

【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 7 月 11 日(2022.7.11)

【公開番号】特開 2020-7308(P2020-7308A)

【公開日】令和 2 年 1 月 16 日(2020.1.16)

【年通号数】公開・登録公報 2020-002

【出願番号】特願 2019-124976(P2019-124976)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04(2006.01)

10

C 07 D 249/08(2006.01)

A 61 K 31/519(2006.01)

A 61 K 31/4196(2006.01)

A 61 P 17/14(2006.01)

A 61 P 17/16(2006.01)

A 61 P 19/02(2006.01)

A 61 K 9/06(2006.01)

A 61 K 9/08(2006.01)

A 61 K 9/70(2006.01)

A 61 K 9/00(2006.01)

20

A 61 K 9/10(2006.01)

A 61 P 1/04(2006.01)

A 61 P 29/00(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 4 0

C 07 D 249/08 5 3 6

A 61 K 31/519

A 61 K 31/4196

A 61 P 17/14

A 61 P 17/16

30

A 61 P 19/02

A 61 K 9/06

A 61 K 9/08

A 61 K 9/70 4 0 1

A 61 K 9/00

A 61 K 9/10

A 61 P 1/04

A 61 P 29/00 1 0 1

【手続補正書】

40

【提出日】令和 4 年 7 月 1 日(2022.7.1)

【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】

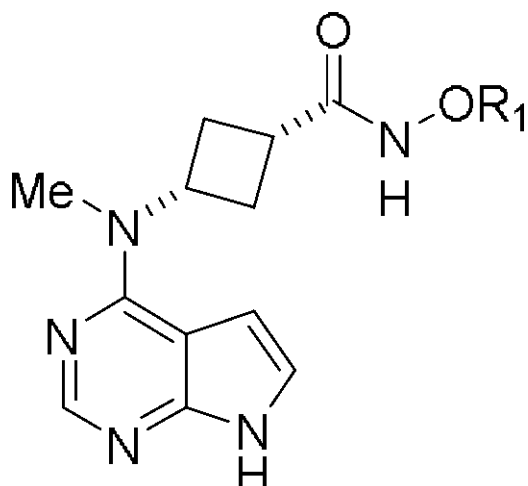
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造：

50

【化 1】



10

[式中、 R_1 は、水素、置換または非置換フェニル、置換または非置換ピリジル、置換または非置換イミダゾリル、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキルから選択され、それは、ハロ、($C_1 \sim C_3$) アルキル、および($C_1 \sim C_3$) アルキルオキシから独立して選択される 1、2 または 3 個の基で任意に置換されていてもよい] を有する化合物、またはナトリウム、カリウム、リチウム、マグネシウムおよびカルシウムからなる群から選択されるその塩。

20

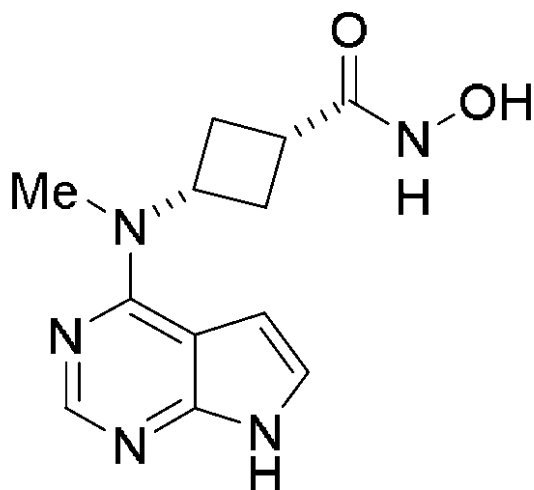
【請求項 2】

R_1 が水素である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 3】

構造：

【化 2】



30

40

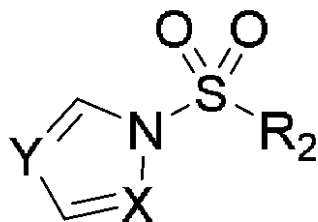
を有する化合物、($1s, 3s$) - N - ヒドロキシ - 3 - (メチル (7H - ピロロ [2, 3 - d] ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロブタン - 1 - カルボキサミドまたはその塩。

【請求項 4】

構造：

50

【化 3】



[式中、 R_2 は、($C_3 \sim C_5$) アルキルおよび ($C_3 \sim C_4$) シクロアルキルから選択され、

X および Y は、 CR_3 および N から独立して選択され、式中、 R_3 は、水素、および ($C_1 \sim C_6$) アルキルから選択される] を有する化合物。

