

(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
2024年1月25日(25.01.2024)



(10) 国際公開番号

WO 2024/019103 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 401/14 (2006.01) A61P 1/18 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/4995 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/513 (2006.01) C07D 487/08 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2023/026522

(22) 国際出願日: 2023年7月20日(20.07.2023)

(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 2022-116367 2022年7月21日(21.07.2022) 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: 吉成 友博 (YOSHINARI, 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). 渡邊 英之 (WATANABE, Hideyuki); 〒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). 石岡 裕貴 (ISHIOKA, Hiroki); 〒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). 河南 英次 (KAWAMINAMI, Eiji); 〒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). 川口 賢一 (KAWAGUCHI, Kenichi); 〒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). ▲高▼橋 史江 (TAKAHASHI, Fumie); 〒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). 上久保 隆 (KAMIKUBO, Takashi); 〒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). 今泉 智禎 (IMAIZUMI, Tomoyoshi); 〒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). 森川 貴裕 (MORIKAWA, Takahiro); 〒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). 濱口 壽雄 (HAMAGUCHI, Hisao); 〒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). 倉本 和幸 (KURAMOTO, Kazuyuki); 〒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). 井波 寛 (INAMI, Hiroshi); 〒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). 長島 建之 (NAGASHIMA, Takeyuki); 〒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). 稲村 耕平 (INAMURA, Kohei); 〒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: 山本 修, 外 (YAMAMOTO, Osamu et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 新大手町ビル206区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).

(54) Title: HETEROCYCLIC COMPOUND THAT ACTS ON G12D MUTANT KRAS PROTEIN

(54) 発明の名称: G12D変異KRASタンパクに作用する複素環化合物

(57) Abstract: Provided is a compound that is effective as an active ingredient in a therapeutic pharmaceutical composition for pancreatic cancer. Having studied compounds that are effective as active ingredients in a therapeutic pharmaceutical composition for pancreatic cancer, the inventors found that the heterocyclic compound shown in formula (I) has excellent degradation-inducing action in the G12D mutant KRAS protein and/or inhibitory activity for G12D mutant KRAS and can be used as a therapeutic drug for pancreatic cancer, and thus completed the present invention. The heterocyclic compound according to the present invention or salts thereof can be used as a therapeutic drug for pancreatic cancer.

(57) 要約: 膵臓癌の治療用医薬組成物の有効成分として有用な化合物を提供する。本発明者らは、膵臓癌治療用医薬組成物の有効成分として有用な化合物について検討し、式(I)に示す複素環化合物が優れたG12D変異KRASタンパクの分解を誘導する作用、及び/又はG12D変異KRAS阻害活性を有し、膵臓癌の治療剤として使用し得ることを知見して、本発明を完成した。本発明の複素環化合物又はその塩は、膵臓癌の治療剤として使用しうる。

[続葉有]

WO 2024/019103 A1

(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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, 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, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, 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, ME, 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))