(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
2022年1月20日(20.01.2022)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2022/014639 A1

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

(21) 国際出願番号： PCT/JP2021/026461

(22) 国際出願日： 2021年7月14日(14.07.2021)

(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 2020-121525 2020年7月15日(15.07.2020) 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１－２７ Tokyo (JP).

(72) 発明者: 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).

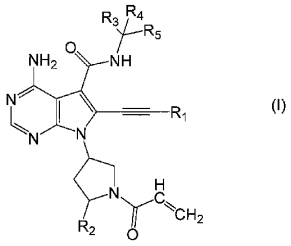
(74) 代理人: 小林 浩，外 (**KOBAYASHI Hiroshi** et al.); 〒1040028 東京都中央区八重洲二丁目８番７号 福岡ビル９階 阿部・井窪・片山法律事務所 Tokyo (JP).

(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, IT, 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.

(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,

(54) **Title:** EGFR INHIBITOR

(54) 発明の名称： ＥＧＦＲ阻害剤

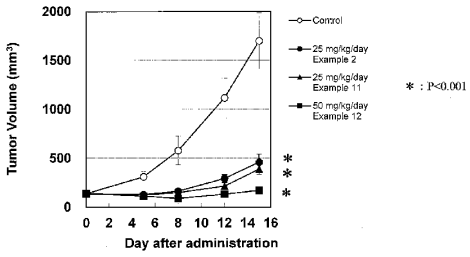


(I)

(57) **Abstract:** Provided is a therapeutic agent for diseases associated with EGFR, the agent containing, as an active ingredient, a compound having EGFR inhibitory activity and brain permeability. The present invention is a compound represented by general formula (I) [wherein R_1, R_2, R_3, R_4, and R_5 are as defined in the specification] or a salt thereof, and a therapeutic agent for diseases associated with EGFR, the agent containing, as an active ingredient, a compound represented by general formula (I) or a salt thereof.

(57) 要約：ＥＧＦＲ阻害活性を有し、かつ脳移行性を有する化合物を有効成分として含有する、ＥＧＦＲが関与する疾患の治療剤の提供。一般式（Ｉ）［式中、R_1、R_2、R_3、R_4及びR_5は明細書中で定義したとおりの意味を有する］で表される化合物又はその塩、並びに下記一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を有効成分として含有するＥＧＦＲが関与する疾患の治療剤。

[図1]



WO 2022/014639 A1

［続葉有］

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)）