【請求項 5】

X および Y が両方とも N であり、 R_2 が ($C_3 \sim C_5$) アルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R_2 が直鎖状または分枝鎖状プロピル基である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_2 が直鎖状プロピル基である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 8】

X が CR_3 であり、式中、 R_3 は水素であり、Y は N である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 9】

R_2 が、直鎖状または分枝鎖状プロピル基である、請求項 8 に記載の化合物。

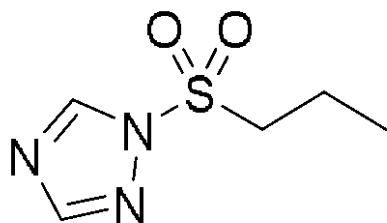
【請求項 10】

R_2 が直鎖状プロピル基である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 11】

構造：

【化 4】



を有する化合物、1 - (プロピルスルホニル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール。

【請求項 12】

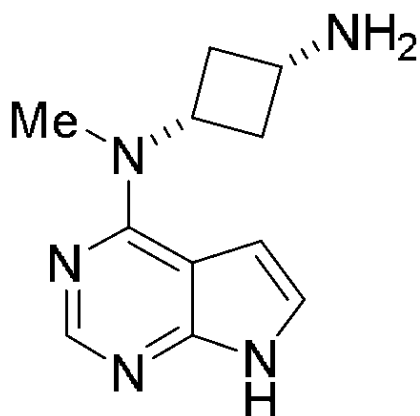
構造：

30

40

50

【化 5】



10

を有する化合物の塩であって、前記塩が、塩酸塩、リン（モノ、ビス、トリス）酸塩、（1S）-（+）-10-カンファースルホン酸塩、1,2-エタンジスルホン酸塩、ジベンゾイル-L-酒石酸塩、ジベンゾイル-D-酒石酸塩、クエン酸塩、コハク酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、L-（+）-酒石酸塩、D-（-）-酒石酸塩、臭化水素酸塩、酸性塩、メシル酸塩およびマロン酸塩からなる群から選択される、化合物の塩。

20

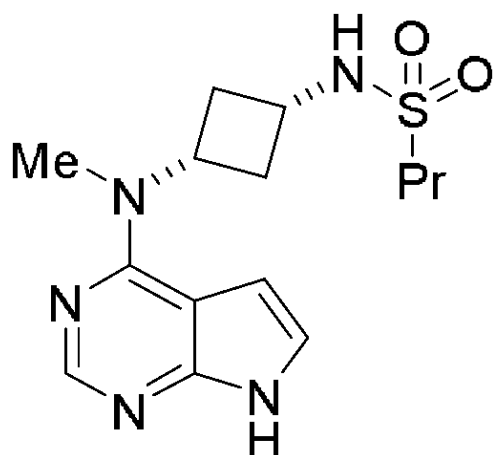
【請求項 13】

請求項 12 に記載のリン酸塩。

【請求項 14】

構造：

【化 6】



30

を有する化合物の酸性塩であって、前記酸性塩が、塩酸塩、リン酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、メシル酸塩、半硫酸塩、半フマル酸塩およびマロン酸塩からなる群から選択される、化合物の酸性塩。

