

(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
2020年7月16日(16.07.2020)



(10) 国際公開番号

WO 2020/145374 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/519 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01) C12N 15/54 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2020/000592

(22) 国際出願日: 2020年1月10日(10.01.2020)

(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 2019-003403 2019年1月11日(11.01.2019) 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: 中村 昌幸 (NAKAMURA Masayuki);
〒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). 浅井 隆宏
(ASAI Takahiro); 〒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). 井口 聡 (IGUCHI Satoru); 〒3002611 茨

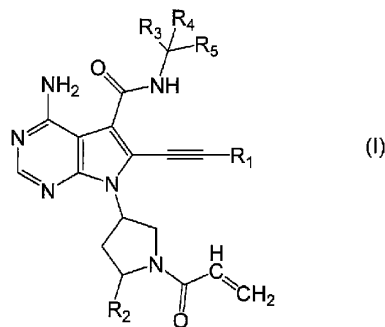
城県つくば市大久保3 大鵬薬品工業株式
会社内 Ibaraki (JP). 小口 憩 (OGUCHI Kei);
〒3002611 茨城県つくば市大久保3 大鵬薬
品工業株式会社内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 小林 浩, 外 (KOBAYASHI Hiroshi et
al.); 〒1040028 東京都中央区八重洲二丁目
8番7号 福岡ビル9階 阿部・井窪・
片山法律事務所 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, DJ, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY,
MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT,
QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(54) Title: PYRIMIDINE COMPOUND OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: ピリミジン化合物又はその塩



(57) Abstract: Provided are a novel pyrimidine compound or a salt thereof that inhibits HER2 activity and exhibits brain migration properties, and a pharmaceutical composition including the same. Disclosed is a compound represented by the following general formula (I), or a salt thereof. (In the formula: R₁ represents a C1-C4 alkyl group that may include a C1-C4 alkoxy group as a substituent, or a C3-C4 cycloalkyl group; R₂ represents a hydrogen atom, a halogen atom, a C1-C6 alkyl group that may include, as a substituent(s), one to five of each of C1-C4 alkoxy group(s) or fluorine atom(s), or a C1-C6 alkoxy group; R₃ represents a hydrogen atom or a C1-C4 alkyl group that may include, as a substituent(s), one to five fluorine atom(s); R₄ represents a hydrogen atom or a C1-C4 alkyl group; and R₅ represents a phenyl group that may include one to three substituent(s) selected from fluorine atoms and chlorine atoms.)

WO 2020/145374 A1

[続葉有]

(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, ST, 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, 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, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))
- 一 明細書の別個の部分として表した配列リスト (規則5.2(a))

(57) 要約: H E R 2 活性を阻害し、脳移行性を示す新規なピリミジン化合物又はその塩、及びこれを含む医薬組成物を提供する。下記一般式 (I) で表される化合物又はその塩。(式中、 R_1 は、置換基としてC 1 - C 4 アルコキシ基を有しても良いC 1 - C 4 アルキル基、又はC 3 - C 4 シクロアルキル基を示し; R_2 は、水素原子、ハロゲン原子、置換基としてC 1 - C 4 アルコキシ基若しくはフッ素原子をそれぞれ1 から5 個有しても良いC 1 - C 6 アルキル基、又はC 1 - C 6 アルコキシ基を示し; R_3 は、水素原子、又は置換基としてフッ素原子を1 から5 個有しても良いC 1 - C 4 アルキル基を示し; R_4 は、水素原子、又はC 1 - C 4 アルキル基を示し; R_5 は、フッ素原子及び塩素原子から選択される置換基を1 から3 個有してもよいフェニル基を示す。)