

(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6月2日(02.06.2022)



(10) 国際公開番号

WO 2022/114164 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 401/12 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01) C07D 403/12 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01) C07D 403/14 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01) C07D 407/14 (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2021/043540
- (22) 国際出願日: 2021年11月29日(29.11.2021)
- (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 2020-197899 2020年11月30日(30.11.2020) 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). 壽製薬株式会社(KOTOBUKI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒3890697 長野県埴科郡坂城町大字坂城6351番地 Nagano (JP).
- (72) 発明者: 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). 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). 神川 晃雄(KAMIKAWA, Akio); 〒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). 鷲尾 卓哉(WASHIO, Takuya); 〒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). 関 陽平(SEKI, Yohei); 〒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). 奥山 圭一郎(OKUYAMA, Keiichiro); 〒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). 池田 収(IKEDA, Osamu); 〒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). 富山 泰(TOMIYAMA, Hiroshi); 〒3890697 長野県埴科郡坂城町大字上五明字東川原198 壽製薬株式会社内 Nagano (JP). 岩井 辰憲(IWAI, Yoshinori); 〒3890697 長野県埴科郡坂城町大字上五明字東川原198 壽製薬株式会社内 Nagano (JP). 中村 章彦(NAKAMURA, Akihiko); 〒3890697 長野県埴科郡坂城町大字上五明字東川原198 壽製薬株式会社内 Nagano (JP). 宮坂 晃三(MIYASAKA, Kozo); 〒3890697 長野県埴科郡坂城町大字上五明字東川原198 壽製薬株式会社内 Nagano (JP).

(54) Title: HETEROARYL CARBOXAMIDE COMPOUND

(54) 発明の名称: ヘテロアリールカルボキシアミド化合物

(57) Abstract: Provided is a compound which is useful as an active ingredient for a pharmaceutical composition for treating cancer associated with the activation of an immunocyte or cancer having resistance to an anti-PD-1 antibody/anti-PD-L1 antibody therapy. The present inventors have studied about a compound useful as an active ingredient for a pharmaceutical composition for treating cancer associated with the activation of an immunocyte or cancer having resistance to an anti-PD-1 antibody/anti-PD-L1 antibody therapy. As a result, it is confirmed that a heteroaryl carboxamide compound has a DGK ζ (DGKzeta) inhibiting activity, and this confirmation leads to the accomplishment of the present invention. The heteroaryl carboxamide compound according to the present invention has a DGK ζ inhibiting activity, and can be used as a therapeutic agent for cancer associated with the activation of an immunocyte or cancer having resistance to an anti-PD-1 antibody/anti-PD-L1 antibody therapy.

(57) 要約: 免疫細胞活性化に関連するがん、又は、抗PD-1抗体/抗PD-L1抗体療法に耐性を有するがん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、免疫細胞活性化に関連するがん、又は、抗PD-1抗体/抗PD-L1抗体療法に耐性を有するがんの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、ヘテロアリールカルボキシアミド化合物がDGK ζ (DGKzeta)阻害作用を有することを確認し、本発明を完成した。本発明のヘテロアリールカルボキシアミド化合物はDGK ζ 阻害作用を有し、免疫細胞活性化に関連するがん、又は、抗PD-1抗体/抗PD-L1抗体療法に耐性を有するがんの治療剤として使用しうる。

[続葉有]

WO 2022/114164 A1

(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).

(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, 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))