(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5 月1 日 (01.05.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/035639 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 401/04, 405/14, 409/14, A61K 31/506, A61P 1/00, 1/10, 3/04, 3/10, 9/12, 11/06, 13/02, 19/10, 25/16, 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/10952

(22) 国際出願日: 2002 年10 月22 日 (22.10.2002)

(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:
特願2001-324018
2001 年10 月22 日 (22.10.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒112-8088 東京都 文京区 小石川４丁目６番１０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): 原田 均 (HARADA,Hitoshi) [JP/JP]; 〒300-1232 茨城県 牛久市 上柏田２−２４−２７ Ibaraki (JP). 浅野 修 (ASANO,Osamu) [JP/JP]; 〒300-1232 茨城県 牛久市 上柏田３−６９−２１ Ibaraki (JP). 上田 正人 (UEDA,Masato) [JP/JP]; 〒305-0061 茨城県 つくば市 稲荷前９−７−４０２ Ibaraki (JP). 宮澤 修平 (MIYAZAWA,Shuhei) [JP/JP]; 〒302-0127 茨城県 守谷市 松ヶ丘２−３９−２６ Ibaraki (JP). 小竹 良彦 (KOTAKE,Yoshihiko) [JP/JP]; 〒300-0832 茨城県 土浦市 桜ヶ丘町３９−１３ Ibaraki (JP). 樺沢 靖弘 (KABASAWA,Yasuhiro) [JP/JP]; 〒371-0105 群馬県 勢多郡 富士見村石井７４−２ Gunma (JP). 安田 昌弘 (YASUDA,Masahiro) [JP/JP]; 〒305-0035 茨城県 つくば市 松代４−２１−２−２−４０１ Ibaraki (JP). 安田 信之 (YASUDA,Nobuyuki) [JP/JP]; 〒300-0065 茨城県 土浦市 常名８２０−１ Ibaraki (JP). 飯田 大介 (IIDA,Daisuke) [JP/JP]; 〒305-0005 茨城県 つくば市 天久保２−２３−５ メゾン学園２０８ Ibaraki (JP). 永川 純一 (NAGAKAWA,Junichi) [JP/JP]; 〒300-0845 茨城県 土浦市 乙戸南１−２２−８ Ibaraki (JP). 広田 和雄 (HIROTA,Kazuo) [JP/JP]; 〒300-0845 茨城県 土浦市 乙戸南１−１３−８ Ibaraki (JP). 中川 誠 (NAKAGAWA,Makoto) [JP/JP]; 〒300-2436 茨城県 筑波郡 谷和原村絹の台６−１８−２ Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 古谷 馨, 外(FURUYA,Kaoru et al.); 〒103-0007 東京都 中央区 日本橋浜町２−１７−８ 浜町花長ビル６階 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, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

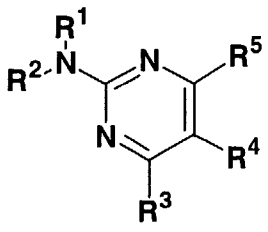
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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:** PYRIMIDINE COMPOUND AND MEDICINAL COMPOSITION THEREOF

(54) 発明の名称: ピリミジン化合物及びその医薬組成物



(I)

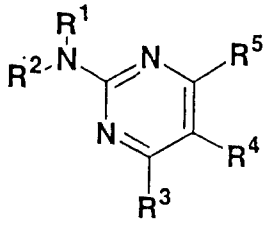
(57) **Abstract:** A novel pyrimidine compound having an excellent antagonistic activity against adenosine receptors (A_1, A_{2A}, and A_{2B} receptors). Specifically, it is a compound represented by the following formula, a salt of the compound, or a solvate of either. (I) In the formula, R^1 and R^2 are the same or different and each represents hydrogen, optionally substituted C_{1-6} alkyl, etc.; R^3 represents hydrogen, halogeno, etc.; R^4 represents an optionally substituted C_{6-14} aromatic hydrocarbon ring group, optionally substituted 5- to 14-membered nonaromatic heterocyclic group having at least one unsaturated bond, etc.; and R^5 represents an optionally substituted C_{6-14} aromatic hydrocarbon ring group or optionally substituted 5- to 14-membered aromatic heterocyclic group.

[続葉有]

WO 03/035639 A1

(57) 要約:

本発明は、優れたアデノシン受容体（A_1、A_{2A}、A_{2B}受容体）拮抗作用を有する新規ピリミジン化合物を提供する。詳しくは、下記式で表される化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物を提供する。



（I）

式中、R^1及びR^2は同一又は相異なって水素原子、置換基を有していてもよいC_{1-6}アルキル基等；R^3は水素原子、ハロゲン原子等；R^4は置換基を有していてもよいC_{6-14}芳香族炭化水素環式基、置換基を有していてもよい少なくとも１以上の不飽和結合を有している５乃至１４員非芳香族複素環式基等；R^5は置換基を有していてもよいC_{6-14}芳香族炭化水素環式基又は置換基を有していてもよい５乃至１４員芳香族複素環式基を示す。