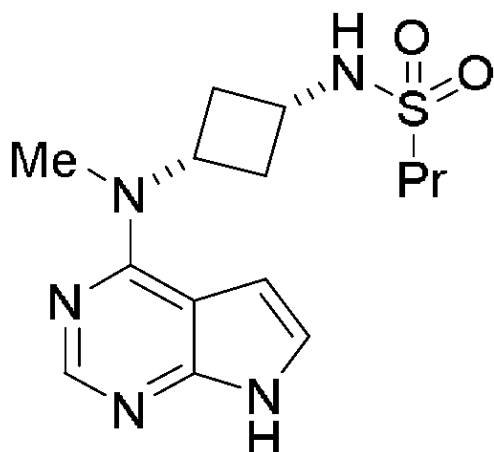
40

【請求項 15】

構造：

50

【化 7】



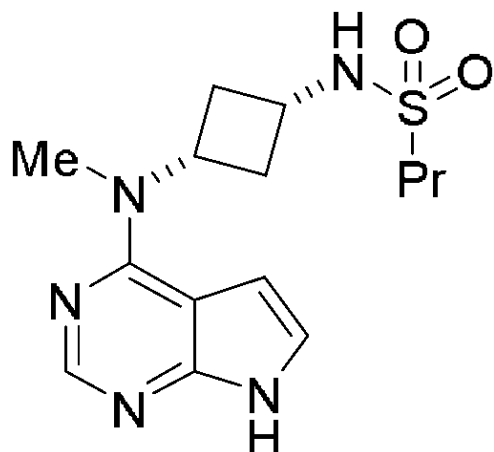
10

を有する化合物の酸性塩であって、前記酸性塩が塩酸塩である、化合物の酸性塩。

【請求項 16】

構造：

【化 8】



20

30

を有する化合物であって、塩酸塩、リン酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、メシル酸塩、半硫酸塩、半フマル酸塩およびマロン酸塩からなる群から選択される酸性塩から調製された、化合物。

【請求項 17】

適当な塩基性条件下で前記化合物の塩酸塩から調製された、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

2 に関して、 13.0° 、 14.8° および $23.3^\circ \pm 0.2^\circ$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する、請求項 16 に記載の化合物。

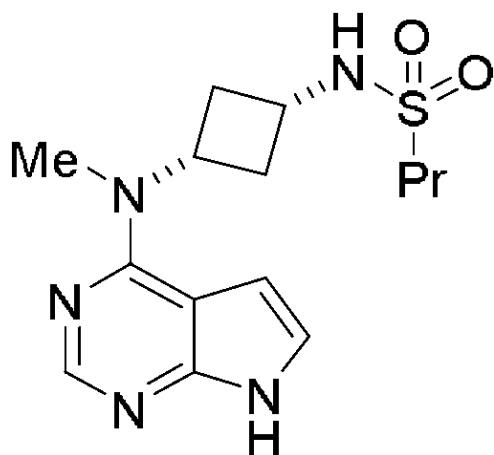
40

【請求項 19】

構造：

50

【化 9】



10

を有する化合物を調製するための方法であって、

(a) 適当な条件下で前記化合物の塩酸塩を調製するステップ、およびその後 (b) 適当な条件下で前記塩を適当な塩基と反応させて化合物を形成するステップを含み、前記適当な塩基が、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、またはトリエチルアミンから選択される、方法。

20

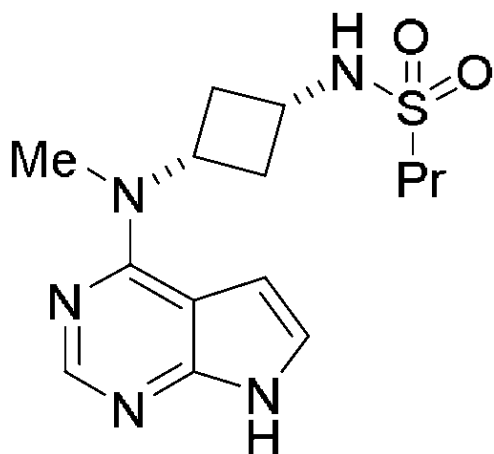
【請求項 20】

前記適当な塩基が、重炭酸ナトリウムまたは重炭酸カリウムである、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

