(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
2011 年 2 月 10 日(10.02.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/016528 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 401/14 (2006.01)	*A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/4184 (2006.01)	*A61P 35/02* (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)	*A61P 43/00* (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)	*C07D 403/14* (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)	*C07D 405/14* (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)	*C07D 409/14* (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01)	*C07D 413/14* (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)	*C07D 417/14* (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01)	*C07D 471/04* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)	*C07D 491/056* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/063315

(22) 国際出願日: 2010 年 8 月 5 日(05.08.2010)

(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 2009-184822 2009 年 8 月 7 日(07.08.2009) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 中外製薬株式会社(CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 Tokyo (JP). エフ. ホフマン－ラ ロシュ アーゲー (F.HOFFMANN-LA ROCHE AG) [CH/CH]; CH4070 スイス・バーゼル・グレンツアーヘルストラツセ１２４ Basel (CH).

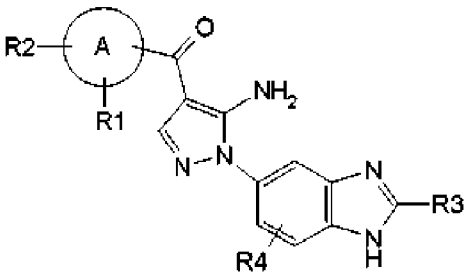
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高 直樹 (TAKA, Naoki) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 大森 正幸(OHMORI, Masayuki) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 高見 京子(TAKAMI, Kyoko) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 松下 正行(MATSUSHITA, Masayuki) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原２００番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 早瀬 忠克(HAYASE, Tadakatsu) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原２００番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 兵藤 郁美(HYODO, Ikumi) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原２００番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 河内 雅美(KOCHI, Masami) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原２００番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 西井 広樹(NISHII, Hiroki) [JP/JP]; 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原２００番地 中外製薬株式会社内

[続葉有]

(54) **Title**: AMINOPYRAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 : アミノピラゾール誘導体



(I)

(57) **Abstract**: A compound represented by formula (I) or a pharmacologically acceptable salt thereof, which can inhibit a fibroblast growth factor receptor (FGFR) family kinase in cancer tissues. (In the formula, A represents a 5- to 10-membered heteroaryl group, or a C_{6-10} aryl group; R_1 and R_2 independently represent H, OH, X, CN, NO_2, a C_{1-4} haloalkyl group, a C_{1-6} alkyl group, or the like <R_1 and R_2 together form a (substituted) 3- to 10-membered heterocyclyl group or a (substituted) 5- to 10-membered heteroaryl group>; R_3 represents H, a C_{1-5} alkyl group, a C_{6-10} aryl group, a C_{1-5} alkyl group, or a C_{1-4} haloalkyl group; and R_4 represents H, X, a C_{1-3} alkyl group, a C_{1-4} haloalkyl group, OH, CN, NO_2, or the like.)

(57) 要約: 本発明は、線維芽細胞増殖因子受容体（ＦＧＦＲ）ファミリーキナーゼを癌組織内で阻害することができる、下記式（Ｉ）で表される化合物またはその薬理学的に許容される塩である。 A :5-10 員ヘテロアリール,C_{6-10} アリール $R_{1,2}$:H,OH,X,CN,NO_2,C_{1-4} ハロアルキル,C_{1-6} アルキル 等 <共に(置換)3-10 員ヘテロシクリル,(置換)5-10 員ヘテロアリールを形成してもよい> R_3:H,C_{1-5} アルキル,C_{6-10} アリール C_{1-5} アルキル,C_{1-4} ハロアルキル R_4:H,X,C_{1-3} アルキル,C_{1-4} ハロアルキル,OH,CN,NO_2 等

WO 2011/016528 A1