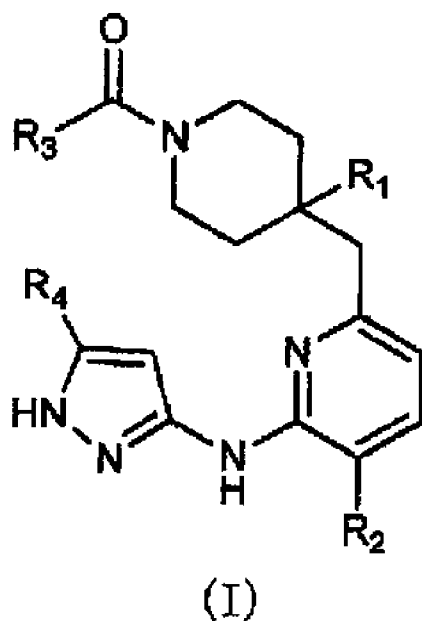
- (51) 国際特許分類:
C07D 401/14 (2006.01) A61P 15/00 (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01) A61P 17/00 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01) A61P 19/00 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01) A61P 21/00 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01) A61P 25/00 (2006.01)
A61P 1/18 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01) A61P 35/02 (2006.01)
A61P 13/08 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61P 13/10 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)
A61P 13/12 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2013/055064
- (22) 国際出願日: 2013 年 2 月 27 日(27.02.2013)
- (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 2012-043303 2012 年 2 月 29 日(29.02.2012) JP
特願 2012-186534 2012 年 8 月 27 日(27.08.2012) JP
- (71) 出願人: 大鵬薬品工業株式会社(TAIHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018444 東京都千代田区神田錦町 1-2-7 Tokyo (JP).

- (72) 発明者: 杉本 哲哉(SUGIMOTO, Tetsuya); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 高橋 秀和(TAKAHASHI, Hidekazu); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 三ツ谷 守弘(MITSUYA, Morihito); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 増子 尋郎(MASUKO, Norio); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 五月女 裕(SOOTOME, Hiroshi); 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 大鵬薬品工業株式会社内 Ibaraki (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); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町 1 丁目 3 番 8 号 沢の鶴人形町ビル 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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH,

[続葉有]

(54) Title: NOVEL PIPERIDINE COMPOUND OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: 新規ピペリジン化合物又はその塩



(57) Abstract: Provided are: a novel compound having an excellent Aurora-A-selective inhibitory activity and useful as an anti-cancer agent that can be administered orally; a novel anti-tumor effect enhancer for a microtubule agonist comprising a taxane-type anti-cancer agent; and a combination therapy. A piperidine compound represented by general formula (I) (wherein R₁ represents a carboxyl group, -C(=O)NR₅R₆, or an oxadiazolyl group which may have a C₁-C₆ alkyl group or a trifluoromethyl group as a substituent; R₂ represents a halogen atom, or a C₁-C₆ alkoxy group; R₃ represents a phenyl group which may have 1 to 3 groups independently selected from a halogen atom, a C₁-C₆ alkyl group, a C₁-C₆ alkoxy group and a trifluoromethyl group as a substituent or substituents; R₄ represents a hydrogen atom, or a C₁-C₆ alkyl group; and R₅ and R₆ may be the same as or different from each other and independently represent a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl group, or a C₃-C₆ cycloalkyl group, or R₅, R₆ and a nitrogen atom to which R₅ and R₆ are bound may together form a 3- to 6-membered nitrogenated saturated heterocyclic group) or a salt thereof.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2013/129443 A1



PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

- (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, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

優れたオーロラ A 選択的な阻害作用を有し、経口投与可能な抗癌剤として有用である、新規化合物を提供すること、更には、タキサン系抗癌剤を含む微小管作動薬の新規な抗腫瘍効果増強剤及び併用療法を提供することにある。一般式 (I) (式中、 R_1 は、カルボキシル基、 $-C(=O)NR_5R_6$ 、又は置換基として C_1-C_6 アルキル基若しくはトリフルオロメチル基を有してもよいオキサジアゾリル基を示し； R_2 は、ハロゲン原子又は C_1-C_6 アルコキシ基を示し； R_3 は、置換基としてハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基及びトリフルオロメチル基から選ばれる基を同一又は異なって 1～3 個有してもよいフェニル基を示し； R_4 は、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し； R_5 及び R_6 は、同一又は異なって、水素原子、 C_1-C_6 アルキル基又は C_3-C_6 シクロアルキル基を示すか、 R_5 及び R_6 は、結合する窒素原子と一緒に 3～6 員の含窒素飽和ヘテロ環基を形成してもよい。) で表されるピペリジン化合物又はその塩。