(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
2015 年 8 月 13 日(13.08.2015)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2015/119122 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/497 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2015/053018

(22) 国際出願日: 2015 年 2 月 3 日(03.02.2015)

(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 2014-019226 2014 年 2 月 4 日(04.02.2014) JP

(71) 出願人: アステラス製薬株式会社 (ASTELLAS PHARMA INC.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 江口 朋宏 (EGUCHI, Tomohiro); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 森 政道 (MORI, Masamichi); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 山木 陽子 (YAMAKI, Yoko); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 森田 拓, 外 (MORITA, Hiroshi et al.); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目５番１号 アステラス製薬株式会社 知的財産部内 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, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, 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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, 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:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

(54) **Title**: MEDICINAL COMPOSITION COMPRISING DIAMINO HETEROCYCLIC CARBOXAMIDE COMPOUND AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称 : ジアミノヘテロ環カルボキサミド化合物を有効成分とする医薬組成物

(57) **Abstract**: [Problem] To provide: a medicinal composition for treating an AXL-related cancer; in another embodiment, a medicinal composition for treating a cancer with high expression of AXL; and, in still another embodiment, a medicinal composition for treating a cancer that has acquired resistance through activation of AXL against anticancer agent therapy. [Solution] As the results of an examination on compounds having AXL inhibitory effect, the present inventors confirmed that specific diamino heterocyclic carboxamide compounds have AXL inhibitory effect and medicinal compositions comprising such a compound as an active ingredient have therapeutic effect on an AXL-related cancer, on a cancer with high expression of AXL in another embodiment, and on a cancer that has acquired resistance through activation of AXL against anticancer agent therapy in still another embodiment, thereby completing the present invention.

(57) 要約: 【課題】 AXL に関連する癌治療用医薬組成物、別の態様として AXL が高発現した癌治療用医薬組成物、さらに別の態様として抗癌剤治療に対する AXL 活性化により抵抗性を獲得した癌治療用医薬組成物を提供する。 【解決手段】本発明者らは、AXL 阻害作用を有する化合物について検討し、特定のジアミノヘテロ環カルボキサミド化合物が AXL 阻害作用を有し、これらの化合物を有効成分として含有する医薬組成物が AXL に関連する癌、別の態様として AXL が高発現した癌、さらに別の態様として抗癌剤治療に対する AXL 活性化により抵抗性を獲得した癌に対する治療効果を有することを確認し、本発明を完成した。

WO 2015/119122 A1