

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 3 年 2 月 12 日 (2021.2.12)

【公表番号】特表 2020-504186 (P2020-504186A)

【公表日】令和 2 年 2 月 6 日 (2020.2.6)

【年通号数】公開・登録公報 2020-005

【出願番号】特願 2019-557681 (P2019-557681)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 7 E

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/437

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 12 月 23 日 (2020.12.23)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

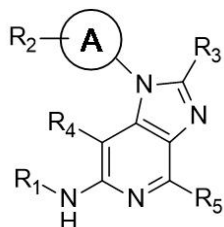
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 ( I )

【化 1】



(I)

の化合物であって、

式中、

A は任意選択で 1 もしくは複数の重水素で置換された C<sub>6</sub> シクロアルキルを表し、

R<sub>1</sub> は任意選択で 1 もしくは複数の重水素で置換された C<sub>1</sub> アルキルを表し、

R<sub>2</sub> は R<sub>6</sub> から選択される置換基で置換され、且つ任意選択で 1 もしくは複数の重水素で置換された C<sub>1</sub> アルキルを表し、

R<sub>3</sub> は R<sub>7</sub> から選択される置換基で置換され、且つ任意選択で 1 もしくは複数の重水素で置換された C<sub>2</sub> アルキルを表し、

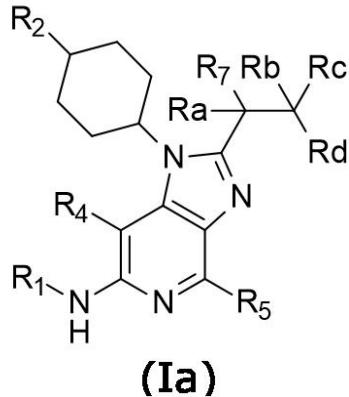
R<sub>4</sub> は水素もしくは重水素を表し、  
 R<sub>5</sub> は水素もしくは重水素を表し、  
 R<sub>6</sub> はシアノを表し、  
 R<sub>7</sub> はヒドロキシルを表す

前記化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

一般式 (I) が一般式 (I a)

【化 2】



であり、

式中、

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub> ~ R<sub>7</sub> は請求項 1 に定義されたとおりであり、

R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、及び R<sub>d</sub> はそれぞれ独立に、水素及び重水素から選択される、

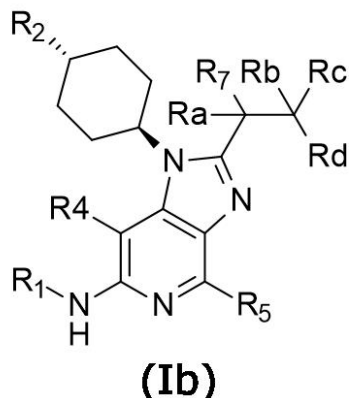
請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、もしくは溶媒和物

。

【請求項 3】

一般式 (I) が一般式 (I b)

【化 3】



であり、

式中、

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub> ~ R<sub>7</sub>、R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、R<sub>c</sub>、ならびに R<sub>d</sub> は、請求項 1 または 2 に定義されたとおりである、

請求項 1 または 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、もしくは溶媒和物。

【請求項 4】

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ ( 1 S ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ ( 1 R ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ ( 1 R ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( トリジウムテリオメチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ 1 , 2 , 2 , 2 - テトラジウムテリオ - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

シス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、及び

シス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ ( 1 R ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル

から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、もしくは溶媒和物。

【請求項 5】

トランス - 2 - [ 4 - [ 2 - [ ( 1 R ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 6 - ( メチルアミノ ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物、もしくは溶媒和物を、薬学的に許容されるビヒクルもしくは賦形剤または薬学的に許容される担体（複数可）と共に含む医薬組成物。

【請求項 7】

1 種または複数種の他の治療上活性な化合物と共に含む、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

JAK1 キナーゼ活性の阻害に応答性である疾患の治療における使用のための、請求項 6 または 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

自己免疫疾患などの免疫系の疾患、もしくは免疫系の調節解除に関連する疾患の予防及び/または治療における使用のための、請求項 6 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

アトピー性皮膚炎の予防及び/または治療における使用のための、請求項 6 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

2 - [ トランス - 4 - [ ( 5 - アミノ - 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル ] アセトニトリルである化合物、またはその塩。

【請求項 12】

2 - [ トランス - 4 - [ 6 - クロロ - 2 - ( 1 - ヒドロキシエチル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、

2 - [ トランス - 4 - [ 6 - クロロ - 2 - [ ( 1 R ) - 1 - ヒドロキシエチル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル、及び

トランス - 2 - [ 4 - [ 6 - クロロ - 2 - ( 1 , 2 , 2 , 2 - テトラジウムテリオ - 1 - ヒドロキシエチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ] シクロヘキシル ] アセトニトリル

から選択される化合物、またはその塩。