

【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5年9月6日(2023.9.6)

【国際公開番号】WO2021/041392
 【公表番号】特表2022-545836(P2022-545836A)
 【公表日】令和4年10月31日(2022.10.31)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-200
 【出願番号】特願2022-513571(P2022-513571)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 4 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 7 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 9 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

20

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

A 6 1 P 1 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (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 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

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

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

30

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

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)

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

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 0

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 C S P

A 6 1 K 9 / 1 2

A 6 1 K 9 / 0 6

40

A 6 1 K 9 / 2 0

A 6 1 K 9 / 4 8

A 6 1 K 9 / 1 0

A 6 1 K 9 / 7 0 4 0 1

A 6 1 K 9 / 0 8

A 6 1 P 3 7 / 0 8

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 2

A 6 1 P 1 7 / 0 4

A 6 1 P 1 7 / 0 0

50

A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

10

【手続補正書】

【提出日】令和5年8月29日(2023.8.29)

【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】

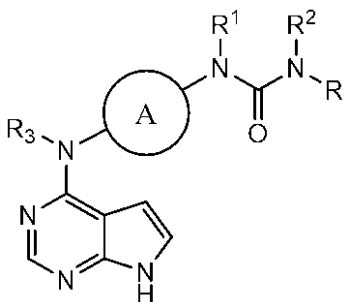
20

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)：

【化1】



30

式(1)

[式中、

Rは、ハロゲン、シアノ、またはアミノで任意に置換されているC₁-C₆アルキルである

；

R¹およびR²は、水素、C₁-C₆アルキル、(C₃-C₆シクロアルキル)C₀-C₂アルキル、(フェニル)C₀-C₂アルキル、および(4~6員複素環)C₀-C₂アルキルから独立して選択される；

40

R³はC₁-C₄アルキルである；および

環A：

【化2】

は、N、O、およびSから独立して選択される1つまたは2つのヘテロ原子を有するC₃-C₇シクロアルキルまたは4~6員ヘテロシクロアルキル環である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

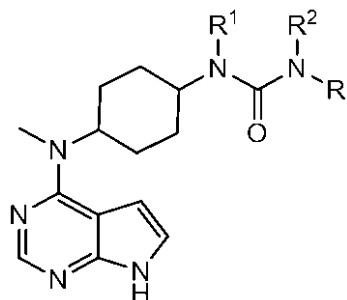
50

環Aが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、アゼチジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフェニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、またはピペラジニル基である、請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

式(IA)：

【化3】



式(IA)

[式中、

Rは、ハロゲン、シアノ、またはアミノで任意に置換されたC₁-C₆アルキルである；および

R¹およびR²は、水素、C₁-C₆アルキル、または(C₃-C₆シクロアルキル)C₀-C₂アルキルから独立して選択される]

で示される請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

Rが、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、-CH₂CN、または-CH₂CF₃である、請求項3に記載の化合物または塩。

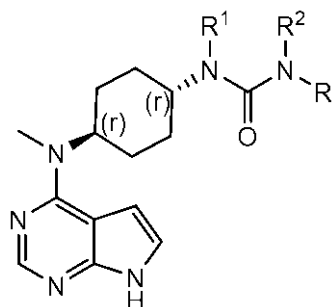
【請求項5】

R¹およびR²の両方が、水素である、請求項1～4のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項6】

式(1)の化合物が、式(1B)：

【化4】



式(1B)

の立体化学を有する化合物である、請求項1～5のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項7】

R¹およびR²の少なくとも1つが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、またはヘキシルである、請求項1～6のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項8】

R¹およびR²の少なくとも1つが、ハロゲン、シアノ、またはアミノで任意に置換されたメチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、またはヘキシルである、請求項1～7

10

20

30

40

50

のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項9】

R¹およびR²の少なくとも1つが、C₃-C₆シクロアルキルである、請求項1～8のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項10】

R¹およびR²の少なくとも1つが、(C₃-C₆シクロアルキル)C₁アルキルである、請求項1～9のいずれか1つに記載の化合物または塩。

【請求項11】

R¹およびR²の少なくとも1つが、(C₃-C₆シクロアルキル)C₂アルキルである、請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物または塩。

10

【請求項12】

請求項1～11のいずれか1つに記載の化合物または塩を、薬学的に許容される賦形剤とともに含む医薬組成物。

【請求項13】

医薬組成物が、エアロゾル、クリーム、ゲル、丸剤、カプセル、錠剤、シロップ、経皮パッチ、または点眼液である、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項14】

医薬組成物が、約0.1～約99重量%(wt.%)の化合物または塩を含む、請求項12または13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

治療有効量の請求項1～11のいずれか1つに記載の化合物または塩を含む、患者のアレルギー性、炎症性、または自己免疫疾患を治療するための医薬組成物。

20

【請求項16】

アレルギー性、炎症性、または自己免疫疾患が、掻痒、アレルギー性皮膚炎、湿疹、または乾癬である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

アレルギー性、炎症性、または自己免疫疾患が、アレルギー反応、関節炎、喘息、閉塞性気道疾患、癌、糖尿病、眼疾患、腸炎、神経変性疾患、皮膚疾患、または移植反応である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項18】

医薬組成物が、経口、局所、静脈内、筋肉内、非経口、吸入または噴霧、舌下、経皮、口腔内投与、直腸、または点眼液として、投与される、請求項15～17のいずれか1つに記載の医薬組成物。

30

【請求項19】

化合物または塩が、少なくとも30のJAK1/JAK2効力比を有する、請求項15～17のいずれか1つに記載の医薬組成物。

【請求項20】

化合物または塩が、少なくとも3のJAK1/JAK3効力比を有する、請求項15～18のいずれか1つに記載の医薬組成物。

【請求項21】

患者が、ヒトである、請求項15～20のいずれか1つに記載の医薬組成物。

40

【請求項22】

患者が、コンパニオンアニマルまたは家畜動物である、請求項15～20のいずれか1つに記載の医薬組成物。

【請求項23】

請求項12～20のいずれか1つに記載の医薬組成物を患者に投与することを含む、患者のアレルギー性、炎症性、または自己免疫疾患を治療する方法であって、患者が、コンパニオンアニマルまたは家畜動物である、方法。

50