(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 12 月 3 日(03.12.2015)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2015/182628 A1

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

(21) 国際出願番号: PCT/JP2015/065154

(22) 国際出願日: 2015 年 5 月 27 日(27.05.2015)

(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 2014-109952 2014 年 5 月 28 日(28.05.2014) 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: 小長井 智史 (KONAGAI, Satoshi); 〒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). 田中 宏明 (TANAKA, Hiroaki); 〒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). 山本 博子 (YAMAMOTO, Hiroko); 〒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). 坂上 秀樹 (SAKAGAMI, Hideki); 〒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)）

WO 2015/182628 A1

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

(54) 発明の名称 : ピラジン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 cancer in which at least one kinase selected from among BTK, JAK3 and ITK participates. [Solution] As the results of studies on compounds having BTK inhibiting effect, JAK3 inhibiting effect and ITK inhibiting effect, the present inventors confirmed that specific pyrazine carboxamide compounds have BTK inhibiting effect, JAK3 inhibiting effect and ITK inhibiting effect, and medicinal compositions comprising these compounds as an active ingredient have therapeutic effect on cancers in which at least one kinase selected from among BTK, JAK3 and ITK participates, cancers in which BTK is overexpressed or activated in another embodiment, cancers in which B cell receptor signals are activated in a still another embodiment, cancers in which JAK3 is activation-mutated or activated in a still another embodiment, and cancers in which ITK is activated in a still another embodiment, thereby completing the present invention.

(57) 要約: 【課題】BTK、JAK3 及び ITK のうち１種又は複数のキナーゼが関与するがんの治療用医薬組成物を提供する。 【解決手段】本発明者らは、BTK 阻害作用、JAK3 阻害作用及び ITK 阻害作用を有する化合物について検討し、特定のピラジンカルボキサミド化合物が BTK 阻害作用、JAK3 阻害作用及び ITK 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 BTK、JAK3 及び ITK のうち１種又は複数のキナーゼが関与するがん、別の態様として BTK が高発現若しくは活性化したがん、別の態様として B 細胞受容体シグナルが活性化したがん、さらに別の態様として JAK3 が活性化変異若しくは活性化したがん、またさらに別の態様として ITK が活性化したがん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。