

(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11月10日(10.11.2022)



(10) 国際公開番号

WO 2022/234853 A1

(51) 国際特許分類:  
A61P 43/00 (2006.01) A61K 38/06 (2006.01)  
C07K 5/083 (2006.01) A61K 38/12 (2006.01)  
C07K 7/54 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/019544

(22) 国際出願日: 2022年5月6日(06.05.2022)

(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 2021-079012 2021年5月7日(07.05.2021) JP

(71) 出願人: 中外製薬株式会社(CHUGAI SEIYAKU  
KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1158543 東京  
都北区浮間5丁目5番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 河田 発夫 (KAWADA, Hatsuo);  
〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原200番地 中  
外製薬株式会社内 Kanagawa (JP). 鷹野 宏治  
(TAKANO, Koji); 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶  
原200番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa  
(JP). 小竹 智也(KOTAKE, Tomoya); 〒4128513  
静岡県御殿場市駒門1丁目135番地 中  
外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 陰 未来  
(KAGE, Mirai); 〒4128513 静岡県御殿場市駒  
門1丁目135番地 中外製薬株式会社内  
Shizuoka (JP). 橋本 哲(HASHIMOTO, Satoshi);  
〒4128513 静岡県御殿場市駒門1丁目13  
5番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP).  
田宮 実(TAMIYA, Minoru); 〒2478530 神奈川  
県鎌倉市梶原200番地 中外製薬株式会  
社内 Kanagawa (JP). 若宮 佑真(WAKAMIYA,  
Yuma); 〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原20  
0番地 中外製薬株式会社内 Kanagawa (JP).  
林 竜児(HAYASHI, Ryuji); 〒2478530 神奈川  
県鎌倉市梶原200番地 中外製薬株式会

内 Kanagawa (JP). 森田 雄也(MORITA, Yuya);  
〒2478530 神奈川県鎌倉市梶原200番地 中  
外製薬株式会社内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外(HASEGAWA Yoshiaki  
et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二  
丁目1番1号 丸の内MYPLAZA  
(明治安田生命ビル) 9階 創英国際特  
許法律事務所 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, IQ, IR, IS, IT, JM, 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,  
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).

規則4.17に規定する申立て:

一 出願し及び特許を与えられる出願人の資格に関  
する申立て (規則4.17(ii))

(54) Title: CYCLIC COMPOUND HAVING INHIBITORY EFFECT SELECTIVE FOR KRAS BUT NOT FOR HRAS  
AND NRAS

(54) 発明の名称: H R A SおよびN R A Sに対して選択的なK R A S阻害作用を有する環状化合物

(57) Abstract: The present inventors found a cyclic compound and an oligopeptide compound that selectively inhibit  
KRAS. The present inventors further found an oligopeptide compound and a non-natural amino acid that are useful for  
producing the cyclic compound. The present inventors furthermore found that the cyclic compound and the oligopeptide  
compound interact with a KRAS-specific amino acid residue.

(57) 要約: KRASを選択的に阻害する環状化合物、およびオリゴペプチド化合物を見出した。また、環状  
化合物の製造に有用なオリゴペプチド化合物および非天然アミノ酸を見出した。さらには、環状化合物  
およびオリゴペプチド化合物がKRASに特異的なアミノ酸残基と相互作用することを見出した。

[続葉有]

WO 2022/234853 A1

添付公開書類：

- 国際調査報告（条約第21条(3)）
- 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)）