構造：

【化 10】



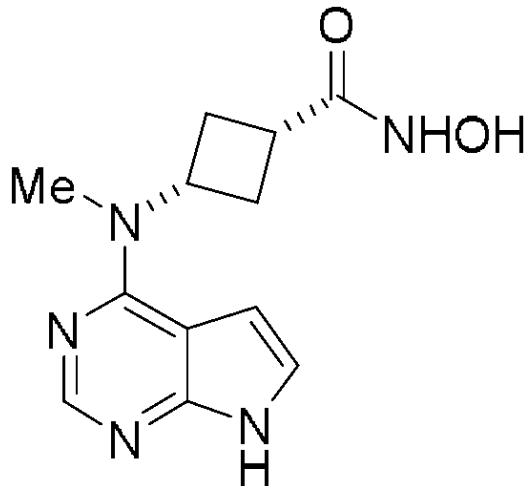
30

40

を有する化合物を調製するための方法であって、 (a) 構造：

50

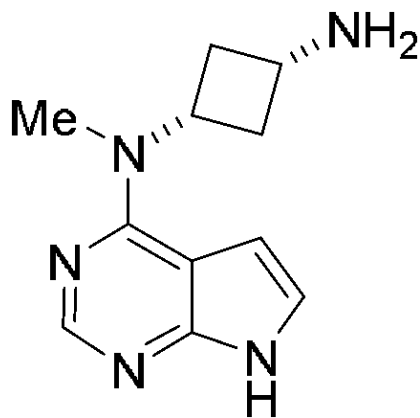
【化 1 1】



10

を有するヒドロキシルアミン化合物を調製するステップ、(b) 適当な条件下で前記ヒドロキシルアミン化合物を反応させて、構造：

【化 1 2】



20

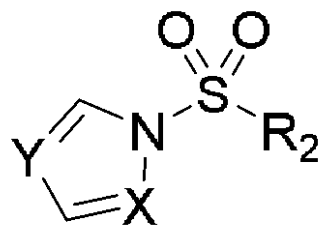
30

を有するアミノ化合物を調製するステップ、およびその後(c) 適当な条件下で前記アミノ化合物を適当な n - プロピルスルホン化試薬で処理して化合物を形成するステップを含む、方法。

【請求項 2 2】

n - プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 1 3】



40

を有する化合物であり、式中、R₂が n - プロピルであり、X および Y が、C₁R₃ および N から独立して選択され、式中、R₃ が、水素、および (C₁ ~ C₆) アルキルから選択される、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 3】

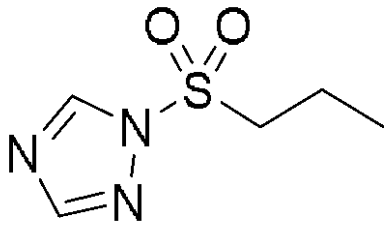
50

X および Y が両方とも N である、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 4】

n - プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 1 4】



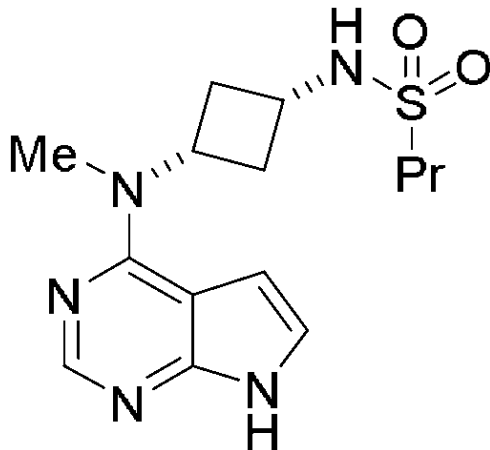
10

を有する化合物、1 - (プロピルスルホニル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾールである、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 5】

構造：

【化 1 5】



20

30

を有する化合物が、2 に関して、 13.0° 、 14.8° および 23.3° $2 \pm 0.2^\circ$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する結晶形態の N - ((1S, 3S) - 3 - (メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル)アミノ)シクロブチル)プロパン - 1 - スルホンアミドである、請求項 2 1 に記載の方法。

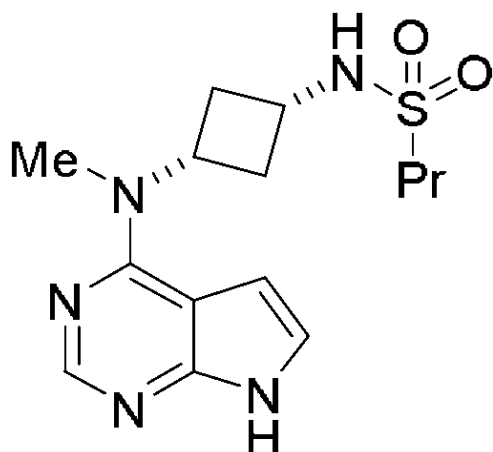
【請求項 2 6】

構造：

40

50

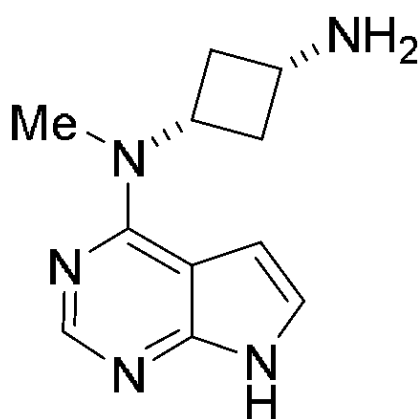
【化 1 6】



10

を有する化合物を調製するための方法であって、(a)構造：

【化 1 7】



20

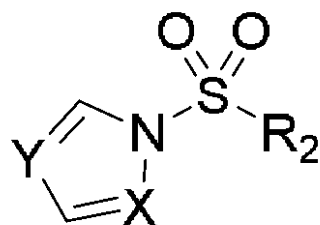
を有するアミノ化合物を調製するステップ、およびその後(b)適当な条件下で前記アミノ化合物を適当なn-プロピルスルホン化試薬で処理して化合物を形成するステップを含む、方法。

