

【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4年6月22日(2022.6.22)

【国際公開番号】WO2020/007698

【公表番号】特表2021-528479(P2021-528479A)

【公表日】令和3年10月21日(2021.10.21)

【出願番号】特願2021-500230(P2021-500230)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 3 / 3 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 2 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 3 / 3 2 C S P

A 6 1 P 3 7 / 0 2

A 6 1 P 1 7 / 0 6

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 8

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 K 3 1 / 5 2

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年6月13日(2022.6.13)

【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

30

【補正方法】変更

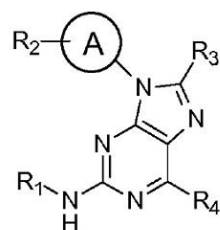
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)：

【化1】



(I)

40

[式中、

A は、C₆シクロアルキルを表し；

R₁は、C₁アルキルを表し、ここで、該C₁アルキルは、重水素からなる群から選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく；

R₂は、C₁アルキルを表し、ここで、該C₁アルキルは、R₅から選択される置換基で置換されており、ここで、該C₁アルキルは、1個以上の重水素で置換されていてもよく；

50

R₃は、C₂アルキルを表し、ここで、該C₂アルキルは、R₆から選択される置換基で置換されており、ここで、該C₂アルキルは、1個以上の重水素で置換されていてもよく；
 R₄は、水素または重水素を表し；
 R₅は、シアノを表し；
 R₆は、ヒドロキシルを表す]

で示される化合物、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】

2 - [トランス - 4 - [8 - [(1R) - 1 - ヒドロキシエチル] - 2 - (メチルアミノ)プリン - 9 - イル]シクロヘキシル]アセトニトリル、

2 - [トランス - 4 - [8 - (1 - ヒドロキシエチル) - 2 - (メチルアミノ)プリン - 9 - イル]シクロヘキシル]アセトニトリル、

2 - [トランス - 4 - [8 - [(1R) - 1 - ヒドロキシエチル] - 2 - (トリジュウテリオメチルアミノ)プリン - 9 - 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】

請求項1または2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含む医薬。

【請求項4】

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と一緒に請求項1または2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含む医薬組成物。

【請求項5】

1種類以上の他の治療活性化合物と合わせた請求項3記載の医薬または請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】

1種類以上の他の治療活性化合物と組み合わせて投与される、請求項3記載の医薬または請求項4記載の医薬組成物。

【請求項7】

自己免疫疾患などの免疫系の疾患、または免疫系の調節解除に関連する疾患の予防および/または処置および/または寛解における使用のための、請求項3記載の医薬、請求項4記載の医薬組成物、または請求項5もしくは6記載の医薬もしくは医薬組成物。

【請求項8】

乾癬およびアトピー性皮膚炎から選択される疾患の予防および/または処置および/または寛解における使用のための、請求項3記載の医薬、請求項4記載の医薬組成物、または請求項5もしくは6記載の医薬もしくは医薬組成物。

【請求項9】

JAK1キナーゼ活性の阻害に応答する疾患の処置において使用するための、請求項3記載の医薬、請求項4記載の医薬組成物、または請求項5もしくは6記載の医薬もしくは医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0104

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0104】

10

20

30

40

50

【表 1】

表 1

| 化合物 | JAK1 EC ₅₀ (nM) | JAK2 EC ₅₀ (nM) | JAK3 EC ₅₀ (nM) | TYK2 EC ₅₀ (nM) | STAT5 EC ₅₀ (nM) | STAT6 EC ₅₀ (nM) |
|-----|----------------------------------|----------------------------------|----------------------------------|----------------------------------|-----------------------------------|--------------------------------|
| 1 | 5 | 157 | 602 | 19 | 5190 | 146 |
| 2 | 9 | 274 | 798 | 47 | 12800 | 213 |
| 3 | 3 | 129 | 510 | 13 | 4870 | 142 |

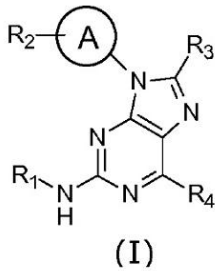
10

本願は下記の態様も包含する。

〔態様 1〕

一般式 (I) :

【化 1 3】



20

〔式中、

A は、C₆シクロアルキルを表し；

R₁ は、C₁アルキルを表し、ここで、該 C₁アルキルは、重水素からなる群から選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく；

R₂ は、C₁アルキルを表し、ここで、該 C₁アルキルは、R₅ から選択される置換基で置換されており、ここで、該 C₁アルキルは、1 個以上の重水素で置換されていてもよく；

30

R₃ は、C₂アルキルを表し、ここで、該 C₂アルキルは、R₆ から選択される置換基で置換されており、ここで、該 C₂アルキルは、1 個以上の重水素で置換されていてもよく；

R₄ は、水素または重水素を表し；

R₅ は、シアノを表し；

R₆ は、ヒドロキシルを表す]

で示される化合物、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。

〔態様 2〕

2 - [トランス - 4 - [8 - [(1R) - 1 - ヒドロキシエチル] - 2 - (メチルアミノ)プリン - 9 - イル]シクロヘキシル]アセトニトリル、

2 - [トランス - 4 - [8 - (1 - ヒドロキシエチル) - 2 - (メチルアミノ)プリン - 9 - イル]シクロヘキシル]アセトニトリル、

2 - [トランス - 4 - [8 - [(1R) - 1 - ヒドロキシエチル] - 2 - (トリジュウテリオメチルアミノ)プリン - 9 - イル]シクロヘキシル]アセトニトリル

から選択される態様 1 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。

40

〔態様 3〕

医薬としての使用のための、態様 1 ~ 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

50

[態様 4]

自己免疫疾患などの免疫系の疾患、または免疫系の調節解除に関連する疾患の予防および/または処置における使用のための、態様 1 ~ 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

[態様 5]

乾癬およびアトピー性皮膚炎から選択される疾患の予防および/または処置における態様 4 に記載の使用のための化合物。

[態様 6]

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と一緒に態様 1 ~ 2 のいずれか 1 つに記載の化合物を含む医薬組成物。

[態様 7]

1 種類以上の他の治療活性化合物と合わせた態様 6 記載の医薬組成物。

[態様 8]

JAK1 キナーゼ活性の阻害に応答する疾患の処置において使用するための、態様 1 ~ 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

[態様 9]

自己免疫疾患などの免疫系の疾患を予防、処置または寛解する方法であって、該疾患の少なくとも 1 つに罹患しているヒトに、態様 1 ~ 2 のいずれか 1 つに記載の 1 種類以上の化合物の有効量を、場合によっては薬学的に許容される担体または 1 種類以上の賦形剤と一緒に、場合によっては他の治療活性化合物と組み合わせて、投与することを含む、方法

—

10

20

30

40

50