30

【請求項 2 7】

n-プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 1 8】



40

を有する化合物であって、式中、R₂がn-プロピルであり、XおよびYがC R₃およびNから独立して選択され、式中、R₃が水素および(C₁~C₆)アルキルから選択される、請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

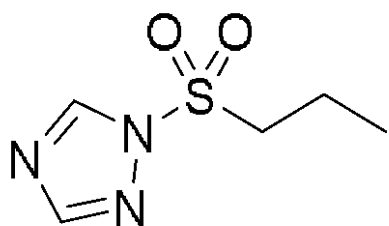
XおよびYが両方ともNである、請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 9】

50

n - プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 1 9】



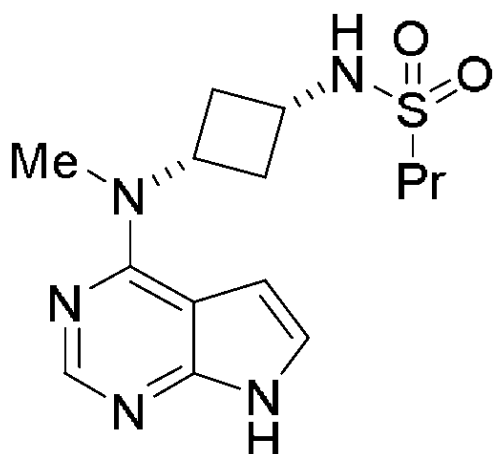
10

を有する化合物、1 - (プロピルスルホニル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾールである、請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 3 0】

構造：

【化 2 0】



20

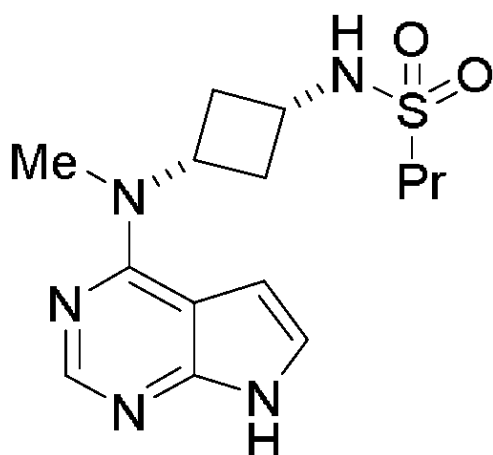
を有する化合物が、2 に関して、 13.0° 、 14.8° および $23.3^\circ \pm 0.2^\circ$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有する結晶形態の N - ((1 S , 3 S) - 3 - (メチル (7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロブチル) プロパン - 1 - スルホンアミドである、請求項 2 9 に記載の方法。

30

【請求項 3 1】

構造：

【化 2 1】



40

50

を有する化合物の医薬組成物であって、前記化合物が、2 に関して、 13.0° 、 14.8° および $23.3^\circ \pm 0.2^\circ$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターンを有し、前記医薬組成物が、薬学的に許容できる担体をさらに含む、医薬組成物。

【請求項 3 2】

クリーム、経皮パッチ、軟膏、点眼薬、ローションおよびゲルから選択される局所製剤を含む、請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

局所製剤が、約 0.1% ~ 約 5.0% (w/v) の N - ((1S, 3S) - 3 - (メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル)アミノ)シクロブチル)プロパン - 1 - スルホンアミドを含有する、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 3 4】

哺乳動物における疾患を治療するために用いられる、請求項 3 1 から 3 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、前記疾患が、狼瘡、リウマチ様関節炎、IBD、潰瘍性大腸炎、クローン病、白斑、脱毛症、乾癬およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項 3 5】

哺乳動物における疾患を局所的に治療するために用いられる、請求項 3 1 から 3 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、前記疾患が、白斑、脱毛症、乾癬およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される、医薬組成物。

20

30

40

50